(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2025-519029
(P2025-519029A)
(43)公表日　令和7年6月24日(2025.6.24)

(51)国際特許分類		FI			テーマコード（参考）
C07C 215/68 (2006.01)		C07C	215/68		4C086
C07D 401/14 (2006.01)		C07D	401/14	CSP	4C206
A61K 31/4545(2006.01)		A61K	31/4545		4H006
A61P 35/00 (2006.01)		A61P	35/00		
A61P 43/00 (2006.01)		A61P	43/00	111	

審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全1536頁）　最終頁に続く

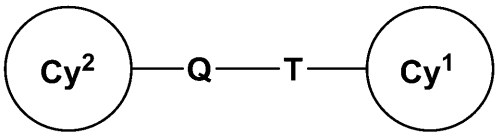
(21)出願番号　特願2024-566284(P2024-566284)
(86)(22)出願日　令和5年5月10日(2023.5.10)
(85)翻訳文提出日　令和7年1月7日(2025.1.7)
(86)国際出願番号　PCT/US2023/021668
(87)国際公開番号　WO2023/220131
(87)国際公開日　令和5年11月16日(2023.11.16)
(31)優先権主張番号　63/364,459
(32)優先日　令和4年5月10日(2022.5.10)
(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)
(81)指定国・地域　AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV
最終頁に続く

(71)出願人　520363742
リレー セラピューティクス， インコーポレイテッド
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９， セカンド フロア
(74)代理人　100078282
弁理士　山本 秀策
(74)代理人　100113413
弁理士　森下 夏樹
(74)代理人　100181674
弁理士　飯田 貴敏
(74)代理人　100181641
弁理士　石川 大輔
(74)代理人　230113332
最終頁に続く

(54)【発明の名称】　ＰＩ３Ｋα阻害剤及びその使用方法

(57)【要約】
本開示は、新規化合物及びその医薬組成物、ならびに本開示の化合物及び組成物を用いてＰＩ３Ｋα酵素の活性を阻害するための方法に関する。本開示は、さらに、本開示の化合物及び組成物を用いてＰＩ３Ｋαシグナル伝達に関連する障害を治療するための方法に関するが、これらに限定されない。ＰＩ３Ｋαの阻害剤は、増殖性疾患やその他の障害の治療において特に価値があると考えられる。ＰＩ３Ｋの複数の阻害剤（例えば、ｔａｓｅｌｉｓｉｂ、ａｌｐｅｌｉｓｉｂ、ｂｕｐａｒｌｉｓｉｂなど）が開発されるが、これらの分子は、複数のクラス１Ａ　ＰＩ３Ｋアイソフォームを阻害する。

【特許請求の範囲】
【請求項１】
式Ｉの化合物：
【化７９１】

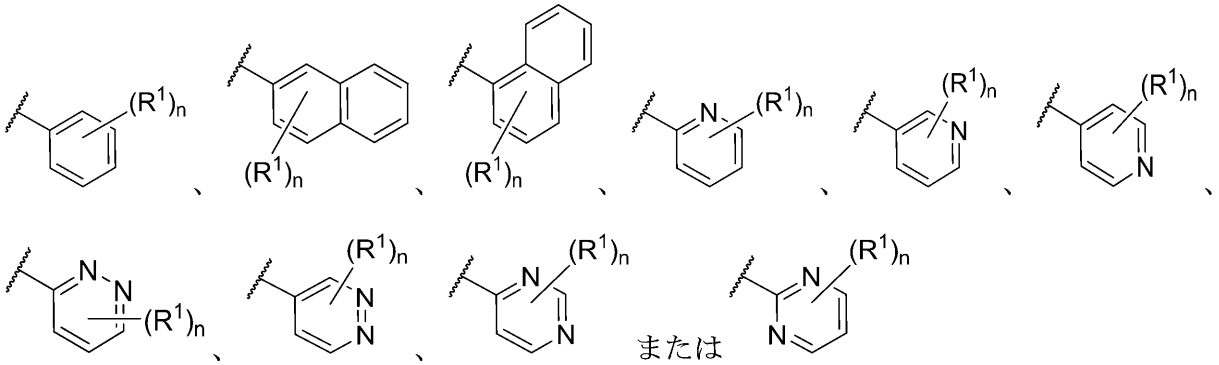


Ｉ

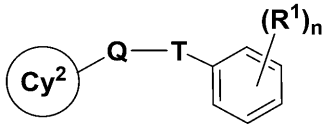
またはその薬学的に許容される塩（式中、
Cy^1は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換され、
Cy^2は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Cy^2は、ｍ個のR^2で置換され、
Ｑは、L^Qであり、
Ｔは、ｑ個のR^Tで置換された二価のC_{1-3}脂肪族鎖であり、
各R^1は、独立して、$-L^1-R^{1A}$であり、
各R^2は、独立して、$-L^2-R^{2A}$であり、
各R^Tは、独立して、$-L^T-R^{TA}$であるか、あるいは
R^Tの２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、前記環は、p^1個のR^{TTC}で置換され、
R^1の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、前記環は、p^2個のR^{11C}で置換され、
R^2の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和、部分不飽和もしくは芳香族の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、前記環は、p^3個のR^{22C}で置換され、
R^Tの１つとR^1の１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、前記環は、p^4個のR^{T1C}で置換されるか、あるいは
R^Tの１つとR^Lの１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテ

ロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、前記環は、p^5個のR^{TLC}で置換され、
L^1、L^2、L^Q、及びL^Tのそれぞれは、独立して、共有結合、またはC_{1-4}の二価の飽和もしくは不飽和の直鎖もしくは分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、前記鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＯＲ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＣＮ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられ、
各R^{1A}は、独立して、r^1個のR^{1C}によって置換されたR^AまたはR^Bであり、
各R^{2A}は、独立して、r^2個のR^{2C}によって置換されたR^AまたはR^Bであり、
各R^{TA}は、独立して、r^3個のR^{TC}によって置換されたR^AまたはR^Bであり、
各R^Lは、独立して、r^4個のR^{LC}によって置換されたR^AまたはR^Bであり、
R^Aの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－SF_5、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）（ＮＣＮ）Ｒ、－Ｓ（ＮＣＮ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$であり、
R^Bの各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、
R^{1C}、R^{2C}、R^{TC}、R^{TTC}、R^{11C}、R^{22C}、R^{T1C}、R^{TLC}、及びR^{LC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－SF_5、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基であり、
Ｒの各個は、独立して、水素、またはC_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基であるか、あるいは
同じ窒素上の２つのＲ基が、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される０～３個のヘテロ原子を有する４～７員の飽和

環、部分不飽和環、またはヘテロアリール環を形成し、
ｎ、ｍ、ｑ、ｐ^{1}、ｐ^{2}、ｐ^{3}、ｐ^{4}、ｐ^{5}、ｒ^{1}、ｒ^{2}、ｒ^{3}、及びｒ^{4}のそれぞれは、独立して、０、１、２、３、４、または５である）。
【請求項２】
Ｃｙ^{1}が、
【化７９２】



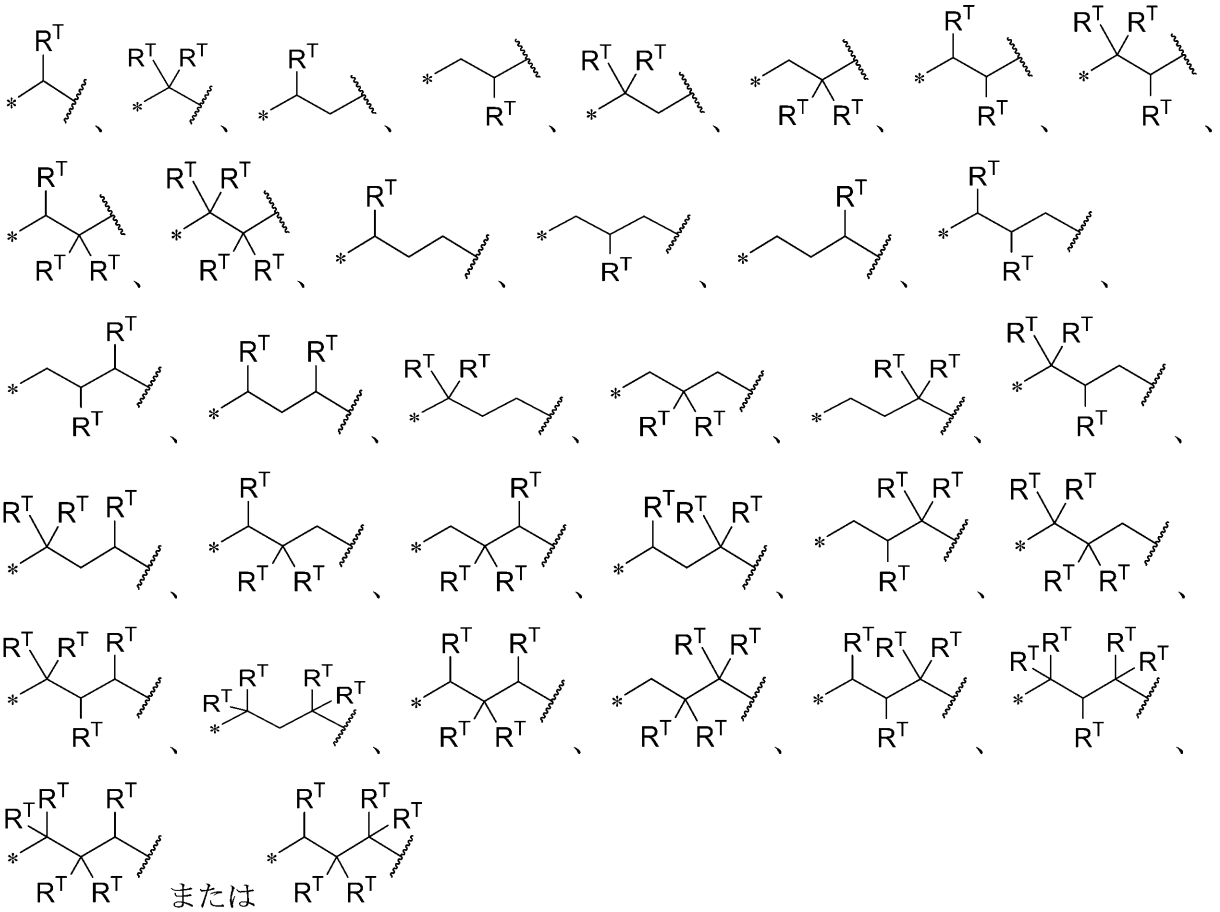
である、請求項１に記載の化合物。
【請求項３】
前記化合物が、式ＩＩの化合物：
【化７９３】



ＩＩ

またはその薬学的に許容される塩である、請求項１または２に記載の化合物。
【請求項４】
Ｑが、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＣＨ$_{2}$－、－Ｎ（Ｒ）－、－ＣＨ$_{2}$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、または共有結合である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項５】
Ｔが、

【化７９４】



または

であり、式中、

【化７９５】



は、Ｑへの結合を表し、

【化７９６】

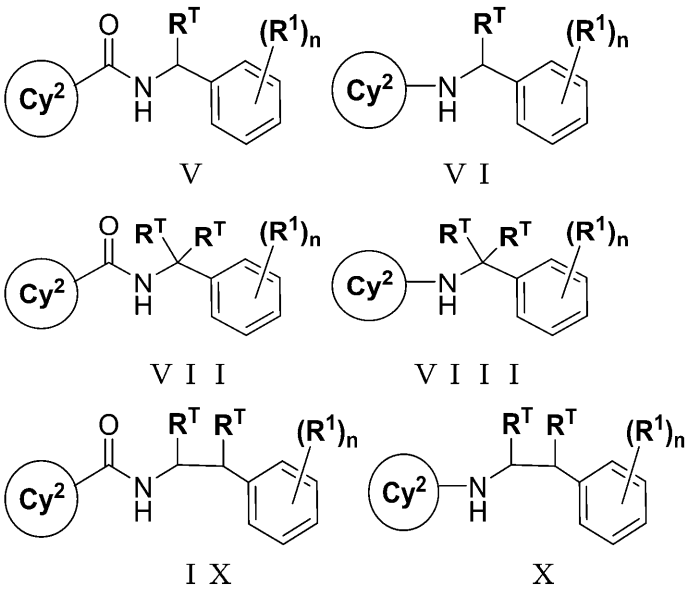


は、Ｃｙ^{1}への結合を表す、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項６】

前記化合物が、式Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、もしくはＸの化合物：

【化７９７】



または、その薬学的に許容される塩である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

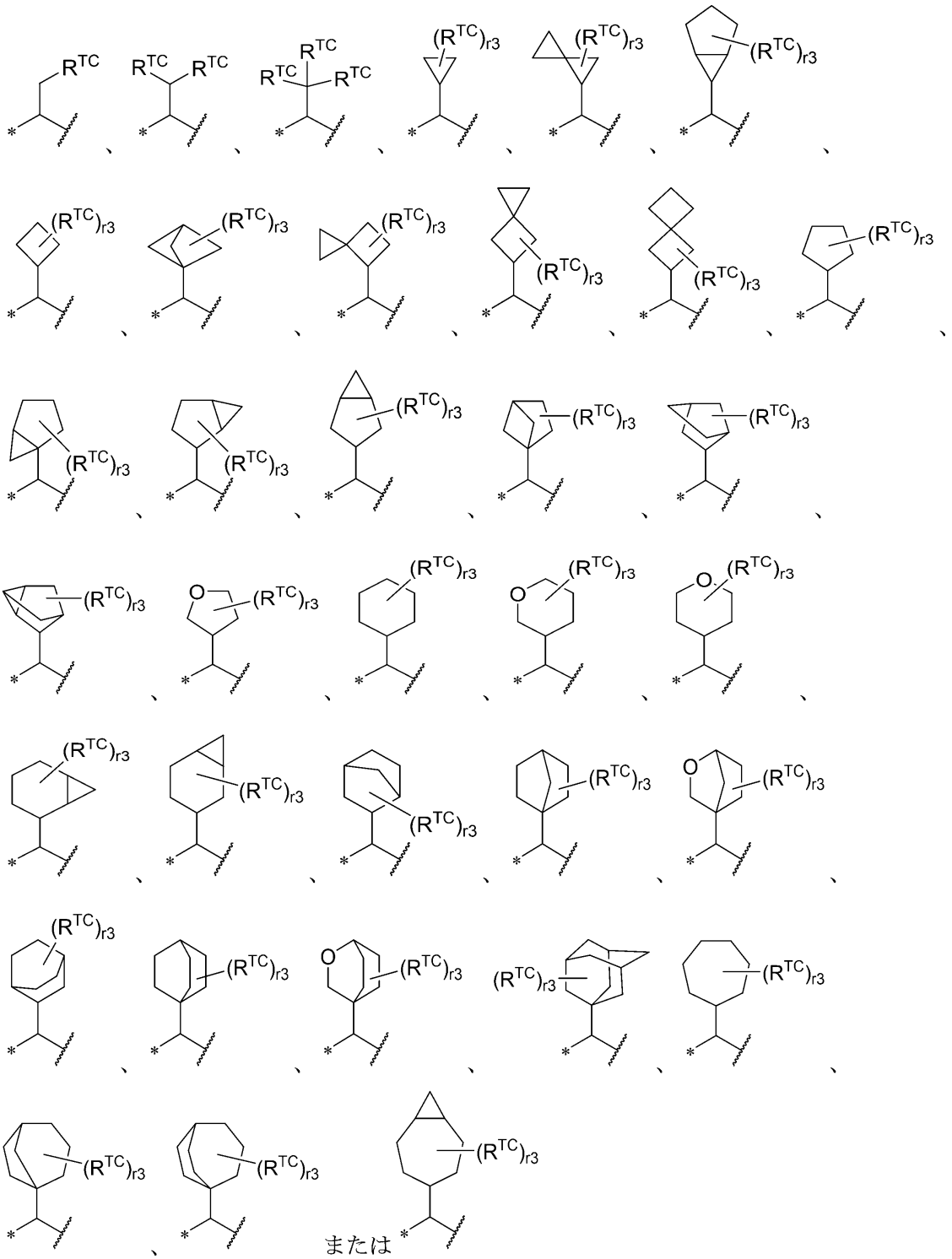
【請求項７】

Ｒ^{T}の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、前記環は、ｐ^{1}個のＲ^{ＴＴＣ}で置換される、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項８】

Ｔが、

【化７９８】



であり、式中、

【化７９９】

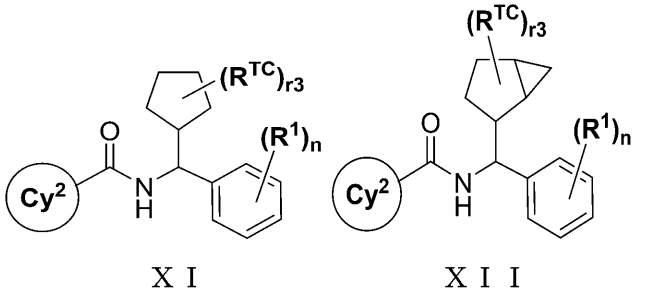


は、Ｑへの結合を表し、

【化８００】

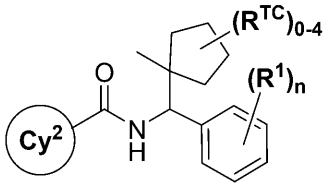


は、Ｃｙ^{1}への結合を表す、請求項１～５のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項９】
前記化合物が、式ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、もしくはＸＩＸの化合物：
【化８０１】

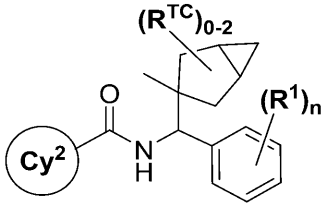


ＸＩ

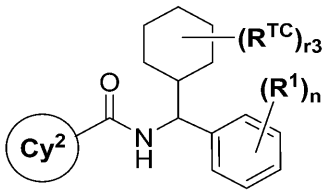
ＸＩＩ



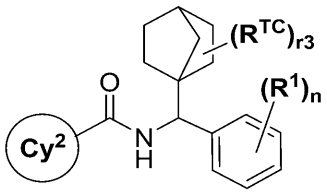
ＸＩＩＩ



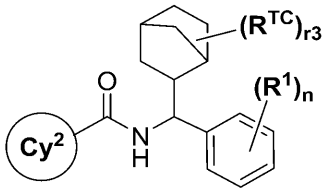
ＸＩＶ



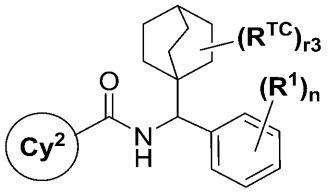
ＸＶ



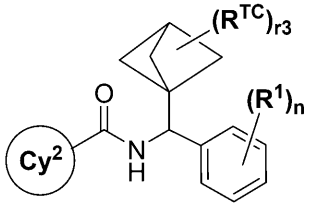
ＸＶＩ



ＸＶＩＩ



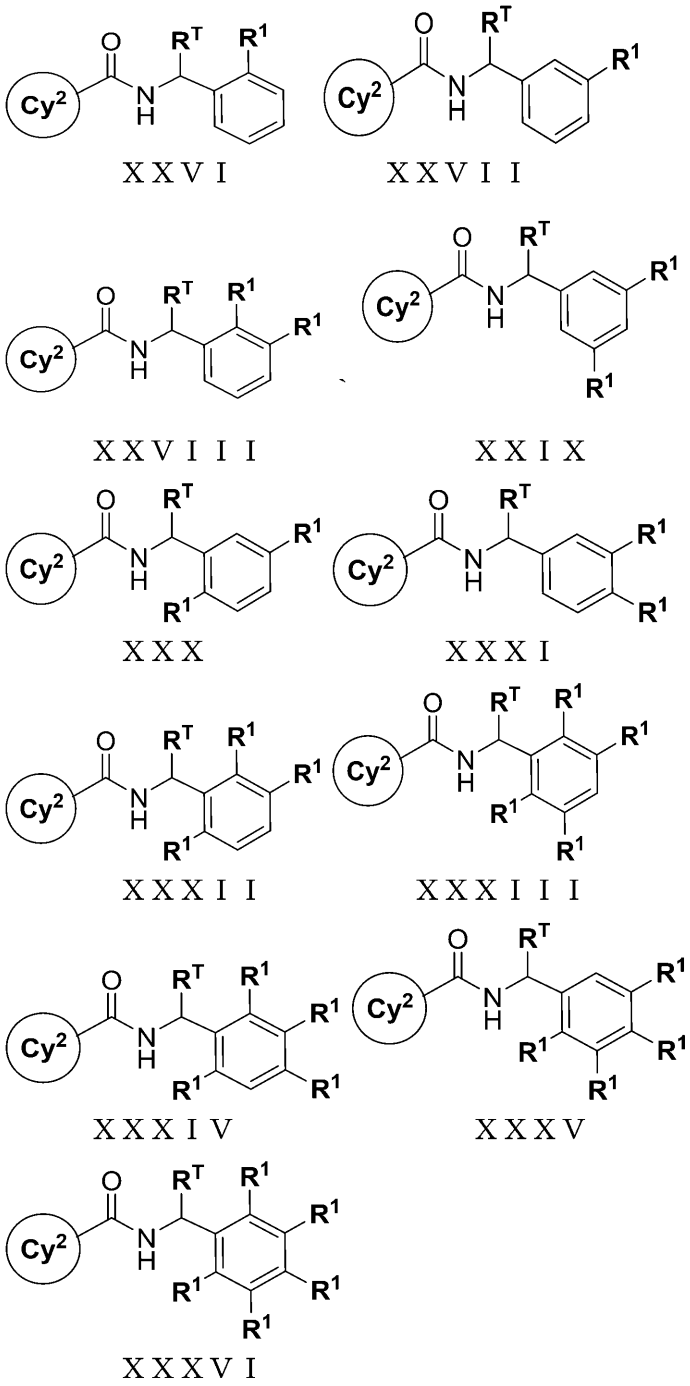
ＸＶＩＩＩ



ＸＩＸ

またはその薬学的に許容される塩である、請求項１～６及び請求項８のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項１０】
前記化合物が、式ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、もしくはＸＸＸＶＩの化合物：

【化８０２】



ＸＸＶＩ　ＸＸＶＩＩ

ＸＸＶＩＩＩ　ＸＸＩＸ

ＸＸＸ　ＸＸＸＩ

ＸＸＸＩＩ　ＸＸＸＩＩＩ

ＸＸＸＩＶ　ＸＸＸＶ

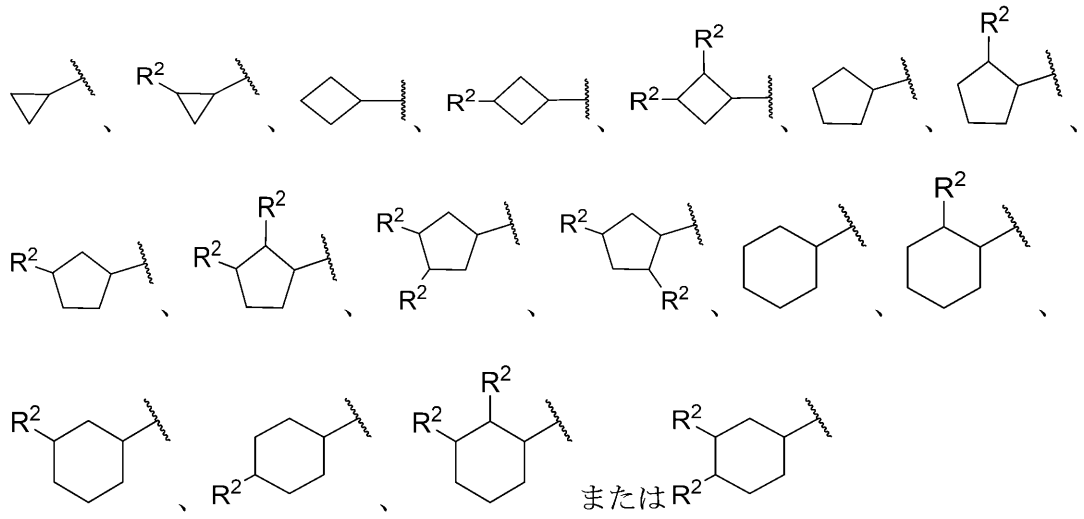
ＸＸＸＶＩ

または その薬学的に許容される塩である、請求項１～３のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１１】

Ｃｙ２が、

【化８０３】

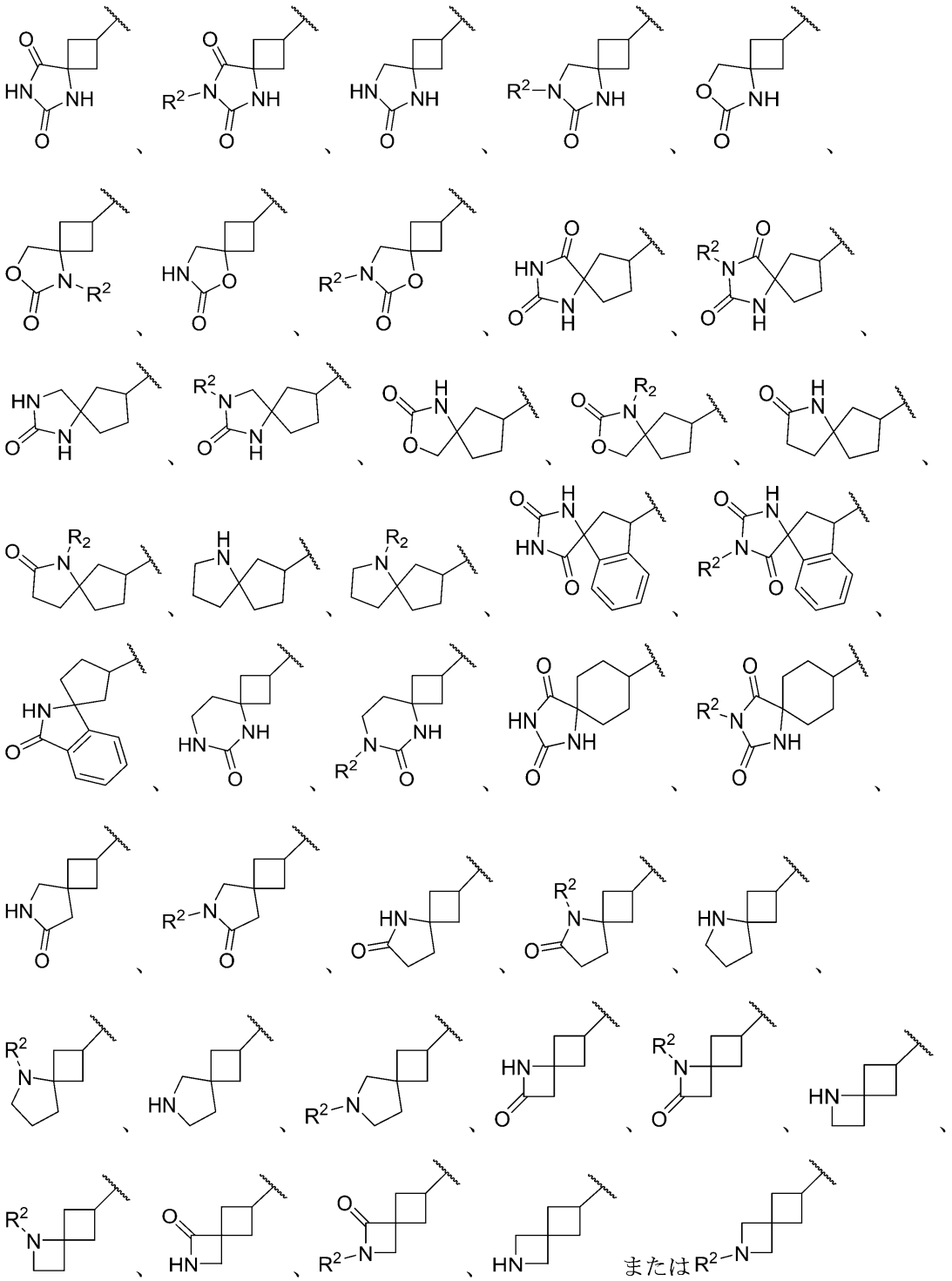


である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１２】

Ｃｙ２が、

【化８０４】

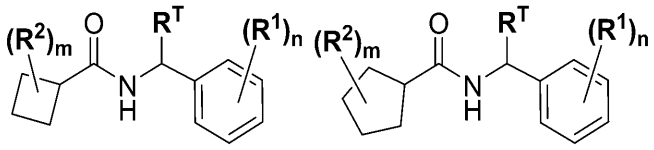


である、請求項１～１０のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１３】

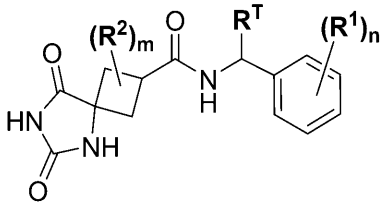
前記化合物が、式ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、もしくはＸＸＶの化合物：

【化８０５】

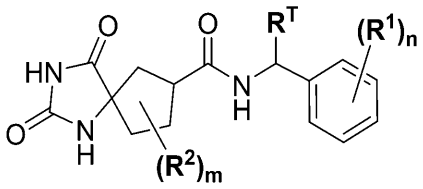


ＸＸ

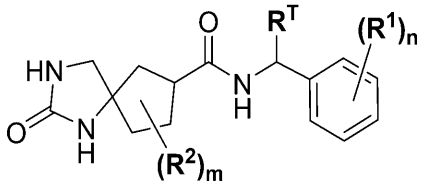
ＸＸＩ



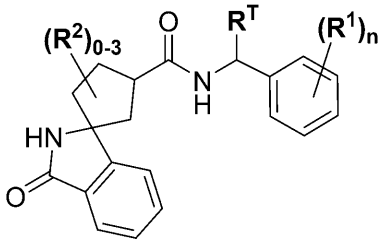
ＸＸＩＩ



ＸＸＩＩＩ



ＸＸＩＶ



ＸＸＶ

またはその薬学的に許容される塩である、請求項１～６のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１４】

Ｒ^{T}が、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{TC}によって置換される、請求項１～６及び１０～１３のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１５】

Ｌ^{1}が、共有結合である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１６】

各Ｒ^{1}が、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（０～５個のハロゲンで置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族鎖）、または０～５個のハロゲンで置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族鎖である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１７】

少なくとも１つのＲ^{1}が、ハロゲンである、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１８】

少なくとも２つのＲ^{1}が、ハロゲンである、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項１９】

少なくとも３つのＲ^{1}が、ハロゲンである、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項２０】

少なくとも１つのＲ^{1}が、１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

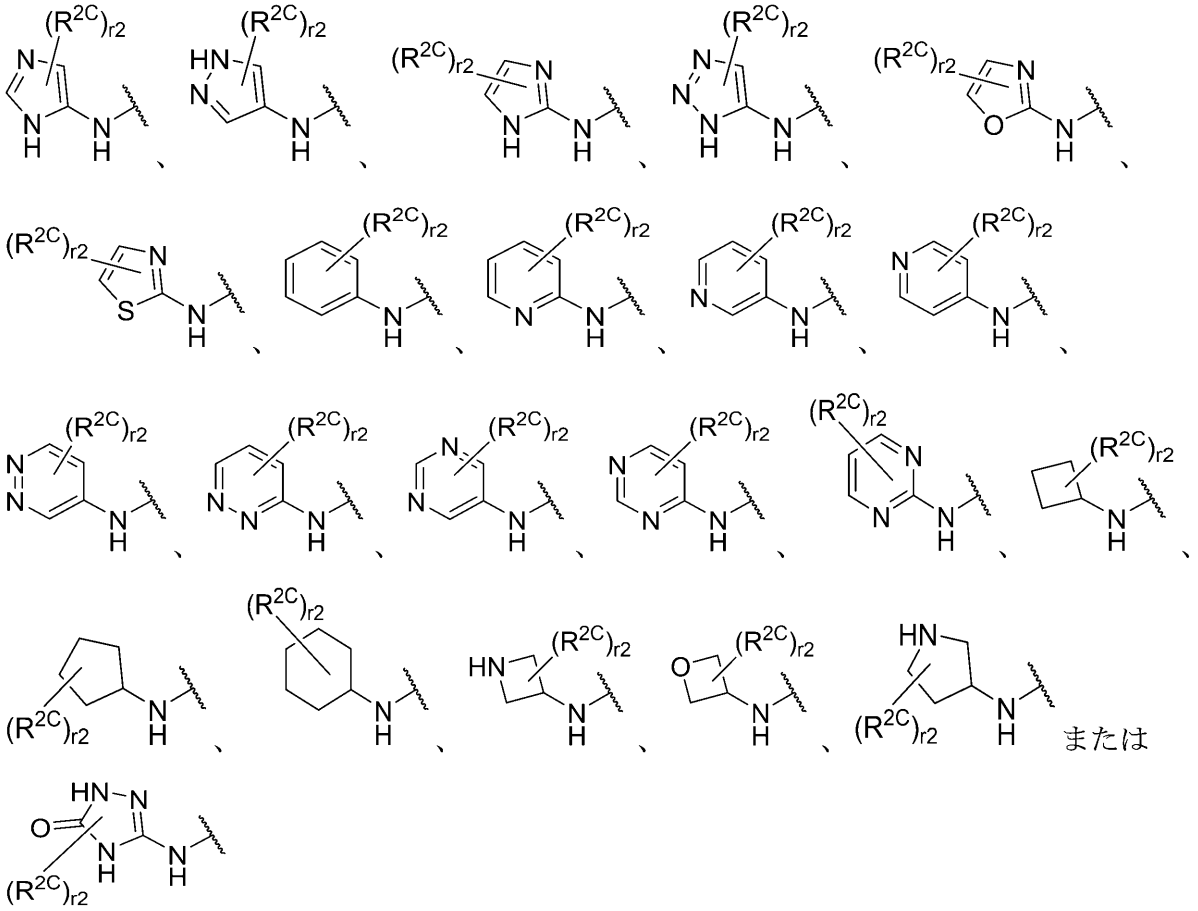
【請求項２１】

少なくとも１つのＲ^{1}が、１～３個のハロゲンで任意選択により置換された－Ｏ－Ｃ$_{1-3}$脂肪族である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項２２】

ｎが、１、２、３、４、または５である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項２３】
R^2が、－Ｎ（Ｒ）－R^{2A}、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－R^{2A}、－ＣＨ（R^L）Ｎ（Ｒ）－R^{2A}、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＣＨ（R^L）－R^{2A}、－ＣＨ（R^L）Ｏ－R^{2A}、－ＣＨ（R^L）－R^{2A}、
または－R^{2A}である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項２４】
R^2が、－Ｎ（Ｈ）－R^{2A}、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－R^{2A}、または－CH_2－R^{2A}である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項２５】
R^{2A}が、r^2個のR^{2C}によって置換されたR^Bである、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項２６】
R^{2A}が、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、R^{2A}は、r^2個のR^{2C}によって置換される、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項２７】
R^{2A}が、r^2個のR^{2C}で置換されたフェニルである、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項２８】
R^{2A}が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、前記環は、r^2個のR^{2C}によって置換される、請求項１～２５のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項２９】
R^{2A}が、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、前記環は、r^2個のR^{2C}によって置換される、請求項１～２５のいずれか１項に記載の化合物。
【請求項３０】
R^2が、

【化８０６】

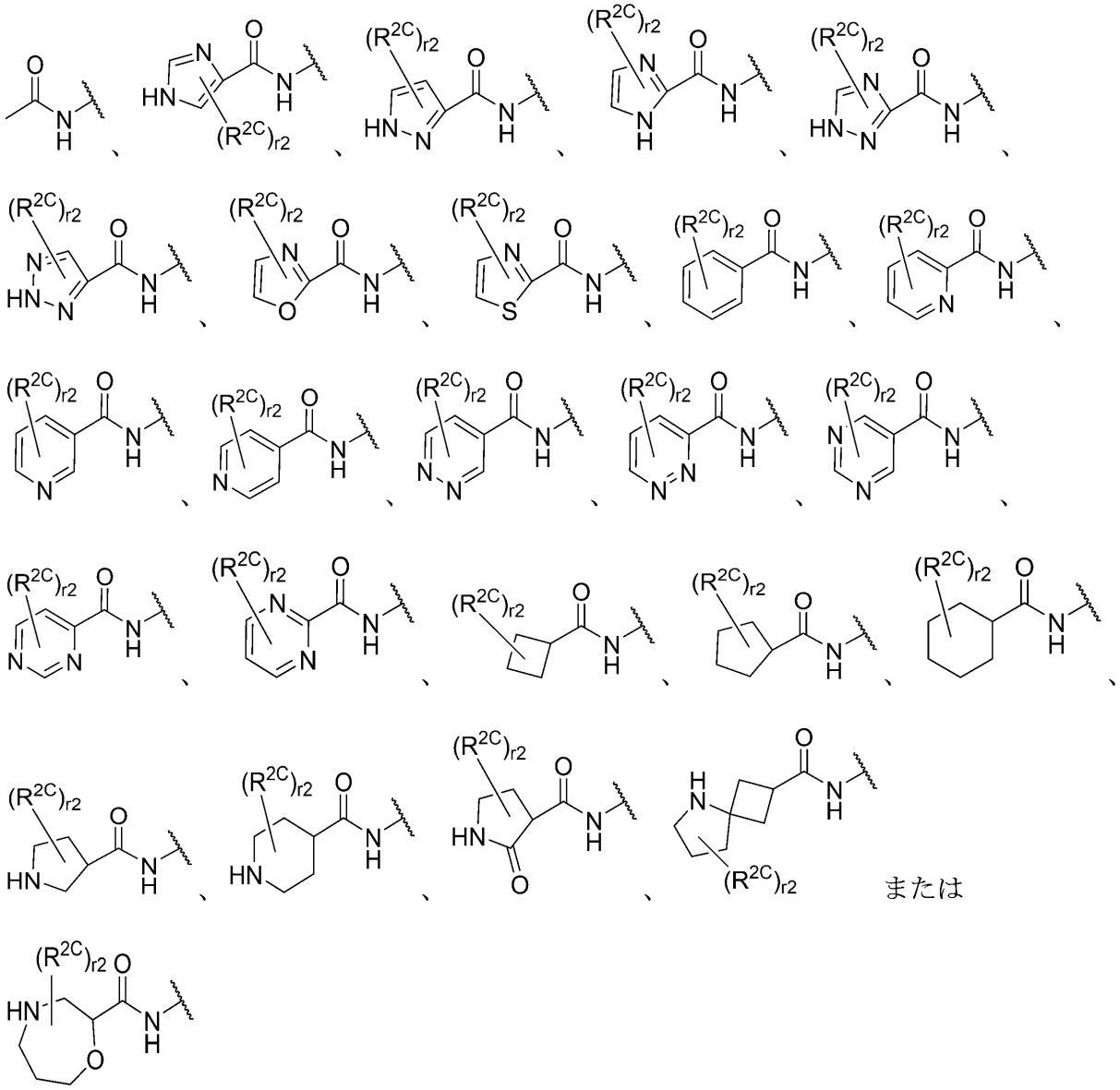


である、請求項１～２５のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項３１】

Ｒ^{2}が、

【化８０７】

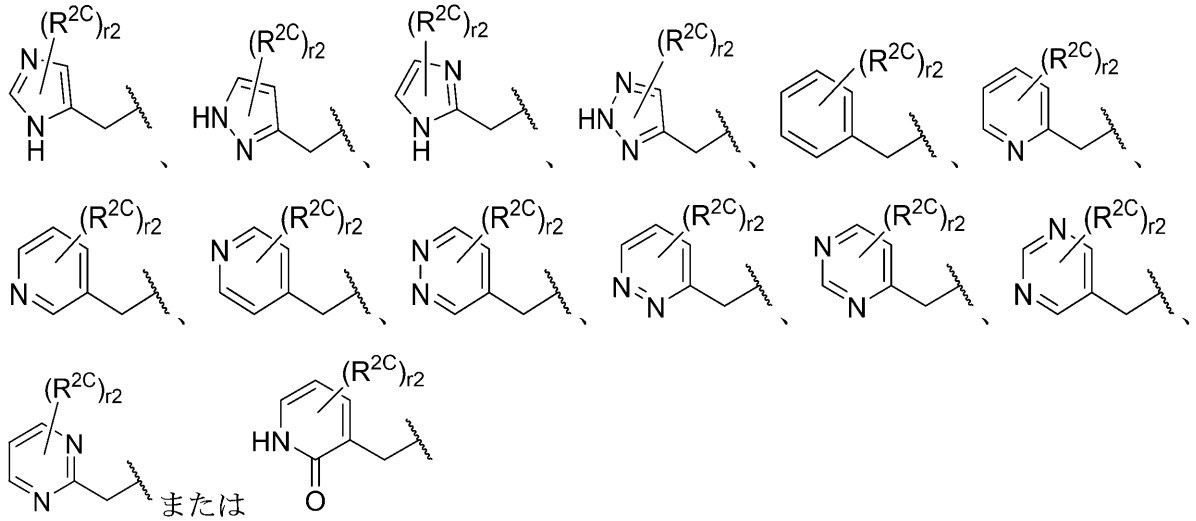


である、請求項１～２５のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項３２】

Ｒ^{2}が、

【化８０８】



である、請求項１～２５のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項３３】

ｍが、１である、先行請求項のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項３４】

R^{2C}の各個が、独立して、（ｉ）－Ｏ－（C_{1-6}脂肪族）、－ＯＨ、－Ｎ（C_{1-6}脂肪族）$_2$、及び－ＣＮから独立して選択される１個または２個の基と、（ｉｉ）ハロゲン及び重水素から独立して選択される１、２、または３個の原子とで任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である、請求項１～３３のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項３５】

R^{2C}の各個が、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される、請求項１～３３のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項３６】

R^{TC}の各個が、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される、請求項１～３５のいずれか１項に記載の化合物。

【請求項３７】

表１に記載されるもの選択される化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項３８】

先行請求項のいずれか１項に記載の化合物と、薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物。

【請求項３９】

対象におけるＰＩ３Ｋαシグナル伝達活性を阻害する方法であって、治療上有効な量の請求項１～３７のいずれか１項に記載の化合物または請求項３８に記載の医薬組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、前記方法。

【請求項４０】

対象におけるＰＩ３Ｋα媒介性障害を治療する方法であって、治療上有効な量の請求項１～３７のいずれか１項に記載の化合物または請求項３８に記載の医薬組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、前記方法。

【請求項４１】

対象における細胞増殖性疾患を治療する方法であって、治療上有効な量の請求項１～３７のいずれか１項に記載の化合物または請求項３８に記載の医薬組成物を、それを必要と

する対象に投与することを含む、前記方法。
【請求項４２】
前記細胞増殖性疾患が、がんである、請求項４１に記載の方法。
【請求項４３】
前記がんが、乳癌である、請求項４２に記載の方法。
【請求項４４】
前記がんが、卵巣癌である、請求項４２に記載の方法。
【請求項４５】
前記卵巣癌が、明細胞卵巣癌である、請求項４４に記載の方法。
【請求項４６】
前記対象が、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する、請求項３９～４５のいずれか１項に記載の方法。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
関連出願の相互参照
本出願は、２０２２年5月１０日に出願された米国仮出願第６３／３６４，４５９号の利益を主張するものであり、その全体は、参照により本明細書に援用される。
【背景技術】
【０００２】
ホスファチジルイノシトール３－キナーゼ（ＰＩ３Ｋ）は、イノシトール脂質のＤ－３’位へのリン酸の転移を触媒してホスホイノシトール－３－リン酸（ＰＩＰ）、ホスホイノシトール－３，４－二リン酸（PIP_2）及びホスホイノシトール－３，４，５－三リン酸（PIP_3）を生成する脂質キナーゼのファミリーを含み、これらは、続いて、プレクストリン相同性、ＦＹＶＥ、Ｐｈｏｘ及びその他のリン脂質結合ドメインを含むタンパク質を、多くの場合細胞膜でさまざまなシグナル伝達複合体にドッキングさせることにより、シグナル伝達カスケードにおけるセカンドメッセンジャーとして機能する（Ｖａｎｈａｅｓｅｂｒｏｅｃｋ ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎｕ．Ｒｅｖ．Ｂｉｏｃｈｅｍ ７０：５３５（２００１）；Ｋａｔｓｏ ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎｕ．Ｒｅｖ．Ｃｅｌｌ Ｄｅｖ．Ｂｉｏｌ．１７：６１５（２００１））。２つのクラス１ ＰＩ３Ｋサブクラスのうち、クラス１Ａ ＰＩ３Ｋは、ｐ８５アルファ、ｐ５５アルファ、ｐ５０アルファ、ｐ８５ベータ、またはｐ５５ガンマの可能性がある調節サブユニットと構成的に結合した触媒ｐ１１０サブユニット（アルファ、ベータ、またはデルタアイソフォーム）で構成されるヘテロ二量体である。クラス１Ｂサブクラスには、２つの調節サブユニット、ｐ１０１またはｐ８４の１つに結合した触媒作用のあるｐ１１０ガンマサブユニットで構成されるヘテロ二量体というファミリーメンバーが１つある（Ｆｒｕｍａｎ ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎｕ Ｒｅｖ．Ｂｉｏｃｈｅｍ．６７：４８１（１９９８）；Ｓｕｉｒｅ ｅｔ ａｌ．，Ｃｕｒｒ．Ｂｉｏｌ．１５：５６６（２００５））。ｐ８５／５５／５０サブユニットのモジュラードメインには、活性化された受容体及び細胞質チロシンキナーゼ上の特定の配列関係でホスホチロシン残基に結合するＳｒｃホモロジー（ＳＨ２）ドメインが含まれており、その結果、クラス１Ａ ＰＩ３Ｋの活性化と局在化が引き起こされる。クラス１Ｂ ＰＩ３Ｋは、ペプチド及び非ペプチドリガンドの多様なレパートリーに結合するＧタンパク質共役受容体によって直接活性化される（Ｓｔｅｐｈｅｎｓ ｅｔ ａｌ．，Ｃｅｌｌ ８９：１０５（１９９７）；Ｋａｔｓｏ ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎｕ．Ｒｅｖ．Ｃｅｌｌ Ｄｅｖ．Ｂｉｏｌ．１７：６１５－６７５（２００１））。
【０００３】
その結果、クラスＩ ＰＩ３Ｋのリン脂質生成物は、上流の受容体を、増殖、生存、走化性、細胞輸送、運動性、代謝、炎症及びアレルギー反応、転写及び翻訳を含む下流の細胞活動と結び付ける（Ｃａｎｔｌｅｙ ｅｔ ａｌ．，Ｃｅｌｌ ６４：２８１（１９９１）；Ｅｓｃｏｂｅｄｏ ａｎｄ Ｗｉｌｌｉａｍｓ，Ｎａｔｕｒｅ ３３５：８５（１

９８８）；Ｆａｎｔｌ ｅｔ ａｌ．，Ｃｅｌｌ ６９：４１３（１９９２））。多くの場合、ＰＩＰ$_2$とＰＩＰ$_3$は、ウイルスの癌遺伝子ｖ－Ａｋｔのヒトホモログの生成物であるＡｉｄを細胞膜に動員し、そこで成長と生存に重要な多くの細胞内シグナル伝達経路の結節点として機能する（Ｆａｎｔｌ ｅｔ ａｌ．，Ｃｅｌｌ ６９：４１３－４２３（１９９２）；Ｂａｄｅｒ ｅｔ ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖ．Ｃａｎｃｅｒ ５：９２１（２００５）；Ｖｉｖａｎｃｏ ａｎｄ Ｓａｗｙｅｒ，Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖ．Ｃａｎｃｅｒ ２：４８９（２００２））。

【０００４】

ＰＩ３Ｋの異常調節は、多くの場合、Ａｉｄの活性化によって生存率を高めるが、これはヒトのがんで最も一般的な事象の１つであり、複数のレベルで発生することが示される。イノシトール環の３’位のホスホイノシチドを脱リン酸化し、それによってＰＩ３Ｋの活性に拮抗する腫瘍抑制遺伝子ＰＴＥＮは、さまざまな腫瘍で機能的に欠失する。他の腫瘍では、ｐ１１０アルファアイソフォーム、ＰＩＫ３ＣＡの遺伝子、及びＡｋｔの遺伝子が増幅され、それらの遺伝子産物のタンパク質発現の増加がいくつかのヒトのがんで実証されている。さらに、ｐ８５－ｐ１１０複合体の上方制御に役立つｐ８５アルファの変異と転座がヒトのがんで報告されている。最後に、下流シグナル伝達経路を活性化するＰＩＫ３ＣＡの体細胞ミスセンス変異は、さまざまなヒトのがんにおいてかなりの頻度で報告されている（Ｋａｎｇ ｅｔ ｅｌ．，Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．ＵＳＡ １０２：８０２（２００５）；Ｓａｍｕｅｌｓ ｅｔ ａｌ．，Ｓｃｉｅｎｃｅ ３０４：５５４（２００４）；Ｓａｍｕｅｌｓ ｅｔ ａｌ．，Ｃａｎｃｅｒ Ｃｅｌｌ ７：５６１－５７３（２００５））。これらの観察結果は、ホスホイノシトール－３キナーゼ及びこのシグナル伝達経路の上流及び下流成分の調節不全が、ヒトのがん及び増殖性疾患に関連する最も一般的な調節不全の１つであることを示す（Ｐａｒｓｏｎｓ ｅｔ ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ ４３６：７９２（２００５）；Ｈｅｎｎｅｓｓｅｙ ａｔ ｅｌ．，Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖ．Ｄｒｕｇ Ｄｉｓｃ．４：９８８－１００４（２００５））。

上記を考慮すると、ＰＩ３Ｋαの阻害剤は、増殖性疾患やその他の障害の治療において特に価値があると考えられる。ＰＩ３Ｋの複数の阻害剤（例えば、ｔａｓｅｌｉｓｉｂ、ａｌｐｅｌｉｓｉｂ、ｂｕｐａｒｌｉｓｉｂなど）が開発されるが、これらの分子は、複数のクラス１Ａ ＰＩ３Ｋアイソフォームを阻害する。複数のクラス１Ａ ＰＩ３Ｋアイソフォームに対して活性を示す阻害剤は、「汎ＰＩ３Ｋ」阻害剤として知られている。従来のＰＩ３Ｋ阻害剤の臨床開発における大きな障害は、がん患者における毒性を回避しながら、腫瘍におけるターゲット阻害の必要レベルを達成できないことである。汎ＰＩ３Ｋ阻害剤は、下痢、発疹、疲労、高血糖などの特定のターゲット関連毒性を共有する。ＰＩ３Ｋ阻害剤の毒性は、それらのアイソフォーム選択性プロファイルに依存する。ＰＩ３Ｋαの阻害は、高血糖及び発疹と関連しており、ＰＩ３Ｋδ又はＰＩ３Ｋγの阻害は、下痢、骨髄抑制及び高トランスアミナーゼ血症と関連している（Ｈａｎｋｅｒ ｅｔ ａｌ．，Ｃａｎｃｅｒ Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ（２０１９）ＰＭＩＤ：３０８３７１６１。したがって、ＰＩ３Ｋαの選択的阻害剤は、がん患者における用量制限毒性を回避しながら、腫瘍内での十分なターゲット阻害を可能にし、治療域を拡大する可能性がある。

【先行技術文献】

【非特許文献】

【０００５】

【非特許文献１】Ｖａｎｈａｅｓｅｂｒｏｅｃｋ ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎｕ．Ｒｅｖ．Ｂｉｏｃｈｅｍ ７０：５３５（２００１）

【非特許文献２】Ｋａｔｓｏ ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎｕ．Ｒｅｖ．Ｃｅｌｌ Ｄｅｖ．Ｂｉｏｌ．１７：６１５（２００１）

【非特許文献３】Ｆｒｕｍａｎ ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎｕ Ｒｅｖ．Ｂｉｏｃｈｅｍ．６７：４８１（１９９８）

【非特許文献４】Ｓｕｉｒｅ ｅｔ ａｌ．，Ｃｕｒｒ．Ｂｉｏｌ．１５：５６６（２００５）

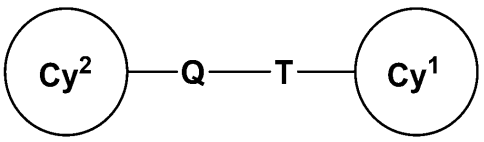
【非特許文献５】Ｓｔｅｐｈｅｎｓ　ｅｔ　ａｌ．，Ｃｅｌｌ　８９：１０５（１９９７）
【非特許文献６】Ｃａｎｔｌｅｙ　ｅｔ　ａｌ．，Ｃｅｌｌ　６４：２８１（１９９１）
【非特許文献７】Ｅｓｃｏｂｅｄｏ　ａｎｄ　Ｗｉｌｌｉａｍｓ，Ｎａｔｕｒｅ　３３５：８５（１９８８）
【非特許文献８】Ｆａｎｔｌ　ｅｔ　ａｌ．，Ｃｅｌｌ　６９：４１３（１９９２）
【非特許文献９】Ｂａｄｅｒ　ｅｔ　ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ　Ｒｅｖ．Ｃａｎｃｅｒ　５：９２１（２００５）
【非特許文献１０】Ｖｉｖａｎｃｏ　ａｎｄ　Ｓａｗｙｅｒ，Ｎａｔｕｒｅ　Ｒｅｖ．Ｃａｎｃｅｒ　２：４８９（２００２）
【非特許文献１１】Ｋａｎｇ　ｅｔ　ｅｌ．，Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．ＵＳＡ　１０２：８０２（２００５）
【非特許文献１２】Ｓａｍｕｅｌｓ　ｅｔ　ａｌ．，Ｓｃｉｅｎｃｅ　３０４：５５４（２００４）

【発明の概要】

【０００６】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｉの化合物：

【化１】



I

またはその薬学的に許容される塩を提供し、式中、Cy^1、Cy^2、Ｑ、及びＴのそれぞれは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０００７】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｉの化合物、またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体、アジュバント、または希釈剤とを含む、医薬組成物を提供する。

【０００８】

いくつかの実施形態において、本開示は、ＰＩ３Ｋα媒介性障害を治療する方法であって、それを必要とする患者に、式Ｉの化合物、または当該化合物を含む組成物を投与することを含む、方法を提供する。

【０００９】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｉの化合物、またはその合成中間体を提供するためのプロセスを提供する。

【００１０】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｉの化合物を含む医薬組成物を提供するためのプロセスを提供する。

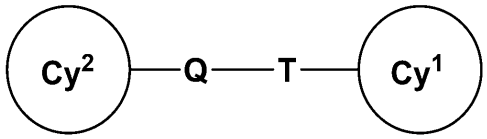
【発明を実施するための形態】

【００１１】

１．本開示のある特定の実施形態に関する概説

本開示の化合物及びその医薬組成物は、ＰＩ３Ｋαの阻害剤として有用である。いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｉの化合物：

【化２】



I

またはその薬学的に許容される塩を提供し、式中、
Cy^1は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換され、
Cy^2は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Cy^2は、ｍ個のR^2で置換され、
Ｑは、L^Qであり、
Ｔは、ｑ個のR^Tで置換された二価のC_{1-3}脂肪族鎖であり、
各R^1は、独立して、$-L^1-R^{1A}$であり、
各R^2は、独立して、$-L^2-R^{2A}$であり、
各R^Tは、独立して、$-L^T-R^{TA}$であるか、あるいは
R^Tの２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^1個のR^{TTC}で置換され、
R^1の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^2個のR^{11C}で置換され、
R^2の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和、部分不飽和もしくは芳香族の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^3個のR^{22C}で置換され、
R^Tの１つとR^1の１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^4個のR^{T1C}で置換されるか、あるいは
R^Tの１つとR^Lの１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^5個のR^{TLC}で置換され、
L^1、L^2、L^Q、及びL^Tのそれぞれは、独立して、共有結合、またはC_{1-4}の二価

の飽和もしくは不飽和の直鎖もしくは分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{L}）－、－Ｃ（Ｒ^{L}）$_{2}$－、Ｃ$_{3-6}$シクロアルキレン、Ｃ$_{3-6}$ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＯＲ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＣＮ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－によって置き換えられ、
各Ｒ^{1A}は、独立して、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換されたＲ^{A}またはＲ^{B}であり、
各Ｒ^{2A}は、独立して、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換されたＲ^{A}またはＲ^{B}であり、
各Ｒ^{TA}は、独立して、ｒ^{3}個のＲ^{TC}によって置換されたＲ^{A}またはＲ^{B}であり、
各Ｒ^{L}は、独立して、ｒ^{4}個のＲ^{LC}によって置換されたＲ^{A}またはＲ^{B}であり、
Ｒ^{A}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－ＯＲ、－ＳＦ$_{5}$、－ＳＲ、－ＮＲ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$ＮＲ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）（ＮＣＮ）Ｒ、－Ｓ（ＮＣＮ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_{2}$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_{2}$であり、
Ｒ^{B}の各個は、独立して、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、
Ｒ^{1C}、Ｒ^{2C}、Ｒ^{TC}、Ｒ^{TTC}、Ｒ^{11C}、Ｒ^{22C}、Ｒ^{T1C}、Ｒ^{TLC}、及びＲ^{LC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－ＯＲ、－ＳＦ$_{5}$、－ＳＲ、－ＮＲ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$ＮＲ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_{2}$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$ＮＲ$_{2}$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_{2}$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_{2}$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基であり、
Ｒの各個は、独立して、水素、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基であるか、あるいは
同じ窒素上の２つのＲ基が、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される０～３個のヘテロ原子を有する４～７員の飽和環、部分不飽和環、またはヘテロアリール環を形成し、
ｎ、ｍ、ｑ、ｐ^{1}、ｐ^{2}、ｐ^{3}、ｐ^{4}、ｐ^{5}、ｒ^{1}、ｒ^{2}、ｒ^{3}、及びｒ^{4}のそれぞれは、独立して、０、１、２、３、４、または５である。

【００１２】
２．化合物及び定義
本開示の化合物は、本明細書で概説されるものを含み、本明細書で開示されるクラス、サブクラス、及び種によってさらに例示される。本明細書で使用される場合、特に指定のない限り、以下の定義が適用される。本開示の目的において、化学元素は、ＣＡＳ版の元素周期表（Ｈａｎｄｂｏｏｋ ｏｆ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ａｎｄ Ｐｈｙｓｉｃｓ，７５ｔｈ Ｅｄ）に従って特定される。加えて、有機化学の一般原則は、“Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”，Ｔｈｏｍａｓ Ｓｏｒｒｅｌｌ，Ｕｎｉｖｅｒｓｉｔｙ Ｓｃｉｅｎｃｅ Ｂｏｏｋｓ，Ｓａｕｓａｌｉｔｏ：１９９９、及び“Ｍａｒｃｈ’ｓ Ａｄｖａｎｃｅｄ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ”，５ｔｈ Ｅｄ．，Ｅｄ．：Ｓｍｉｔｈ，Ｍ．Ｂ．ａｎｄ Ｍａｒｃｈ，Ｊ．，Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ＆ Ｓｏｎｓ，Ｎｅｗ Ｙｏｒｋ：２００１に記載されており、その全内容は、参照により本明細書に援用される。

【００１３】
「脂肪族」または「脂肪族基」という用語は、本明細書で使用される場合、分子の残りの部分への結合点を１つ有する、完全に飽和であるか、もしくは１つ以上の不飽和単位を含有する直鎖（すなわち、非分枝状）もしくは分枝状の置換もしくは非置換の炭化水素鎖、または完全に飽和であるか、もしくは１つ以上の不飽和単位を含有するが、芳香族ではない単環式炭化水素もしくは二環式炭化水素（本明細書では「炭素環」または「環式脂肪族」とも称される）を意味する。特に明記しない限り、脂肪族基は、１～６個の脂肪族炭素原子を含有する。一部の実施形態では、脂肪族基は、１～５個の脂肪族炭素原子を含有する。他の実施形態では、脂肪族基は、１～４個の脂肪族炭素原子を含有する。さらに他の実施形態において、脂肪族基は、１～３個の脂肪族炭素原子を含有し、さらに他の実施形態において、脂肪族基は、１～２個の脂肪族炭素原子を含有する。いくつかの実施形態において、「環式脂肪族」（または「炭素環」）は、分子の残りの部分への結合点を１つ有する、完全に飽和であるか、もしくは１つ以上の不飽和単位を含有するが、芳香族ではない単環式C_3－C_6炭化水素を指す。好適な脂肪族基には、線状または分枝状の置換または非置換のアルキル基、アルケニル基、アルキニル基、及び（シクロアルキル）アルキル、（シクロアルケニル）アルキルまたは（シクロアルキル）アルケニルなどのそれらのハイブリッドが含まれるが、これらに限定されない。

【００１４】
「アルキル」という用語は、特に指定のない限り、本明細書で使用される場合、直鎖、分枝鎖、単環式部分、もしくは多環式部分またはそれらの組み合わせを有する一価の脂肪族炭化水素ラジカルを指し、ここで、ラジカルは、直鎖、分枝鎖、単環式部分、もしくは多環式部分またはそれらの組み合わせの１つ以上の炭素において、各炭素が１つ以上の置換基で任意選択により置換され、１つ以上の置換基は、独立して、C_1－C_{10}アルキルである。「アルキル」基の例としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ｉｓｏ－ブチル、ｓｅｃ－ブチル、ｔｅｒｔ－ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、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、シクロヘプチル、ノルボルニルなどが挙げられる。

【００１５】
「低級アルキル」という用語は、C_{1-4}の直鎖または分枝状のアルキル基を指す。例示的な低級アルキル基は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、及びｔｅｒｔ－ブチルである。

【００１６】
「低級ハロアルキル」という用語は、１個または複数のハロゲン原子と置換されているC_{1-4}直鎖または分岐状アルキル基を指す。

【００１７】
「ヘテロ原子」という用語は、酸素、硫黄、窒素、リン、またはケイ素のうちの１つ以上を意味する（窒素、硫黄、リン、もしくはケイ素の任意の酸化形態；任意の塩基性窒素

の四級化形態；または複素環の置換可能な窒素、例えば、Ｎ（３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピロリル中にあるもの）、ＮＨ（ピロリジニル中にあるもの）もしくはＮＲ$^{+}$（Ｎ－置換ピロリジニル中にあるもの）を含む）。

【００１８】

「不飽和」という用語は、本明細書で使用される場合、部分が１つ以上の不飽和単位を有することを意味する。

【００１９】

本明細書で使用される場合、「C_{1-8}（またはC_{1-6}、またはC_{1-4}）の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖」という用語は、本明細書に定義される直鎖または分枝状である二価のアルキレン鎖、アルケニレン鎖、及びアルキニレン鎖を指す。

【００２０】

「アルキレン」という用語は、二価のアルキル基を指す。「アルキレン鎖」は、ポリメチレン基、すなわち、－（CH_2）$_n$－であり、式中、ｎは、正の整数、好ましくは、１～６、１～４、１～３、１～２、または２～３である。置換アルキレン鎖は、１つ以上のメチレン水素原子が置換基で置き換えられているポリメチレン基である。好適な置換基には、置換脂肪族基について下記に記載されるものが含まれる。

【００２１】

「アルケニレン」という用語は、二価アルケニル基を指す。置換アルケニレン鎖は、１個または複数の水素原子が置換基と置き換えられている、少なくとも１つの二重結合を含有するポリメチレン基である。好適な置換基には、置換脂肪族基について下記に記載されるものが含まれる。

【００２２】

「ハロゲン」という用語は、Ｆ、Ｃｌ、Ｂｒ、またはＩを意味する。

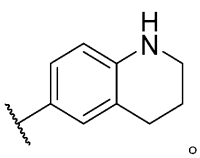
【００２３】

単独で、または「アラルキル」、「アラルコキシ」、または「アリールオキシアルキル」という大きな部分の一部として使用される「アリール」という用語は、合計５～１４個の環員を有する単環式または二環式環系であって、系中の少なくとも１つの環が芳香族であり、系中の各環が３～７個の環員を含むものを指す。「アリール」という用語は、「アリール環」という用語と区別なく使用することができる。本開示のある特定の実施形態において、「アリール」は、フェニル、ビフェニル、ナフチル、アントラシルなどを含むがこれらに限定されない、芳香環系を指し、１つ以上の置換基を有していてもよい。

【００２４】

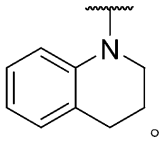
「ヘテロアリール」または「複素環式芳香族」と言う用語は、別段の定義がない限り、本明細書で使用される場合、窒素、酸素、及び硫黄などの１つ以上のヘテロ原子、例えば、１～３個のヘテロ原子を含有する５～６員の単環式芳香環、または１つ以上のヘテロ原子を含有する８～１０員の多環式環系であって、多環式環系中の少なくとも１つの環が芳香族であり、多環式環系の結合点が芳香環上の環原子を介しているものを指す。ヘテロアリール環は、炭素または窒素を介して隣接するラジカルに連結していてもよい。ヘテロアリールの例としては、フラン、チオフェン、ピロール、チアゾール、オキサゾール、イソチアゾール、イソオキサゾール、イミダゾール、ピラゾール、トリアゾール、ピリジン、ピリミジン、インドールなどが挙げられるが、これらに限定されない。例えば、別段の定義がない限り、１，２，３，４－テトラヒドロキノリンは、例えば、以下のように、その結合点がベンゾ環を介している場合、ヘテロアリール環である：

【化３】

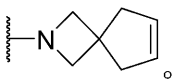


。

【００２５】
「ヘテロシクリル」または「複素環式基」という用語は、別段の定義がない限り、飽和または部分不飽和の３～１０員の単環式または７～１４員の多環式の環系であって、架橋環または縮合環を含み、その環系が窒素、酸素、及び硫黄などの１～４個のヘテロ原子を含むものを指す。ヘテロシクリル環は、炭素または窒素を介して隣接するラジカルに連結していてもよい。
【００２６】
環の文脈における「部分不飽和」という用語は、別段の定義がない限り、単環式環、または多環式（例えば、二環式、三環式など）環系内の構成環であって、構成環が、環自体によって提供される不飽和度に加えて、少なくとも１の不飽和度を含有し、芳香族ではないことを指す。部分不飽和環の例としては、３，４－ジヒドロ－２Ｈ－ピラン、３－ピロリン、２－チアゾリンなどが挙げられるが、これらに限定されない。部分不飽和環が多環式環系の一部である場合、多環式環系中の他の構成環は、飽和、部分不飽和または芳香族であってもよいが、多環式環系の結合点は、部分不飽和構成環上にある。例えば、別段の定義がない限り、１，２，３，４－テトラヒドロキノリンは、例えば、以下のように、その結合点がピペリジノ環を介している場合、部分不飽和環である：
【化４】



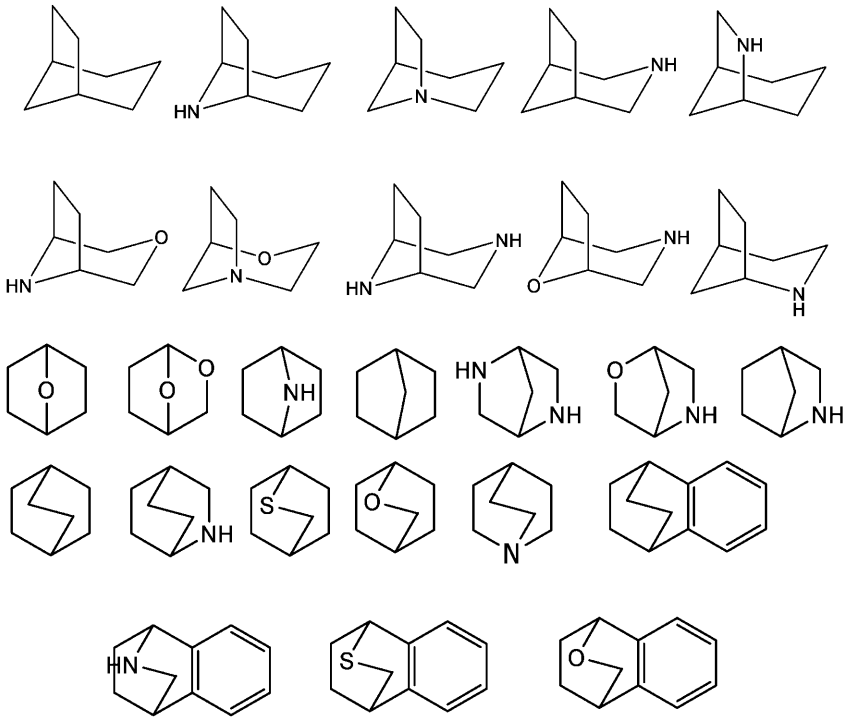
【００２７】
環の文脈における「飽和」という用語は、別段の定義がない限り、３～１０員の単環式環、または７～１４員の多環式（例えば、二環式、三環式など）環系であって、単環式環または多環式環系の結合点である構成環が、環自体によって提供される不飽和度に加えて、追加の不飽和度を有しないことを指す。単環式飽和環の例としては、アゼチジン、オキセタン、シクロヘキサンなどが挙げられるが、これらに限定されない。飽和環が、多環式環系の一部である場合、多環式環系中の他の構成環は、飽和、部分不飽和または芳香族であってもよいが、多環式環系の結合点は、不飽和構成環上にある。例えば、別段の定義がない限り、２－アザスピロ［３．４］オクター６－エンは、例えば、以下のように、その結合点がアゼチジノ環を介している場合、飽和環である：
【化５】



【００２８】
本明細書で使用される「アルキレン」、「アリーレン」、「シクロアルキレン」、「ヘテロアリーレン」、「ヘテロシクロアルキレン」、及び接尾辞「－イレン（－ｙｌｅｎｅ）」を含む他の類似の用語は、接尾辞が修飾している基の二価結合型を指す。例えば、「アルキレン」は、当該基が結合している基をつなげる二価のアルキル基である。
【００２９】
本明細書で使用される場合、「架橋二環式」という用語は、少なくとも１つの架橋を有する飽和または部分不飽和の任意の二環式環系、すなわち、炭素環式または複素環式環系を指す。ＩＵＰＡＣの定義によれば、「架橋」は、２つの橋頭をつなぐ１つ以上の原子の非分枝状鎖または原子価結合であり、「橋頭」は、３つ以上の骨格原子（水素を除く）に結合している環系の任意の骨格原子である。一部の実施形態では、架橋二環式基は、７～１２個の環員、及び窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原

子を有する。かかる架橋二環式基は、当該技術分野で周知であり、下記に述べられる基を含み、ここで、各基は、任意の置換可能な炭素または窒素原子にて分子の残りに結合している。別途明記されない限り、架橋二環式基は、任意選択で、脂肪族基について述べられるような１つまたは複数の置換基と置換される。代替的にまたは追加的に、架橋二環式基の置換可能な窒素は、任意選択により置換される。例示的な架橋二環式には、以下が含まれる：

【化６】



。

【００３０】

本明細書に記載される場合、本開示の化合物は、「任意選択により置換された」部分を含有し得る。一般に、「置換された」という用語は、「任意選択により」という用語が先行しているかどうかにかかわらず、指定部分の１つ以上の水素が好適な置換基で置き換えられることを意味する。特に指定のない限り、「任意選択により置換された」基は、その基のそれぞれの置換可能な位置に好適な置換基を有し得、任意の所定の構造の２つ以上の位置が、特定の基から選択される２つ以上の置換基で置換され得、その置換基は、各位置で同じでも異なっていてもよい。本開示によって想定される置換基の組み合わせは、好ましくは、安定な化合物または化学的に実現可能な化合物の形成をもたらす置換基である。「安定な」という用語は、本明細書で使用される場合、化合物の生成、検出、ある特定の実施形態においては、本明細書で開示される目的のうちの１つ以上のためのその回収、精製、及び使用を可能にする条件に供しても、実質的に変化しない化合物を指す。

【００３１】

「任意選択により置換された」基の置換可能な炭素原子上の好適な一価の置換基は、独立して、ハロゲン；－（CH_2）$_{0-4}$R°；－（CH_2）$_{0-4}$OR°；－O（CH_2）$_{0-4}$R°、－O－（CH_2）$_{0-4}$C（O）OR°；－（CH_2）$_{0-4}$CH（OR°）$_2$；－（CH_2）$_{0-4}$SR°；－（CH_2）$_{0-4}$Ph（R°で置換され得る）；－（CH_2）$_{0-4}$O（CH_2）$_{0-1}$Ph（R°で置換され得る）；－CH＝CHPh（R°で置換され得る）；－（CH_2）$_{0-4}$O（CH_2）$_{0-1}$－ピリジル（R°で置換され得る）；－NO_2；－CN；－N_3；－（CH_2）$_{0-4}$N（R°）$_2$；－（CH_2）$_{0-4}$N（R°）C（O）R°；－N（R°）C（S）R°；－（CH_2）$_{0-4}$N（R°）C（O）$NR°_2$；－N（R°）C（S）$NR°_2$；－（CH_2）$_{0-4}$N（R°）C（O）OR°；－N（R°）N（R°）C（O）R°；－N（R°）N（R°）C（O）NR°

$_2$；－Ｎ（Ｒ°）Ｎ（Ｒ°）Ｃ（Ｏ）ＯＲ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$Ｃ（Ｏ）Ｒ°；－Ｃ（Ｓ）Ｒ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$Ｃ（Ｏ）ＳＲ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$Ｃ（Ｏ）ＯＳｉＲ°$_3$；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$ＯＣ（Ｏ）Ｒ°；－ＯＣ（Ｏ）（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$ＳＲ°；－ＳＣ（Ｓ）ＳＲ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$ＳＣ（Ｏ）Ｒ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$Ｃ（Ｏ）ＮＲ°$_2$；－Ｃ（Ｓ）ＮＲ°$_2$；－Ｃ（Ｓ）ＳＲ°；－ＳＣ（Ｓ）ＳＲ°、－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$ＯＣ（Ｏ）ＮＲ°$_2$；－Ｃ（Ｏ）Ｎ（ＯＲ°）Ｒ°；－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｒ°；－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_2$Ｃ（Ｏ）Ｒ°；－Ｃ（ＮＯＲ°）Ｒ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$ＳＳＲ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$Ｓ（Ｏ）$_2$ＯＲ°；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$ＯＳ（Ｏ）$_2$Ｒ°；－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ°$_2$；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$Ｓ（Ｏ）Ｒ°；－Ｎ（Ｒ°）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ°$_2$；－Ｎ（Ｒ°）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ°；－Ｎ（ＯＲ°）Ｒ°；－Ｃ（ＮＨ）ＮＲ°$_2$；－Ｐ（Ｏ）（ＯＲ°）Ｒ°；－Ｐ（Ｏ）Ｒ°$_2$；－ＯＰ（Ｏ）Ｒ°$_2$；－ＯＰ（Ｏ）（ＯＲ°）$_2$；－ＳｉＲ°$_3$；－（Ｃ$_{1-4}$直鎖または分枝状アルキレン）Ｏ－Ｎ（Ｒ°）$_2$；または－（Ｃ$_{1-4}$直鎖または分枝状アルキレン）Ｃ（Ｏ）Ｏ－Ｎ（Ｒ°）$_2$であり、式中、各Ｒ°は、以下に定義されるように置換され得、独立して、水素、Ｃ$_{1-6}$脂肪族、－ＣＨ$_2$Ｐｈ、－Ｏ（ＣＨ$_2$）$_{0-1}$Ｐｈ、－ＣＨ$_2$－（５～６員のヘテロアリール環）、または５～６員の飽和環、部分不飽和環、もしくは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール環であり、あるいは上の定義に関わらず、独立して出現する２つのＲ°がその介在する原子（複数可）と一緒になって、３～１２員の飽和環、部分不飽和環、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール単環式環もしくは二環式環を形成し、以下に定義されるように置換され得る。

【００３２】

Ｒ°（または独立して出現する２つのＲ°がその介在する原子と一緒になって形成される環）上の好適な一価の置換基は、独立して、ハロゲン、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$Ｒ●、－（ハロＲ●）、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$ＯＨ、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$ＯＲ●、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$ＣＨ（ＯＲ●）$_2$；－Ｏ（ハロＲ●）、－ＣＮ、－Ｎ$_3$、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$Ｃ（Ｏ）Ｒ●、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$Ｃ（Ｏ）ＯＨ、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$Ｃ（Ｏ）ＯＲ●、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$ＳＲ●、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$ＳＨ、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$ＮＨ$_2$、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$ＮＨＲ●、－（ＣＨ$_2$）$_{0-2}$ＮＲ●$_2$、－ＮＯ$_2$、－ＳｉＲ●$_3$、－ＯＳｉＲ●$_3$、－Ｃ（Ｏ）ＳＲ●、－（Ｃ$_{1-4}$直鎖または分枝状のアルキレン）Ｃ（Ｏ）ＯＲ●、または－ＳＳＲ●であり、式中、各Ｒ●は、非置換であるか、または「ハロ」が前にある場合は、１つ以上のハロゲンのみで置換され、Ｃ$_{1-4}$脂肪族、－ＣＨ$_2$Ｐｈ、－Ｏ（ＣＨ$_2$）$_{0-1}$Ｐｈ、または５～６員の飽和環、部分不飽和環、もしくは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール環から独立して選択される。Ｒ°の飽和炭素原子上の好適な二価の置換基には、＝Ｏ及び＝Ｓが含まれる。

【００３３】

「任意選択により置換された」基の飽和炭素原子上の好適な二価の置換基には、以下が含まれる：＝Ｏ、＝Ｓ、＝ＮＮＲ＊$_2$、＝ＮＮＨＣ（Ｏ）Ｒ＊、＝ＮＮＨＣ（Ｏ）ＯＲ＊、＝ＮＮＨＳ（Ｏ）$_2$Ｒ＊、＝ＮＲ＊、＝ＮＯＲ＊、－Ｏ（Ｃ（Ｒ＊$_2$））$_{2-3}$Ｏ－、または－Ｓ（Ｃ（Ｒ＊$_2$））$_{2-3}$Ｓ－（式中、独立して出現する各Ｒ＊は、水素、以下に定義されるように置換され得るＣ$_{1-6}$脂肪族、または非置換の５～６員の飽和環、部分不飽和環、もしくは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール環から選択される）。「任意選択により置換された」基のビシナルの置換可能な炭素に結合している好適な二価の置換基には、以下が含まれる：－Ｏ（ＣＲ＊$_2$）$_{2-3}$Ｏ－（式中、独立して出現する各Ｒ＊は、水素、以下に定義されるように置換され得るＣ$_{1-6}$脂肪族、または非置換の５～６員の飽和環、部分不飽和環、もしくは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール環から選択される）。

【００３４】

Ｒ＊の脂肪族基上の好適な置換基には、ハロゲン、－Ｒ●、－（ハロＲ●）、－ＯＨ、

－ＯＲ●、－Ｏ（ハロＲ●）、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ●、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＲ●、－ＮＲ●$_2$、または－ＮＯ$_2$が含まれ、式中、各Ｒ●は、非置換であるか、または「ハロ」が前にある場合は、１つ以上のハロゲンのみで置換され、独立して、Ｃ$_{1-4}$脂肪族、－ＣＨ$_2$Ｐｈ、－Ｏ（ＣＨ$_2$）$_{0-1}$Ｐｈ、または５～６員の飽和環、部分不飽和環、もしくは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール環である。

【００３５】

「任意選択により置換された」基の置換可能な窒素上の好適な置換基には、－Ｒ†、－ＮＲ†$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｒ†、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ†、－Ｃ（Ｏ）Ｃ（Ｏ）Ｒ†、－Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_2$Ｃ（Ｏ）Ｒ†、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ†、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ†$_2$、－Ｃ（Ｓ）ＮＲ†$_2$、－Ｃ（ＮＨ）ＮＲ†$_2$、または－Ｎ（Ｒ†）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ†が含まれ、式中、各Ｒ†は、独立して、水素、以下に定義されるように置換され得るＣ$_{1-6}$脂肪族、非置換－ＯＰｈ、または非置換の５～６員の飽和環、部分不飽和環、もしくは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール環であり、あるいは上の定義に関わらず、独立して出現する２つのＲ†がその介在する原子（複数可）と一緒になって、非置換の３～１２員の飽和環、部分不飽和環、または窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール単環式環もしくは二環式環を形成する。

【００３６】

Ｒ†の脂肪族基上の好適な置換基は、独立して、ハロゲン、－Ｒ●、－（ハロＲ●）、－ＯＨ、－ＯＲ●、－Ｏ（ハロＲ●）、－ＣＮ、－Ｃ（Ｏ）ＯＨ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ●、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＲ●、－ＮＲ●$_2$、または－ＮＯ$_2$であり、式中、各Ｒ●は、非置換であるか、または「ハロ」が前にある場合は、１つ以上のハロゲンのみで置換され、独立して、Ｃ$_{1-4}$脂肪族、－ＣＨ$_2$Ｐｈ、－Ｏ（ＣＨ$_2$）$_{0-1}$Ｐｈ、または５～６員の飽和環、部分不飽和環、もしくは窒素、酸素、もしくは硫黄から独立して選択される０～４個のヘテロ原子を有するアリール環である。

【００３７】

本明細書で使用される「異性体」という用語は、同一の化学式を有するが、構造的または光学的配置が異なる化合物を指す。本明細書で使用される「立体異性体」という用語は、同一の分子式を有するが、原子及び／または官能基の空間における位置が異なる異性体分子を指し、それらを含む。エナンチオマー形態及びジアステレオマー形態を含む本化合物の全ての立体異性体（例えば、さまざまな置換基上の不斉炭素によって存在し得るもの）は、本開示の範囲内であることが企図される。したがって、特に記載のない限り、本化合物の１つの立体化学異性体だけでなく、エナンチオマー、ジアステレオマー、及び幾何異性体（または配座異性体）の混合物も本開示の範囲内である。

【００３８】

本明細書で使用される「互変異性体」という用語は、平衡状態で存在し、ある異性体形態から別の異性体形態へと容易に変換される２つ以上の構造異性体のうちの１つを指す。互変異性体は、原子価互変異性体及びプロトン互変異性体（プロトトロピー互変異性体としても知られている）を包含することが理解される。原子価互変異性体は、結合電子の一部の再編成による相互転換を含む。プロトン互変異性体は、ケト－エノール及びイミン－エナミン異性化などのプロトンの移動を介した相互転換を含む。特に記載のない限り、本開示の化合物の全ての互変異性体は、本開示の範囲内である。

【００３９】

本明細書で使用される「同位体置換」という用語は、原子をその同位体で置換することを指す。本明細書で使用される「同位体」という用語は、自然界で優勢な原子と同じ原子番号を有するが、自然界で優勢な原子の質量数とは異なる質量数（中性子数）を有する原子を指す。同位体置換を有する化合物は、化合物に含まれる少なくとも１つの原子がその同位体で置換されている化合物を指すことが理解される。同位体で置換することができる原子には、水素、炭素、及び酸素が含まれるが、これらに限定されない。水素原子の同位

体の例としては、^{2}Ｈ（Ｄとも表される）及び^{3}Ｈが挙げられる。炭素原子の同位体の例としては、^{13}Ｃ及び^{14}Ｃが挙げられる。酸素原子の同位体の例としては、^{18}Ｏが挙げられる。特に記載のない限り、本開示の化合物の全ての同位体置換は、本開示の範囲内である。そのような化合物は、例えば、分析ツール、生物学的アッセイのプローブ、または本開示による治療剤として有用である。

【００４０】

本明細書で使用される場合、「薬学的に許容される塩」という用語は、適切な医学的判断の範囲内で、過剰な毒性、刺激、アレルギー反応などを伴うことなく、妥当な利益／リスク比に見合った、ヒト及び下等動物の組織と接触して使用するのに好適な塩を表す。例示的な薬学的に許容される塩は、例えば、Ｂｅｒｇｅ，ｅｔ　ａｌ．（Ｊ．Ｐｈａｒｍ．Ｓｃｉ．１９７７，６６（１），１；ａｎｄ　Ｇｏｕｌｄ，Ｐ．Ｌ．，Ｉｎｔ．Ｊ．Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃｓ　１９８６，３３，２０１－２１７；（それぞれは、その全体が参照により本明細書に援用される）に見出される。

【００４１】

本開示の化合物の薬学的に許容される塩には、好適な無機及び有機の酸及び塩基から誘導されるものが含まれる。薬学的に許容される無毒性の酸付加塩の例は、塩酸、臭化水素酸、リン酸、硫酸及び過塩素酸などの無機酸、または酢酸、シュウ酸、マレイン酸、酒石酸、クエン酸、コハク酸もしくはマロン酸などの有機酸、またはイオン交換などの当該技術分野において使用される他の方法を使用することによって形成される、アミノ基の塩である。他の薬学的に許容される塩には、アジピン酸塩、アルギン酸塩、アスコルビン酸塩、アスパラギン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、安息香酸塩、硫酸水素塩、ホウ酸塩、酪酸塩、ショウノウ酸塩、カンファースルホン酸塩、クエン酸塩、シクロペンタンプロピオン酸塩、ジグルコン酸塩、ドデシル硫酸塩、エタンスルホン酸塩、ギ酸塩、フマル酸塩、グルコヘプトン酸塩、グリセロリン酸塩、グルコン酸塩、ヘミ硫酸塩、ヘプタン酸塩、ヘキサン酸塩、ヨウ化水素酸塩、２－ヒドロキシ－エタンスルホン酸塩、ラクトビオン酸塩、乳酸塩、ラウリン酸塩、ラウリル硫酸塩、リンゴ酸塩、マレイン酸塩、マロン酸塩、メタンスルホン酸塩、２－ナフタレンスルホン酸塩、ニコチン酸塩、硝酸塩、オレイン酸塩、シュウ酸塩、パルミチン酸塩、パモ酸塩、ペクチン酸塩、過硫酸塩、３－フェニルプロピオン酸塩、リン酸塩、ピバリン酸塩、プロピオン酸塩、ステアリン酸塩、コハク酸塩、硫酸塩、酒石酸塩、チオシアン酸塩、ｐ－トルエンスルホン酸塩、ウンデカン酸塩、吉草酸塩などが含まれる。

【００４２】

適切な塩基に由来する塩には、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、アンモニウム塩、及びN^{+}（C_{1-4}アルキル）$_4$塩が含まれる。代表的なアルカリ塩またはアルカリ土類金属塩には、ナトリウム、リチウム、カリウム、カルシウム、マグネシウムなどが挙げられる。さらなる薬学的に許容される塩には、適切な場合、ハロゲン化物、水酸化物、カルボン酸、硫酸、リン酸、硝酸、低級アルキルスルホン酸、及びアリールスルホン酸などの対イオンを使用して形成される、無毒性のアンモニウム、四級アンモニウム、及びアミンカチオンが含まれる。

【００４３】

薬学的に許容される塩は、化合物：酸の比がそれぞれ２：１であるヘミ塩を包含することも意図される。例示的なヘミ塩は、リンゴ酸、フマル酸、マレイン酸、コハク酸、酒石酸、グルタル酸、シュウ酸、アジピン酸及びクエン酸などの２つのカルボン酸基を含む酸から誘導される塩である。他の例示的なヘミ塩は、硫酸などの二塩基性鉱酸から誘導される塩である。例示的な好ましいヘミ塩には、ヘミマレイン酸塩、ヘミフマル酸塩、及びヘミコハク酸塩が挙げられるが、これらに限定されない。

【００４４】

本明細書で使用される場合、「約」という用語は、およそ、大まか、前後、またはその領域内を意味するために使用される。「約」という用語が数値範囲とともに使用される場合、記載される数値の上下に境界を広げることによって、当該範囲を修飾する。一般に、

「約」という用語は、上下（高低）２０％の変動率で、指定される値を上下に数値を修飾するために本明細書で使用される。

【００４５】

本明細書で使用される「有効量」、「十分量」、または「治療上有効な量」は、臨床結果を含む有益なまたは所望の結果をもたらすのに十分な化合物の量である。したがって、有効量は、例えば、ＰＩ３Ｋαシグナル伝達に関連する苦痛もしくは１つ以上のその症状の重症度及び／もしくは期間を減少もしくは改善すること、ＰＩ３Ｋαシグナル伝達に関連する苦痛に関連する状態もしくは症状の進行を予防すること、または別の治療法の予防効果もしくは治療効果（複数可）の増強もしくは別様に改善することに十分であり得る。有効量には、望ましくない副作用を回避または実質的に減弱する化合物の量も含まれる。

【００４６】

本明細書で使用され、また当該技術分野でよく理解されるように、「治療」とは、臨床結果を含む有益なまたは所望の結果を得るためのアプローチである。有益なまたは所望の臨床結果には、検出可能であるか検出不可能であるかに関わらず、１つ以上の症状または状態の緩和または改善、疾患または苦痛の程度の減少、安定化した（すなわち、悪化していない）疾患または苦痛状態、疾患または苦痛の拡大防止、疾患または苦痛の進行の遅延または緩徐化、疾患または苦痛状態の改善または一時的軽減及び寛解（部分的か完全かに関わらない）が含まれ得るが、これらに限定されない。「治療」はまた、治療を受けなかった場合に予想される生存期間と比較して、生存期間を延長することも意味し得る。いくつかの実施形態において、治療は、１つ以上の症状が発現した後に行われ得る。他の実施形態では、治療は、症状の不在下で施されてもよい。例えば、治療は、症状の発現前に、疾患に罹りやすい個体に行ってもよい（例えば、症状の既往歴及び／または遺伝的因子もしくは他の易罹患性因子に照らして）。治療はまた、症状が消失した後も、例えば、その再発を予防または遅延させるために、継続され得る。

【００４７】

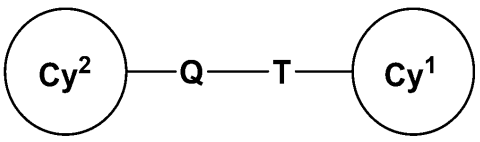
「それを必要とする」という文言は、ＰＩ３Ｋαシグナル伝達活性に関連する状態、または本開示の化合物及び／もしくは組成物によって別様に解消され得る状態からの症候性または無症候性の緩和の必要性を指す。

【００４８】

３．例示的な実施形態の説明

上述のとおり、いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｉの化合物：

【化７】



I

またはその薬学的に許容される塩を提供し、式中、

Cy^1は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換され、

Cy^2は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の

二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Cy^2は、m個のR^2で置換され、
Qは、L^Qであり、
Tは、q個のR^Tで置換された二価のC_{1-3}脂肪族鎖であり、
各R^1は、独立して、$-L^1-R^{1A}$であり、
各R^2は、独立して、$-L^2-R^{2A}$であり、
各R^Tは、独立して、$-L^T-R^{TA}$であるか、あるいは
R^Tの２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^1個のR^{TTC}で置換され、
R^1の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^2個のR^{11C}で置換され、
R^2の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和、部分不飽和もしくは芳香族の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^3個のR^{22C}で置換され、
R^Tの１つとR^1の１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^4個のR^{T1C}で置換されるか、あるいは
R^Tの１つとR^Lの１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^5個のR^{TLC}で置換され、
L^1、L^2、L^Q、及びL^Tのそれぞれは、独立して、共有結合、またはC_{1-4}の二価の飽和もしくは不飽和の直鎖もしくは分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、$-CH(R^L)-$、$-C(R^L)_2-$、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、$-N(R)-$、$-N(R)C(O)-$、$-N(R)C(NR)-$、$-N(R)C(NOR)-$、$-N(R)C(NCN)-$、$-C(O)N(R)-$、$-N(R)S(O)_2-$、$-S(O)_2N(R)-$、$-O-$、$-C(O)-$、$-OC(O)-$、$-C(O)O-$、$-S-$、$-S(O)-$、または$-S(O)_2-$によって置き換えられ、
各R^{1A}は、独立して、r^1個のR^{1C}によって置換されたR^AまたはR^Bであり、
各R^{2A}は、独立して、r^2個のR^{2C}によって置換されたR^AまたはR^Bであり、
各R^{TA}は、独立して、r^3個のR^{TC}によって置換されたR^AまたはR^Bであり、
各R^Lは、独立して、r^4個のR^{LC}によって置換されたR^AまたはR^Bであり、
R^Aの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、$-CN$、$-NO_2$、$-OR$、$-SF_5$、$-SR$、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、$-S(O)R$、$-S(O)NR_2$、$-S(O)(NR)R$、$-S(O)(NCN)R$、$-S(NCN)R$、$-C(O)R$、$-C(O)OR$、$-C(O)NR_2$、$-C(O)N(R)OR$、$-OC(O)R$、$-OC(O)NR_2$、$-N(R)C(O)OR$、$-N(R)C(O)R$、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、$-P(O)(R)OR$、または$-B$

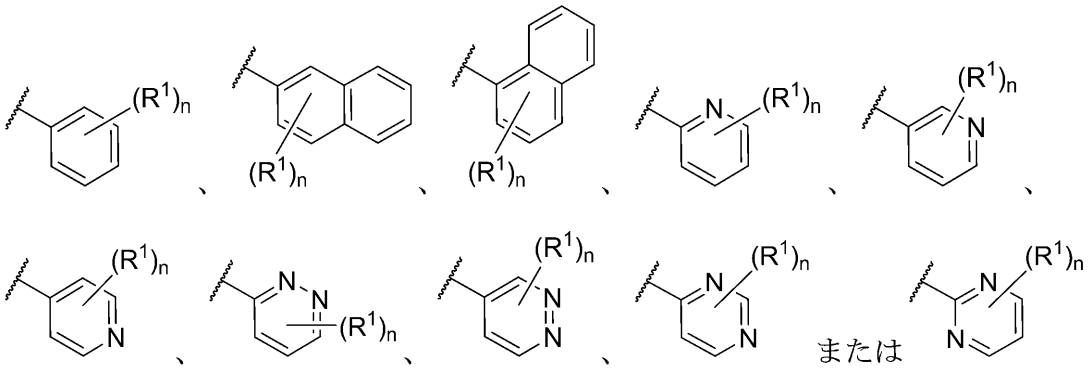
（ＯＲ）$_2$であり、
R^Bの各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、
R^{1C}、R^{2C}、R^{TC}、R^{TTC}、R^{11C}、R^{22C}、R^{T1C}、R^{TLC}、及びR^{LC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＦ$_5$、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはC_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基であり、
Ｒの各個は、独立して、水素、またはC_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基であるか、あるいは
同じ窒素上の２つのＲ基が、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される０～３個のヘテロ原子を有する４～７員の飽和環、部分不飽和環、またはヘテロアリール環を形成し、
ｎ、ｍ、ｑ、p^1、p^2、p^3、p^4、p^5、r^1、r^2、r^3、及びr^4のそれぞれは、独立して、０、１、２、３、４、または５である。
【００４９】
上記で全体的に定義されるとおり、Cy^1は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換される。
【００５０】
いくつかの実施形態において、Cy^1は、フェニルであり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換される。いくつかの実施形態において、Cy^1は、ナフチルであり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換される。いくつかの実施形態において、Cy^1は、クバニルであり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換される。いくつかの実施形態において、Cy^1は、アダマンチルであり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換される。いくつかの実施形態において、Cy^1は、３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換される。いくつかの実施形態において、Cy^1は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、Cy^1は、ｎ個のR^1で置換され

る。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{1}は、ｎ個のＲ^{1}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{1}は、ｎ個のＲ^{1}で置換される。

【００５１】

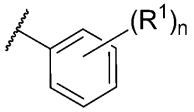
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化８】



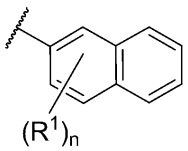
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化９】



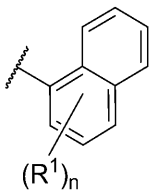
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１０】



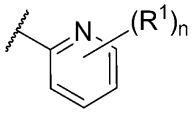
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１１】



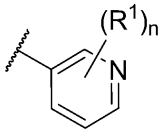
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１２】



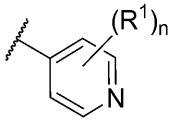
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１３】



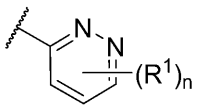
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１４】



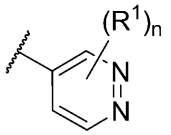
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１５】



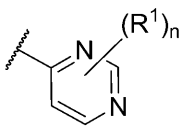
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１６】



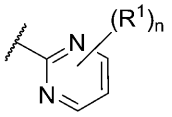
であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１７】



であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１８】

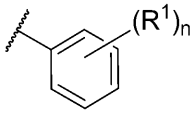


であり、式中、Ｒ^{1}及びｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００５２】

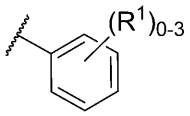
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化１９】



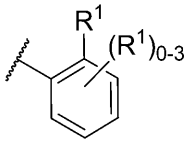
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンであり、ｎは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２０】



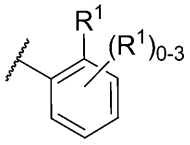
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２１】



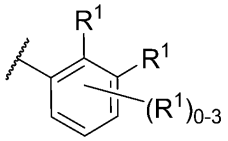
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２２】



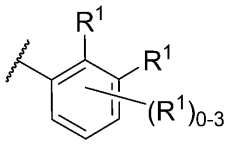
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２３】



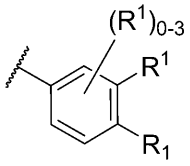
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２４】



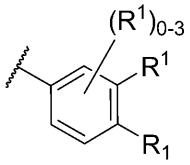
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２５】



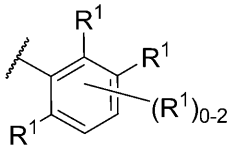
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２６】



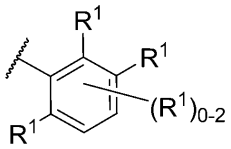
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２７】



であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２８】

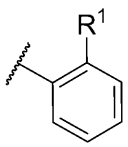


であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。

【００５３】

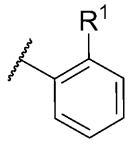
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化２９】

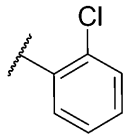


であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

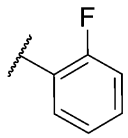
【化３０】



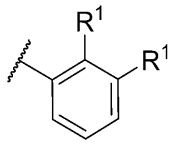
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化３１】



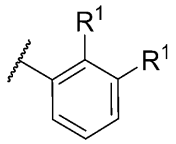
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化３２】



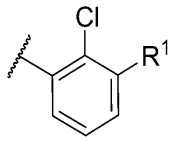
である。
【００５４】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化３３】



であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化３４】

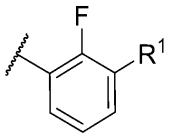


であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化３５】

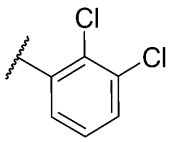


であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

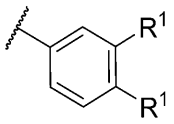
【化３６】



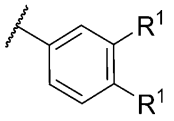
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化３７】



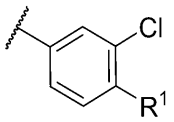
である。
【００５５】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化３８】



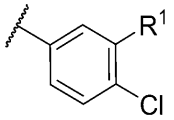
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化３９】



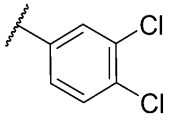
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４０】



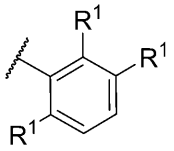
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４１】



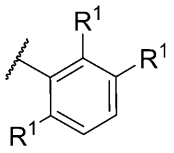
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４２】



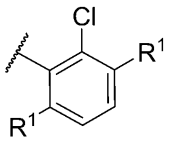
である。
【００５６】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４３】



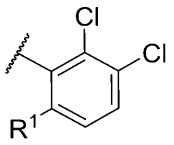
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４４】



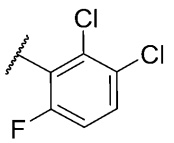
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４５】



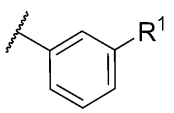
であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４６】



であり、式中、Ｒ^{1}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４７】

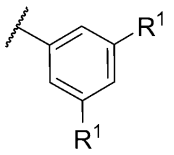


である。
【００５７】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、
【化４８】



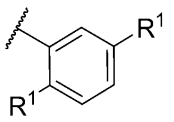
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化４９】



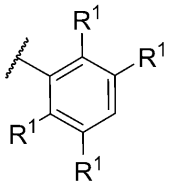
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化５０】



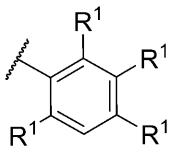
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化５１】



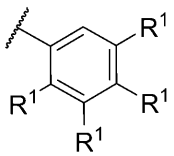
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化５２】



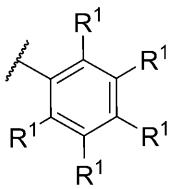
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化５３】



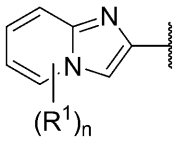
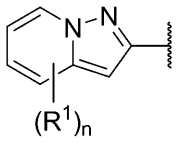
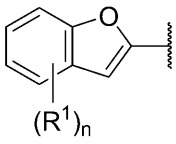
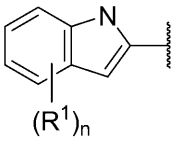
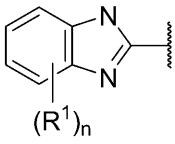
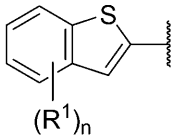
であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化５４】

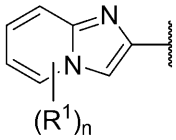


であり、式中、Ｒ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

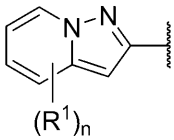
【００５８】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ[1]は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ[1]は、ｎ個のＲ[1]で置換され、式中、Ｒ[1]は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ[1]は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ[1]は、ｎ個のＲ[1]で置換され、式中、Ｒ[1]は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ[1]は、
【化５５】


、

、

、

、

または


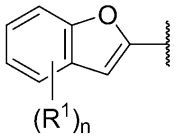
であり、式中、ｎ及びＲ[1]は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ[1]は、
【化５６】



であり、式中、ｎ及びＲ[1]は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ[1]は、
【化５７】

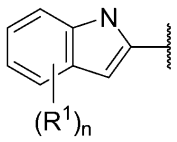


であり、式中、ｎ及びＲ[1]は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ[1]は、
【化５８】



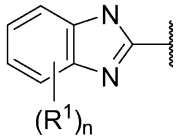
であり、式中、ｎ及びＲ[1]は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ[1]は、

【化５９】



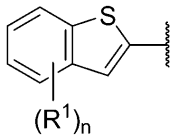
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６０】



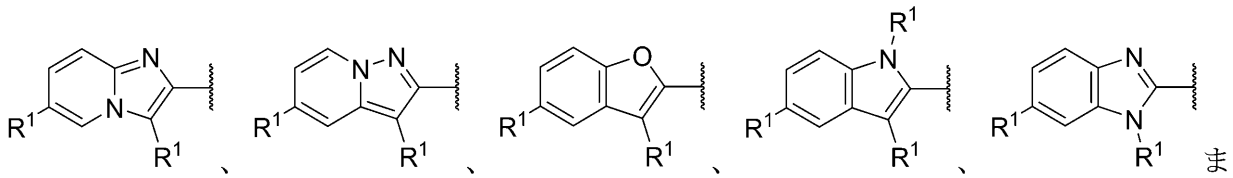
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６１】

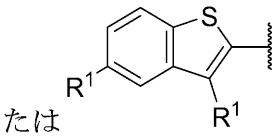


であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６２】

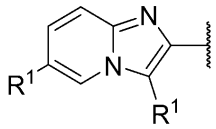


または



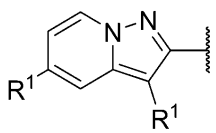
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６３】



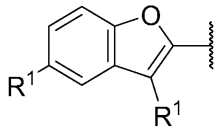
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６４】



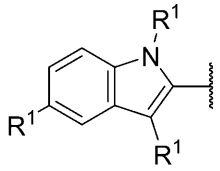
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６５】



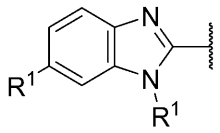
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６６】



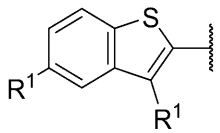
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６７】



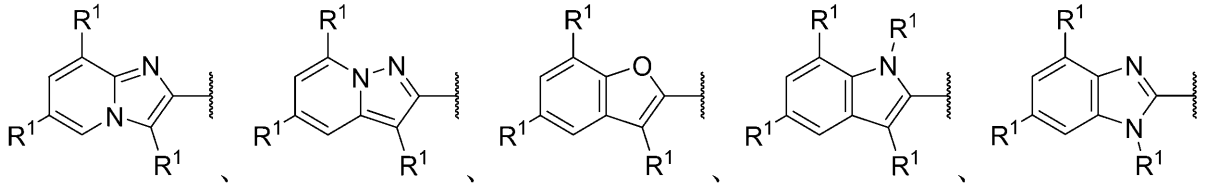
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６８】



であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化６９】

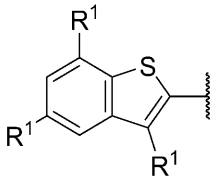

、

、

、

、

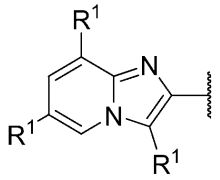
または



であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義

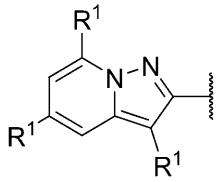
されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化７０】



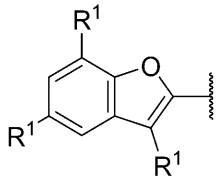
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化７１】



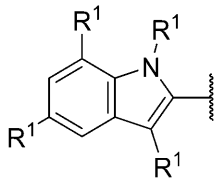
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化７２】



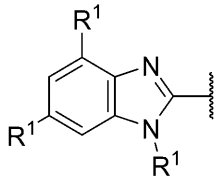
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化７３】



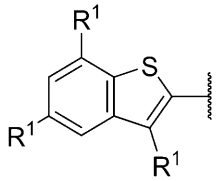
であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化７４】



であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化７５】

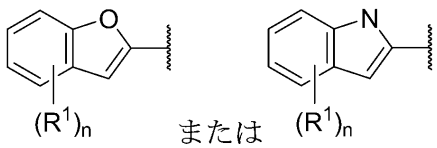


であり、式中、ｎ及びＲ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００５９】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、表１の化合物に示される基から選択される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{1}は、

【化７６】



ではない。

【００６０】

上記で全体的に定義されるとおり、Ｃｙ^{2}は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。

【００６１】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、フェニルであり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、ナフチルであり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、クバニルであり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、アダマンチルであり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、５～１２員の飽和または部分不飽和の二環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。

【００６２】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する９～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～９員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する９員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。

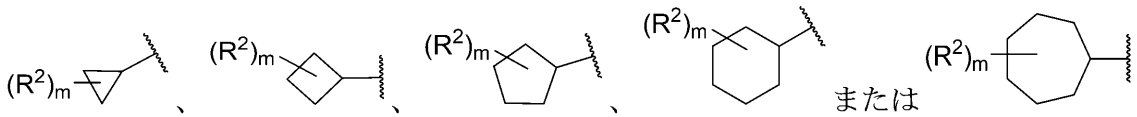
【００６３】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、４～６員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、４～５員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、５～６員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、４員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、５員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、６員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。

【００６４】

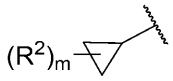
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化７７】



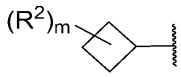
であり、式中、Ｒ^{2}及びｍは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化７８】



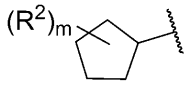
であり、式中、Ｒ^{2}及びｍは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化７９】



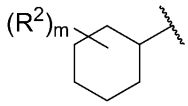
であり、式中、R^2及びmは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化８０】



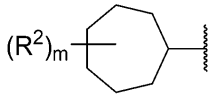
であり、式中、R^2及びmは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化８１】



であり、式中、R^2及びmは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化８２】

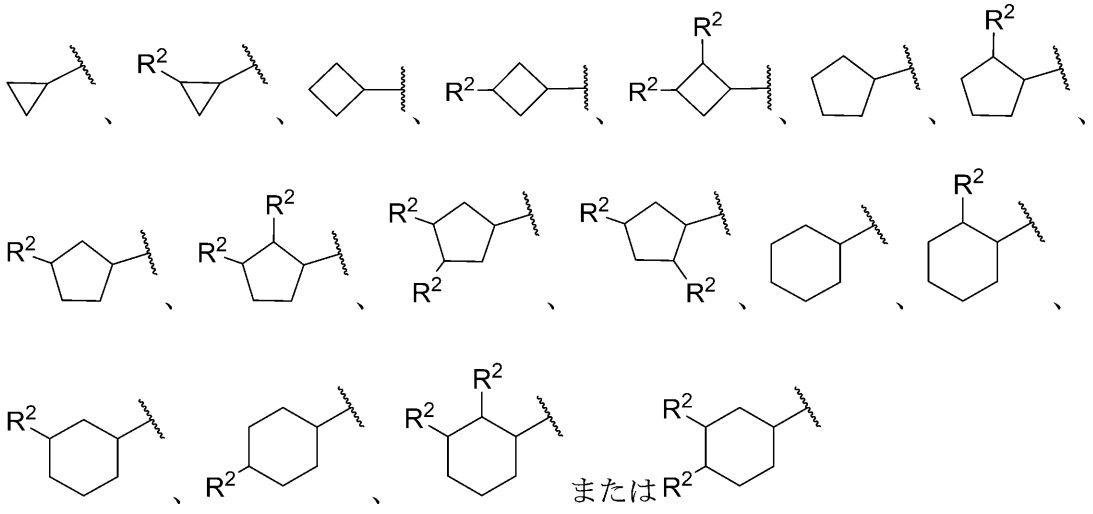


であり、式中、R^2及びmは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００６５】

いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化８３】



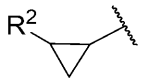
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化８４】



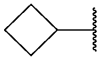
である。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化８５】



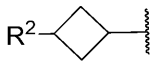
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化８６】



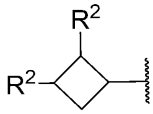
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化８７】



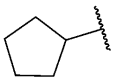
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化８８】



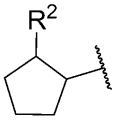
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化８９】



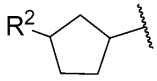
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９０】



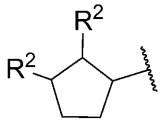
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９１】



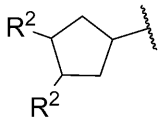
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９２】



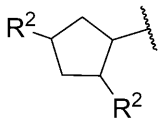
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９３】



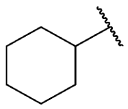
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９４】



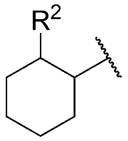
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９５】



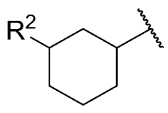
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９６】



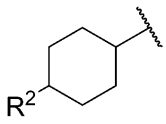
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９７】



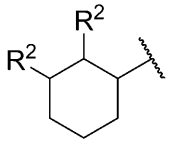
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９８】



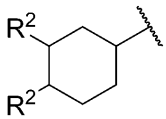
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化９９】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１００】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

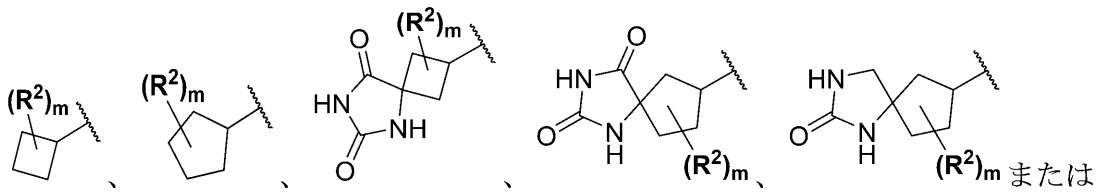
【００６６】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～９員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する９員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。

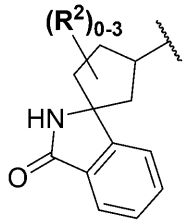
【００６７】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１０１】

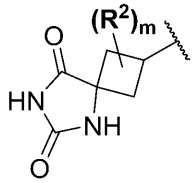


、
、
、
、
、
または



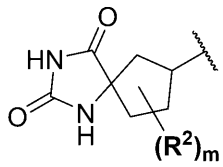
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ２は、

【化１０２】



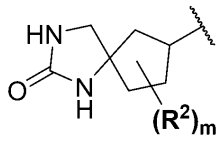
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ２は、

【化１０３】



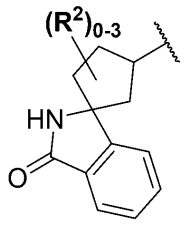
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ２は、

【化１０４】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ２は、

【化１０５】

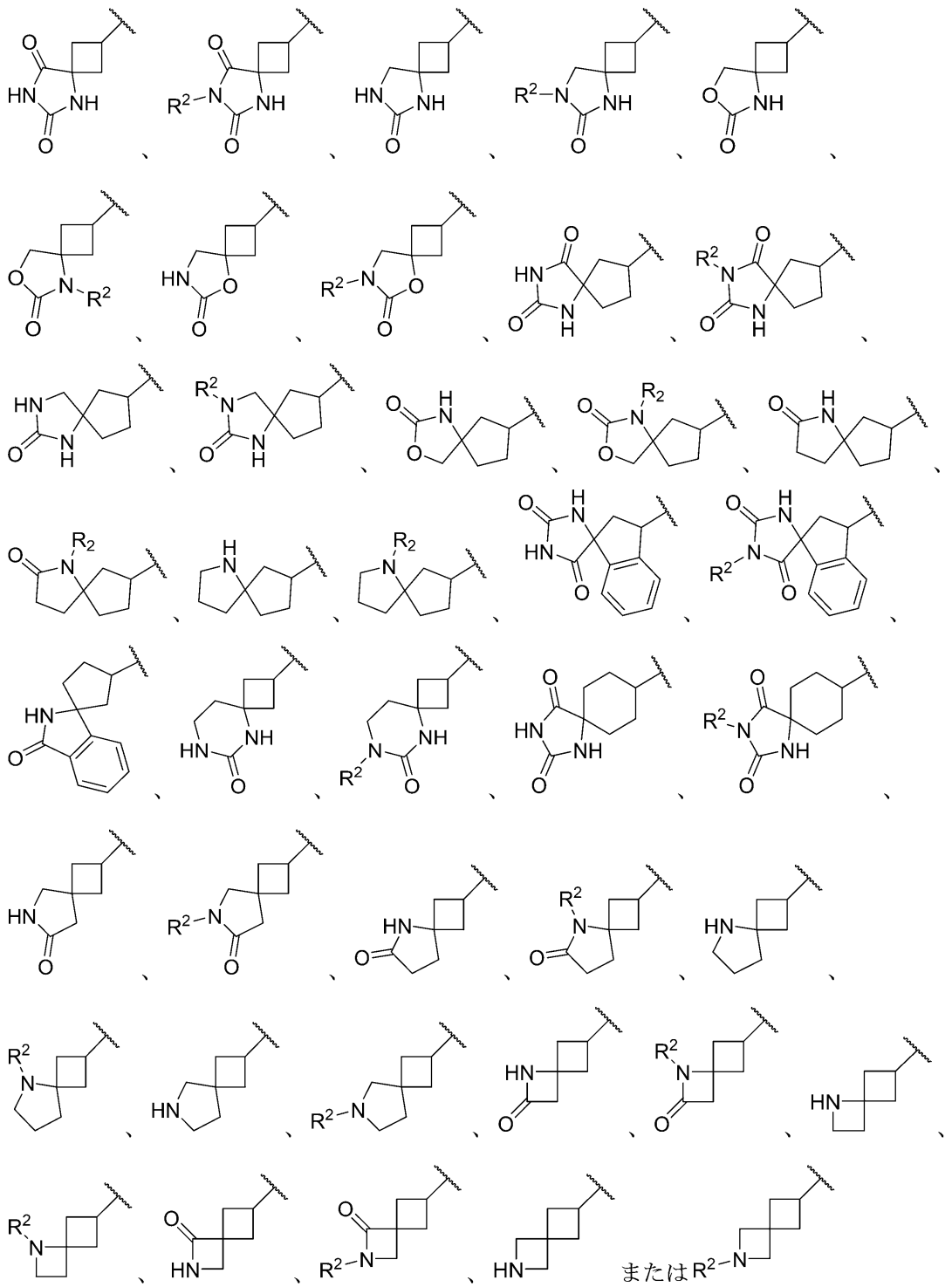


である。

【００６８】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ２は、

【化１０６】

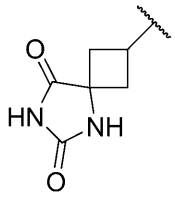


であり、式中、Ｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００６９】

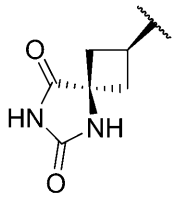
いくつかの実施形態において、Ｃｙ２は、

【化１０７】



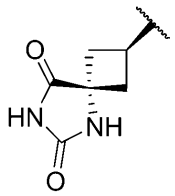
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１０８】



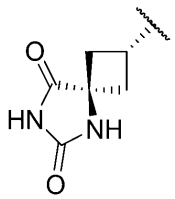
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１０９】



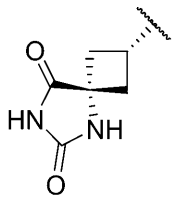
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１１０】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１１１】

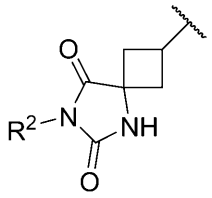


である。

【００７０】

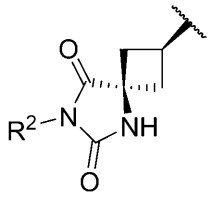
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１１２】



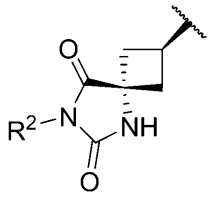
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１１３】



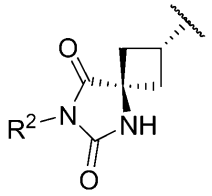
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１１４】



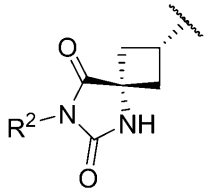
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１１５】



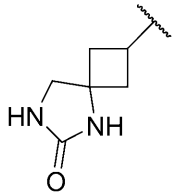
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１１６】

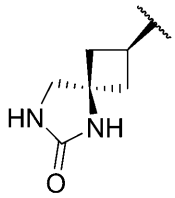


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

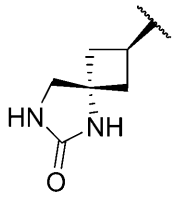
【００７１】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１１７】



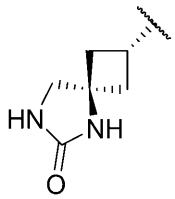
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１１８】



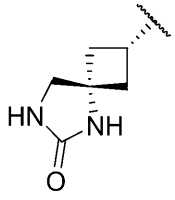
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１１９】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１２０】

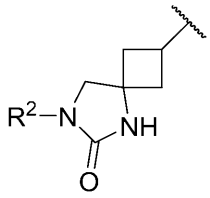


である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１２１】



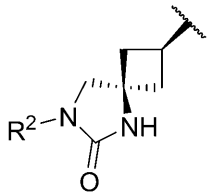
である。
【００７２】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１２２】



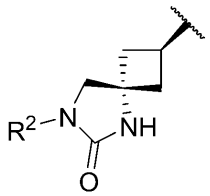
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化１２３】



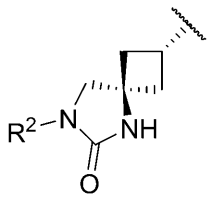
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化１２４】



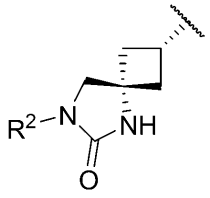
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化１２５】



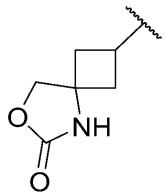
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化１２６】

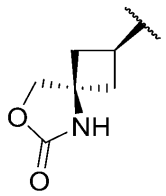


であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

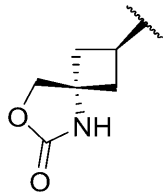
【００７３】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１２７】



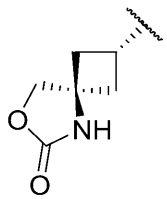
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１２８】



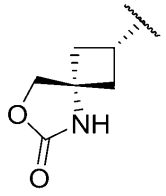
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１２９】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１３０】

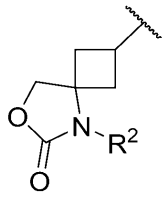


である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１３１】



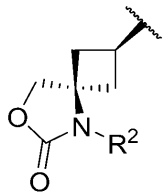
である。
【００７４】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１３２】



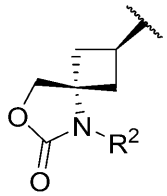
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１３３】



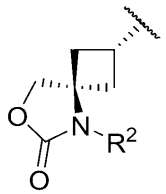
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１３４】



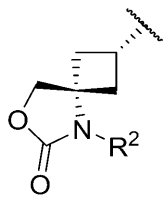
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１３５】



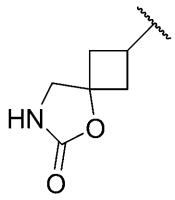
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１３６】

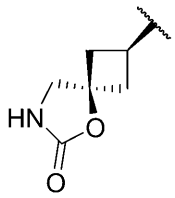


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

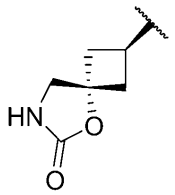
【００７５】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１３７】



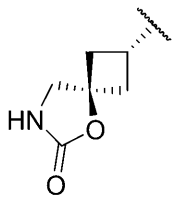
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１３８】



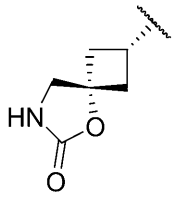
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１３９】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１４０】

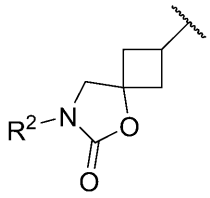


である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１４１】



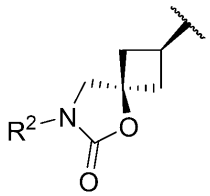
である。
【００７６】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１４２】



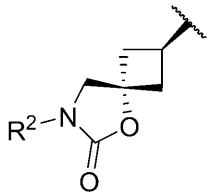
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化１４３】



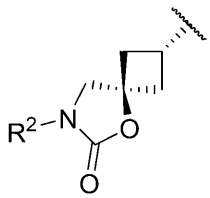
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化１４４】



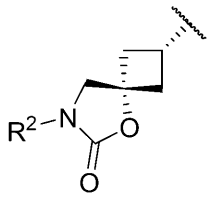
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化１４５】



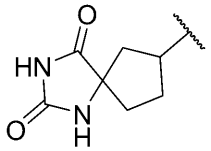
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化１４６】

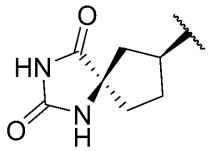


であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

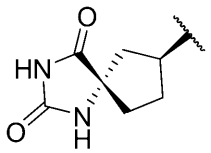
【００７７】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１４７】



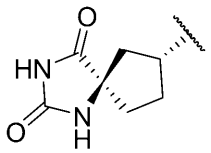
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１４８】



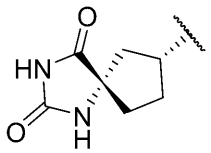
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１４９】



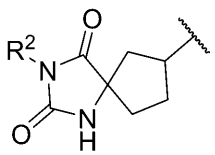
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１５０】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１５１】

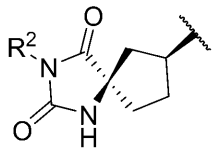


である。
【００７８】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１５２】



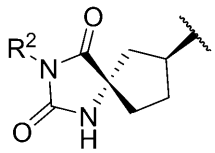
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１５３】



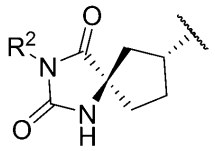
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１５４】



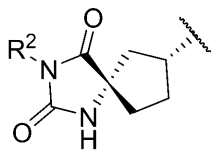
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１５５】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１５６】

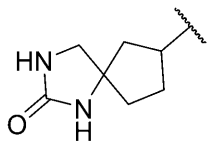


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００７９】

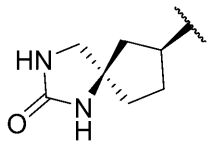
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１５７】



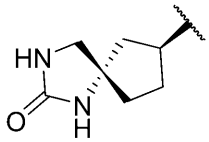
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１５８】

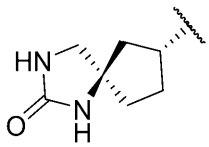


である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

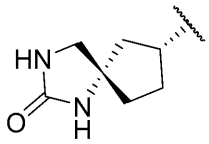
【化１５９】



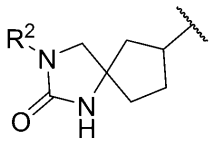
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１６０】



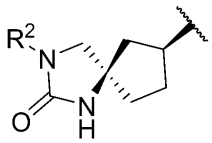
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１６１】



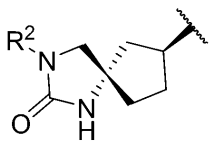
である。
【００８０】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１６２】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１６３】

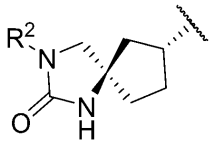


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１６４】



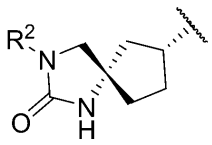
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１６５】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１６６】

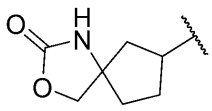


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００８１】

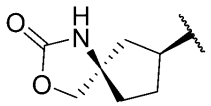
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１６７】



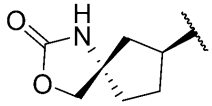
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１６８】



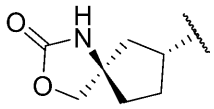
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１６９】



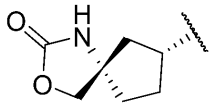
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１７０】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１７１】

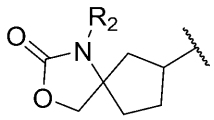


である。

【００８２】

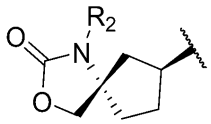
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１７２】



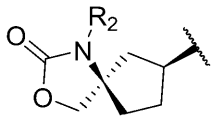
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１７３】



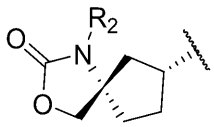
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１７４】



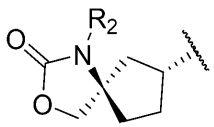
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１７５】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１７６】

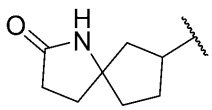


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００８３】

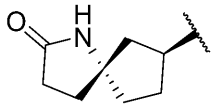
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１７７】

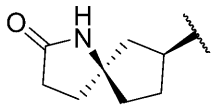


である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

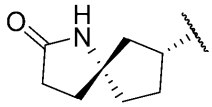
【化１７８】



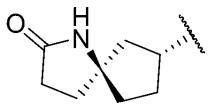
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１７９】



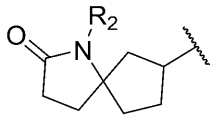
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１８０】



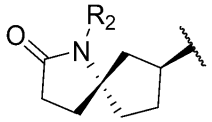
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１８１】



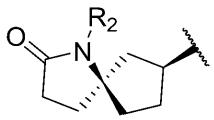
である。
【００８４】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１８２】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１８３】

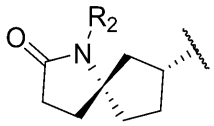


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化１８４】



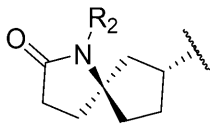
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１８５】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１８６】

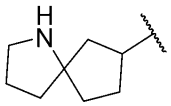


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００８５】

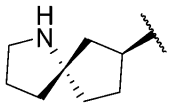
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１８７】



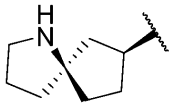
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１８８】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１８９】



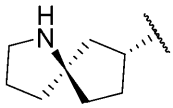
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９０】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９１】

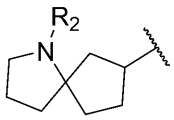


である。

【００８６】

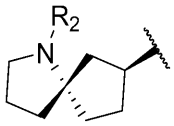
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９２】



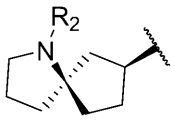
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９３】



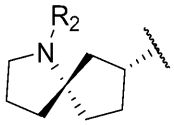
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９４】



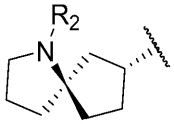
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９５】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９６】

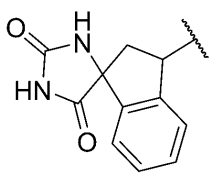


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００８７】

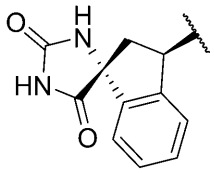
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９７】



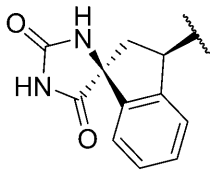
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９８】



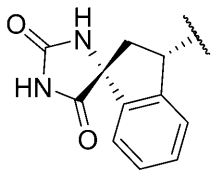
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化１９９】



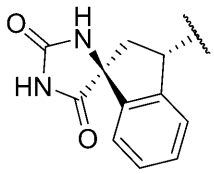
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２００】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２０１】

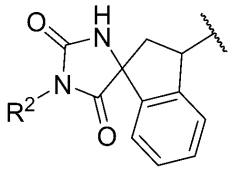


である。

【００８８】

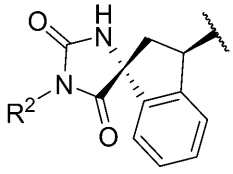
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２０２】



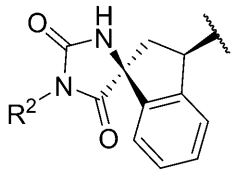
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２０３】



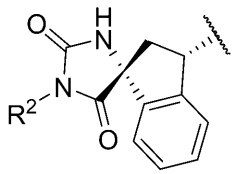
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２０４】



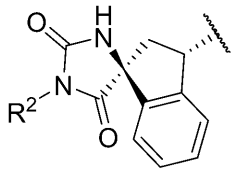
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２０５】



であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２０６】

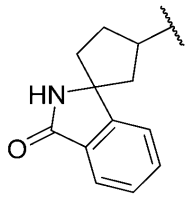


であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００８９】

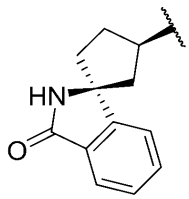
いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２０７】



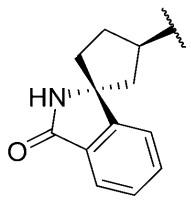
である。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２０８】



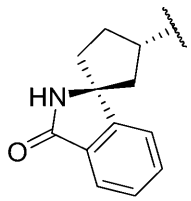
である。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２０９】



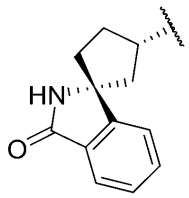
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１０】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１１】

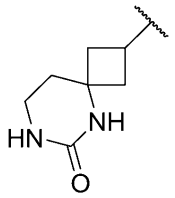


である。

【００９０】

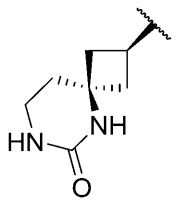
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１２】



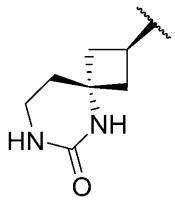
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１３】



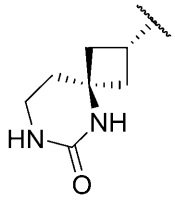
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１４】



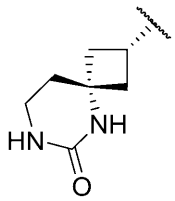
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１５】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１６】

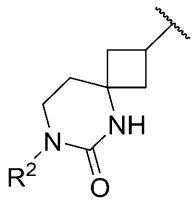


である。

【００９１】

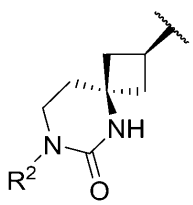
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１７】



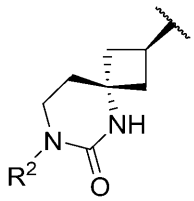
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１８】



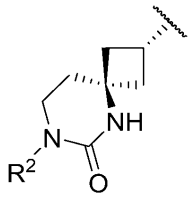
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２１９】



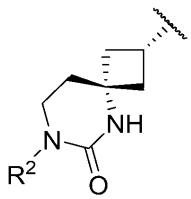
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２０】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２１】

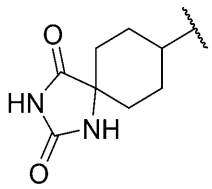


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００９２】

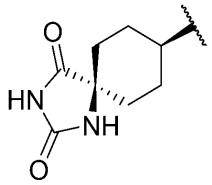
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２２】



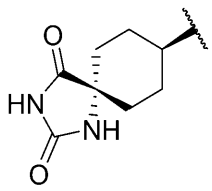
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２３】



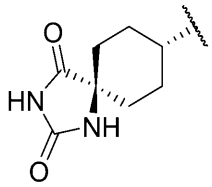
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２４】



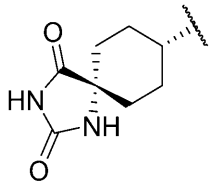
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２５】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２６】

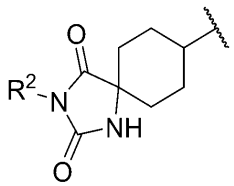


である。

【００９３】

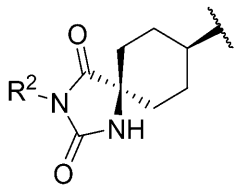
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２７】



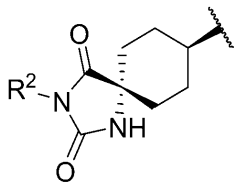
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２８】



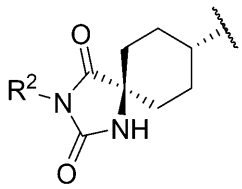
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２２９】



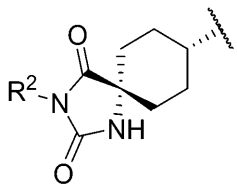
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３０】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３１】

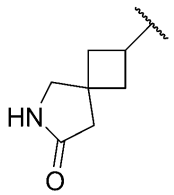


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００９４】

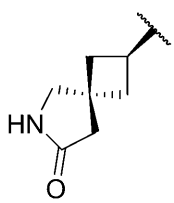
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３２】



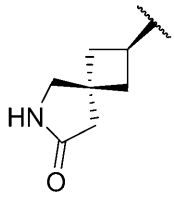
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３３】



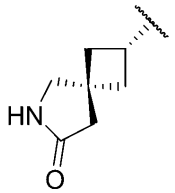
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３４】



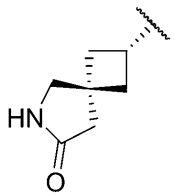
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３５】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３６】

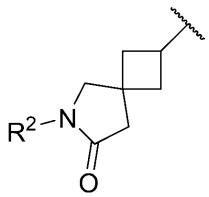


である。

【００９５】

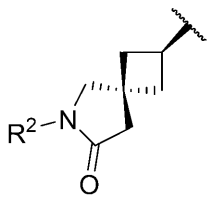
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３７】



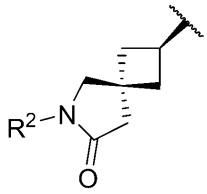
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３８】



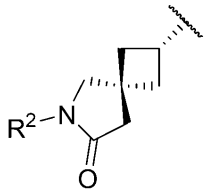
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２３９】



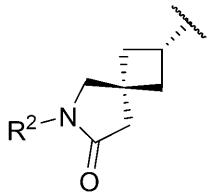
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２４０】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２４１】

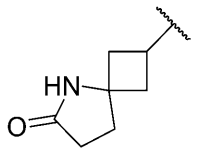


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書のクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００９６】

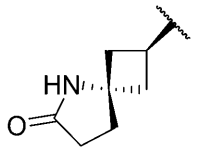
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２４２】



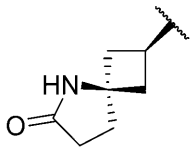
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２４３】

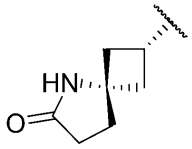


である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

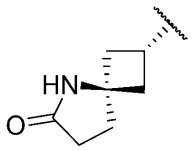
【化２４４】



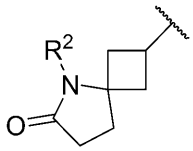
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２４５】



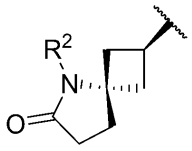
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２４６】



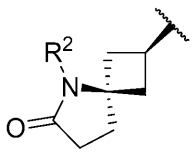
である。
【００９７】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２４７】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２４８】

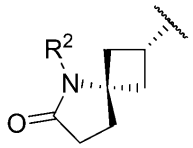


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２４９】



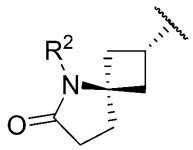
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５０】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５１】

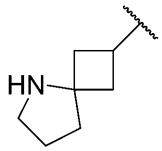


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書のクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【００９８】

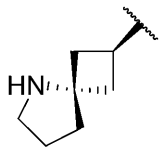
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５２】



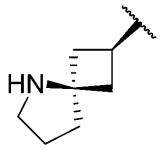
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５３】



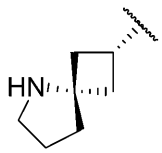
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５４】



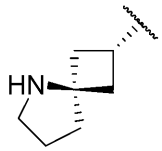
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５５】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５６】

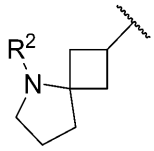


である。

【００９９】

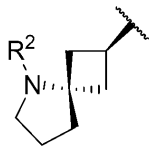
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５７】



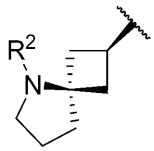
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５８】



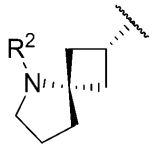
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２５９】



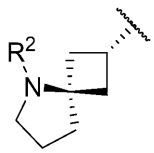
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６０】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６１】

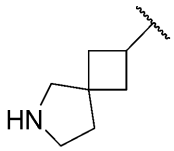


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１００】

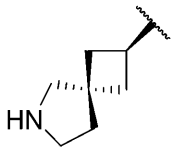
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６２】



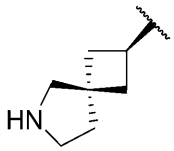
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６３】



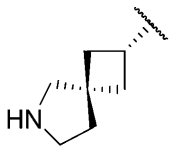
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６４】



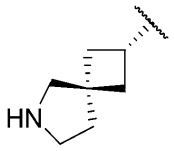
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６５】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６６】

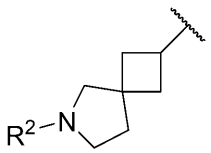


である。

【０１０１】

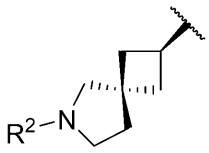
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６７】



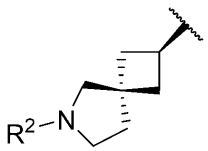
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６８】



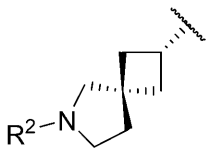
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２６９】



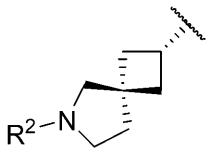
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２７０】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２７１】

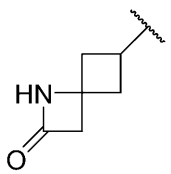


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１０２】

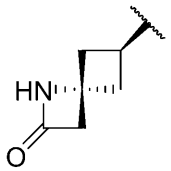
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２７２】



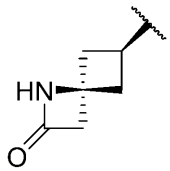
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２７３】

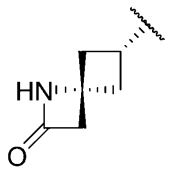


である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

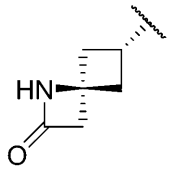
【化２７４】



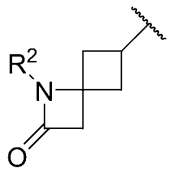
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２７５】



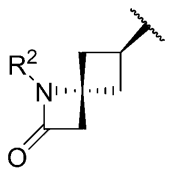
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２７６】



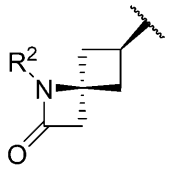
である。
【０１０３】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２７７】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２７８】

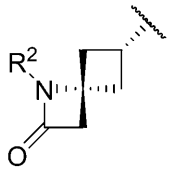


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２７９】



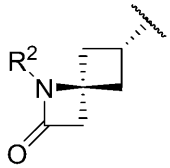
であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２８０】



であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２８１】

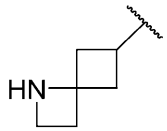


であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１０４】

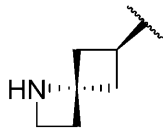
いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２８２】



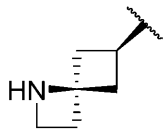
である。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２８３】



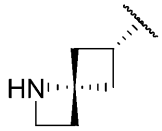
である。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２８４】



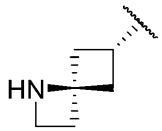
である。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２８５】



である。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化２８６】

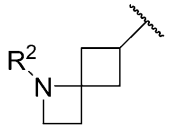


である。

【０１０５】

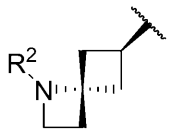
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２８７】



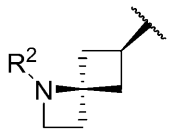
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２８８】



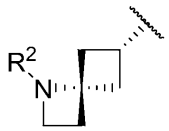
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２８９】



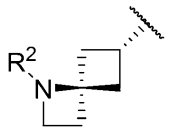
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２９０】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

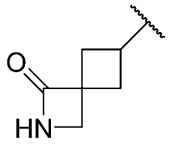
【化２９１】



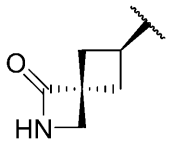
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１０６】

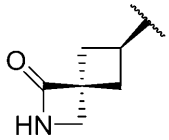
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２９２】



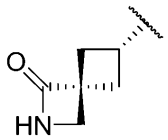
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２９３】



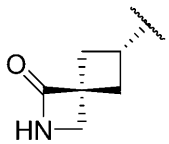
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２９４】



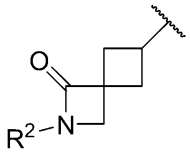
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２９５】



である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２９６】

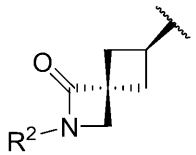


である。
【０１０７】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化２９７】



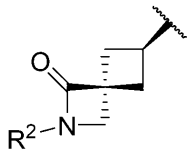
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２９８】



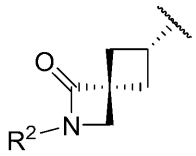
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化２９９】



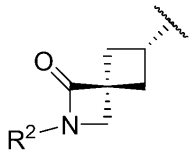
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３００】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３０１】

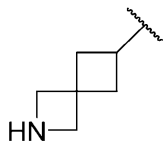


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１０８】

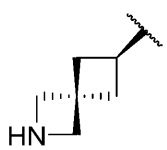
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３０２】



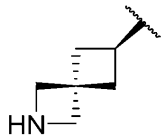
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３０３】

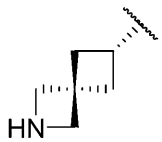


である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

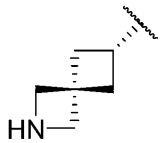
【化３０４】



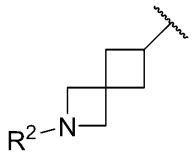
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化３０５】



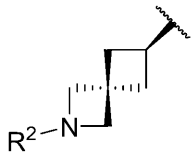
である。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化３０６】



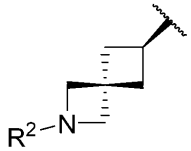
である。
【０１０９】
いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化３０７】



であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化３０８】

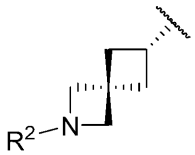


であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、
【化３０９】



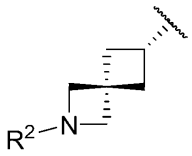
であり、式中、Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３１０】



であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化３１１】

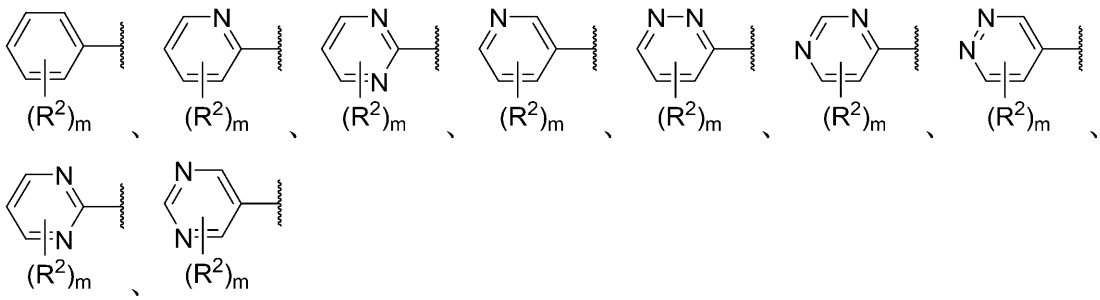


であり、式中、R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１１０】

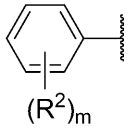
いくつかの実施形態において、Cy^2は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、Cy^2は、m個のR^2で置換される。いくつかの実施形態において、Cy^2は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、Cy^2は、m個のR^2で置換される。いくつかの実施形態において、Cy^2は、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、トリアジニル、またはテトラジニルである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化３１２】



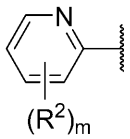
であり、式中、各R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化３１３】



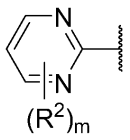
であり、式中、各R^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Cy^2は、

【化３１４】



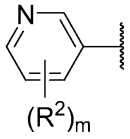
であり、式中、各Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３１５】



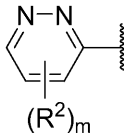
であり、式中、各Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３１６】



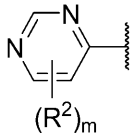
であり、式中、各Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３１７】



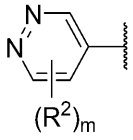
であり、式中、各Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３１８】



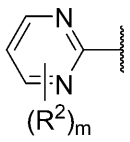
であり、式中、各Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３１９】



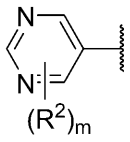
であり、式中、各Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３２０】



であり、式中、各Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３２１】

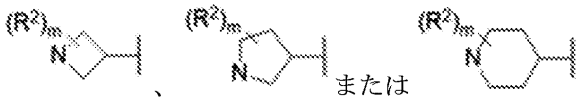


であり、式中、各Ｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１１１】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、Ｃｙ^{2}は、ｍ個のＲ^{2}で置換される。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、アジリジニル、オキシラニル、アゼチジニル、オキセタニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、モルホリニル、テトラヒドロチオフラニル、テトラヒドロチオピラニル、チオモルホリニル、アゼパニル、ホモモルホリニル、及びホモチオモルホリニルである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、アゼチジニル、ピロリジニル、またはピペリジニルである。いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、

【化３２２】



である。

【０１１２】

いくつかの実施形態において、Ｃｙ^{2}は、表１の化合物に示される基から選択される。

【０１１３】

上記で全体的に定義されるとおり、Ｑは、Ｌ^{Q}であり、式中、Ｌ^{Q}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１１４】

いくつかの実施形態において、Ｑは、共有結合、またはＣ$_{1-4}$の二価の飽和もしくは不飽和の直鎖もしくは分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{L}）－、－Ｃ（Ｒ^{L}）$_{2}$－、Ｃ$_{3-6}$シクロアルキレン、Ｃ$_{3-6}$ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、Ｑは、共有結合である。いくつかの実施形態において、Ｑは、Ｃ$_{1-4}$の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{L}）－、－Ｃ（Ｒ^{L}）$_{2}$－、Ｃ$_{3-6}$シクロアルキレン、Ｃ$_{3-6}$ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－

、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、Ｑは、Ｃ$_{1-4}$の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖である。

【０１１５】

いくつかの実施形態において、Ｑは、Ｃ$_{1-2}$の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{Ｌ}）－、－Ｃ（Ｒ^{Ｌ}）$_2$－、Ｃ$_{3-6}$シクロアルキレン、Ｃ$_{3-6}$ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、Ｑは、Ｃ$_{1-2}$の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{Ｌ}）－、－Ｃ（Ｒ^{Ｌ}）$_2$－、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、または－Ｏ－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、Ｑは、Ｃ$_{1-2}$の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖である。

【０１１６】

いくつかの実施形態において、Ｑは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＣＨ$_2$－、－Ｎ（Ｒ）－、－ＣＨ$_2$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、Ｑは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ＣＨ$_2$－、－Ｎ（Ｈ）－、－ＣＨ$_2$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、Ｑは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ＣＨ$_2$－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、Ｑは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ＣＨ$_2$－である。いくつかの実施形態において、Ｑは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、Ｑは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ＣＨ$_2$－である。いくつかの実施形態において、Ｑは、－Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、Ｑは、－ＣＨ$_2$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、Ｑは、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、Ｑは、共有結合である。

【０１１７】

いくつかの実施形態において、Ｑは、表１の化合物に示される基から選択される。

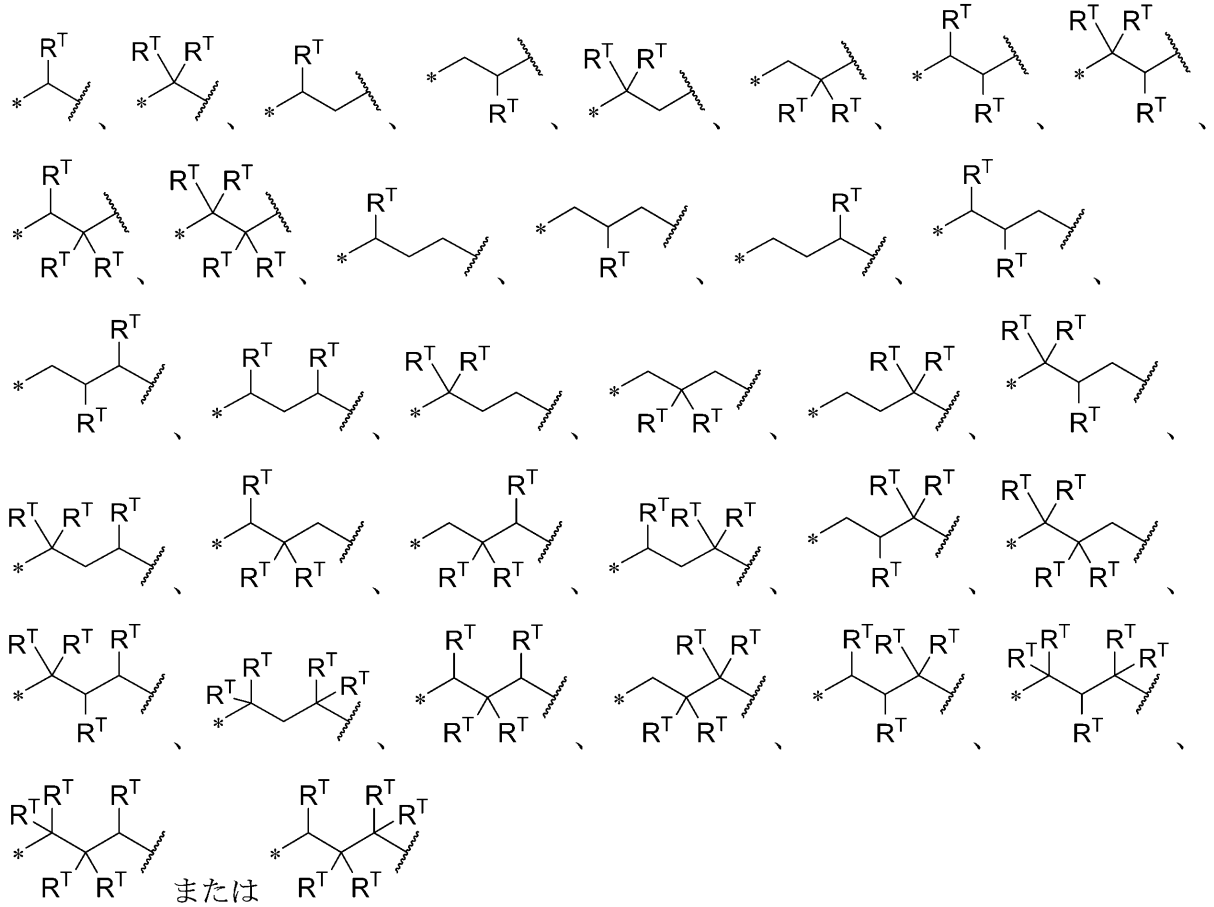
【０１１８】

上記で全体的に定義されるとおり、Ｔは、ｑ個のＲ^{Ｔ}で置換された二価のＣ$_{1-3}$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、Ｔは、ｑ個のＲ^{Ｔ}で置換された二価のＣ$_{2-3}$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、Ｔは、ｑ個のＲ^{Ｔ}で置換された二価のＣ$_{1-2}$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、Ｔは、ｑ個のＲ^{Ｔ}で置換された二価のＣ$_1$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、Ｔは、ｑ個のＲ^{Ｔ}で置換された二価のＣ$_2$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、Ｔは、ｑ個のＲ^{Ｔ}で置換された二価のＣ$_3$脂肪族鎖である。

【０１１９】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３２３】



であり、式中、

【化３２４】



は、Ｑへの結合を表し、

【化３２５】

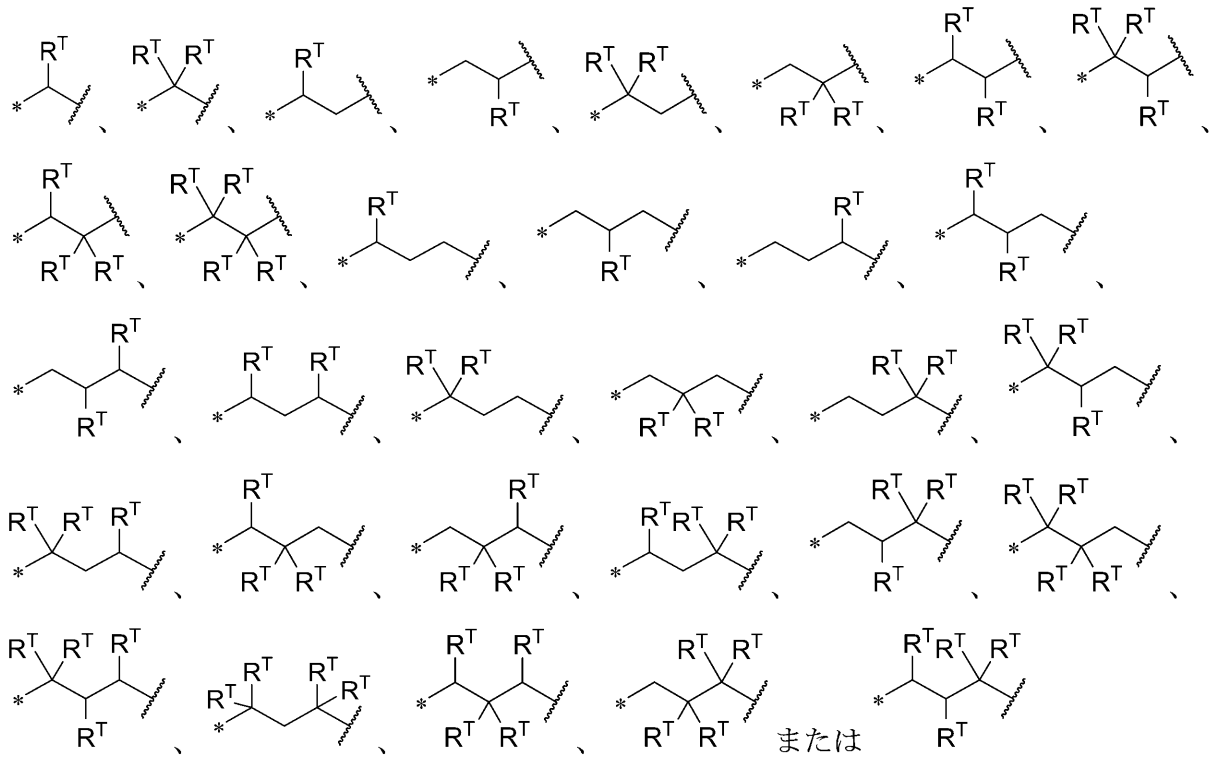


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１２０】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３２６】



であり、式中、

【化３２７】



は、Ｑへの結合を表し、

【化３２８】

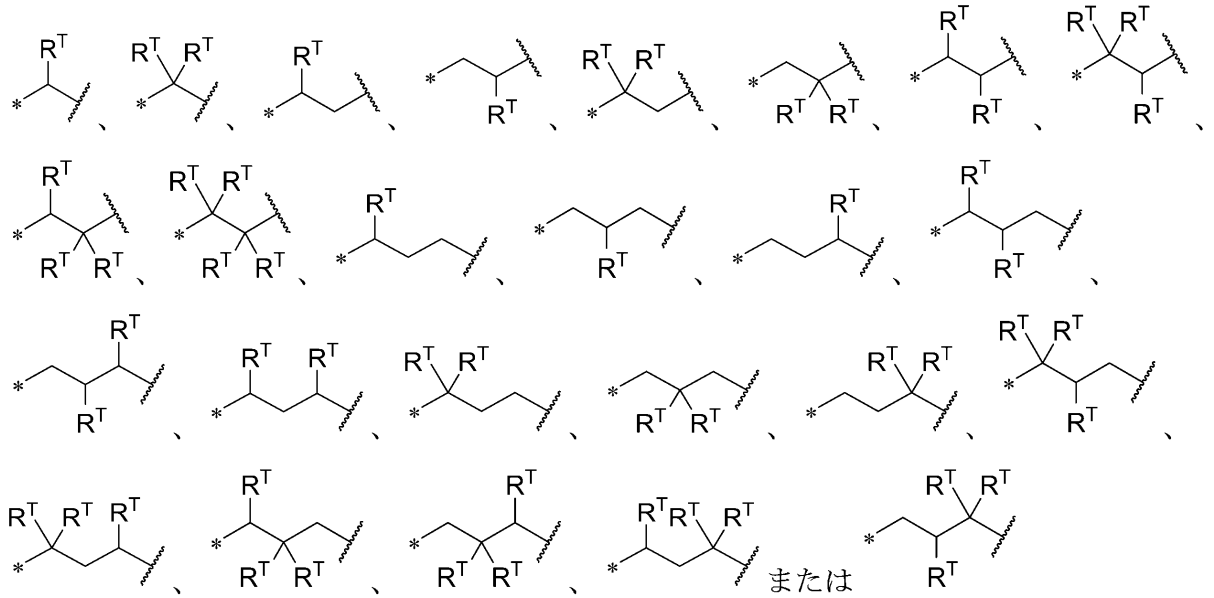


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１２１】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３２９】



であり、式中、

【化３３０】



は、Ｑへの結合を表し、

【化３３１】

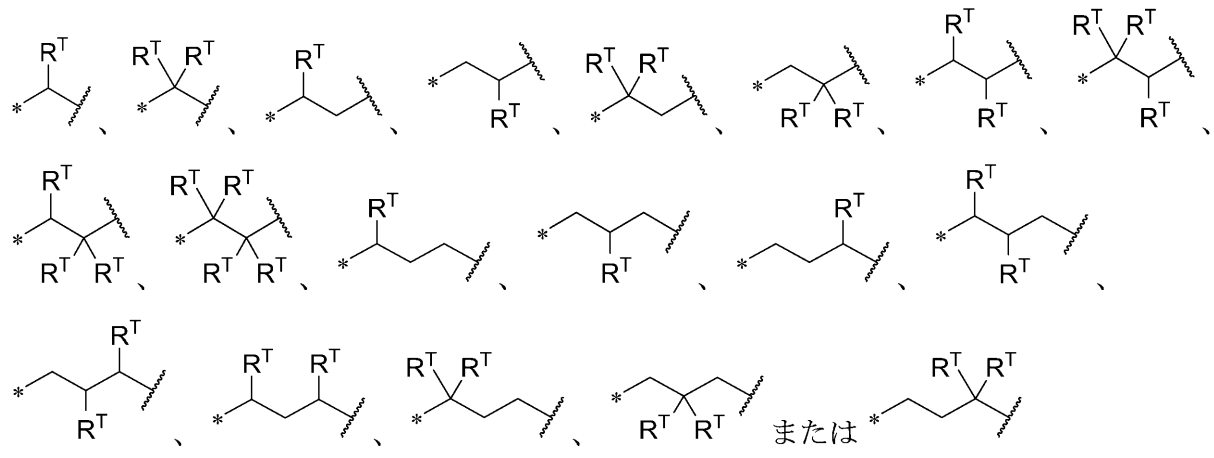


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１２２】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３３２】



であり、式中、

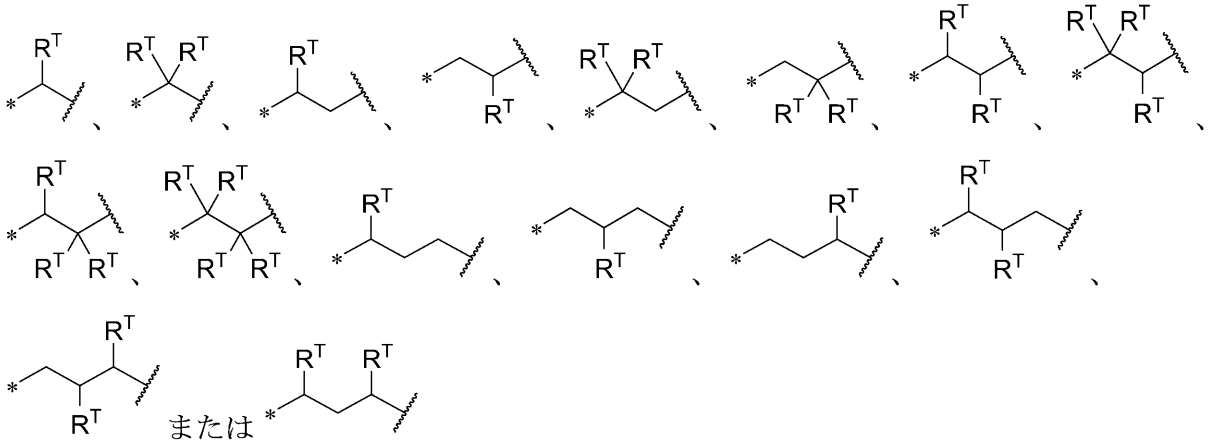
【化３３３】



は、Ｑへの結合を表し、
【化３３４】



は、Ｃｙ１への結合を表し、Ｒ Ｔは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。
【０１２３】
いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化３３５】



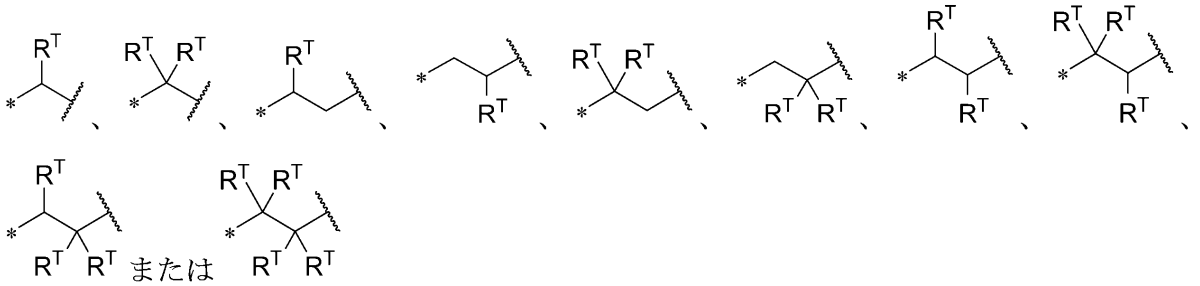
であり、式中、
【化３３６】



は、Ｑへの結合を表し、
【化３３７】



は、Ｃｙ１への結合を表し、Ｒ Ｔは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。
【０１２４】
いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化３３８】



であり、式中、

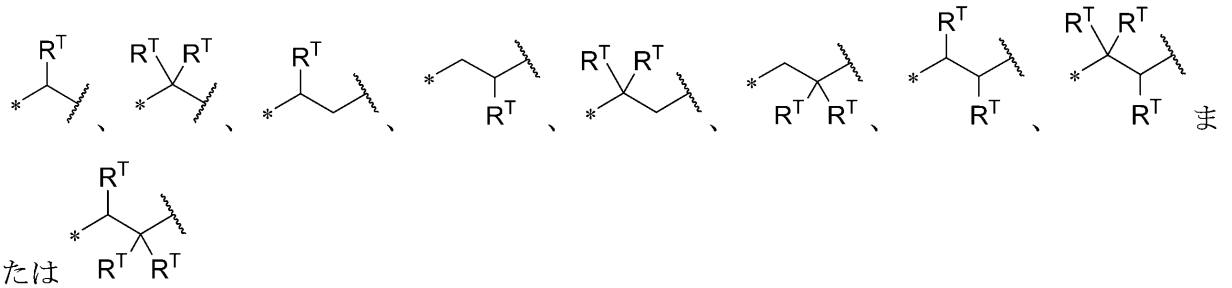
【化３３９】



は、Ｑへの結合を表し、
【化３４０】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。
【０１２５】
いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化３４１】



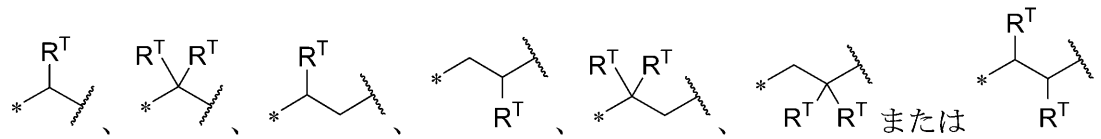
であり、式中、
【化３４２】



は、Ｑへの結合を表し、
【化３４３】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。
【０１２６】
いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化３４４】



であり、式中、
【化３４５】



は、Ｑへの結合を表し、

【化３４６】

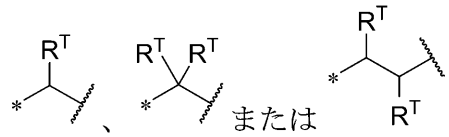


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１２７】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３４７】



であり、式中、

【化３４８】



は、Ｑへの結合を表し、

【化３４９】

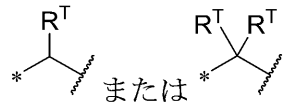


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１２８】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３５０】



であり、式中、

【化３５１】



は、Ｑへの結合を表し、

【化３５２】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１２９】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３５３】



であり、式中、

【化３５４】



は、Ｑへの結合を表し、

【化３５５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３５６】



であり、式中、

【化３５７】



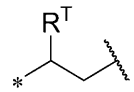
は、Ｑへの結合を表し、

【化３５８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３５９】



であり、式中、

【化３６０】



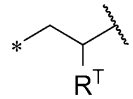
は、Ｑへの結合を表し、

【化３６１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３６２】



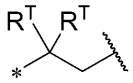
であり、式中、
【化３６３】



は、Ｑへの結合を表し、
【化３６４】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化３６５】



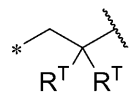
であり、式中、
【化３６６】



は、Ｑへの結合を表し、
【化３６７】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化３６８】



であり、式中、
【化３６９】

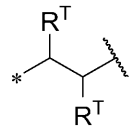


は、Ｑへの結合を表し、
【化３７０】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３７１】



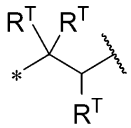
であり、式中、
【化３７２】



は、Ｑへの結合を表し、
【化３７３】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化３７４】



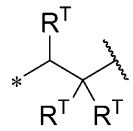
であり、式中、
【化３７５】



は、Ｑへの結合を表し、
【化３７６】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化３７７】



であり、式中、
【化３７８】



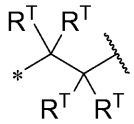
は、Ｑへの結合を表し、
【化３７９】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラス

で定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３８０】



であり、式中、

【化３８１】



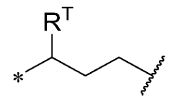
は、Ｑへの結合を表し、

【化３８２】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３８３】



であり、式中、

【化３８４】



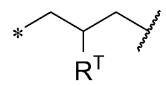
は、Ｑへの結合を表し、

【化３８５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３８６】



であり、式中、

【化３８７】



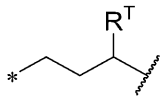
は、Ｑへの結合を表し、

【化３８８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３８９】



であり、式中、

【化３９０】



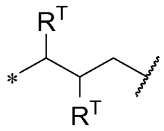
は、Ｑへの結合を表し、

【化３９１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３９２】



であり、式中、

【化３９３】



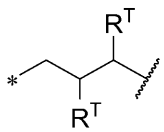
は、Ｑへの結合を表し、

【化３９４】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３９５】



であり、式中、

【化３９６】



は、Ｑへの結合を表し、

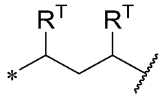
【化３９７】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラス

で定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化３９８】



であり、式中、

【化３９９】



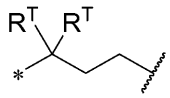
は、Ｑへの結合を表し、

【化４００】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４０１】



であり、式中、

【化４０２】



は、Ｑへの結合を表し、

【化４０３】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４０４】



であり、式中、

【化４０５】



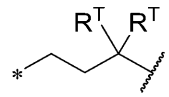
は、Ｑへの結合を表し、

【化４０６】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４０７】



であり、式中、

【化４０８】



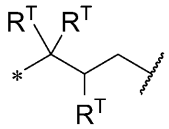
は、Ｑへの結合を表し、

【化４０９】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４１０】



であり、式中、

【化４１１】



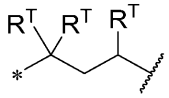
は、Ｑへの結合を表し、

【化４１２】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４１３】



であり、式中、

【化４１４】



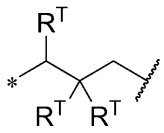
は、Ｑへの結合を表し、

【化４１５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４１６】



であり、式中、

【化４１７】



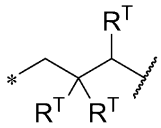
は、Ｑへの結合を表し、

【化４１８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４１９】



であり、式中、

【化４２０】



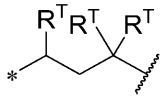
は、Ｑへの結合を表し、

【化４２１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４２２】



であり、式中、

【化４２３】



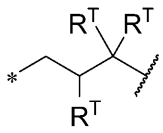
は、Ｑへの結合を表し、

【化４２４】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４２５】



であり、式中、

【化４２６】



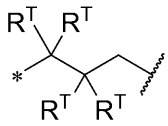
は、Ｑへの結合を表し、

【化４２７】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４２８】



であり、式中、

【化４２９】



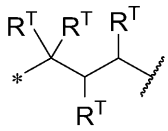
は、Ｑへの結合を表し、

【化４３０】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４３１】



であり、式中、

【化４３２】



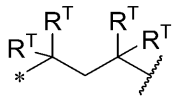
は、Ｑへの結合を表し、

【化４３３】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラス

で定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化４３４】



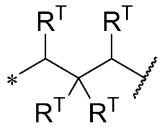
であり、式中、
【化４３５】



は、Ｑへの結合を表し、
【化４３６】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化４３７】



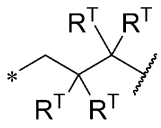
であり、式中、
【化４３８】



は、Ｑへの結合を表し、
【化４３９】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化４４０】



であり、式中、
【化４４１】



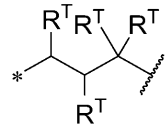
は、Ｑへの結合を表し、
【化４４２】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラス

で定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４４３】



であり、式中、

【化４４４】



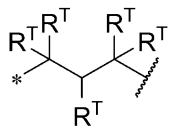
は、Ｑへの結合を表し、

【化４４５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４４６】



であり、式中、

【化４４７】



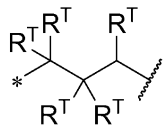
は、Ｑへの結合を表し、

【化４４８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４４９】



であり、式中、

【化４５０】



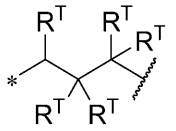
は、Ｑへの結合を表し、

【化４５１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４５２】



であり、式中、

【化４５３】



は、Ｑへの結合を表し、

【化４５４】

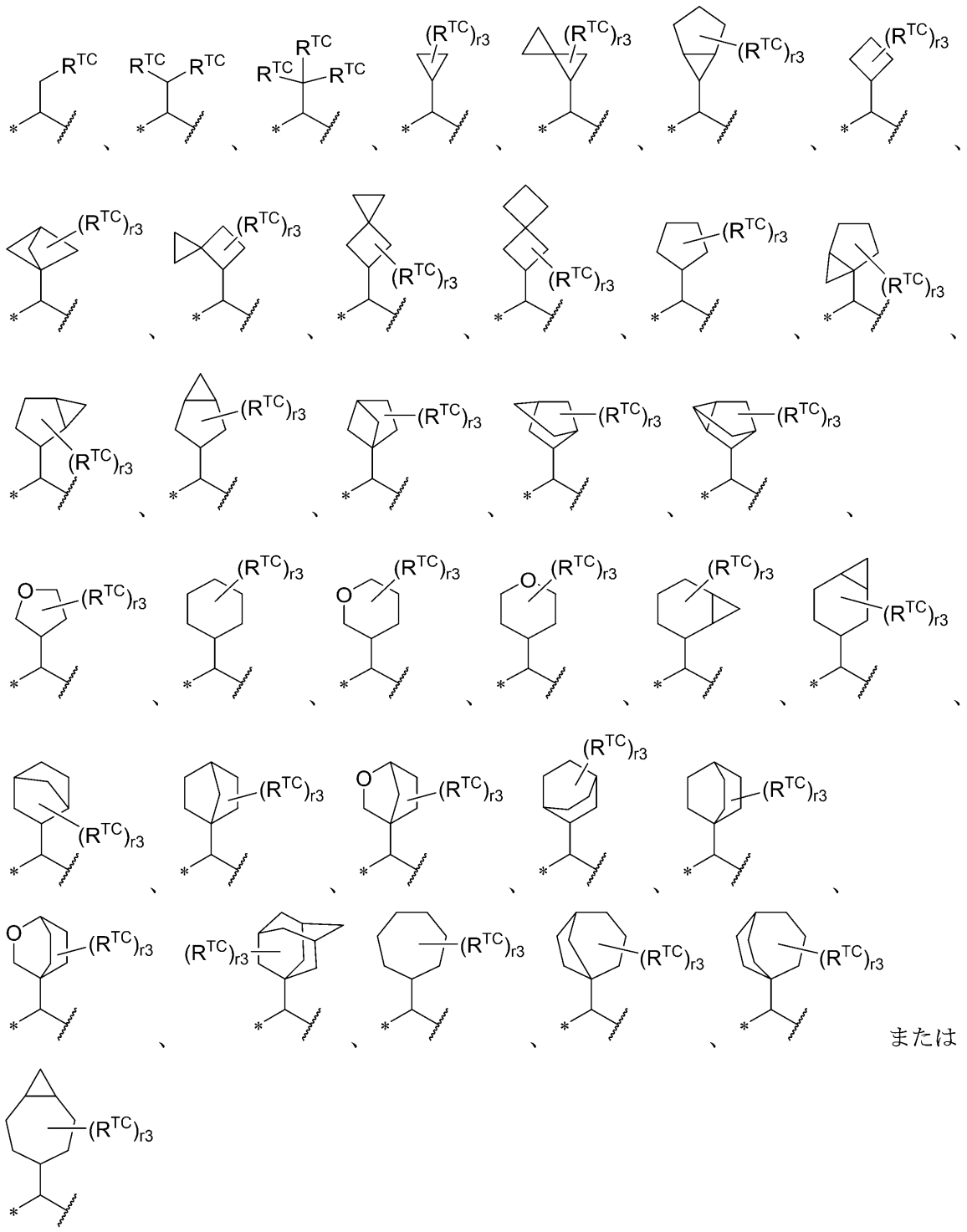


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１３０】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４５５】



であり、式中、

【化４５６】

は、Ｑへの結合を表し、

【化４５７】

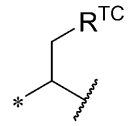


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１３１】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４５８】



であり、式中、

【化４５９】



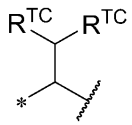
は、Ｑへの結合を表し、

【化４６０】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４６１】



であり、式中、

【化４６２】



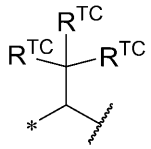
は、Ｑへの結合を表し、

【化４６３】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４６４】



であり、式中、

【化４６５】



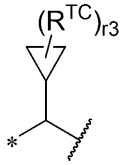
は、Ｑへの結合を表し、

【化４６６】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４６７】



であり、式中、

【化４６８】



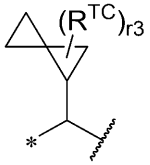
は、Ｑへの結合を表し、

【化４６９】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４７０】



であり、式中、

【化４７１】



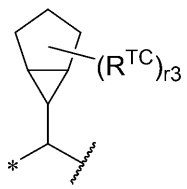
は、Ｑへの結合を表し、

【化４７２】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４７３】



であり、式中、

【化４７４】



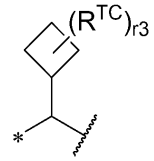
は、Ｑへの結合を表し、

【化４７５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４７６】



であり、式中、

【化４７７】



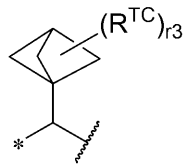
は、Ｑへの結合を表し、

【化４７８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４７９】



であり、式中、

【化４８０】



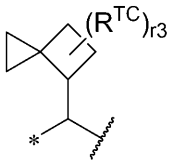
は、Ｑへの結合を表し、

【化４８１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４８２】



であり、式中、

【化４８３】



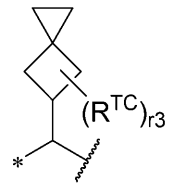
は、Ｑへの結合を表し、

【化４８４】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４８５】



であり、式中、

【化４８６】



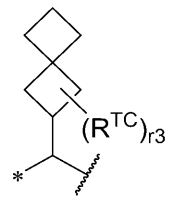
は、Ｑへの結合を表し、

【化４８７】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４８８】



であり、式中、

【化４８９】



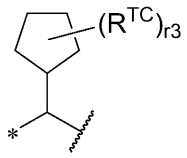
は、Ｑへの結合を表し、

【化４９０】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４９１】



であり、式中、

【化４９２】



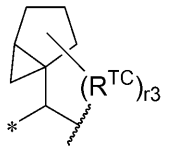
は、Ｑへの結合を表し、

【化４９３】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４９４】



であり、式中、

【化４９５】



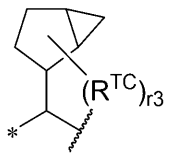
は、Ｑへの結合を表し、

【化４９６】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化４９７】



であり、式中、

【化４９８】



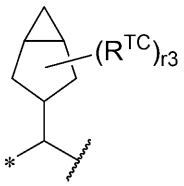
は、Ｑへの結合を表し、

【化４９９】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５００】



であり、式中、

【化５０１】



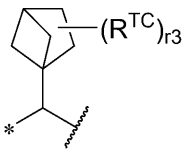
は、Ｑへの結合を表し、

【化５０２】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５０３】



であり、式中、

【化５０４】



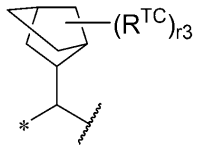
は、Ｑへの結合を表し、

【化５０５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５０６】



であり、式中、

【化５０７】



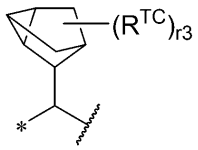
は、Ｑへの結合を表し、

【化５０８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５０９】



であり、式中、

【化５１０】



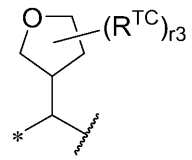
は、Ｑへの結合を表し、

【化５１１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５１２】



であり、式中、

【化５１３】



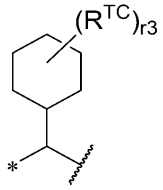
は、Ｑへの結合を表し、

【化５１４】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５１５】



であり、式中、

【化５１６】



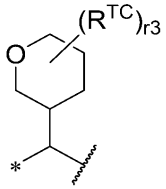
は、Ｑへの結合を表し、

【化５１７】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５１８】



であり、式中、

【化５１９】



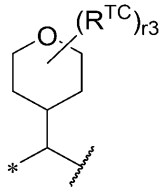
は、Ｑへの結合を表し、

【化５２０】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５２１】



であり、式中、

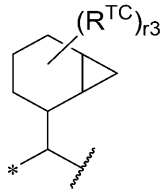
【化５２２】



は、Ｑへの結合を表し、
【化５２３】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化５２４】



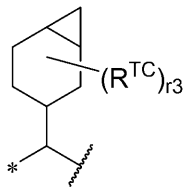
であり、式中、
【化５２５】



は、Ｑへの結合を表し、
【化５２６】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化５２７】



であり、式中、
【化５２８】

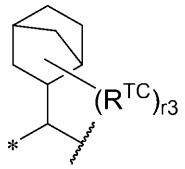


は、Ｑへの結合を表し、
【化５２９】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５３０】



であり、式中、

【化５３１】



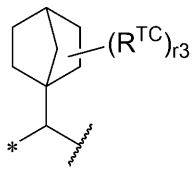
は、Ｑへの結合を表し、

【化５３２】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５３３】



であり、式中、

【化５３４】



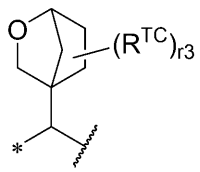
は、Ｑへの結合を表し、

【化５３５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５３６】



であり、式中、

【化５３７】



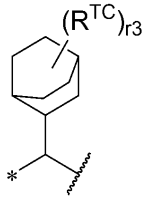
は、Ｑへの結合を表し、

【化５３８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５３９】



であり、式中、

【化５４０】



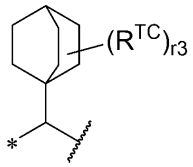
は、Ｑへの結合を表し、

【化５４１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５４２】



であり、式中、

【化５４３】



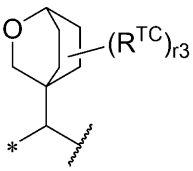
は、Ｑへの結合を表し、

【化５４４】



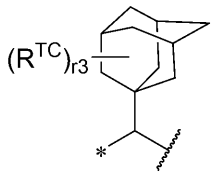
は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５４５】



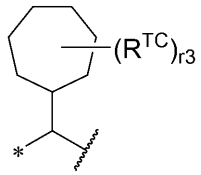
であり、式中、
【化５４６】


は、Ｑへの結合を表し、
【化５４７】


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化５４８】


であり、式中、
【化５４９】


は、Ｑへの結合を表し、
【化５５０】

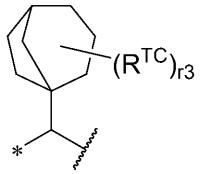

は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化５５１】


であり、式中、
【化５５２】


は、Ｑへの結合を表し、
【化５５３】


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５５４】



であり、式中、

【化５５５】



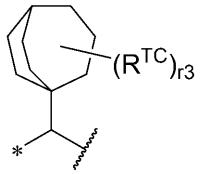
は、Ｑへの結合を表し、

【化５５６】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５５７】



であり、式中、

【化５５８】



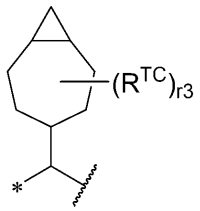
は、Ｑへの結合を表し、

【化５５９】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５６０】



であり、式中、

【化５６１】



は、Ｑへの結合を表し、

【化５６２】

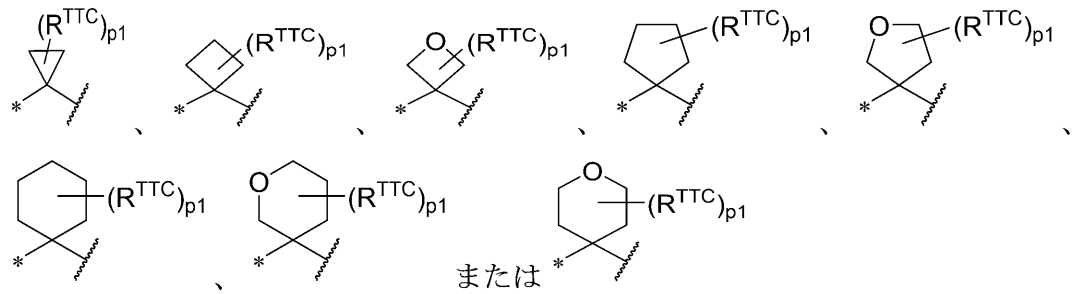


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＣ}及びｒ^{3}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１３２】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５６３】



であり、式中、

【化５６４】



は、Ｑへの結合を表し、

【化５６５】

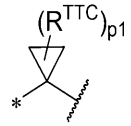


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１３３】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５６６】



であり、式中、

【化５６７】



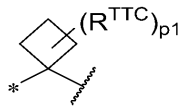
は、Ｑへの結合を表し、

【化５６８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５６９】



であり、式中、

【化５７０】



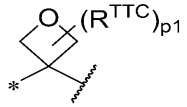
は、Ｑへの結合を表し、

【化５７１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５７２】



であり、式中、

【化５７３】



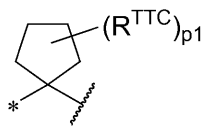
は、Ｑへの結合を表し、

【化５７４】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５７５】



であり、式中、

【化５７６】



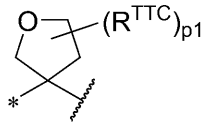
は、Ｑへの結合を表し、

【化５７７】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５７８】



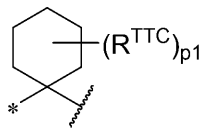
であり、式中、
【化５７９】



は、Ｑへの結合を表し、
【化５８０】



は、Ｃｙ１への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ１は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化５８１】



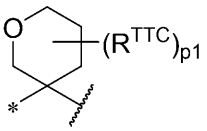
であり、式中、
【化５８２】



は、Ｑへの結合を表し、
【化５８３】



は、Ｃｙ１への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ１は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化５８４】



であり、式中、
【化５８５】



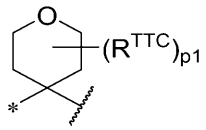
は、Ｑへの結合を表し、
【化５８６】



は、Ｃｙ１への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ１は、本明細書の実施形態ならびにクラス及

びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５８７】



であり、式中、

【化５８８】



は、Ｑへの結合を表し、

【化５８９】

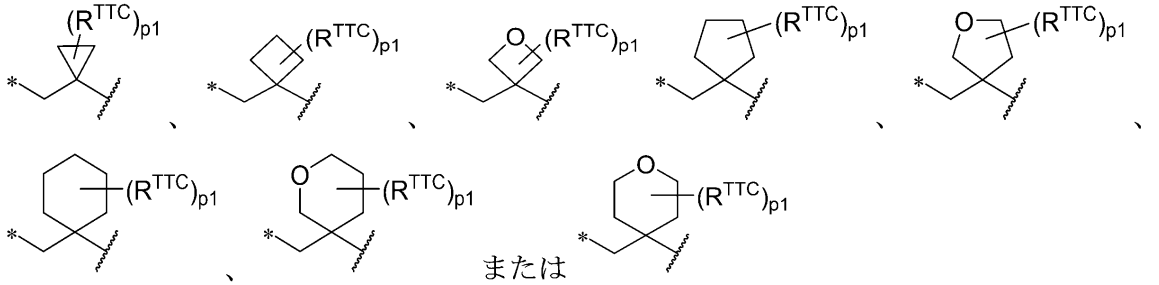


は、Ｃｙ１への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ１は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１３４】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５９０】



または

であり、式中、

【化５９１】



は、Ｑへの結合を表し、

【化５９２】

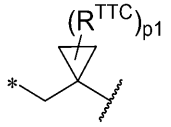


は、Ｃｙ１への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ１は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１３５】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５９３】



であり、式中、

【化５９４】



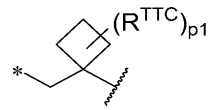
は、Ｑへの結合を表し、

【化５９５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５９６】



であり、式中、

【化５９７】



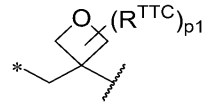
は、Ｑへの結合を表し、

【化５９８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化５９９】



であり、式中、

【化６００】



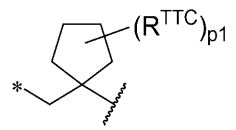
は、Ｑへの結合を表し、

【化６０１】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６０２】



であり、式中、

【化６０３】



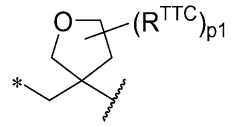
は、Ｑへの結合を表し、

【化６０４】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６０５】



であり、式中、

【化６０６】



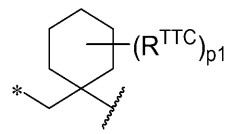
は、Ｑへの結合を表し、

【化６０７】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６０８】



であり、式中、

【化６０９】



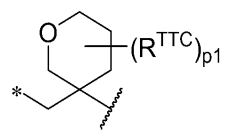
は、Ｑへの結合を表し、

【化６１０】



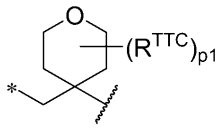
は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６１１】



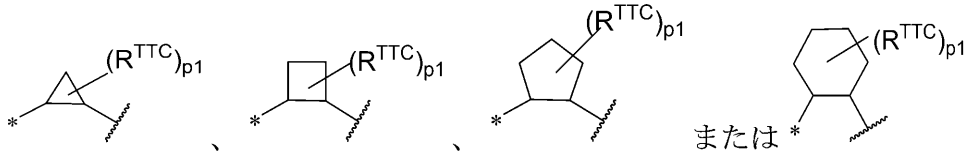
であり、式中、
【化６１２】


は、Ｑへの結合を表し、
【化６１３】


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６１４】


であり、式中、
【化６１５】


は、Ｑへの結合を表し、
【化６１６】


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。
【０１３６】
いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６１７】


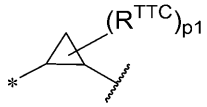
であり、式中、
【化６１８】


は、Ｑへの結合を表し、
【化６１９】


は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、Ｒ^{ＴＴＣ}及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。
【０１３７】

いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６２０】



であり、式中、

【化６２１】



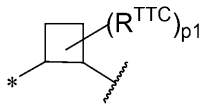
は、Ｑへの結合を表し、

【化６２２】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６２３】



であり、式中、

【化６２４】



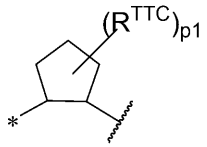
は、Ｑへの結合を表し、

【化６２５】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６２６】



であり、式中、

【化６２７】



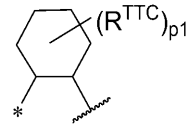
は、Ｑへの結合を表し、

【化６２８】



は、Ｃｙ^{1}への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ^{1}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６２９】



であり、式中、

【化６３０】



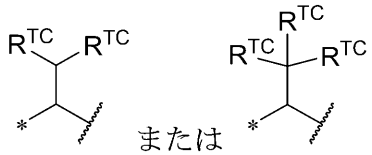
は、Ｑへの結合を表し、

【化６３１】



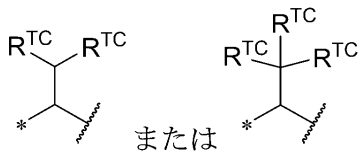
は、Ｃｙ１への結合を表し、ＲＴＴＣ及びｐ１は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６３２】



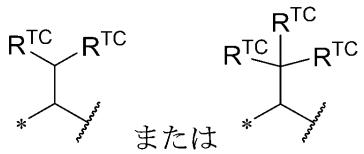
であり、式中、各ＲＴＣは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６３３】



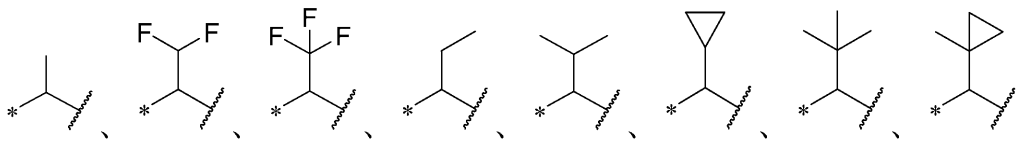
であり、式中、各ＲＴＣは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６３４】



であり、式中、各ＲＴＣは、独立して、重水素、ハロゲン、またはＣ１－６脂肪族から選択される任意選択により置換された基である。いくつかの実施形態において、Ｔは、

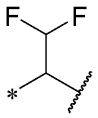
【化６３５】



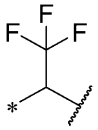
である。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６３６】



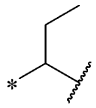
である。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６３７】



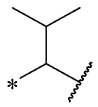
である。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６３８】



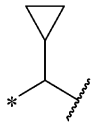
である。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６３９】



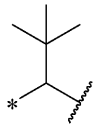
である。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６４０】



である。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６４１】

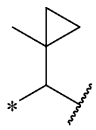


である。いくつかの実施形態において、Ｔは、
【化６４２】



である。いくつかの実施形態において、Ｔは、

【化６４３】



である。

【０１３８】

いくつかの実施形態において、Ｔは、表１の化合物に示される基から選択される。

【０１３９】

上記で全体的に定義されるとおり、各R^1は、独立して、$-L^1-R^{1A}$であるか、あるいはR^1の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^2個のR^{11C}で置換されるか、あるいはR^Tの１つとR^1の１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^4個のR^{T1C}で置換される。

【０１４０】

いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、$-L^1-R^{1A}$である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、$-R^{1A}$である。

【０１４１】

いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、R^Aである。いくつかの実施形態において、各R^1（すなわち、$-L^1-R^{1A}$の総称）は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、$-CN$、$-NO_2$、$-OR$、$-SF_5$、$-SR$、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、$-S(O)R$、$-S(O)NR_2$、$-S(O)(NR)R$、$-S(O)(NCN)R$、$-S(NCN)R$、$-C(O)R$、$-C(O)OR$、$-C(O)NR_2$、$-C(O)N(R)OR$、$-OC(O)R$、$-OC(O)NR_2$、$-N(R)C(O)OR$、$-N(R)C(O)R$、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、$-P(O)(R)OR$、または$-B(OR)_2$であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１４２】

いくつかの実施形態において、R^1は、オキソである。いくつかの実施形態において、R^1は、重水素である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^1は、$-CN$である。いくつかの実施形態において、R^1は、$-NO_2$である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、$-OR$であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^1は、$-SF_5$である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、SRであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、$-NR_2$であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、$-S(O)_2R$であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、$-S(O)_2NR_2$であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^1は、$-S(O)_2F$である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、$-S(O)R$であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、$-S(O)NR_2$であり、式中、Ｒ

は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｓ（Ｏ）（ＮＣＮ）Ｒであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｓ（ＮＣＮ）Ｒであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｃ（Ｏ）ＯＲであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｃ（Ｏ）NR_2であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）NR_2であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｐ（Ｏ）R_2であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲであり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、－Ｂ（ＯＲ）$_2$であり、式中、Ｒは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１４３】

いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、r^1個のR^{1C}によって置換されたR^Bである。いくつかの実施形態において、R^1（すなわち、$-L^1-R^{1A}$の総称）は、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である、そのそれぞれは、r^1個のR^{1C}によって置換される。

【０１４４】

いくつかの実施形態において、各R^1（すなわち、$-L^1-R^{1A}$の総称）は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＲ、またはr^1個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＲまたは０～５個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（０～５個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖）、または０～５個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、ハロゲンまたは０～５個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、ハロゲンまたは０～４個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、ハロゲンまたは０～３個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、ハロゲンまたは０～３個のハロゲンで置換されたC_{1-3}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、ハロゲンまたは０～２個のハロゲンで置換されたC_{1-3}脂肪族鎖である。

【０１４５】

いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、Ｂｒ、Ｃｌ、及びＦから選択されるハロゲンである。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、Ｃｌ及びＦから選択されるハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^1は、Ｃｌである。いくつかの実施形態において、R^1は、Ｆである。

【０１４６】

いくつかの実施形態において、少なくとも１つのR^1は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、少なくとも２つのR^1は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、少なくとも３つのR^1は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^1の１つは、Ｃｌである。いくつかの実施形態において、R^1の２つは、Ｃｌである。いくつかの実施形態において、R^1の１つは、Ｆである。いくつかの実施形態において、R^1の２つは、Ｆである。いくつかの実施形態において、R^1の１つは、Ｃｌであり、R^1の１つは、Ｆである。いくつかの実施形態において、R^1の２つは、Ｃｌであり、R^1の１つは、Ｆである。いくつかの実施形態において、R^1の１つは、Ｃｌであり、R^1の２つは、Ｆである。

【０１４７】

いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、０～５個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、０～４個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、０～３個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、０～３個のハロゲンで置換されたC_{1-3}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、０～２個のハロゲンで置換されたC_{1-3}脂肪族鎖である。

【０１４８】

いくつかの実施形態において、少なくとも１つのR^1は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、少なくとも１つのR^1は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換された$-O-C_{1-3}$脂肪族である。

【０１４９】

いくつかの実施形態において、各R^1（すなわち、$-L^1-R^{1A}$の総称）は、独立して、ハロゲン、－ＯＨ、$-OCH_3$、または１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、各R^1は、独立して、フッ素、塩素、$-OCH_3$、または$-CH_3$である。いくつかの実施形態において、R^1は、－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R^1は、$-CH_3$である。いくつかの実施形態において、R^1は、$-OCH_3$である。いくつかの実施形態において、R^1は、$-CF_3$である。いくつかの実施形態において、R^1は、$-CHF_2$である。

【０１５０】
いくつかの実施形態において、R^1の２つは、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^2個のR^{11C}で置換され、p^2及びR^{11C}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。
【０１５１】
いくつかの実施形態において、R^Tの１つとR^1の１つは、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^4個のR^{T1C}で置換され、p^4及びR^{T1C}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。
【０１５２】
いくつかの実施形態において、R^1は、表１の化合物に示される基から選択される。
【０１５３】
上記で全体的に定義されるとおり、各R^2は、独立して、$-L^2-R^{2A}$であるか、あるいはR^2の２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和、部分不飽和もしくは芳香族の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^3個のR^{22C}で置換される。
【０１５４】
いくつかの実施形態において、各R^2は、独立して、$-L^2-R^{2A}$である。いくつかの実施形態において、各R^2は、独立して、R^{2A}である。
【０１５５】
いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-N(R)-R^{2A}$であり、式中、R及びR^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-NH-R^{2A}$であり、式中、R^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-CH(R^L)-R^{2A}$であり、式中、R及びR^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-CH_2-R^{2A}$であり、式中、R^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-N(R)C(O)-R^{2A}$であり、式中、R及びR^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-NHC(O)-R^{2A}$であり、式中、R^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-N(R)C(O)CH(R^L)-R^{2A}$であり、式中、R及びR^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-NHC(O)CH_2-R^{2A}$であり、式中、R^{2A}本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-N(R)C(O)N(R)-R^{2A}$であり、式中、R及びR^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-NHC(O)NH-R^{2A}$であり、式中、R^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-N(R)C(O)CH(R^L)O-R^{2A}$であり、式中、R及びR^{2A}は、本明細書の

実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-NHC(O)CH_2O-R^{2A}$であり、式中、R^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-CH(R^L)N(R)-R^{2A}$であり、式中、R及びR^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、$-CH(R^L)O-R^{2A}$であり、式中、R及びR^{2A}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１５６】

いくつかの実施形態において、R^2は、$-N(R)-R^{2A}$、$-N(R)C(O)-R^{2A}$、$-CH(R^L)N(R)-R^{2A}$、$-N(R)C(O)CH(R^L)-R^{2A}$、$-CH(R^L)O-R^{2A}$、$-CH(R^L)-R^{2A}$、または$-R^{2A}$である。いくつかの実施形態において、R^2は、$-N(R)-R^{2A}$、$-N(R)C(O)-R^{2A}$、$-CH(R^L)N(R)-R^{2A}$、または$-R^{2A}$である。いくつかの実施形態において、R^2は、$-N(R)-R^{2A}$、$-N(R)C(O)-R^{2A}$、または$-R^{2A}$である。いくつかの実施形態において、R^2は、$-N(R)C(O)-R^{2A}$または$-R^{2A}$である。

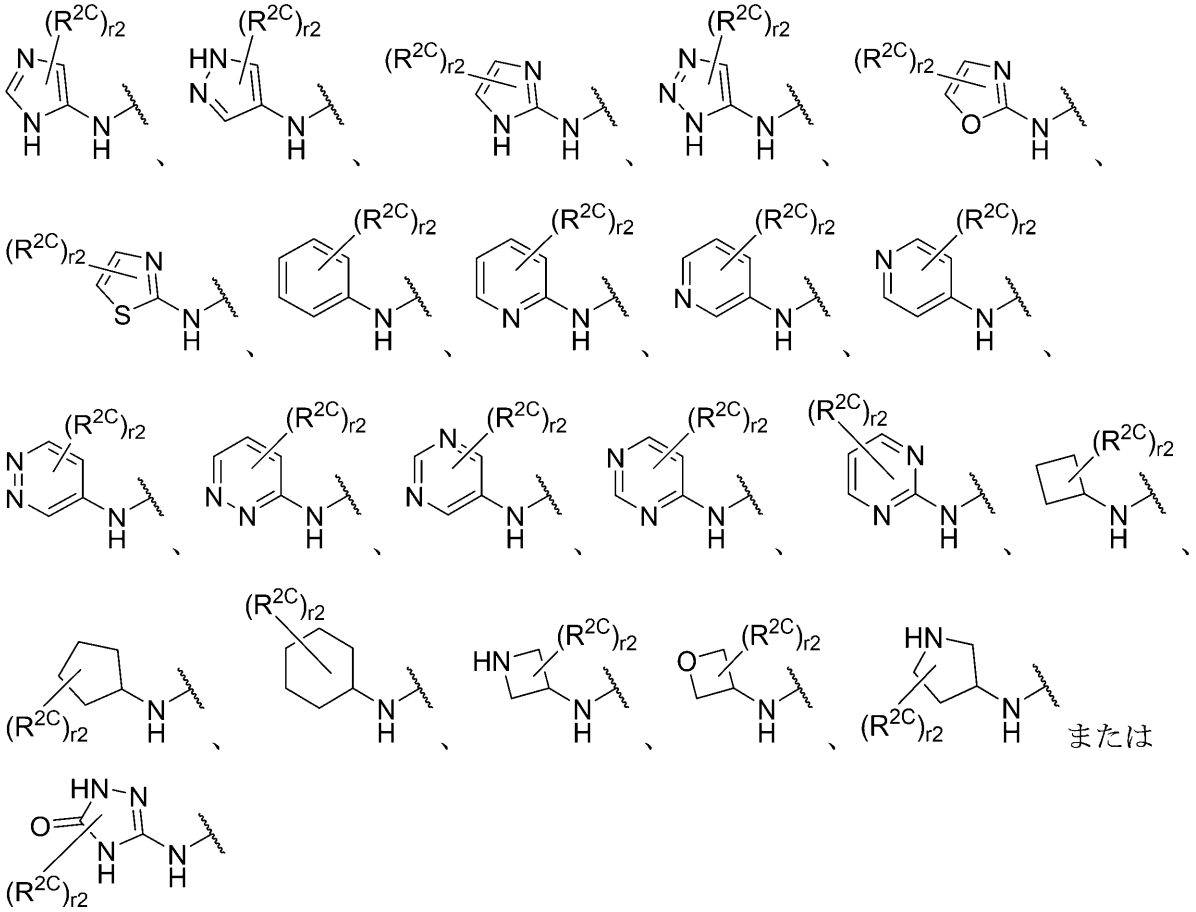
【０１５７】

いくつかの実施形態において、R^2は、$-N(H)-R^{2A}$、$-N(H)C(O)-R^{2A}$、$-CH_2N(H)-R^{2A}$、$-N(H)C(O)CH_2-R^{2A}$、$-CH_2O-R^{2A}$、$-CH_2-R^{2A}$、または$-R^{2A}$である。いくつかの実施形態において、R^2は、$-N(H)-R^{2A}$、$-N(H)C(O)-R^{2A}$、$-CH_2N(H)-R^{2A}$、または$-R^{2A}$である。いくつかの実施形態において、R^2は、$-N(H)-R^{2A}$、$-N(H)C(O)-R^{2A}$、または$-R^{2A}$である。いくつかの実施形態において、R^2は、$-N(H)C(O)-R^{2A}$または$-R^{2A}$である。

【０１５８】

いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６４４】

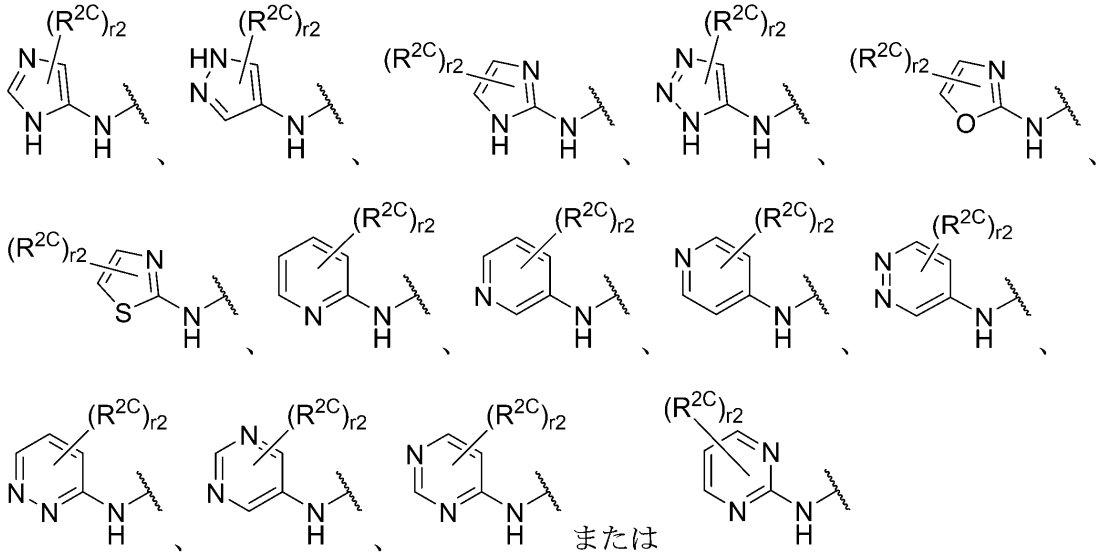


であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１５９】

いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６４５】

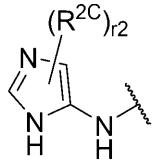


であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１６０】

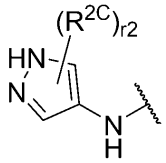
いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６４６】



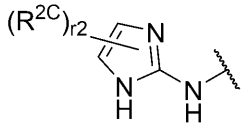
であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６４７】



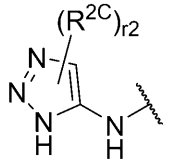
であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６４８】



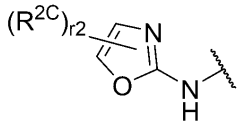
であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６４９】



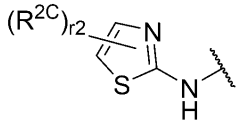
であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６５０】



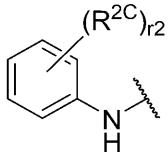
であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６５１】



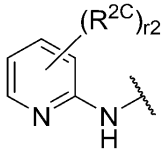
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６５２】



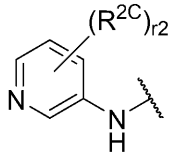
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６５３】



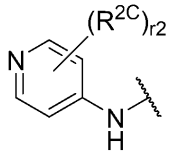
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６５４】



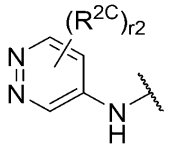
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６５５】



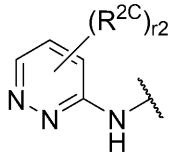
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６５６】



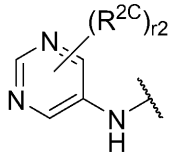
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６５７】



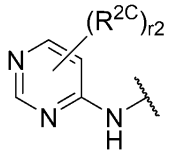
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６５８】



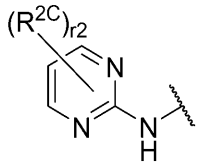
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６５９】



であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６６０】

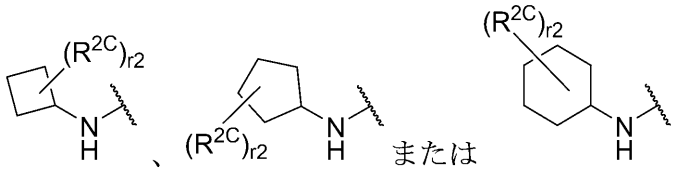


であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１６１】

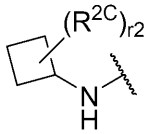
いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６６１】



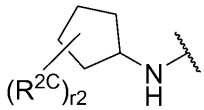
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６６２】



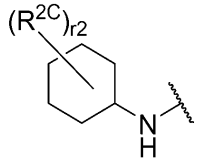
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６６３】



であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６６４】

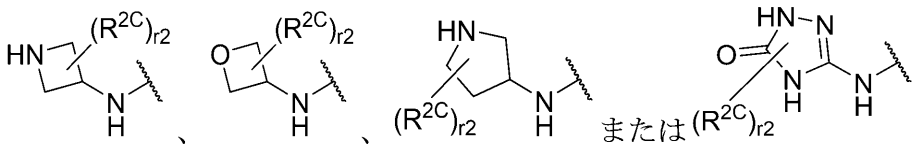


であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１６２】

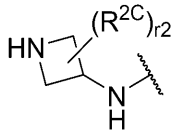
いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６６５】



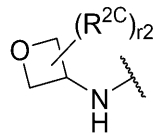
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６６６】



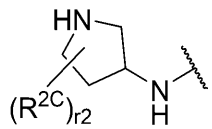
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６６７】



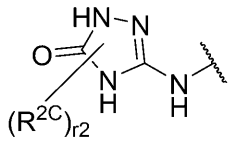
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６６８】



であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６６９】

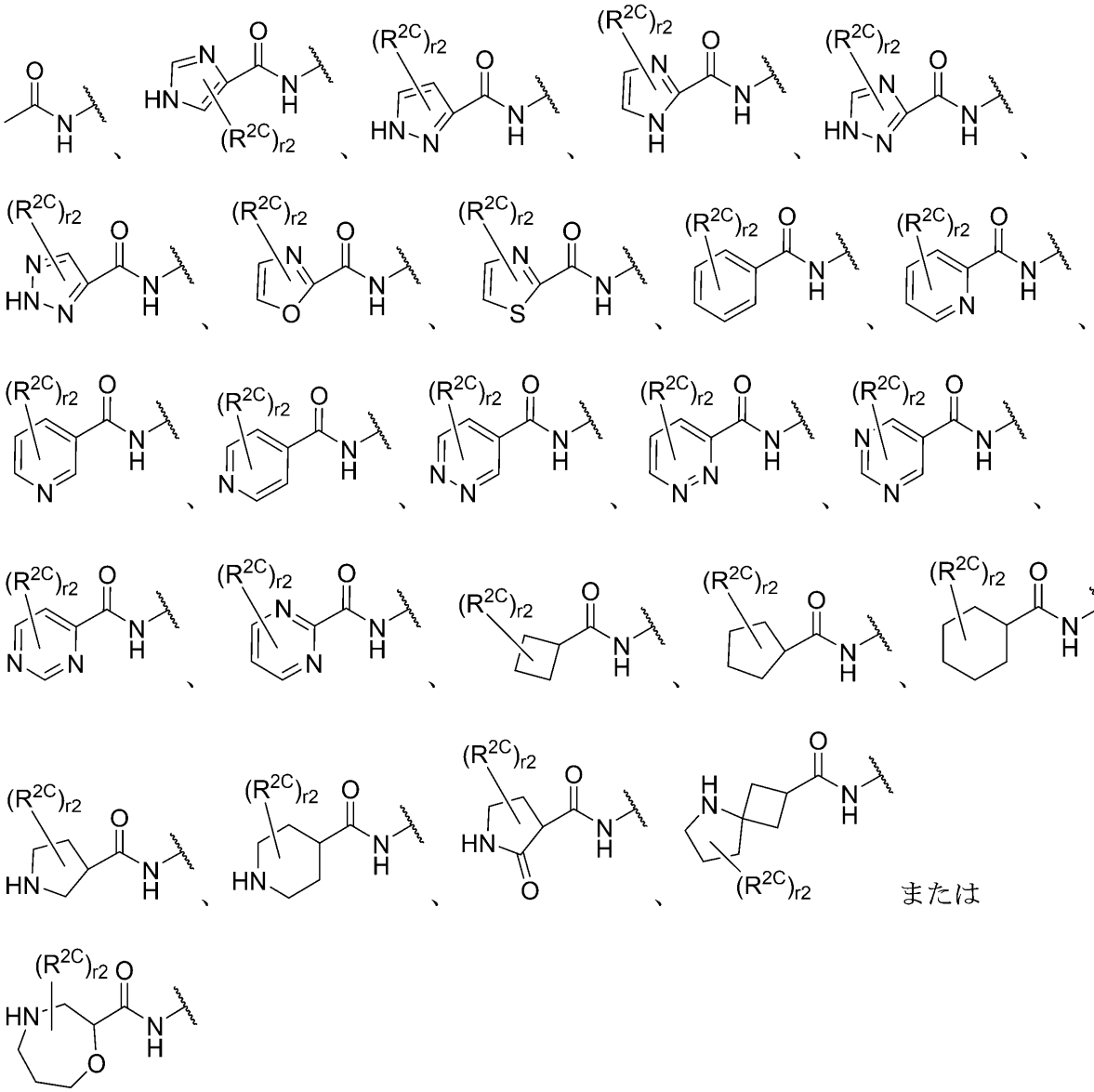


であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１６３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７０】

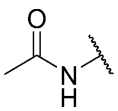


であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１６４】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７１】

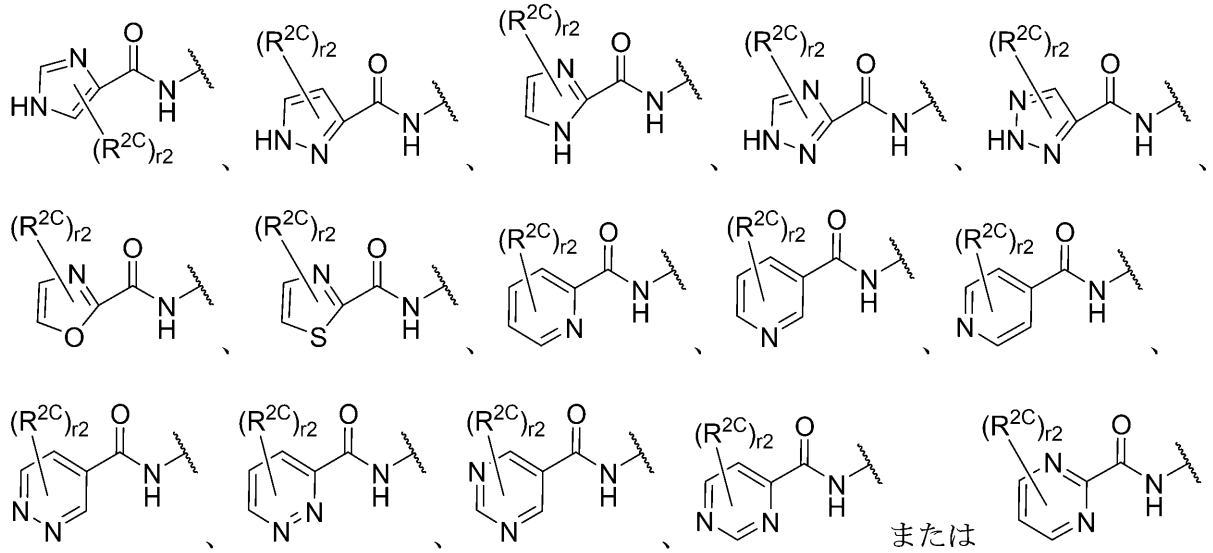


である。

【０１６５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７２】

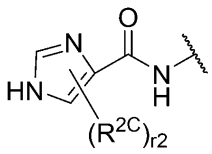


であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１６６】

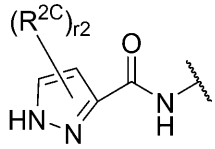
いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７３】



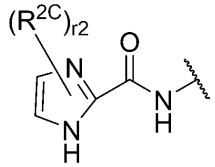
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７４】



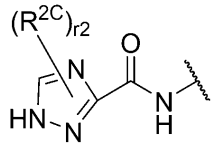
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７５】



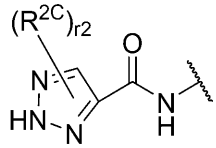
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７６】



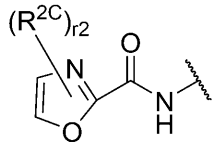
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７７】



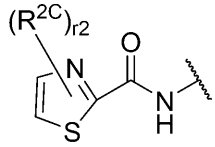
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７８】



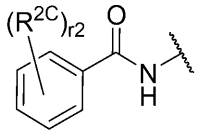
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６７９】



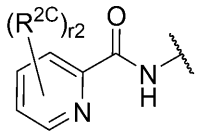
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６８０】



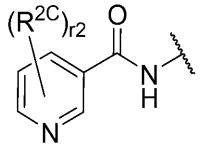
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化６８１】



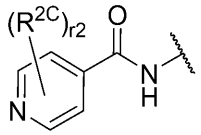
であり、式中、R^{2C}及び$r2$は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６８２】



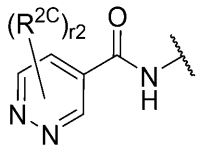
であり、式中、R^{2C}及び$r2$は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６８３】



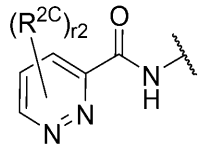
であり、式中、R^{2C}及び$r2$は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６８４】



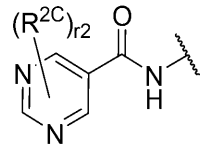
であり、式中、R^{2C}及び$r2$は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６８５】



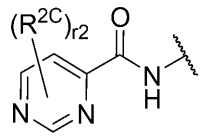
であり、式中、R^{2C}及び$r2$は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６８６】



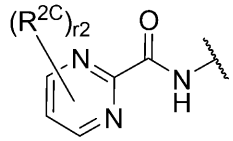
であり、式中、R^{2C}及び$r2$は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化６８７】



であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６８８】

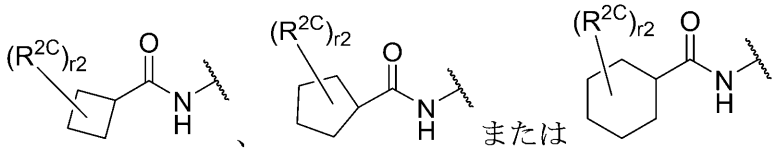


であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１６７】

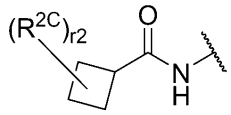
いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６８９】



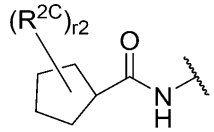
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９０】



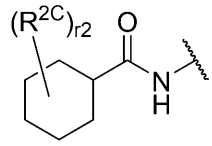
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９１】



であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９２】

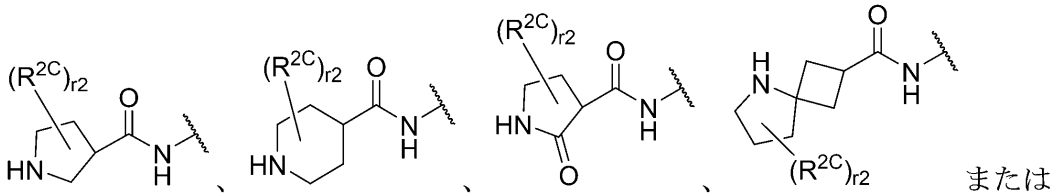


であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

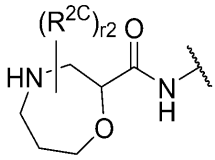
【０１６８】

いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９３】

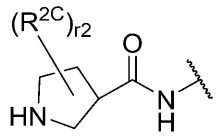


または



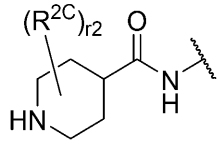
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９４】



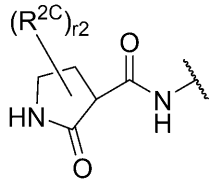
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９５】



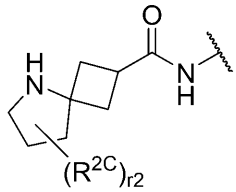
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９６】



であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９７】



であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９８】

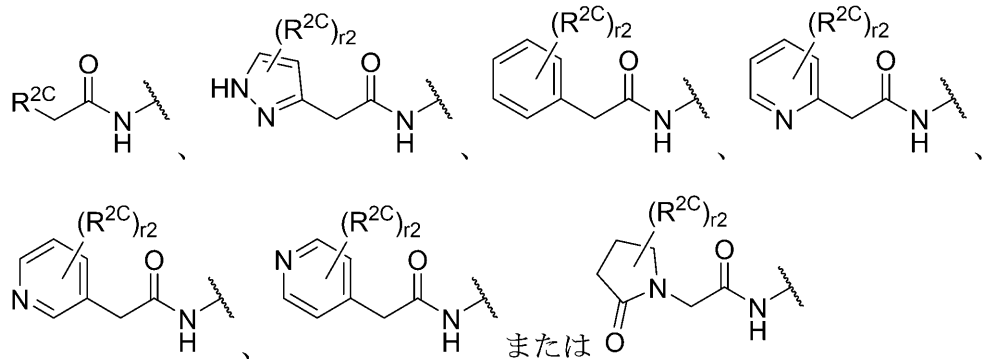


であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１６９】

いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化６９９】

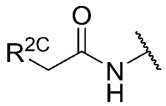


であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１７０】

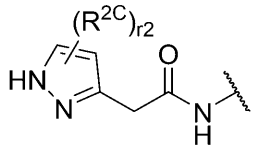
いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化７００】



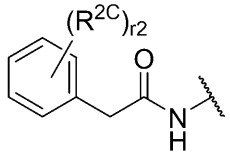
であり、式中、Ｒ２Ｃは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化７０１】



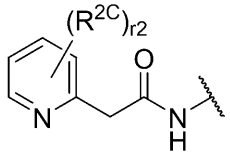
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化７０２】



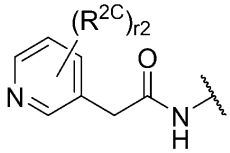
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化７０３】



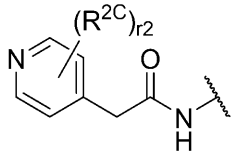
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化７０４】



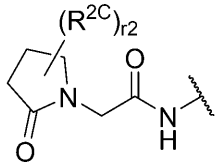
であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化７０５】



であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化７０６】

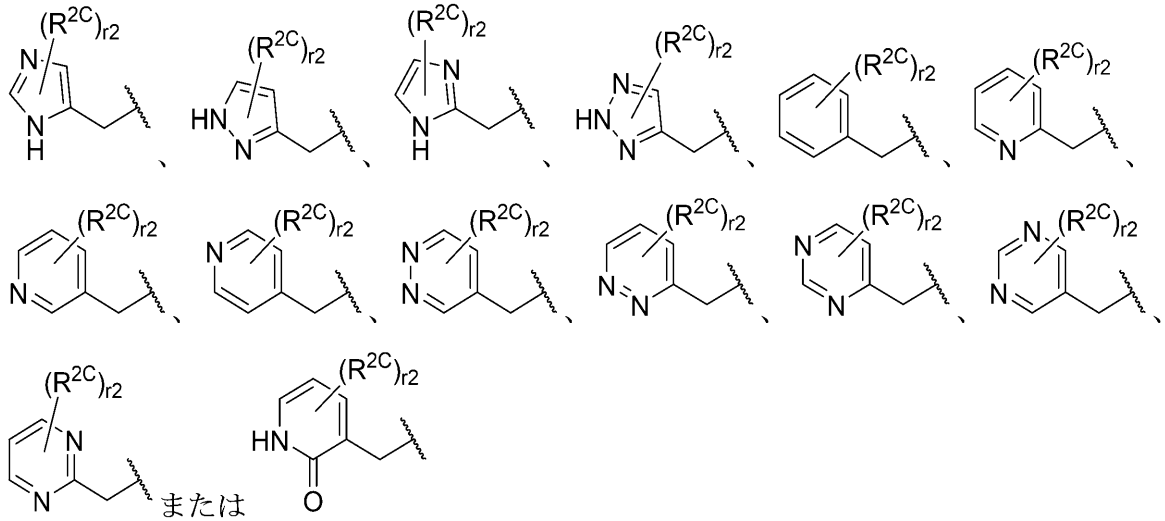


であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１７１】

いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

【化７０７】

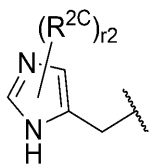


であり、式中、Ｒ２Ａ、Ｒ２Ｃ、及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１７２】

いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２Ａの総称）は、

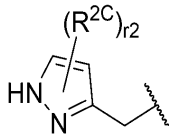
【化７０８】



であり、式中、Ｒ２Ｃ及びｒ２は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ２（すなわち、－Ｌ２－Ｒ２

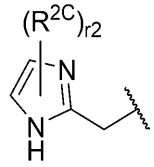
^{A}の総称）は、

【化７０９】



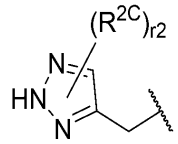
であり、式中、R^{2C}及びr^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^{2}（すなわち、$-L^{2}-R^{2}$ ^{A}の総称）は、

【化７１０】



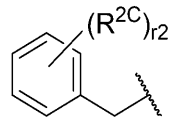
であり、式中、R^{2C}及びr^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^{2}（すなわち、$-L^{2}-R^{2}$ ^{A}の総称）は、

【化７１１】



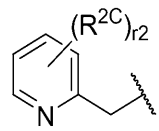
であり、式中、R^{2C}及びr^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^{2}（すなわち、$-L^{2}-R^{2}$ ^{A}の総称）は、

【化７１２】



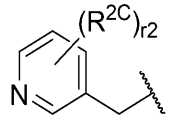
であり、式中、R^{2C}及びr^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^{2}（すなわち、$-L^{2}-R^{2}$ ^{A}の総称）は、

【化７１３】



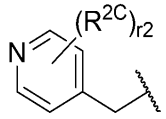
であり、式中、R^{2C}及びr^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^{2}（すなわち、$-L^{2}-R^{2}$ ^{A}の総称）は、

【化７１４】



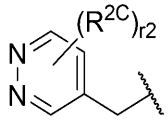
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化７１５】



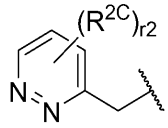
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化７１６】



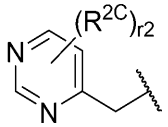
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化７１７】



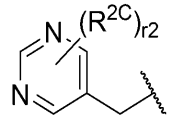
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化７１８】



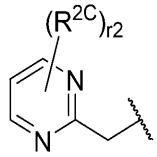
であり、式中、Ｒ^{2C}及びｒ^{2}は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}（すなわち、－Ｌ^{2}－Ｒ^{2A}の総称）は、

【化７１９】



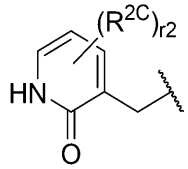
であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化７２０】



であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。いくつかの実施形態において、R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、

【化７２１】



であり、式中、R^{2C}及びr^2は、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０１７３】

いくつかの実施形態において、各R^2（すなわち、$-L^2-R^{2A}$の総称）は、独立して、ハロゲン、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、または１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、各R^2は、独立して、フッ素、塩素、－ＯＣＨ$_3$、または－ＣＨ$_3$である。いくつかの実施形態において、R^2は、－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R^2は、－ＣＨ$_3$である。いくつかの実施形態において、R^2は、－ＯＣＨ$_3$である。いくつかの実施形態において、R^2は、－ＣＦ$_3$である。いくつかの実施形態において、R^2は、－ＣＨＦ$_2$である。

【０１７４】

いくつかの実施形態において、R^2の２つは、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和、部分不飽和もしくは芳香族の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^3個のR^{22C}で置換される。いくつかの実施形態において、R^2の２つは、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和、部分不飽和または芳香族の炭素環を形成し、ここで、環は、p^3個のR^{22C}で置換される。いくつかの実施形態において、R^2の２つは、それらの介在原子と一緒になって、６員の芳香族炭素環を形成し、ここで、環は、p^3個のR^{22C}で置換される。

【０１７５】

いくつかの実施形態において、R^2は、表１の化合物に示される基から選択される。

【０１７６】

上記で全体的に定義されるとおり、各R^Tは、独立して、$-L^T-R^{TA}$であるか、あるいはR^Tの２つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^1個のR^{TTC}で置換されるか、あるいはR^Tの１つとR^1の１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^4個のR^{T1C}で置換されるか、あるい

はR^{T}の１つとR^{L}の１つが、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^{5}個のR^{TLC}で置換される。

【０１７７】

いくつかの実施形態において、各R^{T}は、独立して、－L^{T}－R^{TA}である。いくつかの実施形態において、各R^{T}は、独立して、－R^{TA}である。いくつかの実施形態において、各R^{T}は、独立して、R^{A}である。いくつかの実施形態において、各R^{T}は、独立して、r^{3}個のR^{TC}によって置換されたR^{B}である。

【０１７８】

いくつかの実施形態において、R^{T}（すなわち、－L^{T}－R^{TA}の総称）は、C$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^{3}個のR^{TC}で置換される。

【０１７９】

いくつかの実施形態において、R^{T}は、C$_{1-6}$脂肪族鎖；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^{3}個のR^{TC}で置換される。

【０１８０】

いくつかの実施形態において、R^{T}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、r^{3}個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{T}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^{3}個のR^{TC}で置換される。

【０１８１】

いくつかの実施形態において、R^{T}は、３～７員の飽和単環式炭素環；５～１２員の飽和二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^{3}個のR^{TC}で置換される。いくつかの実施形態において、R^{T}は、３～７員の飽和単環式炭素環；または５～１２員の飽和二環式炭素環であり、そのそれぞれは、r^{3}個のR^{TC}で置換される。いくつかの実施形態において、R^{T}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^{3}個のR^{TC}で置換される。

【０１８２】

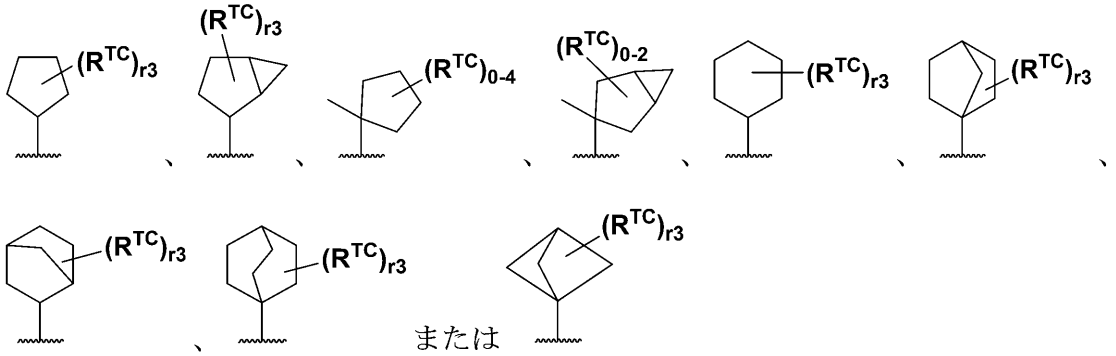
いくつかの実施形態において、R^{T}（すなわち、－L^{T}－R^{TA}の総称）は、r^{3}個のR^{TC}で置換されたC$_{1-6}$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^{T}（すなわち、－L^{T}－R^{TA}の総称）は、r^{3}個のR^{TC}で置換されたフェニルである。いくつ

かの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、r^3個のR^{TC}で置換されたナフチルである。いくつかの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、r^3個のR^{TC}で置換されたクバニルである。いくつかの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、r^3個のR^{TC}で置換されたアダマンチルである。いくつかの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、環は、r^3個のR^{TC}で置換される。いくつかの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、環は、r^3個のR^{TC}で置換される。いくつかの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、環は、r^3個のR^{TC}で置換される。いくつかの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、５～１２員の飽和または部分不飽和の二環式炭素環であり、ここで、環は、r^3個のR^{TC}で置換される。いくつかの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、環は、r^3個のR^{TC}で置換される。いくつかの実施形態において、R^T（すなわち、$-L^T-R^{TA}$の総称）は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、環は、r^3個のR^{TC}で置換される。

【０１８３】

いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７２２】

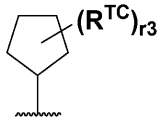


である。

【０１８４】

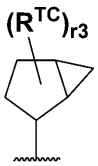
いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７２３】



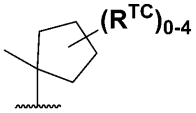
である。いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７２４】



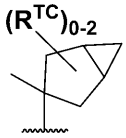
である。いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７２５】



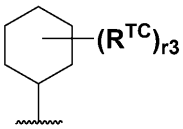
である。いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７２６】



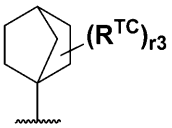
である。いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７２７】



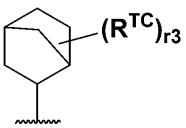
である。いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７２８】



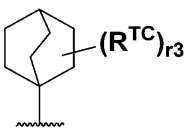
である。いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７２９】



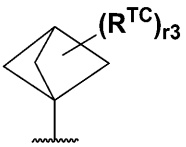
である。いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７３０】



である。いくつかの実施形態において、R^Tは、

【化７３１】



である。いくつかの実施形態において、R^Tは、ＣＦ３である。いくつかの実施形態にお

いて、R^Tは、r^3個のR^{TC}によって置換されたC_{1-6}アルキルである。いくつかの実施形態において、R^Tは、r^3個のR^{TC}によって置換されたC_{3-8}シクロアルキルである。

【０１８５】

いくつかの実施形態において、R^Tの２つは、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^1個のR^{TTC}で置換される。

【０１８６】

いくつかの実施形態において、R^Tの１つとR^1の１つは、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^4個のR^{T1C}で置換される。

【０１８７】

いくつかの実施形態において、R^Tの１つとR^Lの１つは、それらの介在原子と一緒になって、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環を形成し、ここで、環は、p^5個のR^{TLC}で置換される。

【０１８８】

いくつかの実施形態において、R^Tは、表１の化合物に示される基から選択される。

【０１８９】

上記で全体的に定義されるとおり、L^1は、共有結合、またはC_{1-4}の二価の飽和もしくは不飽和の直鎖もしくは分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^1は、共有結合である。いくつかの実施形態において、L^1は、C_{1-4}の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^1は、C_{1-4}の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖である。

【０１９０】

いくつかの実施形態において、L^1は、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^1は、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、または－Ｏ－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^1は、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖である。

【０１９１】

いくつかの実施形態において、L^1は、表１の化合物に示される基から選択される。

【０１９２】

上記で全体的に定義されるとおり、L^2は、共有結合、またはC_{1-4}の二価の飽和もしくは不飽和の直鎖もしくは分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^2は、共有結合である。いくつかの実施形態において、L^2は、C_{1-4}の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^2は、C_{1-4}の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖である。

【０１９３】

いくつかの実施形態において、L^2は、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^2は、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、または－Ｏ－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^2は、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖である。

【０１９４】

いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－ＣＨ（R^L）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＣＨ（R^L）－、－ＣＨ（R^L）Ｏ－、－ＣＨ（R^L）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、R^2は、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－ＣＨ（R^L）Ｎ（Ｒ）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、R^2は、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、R^2は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－または共有結合である。

【０１９５】

いくつかの実施形態において、R^2は、－Ｎ（Ｈ）－、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－、－ＣＨ$_2$Ｎ（Ｈ）－、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_2$－、－ＣＨ$_2$Ｏ－、－ＣＨ$_2$－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、R^2は、－Ｎ（Ｈ）－、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－、－ＣＨ$_2$Ｎ（Ｈ）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、R^2は、－Ｎ（Ｈ）－、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、R^2は、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－または共有結合である。

【０１９６】

いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－または－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－で

ある。いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｒ）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、共有結合である。いくつかの実施形態において、L^2は、－ＣＨ（R^L）Ｎ（Ｒ）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＣＨ（R^L）－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－ＣＨ（R^L）Ｏ－である。いくつかの実施形態において、L^2は、－ＣＨ（R^L）－である。

【０１９７】

いくつかの実施形態において、L^2は、表１の化合物に示される基から選択される。

【０１９８】

上記で全体的に定義されるとおり、L^Qは、共有結合、またはC_{1-4}の二価の飽和もしくは不飽和の直鎖もしくは分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^Qは、共有結合である。いくつかの実施形態において、L^Qは、C_{1-4}の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^Qは、C_{1-4}の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖である。

【０１９９】

いくつかの実施形態において、L^Qは、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、C_{3-6}シクロアルキレン、C_{3-6}ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_2$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^Qは、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（R^L）－、－Ｃ（R^L）$_2$－、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$－、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｎ（Ｒ）－、または－Ｏ－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、L^Qは、C_{1-2}の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖である。

【０２００】

いくつかの実施形態において、L^Qは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＣＨ$_2$－、－Ｎ（Ｒ）－、－ＣＨ$_2$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、L^Qは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ＣＨ$_2$－、－Ｎ（Ｈ）－、－ＣＨ$_2$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、L^Qは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ＣＨ$_2$－、または共有結合である。いくつかの実施形態において、L^Qは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ＣＨ$_2$－である。いくつかの実施形態において、L^Qは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、L^Qは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）ＣＨ$_2$－である。いくつかの実施形態において、L^Qは、－Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、L^Qは、－ＣＨ$_2$

Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、Ｌ^{Q}は、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｈ）－である。いくつかの実施形態において、Ｌ^{Q}は、共有結合である。

【０２０１】

いくつかの実施形態において、Ｌ^{Q}Ｑは、表１の化合物に示される基から選択される。

【０２０２】

上記で全体的に定義されるとおり、Ｌ^{T}は、共有結合、またはＣ$_{1-4}$の二価の飽和もしくは不飽和の直鎖もしくは分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{L}）－、－Ｃ（Ｒ^{L}）$_{2}$－、Ｃ$_{3-6}$シクロアルキレン、Ｃ$_{3-6}$ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、Ｌ^{T}は、共有結合である。いくつかの実施形態において、Ｌ^{T}は、Ｃ$_{1-4}$の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{L}）－、－Ｃ（Ｒ^{L}）$_{2}$－、Ｃ$_{3-6}$シクロアルキレン、Ｃ$_{3-6}$ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、Ｌ^{X}は、Ｃ$_{1-4}$の二価の飽和または不飽和の直鎖または分枝状の炭化水素鎖である。

【０２０３】

いくつかの実施形態において、Ｌ^{T}は、Ｃ$_{1-2}$の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{L}）－、－Ｃ（Ｒ^{L}）$_{2}$－、Ｃ$_{3-6}$シクロアルキレン、Ｃ$_{3-6}$ヘテロシクロアルキレン、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ）－、－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－、－ＯＣ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｏ－、－Ｓ－、－Ｓ（Ｏ）－、または－Ｓ（Ｏ）$_{2}$－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、Ｌ^{T}は、Ｃ$_{1-2}$の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖であり、ここで、鎖の１つまたは２つのメチレン単位は、任意選択により、独立して、－ＣＨ（Ｒ^{L}）－、－Ｃ（Ｒ^{L}）$_{2}$－、－Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）－、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_{2}$－、－Ｓ（Ｏ）$_{2}$Ｎ（Ｒ）－、または－Ｏ－によって置き換えられる。いくつかの実施形態において、Ｌ^{T}は、Ｃ$_{1-2}$の二価の飽和または不飽和の炭化水素鎖である。

【０２０４】

いくつかの実施形態において、Ｌ^{T}は、表１の化合物に示される基から選択される。

【０２０５】

上記で全体的に定義されるとおり、各Ｒ^{1A}は、独立して、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換されたＲ^{A}またはＲ^{B}である。いくつかの実施形態において、各Ｒ^{1A}は、独立して、Ｒ^{A}である。いくつかの実施形態において、各Ｒ^{1A}は、独立して、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換されたＲ^{B}である。

【０２０６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、Ｒ^{1A}は、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２０７】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換される。
【０２０８】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、ここで、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換される。
【０２０９】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、及び任意選択により置換された$C_{1-6}$脂肪族から独立して選択される$r^1$個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{1A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、及び任意選択により置換された$C_{1-6}$脂肪族から独立して選択される$r^1$個の基によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{1A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、及び任意選択により置換された$C_{1-6}$脂肪族から独立して選択される$r^1$個の基によって置換される。
【０２１０】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、１～３個のR^{1C}によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、２個のR^{1C}によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、１個のR^{1C}によって置換されたフェニルである。
【０２１１】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族）、及び任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族から独立し

て選択される１～３個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、ハロゲン及び１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族から独立して選択される１～３個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、フッ素、塩素、－CH_3、－CHF_2、及び－CF_3から独立して選択される１～３個の基によって置換されたフェニルである。

【０２１２】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族）、及び任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族から独立して選択される２個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、ハロゲン及び１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族から独立して選択される２個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、フッ素、塩素、－CH_3、－CHF_2、及び－CF_3から独立して選択される２個の基によって置換されたフェニルである。

【０２１３】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族）、及び任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族から選択される１個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、１個のハロゲンまたは１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、１個のフッ素、塩素、－CH_3、－CHF_2、または－CF_3によって置換されたフェニルである。

【０２１４】

いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または重水素である。

【０２１５】

いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０２１６】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、オキソである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－NO_2である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－NR_2である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{1A}$は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、各$R^{1A}$は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｓ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、

独立して、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、重水素である。

【０２１７】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０２１８】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、ハロゲン、－ＣＮ、または－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＯＲ、－ＳＲ、または－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０２１９】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０２２０】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０２２１】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{1A}$は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{1A}$は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。
【０２２２】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。
【０２２３】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^1個のR^{1C}によって置換される。
【０２２４】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換されたナフチルである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、当該環は、r^1個のR^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリールであり、ここで、当該環は、r^1個のR^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、r^1個のR^{1C}によって置換された５～１２員の飽和または部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、当該環は、r^1個のR^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、当該環は、r^1個のR^{1C}によって置換される。
【０２２５】
いくつかの実施形態において、R^{1A}は、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、r^1個のR^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは

部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２２６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、フェニル；ナフチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２２７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の　飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２２８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、フェニルまたはナフチルであり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２２９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、ナフチル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環または窒素、酸素、

及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２３０】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、フェニルまたは３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、ナフチルまたは５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２３１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２３２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1A}は、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖、フェニル、または３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{1}個のＲ^{1C}によって置換される。

【０２３３】

いくつかの実施形態において、各Ｒ^{1A}は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＲ、またはｒ^{1}個のハロゲンで置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各Ｒ^{1A}は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＲ、または０～５個のハロゲンで置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各Ｒ^{1A}は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（０～５個のハロゲンで置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族鎖）、または０～５個のハロゲンで置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各Ｒ^{1A}は、独立して、ハロゲン、または０～５個のハロゲンで置換されたＣ$_{1-}$

$_6$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、ハロゲン、または０～４個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、ハロゲン、または０～３個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、ハロゲン、または０～３個のハロゲンで置換されたC_{1-3}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、ハロゲン、または０～２個のハロゲンで置換されたC_{1-3}脂肪族鎖である。

【０２３４】

いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、Ｂｒ、Ｃｌ、及びＦから選択されるハロゲンである。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、Ｃｌ及びＦから選択されるハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、Ｃｌである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、Ｆである。

【０２３５】

いくつかの実施形態において、少なくとも１つのR^{1A}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、少なくとも２つのR^{1A}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、少なくとも３つのR^{1A}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{1A}の１つは、Ｃｌである。いくつかの実施形態において、R^{1A}の２つは、Ｃｌである。いくつかの実施形態において、R^{1A}の１つは、Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{1A}の２つは、Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{1A}の１つは、Ｃｌであり、R^{1A}の１つは、Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{1A}の２つは、Ｃｌであり、R^{1A}の１つは、Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{1A}の１つは、Ｃｌであり、R^{1A}の２つは、Ｆである。

【０２３６】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、０～５個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、０～４個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、０～３個のハロゲンで置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、０～３個のハロゲンで置換されたC_{1-3}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、０～２個のハロゲンで置換されたC_{1-3}脂肪族鎖である。

【０２３７】

いくつかの実施形態において、少なくとも１つのR^{1A}は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、少なくとも１つのR^{1A}は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換された－Ｏ－C_{1-3}脂肪族である。

【０２３８】

いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、ハロゲン、－ＯＨ、－ＯＣH_3、または１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、各R^{1A}は、独立して、フッ素、塩素、－ＯＣH_3、または－ＣH_3である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＣH_3である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＯＣH_3である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＣF_3である。いくつかの実施形態において、R^{1A}は、－ＣＨF_2である。

【０２３９】

いくつかの実施形態において、R^{1A}は、表１の化合物に示される基から選択される。

【０２４０】

上記で全体的に定義されるとおり、各R^{2A}は、独立して、r^2個のR^{2C}によって置換されたR^AまたはR^Bである。いくつかの実施形態において、各R^{2A}は、R^Aである。いくつかの実施形態において、各R^{2A}は、r^2個のR^{2C}によって置換されたR^Bである。

【０２４１】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、R^{2A}は、r^2個のR^{2C}によって置換される。

【０２４２】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、R^{2A}は、r^2個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、R^{2A}は、r^2個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{2A}は、r^2個のR^{2C}によって置換される。

【０２４３】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、R^{2A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－$S(O)_2R$、－$S(O)_2NR_2$、－$S(O)_2F$、－$S(O)R$、－$S(O)NR_2$、－$S(O)(NR)R$、－$C(O)R$、－$C(O)OR$、－$C(O)NR_2$、－$C(O)N(R)OR$、－$OC(O)R$、－$OC(O)NR_2$、－$N(R)C(O)OR$、－$N(R)C(O)R$、－$N(R)C(O)NR_2$、－$N(R)C(NR)NR_2$、－$N(R)S(O)_2NR_2$、－$N(R)S(O)_2R$、－$P(O)R_2$、－$P(O)(R)OR$、－$B(OR)_2$、及び任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族から独立して選択されるr^2個の基によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、R^{2A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－$S(O)_2R$、－$S(O)_2NR_2$、－$S(O)_2F$、－$S(O)R$、－$S(O)NR_2$、－$S(O)(NR)R$、－$C(O)R$、－$C(O)OR$、－$C(O)NR_2$、－$C(O)N(R)OR$、－$OC(O)R$、－$OC(O)NR_2$、－$N(R)C(O)OR$、－$N(R)C(O)R$、－$N(R)C(O)NR_2$、－$N(R)C(NR)NR_2$、－$N(R)S(O)_2NR_2$、－$N(R)S(O)_2R$、－$P(O)R_2$、－$P(O)(R)OR$、－$B(OR)_2$、及び任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族から独立して選択されるr^2個の基によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{2A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－$S(O)_2R$、－$S(O)_2NR_2$、－$S(O)_2F$、－$S(O)R$、－$S(O)NR_2$、－$S(O)(NR)R$、－$C(O)R$、－$C(O)OR$、－$C(

Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、及び任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族から独立して選択されるｒ^{2}個の基によって置換される。

【０２４４】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、及び任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族から独立して選択されるｒ^{2}個の基によって置換されたフェニルである。

【０２４５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族）、及び任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族から独立して選択される１～３個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、ハロゲン及び１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族から独立して選択される１～３個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、フッ素、塩素、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、及び－ＣＦ$_3$から独立して選択される１～３個の基によって置換されたフェニルである。

【０２４６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族）、及び任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族から独立して選択される２個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、ハロゲン及び１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族から独立して選択される２個の基によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、フッ素、塩素、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、及び－ＣＦ$_3$から独立して選択される２個の基によって置換されたフェニルである。

【０２４７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｒ^{2A}は、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｒ^{2A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、及び任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族から独立して選択されるｒ^{2}個の基によって置換される。

【０２４８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｒ^{2A}は、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、Ｒ^{2A}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－

NO_2、－OR、－SR、－NR_2、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2NR_2$、－S（O）$_2F$、－S（O）R、－S（O）NR_2、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR_2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR_2、－N（R）C（NR）NR_2、－N（R）S（O）$_2NR_2$、－N（R）S（O）$_2$R、－P（O）R_2、－P（O）（R）OR、または－B（OR）$_2$、及び任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族から独立して選択されるr^{2}個の基によって置換される。

【０２４９】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{2A}は、ハロゲン、－CN、－O－（任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族）、及び任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族から独立して選択される０～２個の基によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{2A}は、ハロゲン及び１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族から独立して選択される０～２個の基によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、ここで、R^{2A}は、フッ素、塩素、－CH_3、－CHF_2、及び－CF_3から独立して選択される０～２個の基によって置換される。

【０２５０】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、オキソ、ハロゲン、－CN、－NO_2、－OR、－SR、－NR_2、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2NR_2$、－S（O）$_2$F、－S（O）R、－S（O）NR_2、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR_2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR_2、－N（R）C（NR）NR_2、－N（R）S（O）$_2NR_2$、－N（R）S（O）$_2$R、－P（O）R_2、－P（O）（R）OR、－B（OR）$_2$、または重水素である。

【０２５１】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、オキソ、ハロゲン、－CN、－NO_2、－OR、－SR、－NR_2、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2NR_2$、－S（O）$_2$F、－S（O）R、－S（O）NR_2、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR_2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR_2、－N（R）C（NR）NR_2、－N（R）S（O）$_2NR_2$、－N（R）S（O）$_2$R、－P（O）R_2、－P（O）（R）OR、または－B（OR）$_2$である。

【０２５２】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、オキソである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－CNである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ORである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－SRである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－S（O）$_2$Rである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－S（O）$_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－S（O）$_2$Fである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－S（O）Rである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－S（O）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－S（O）（NR）Rである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－C（O）Rである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－C（O）ORである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－C（O）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－C（O）N（R）ORである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－OC（O）

Rである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、重水素である。

【０２５３】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０２５４】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ハロゲン、－ＣＮ、または－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ＯＲ、－ＳＲ、または－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０２５５】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０２５６】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０２５７】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形

態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０２５８】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０２５９】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。

【０２６０】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換されたC_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換されたナフチルである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換されたクバニルである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換されたアダマンチルである。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、当該環は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリールであり、ここで、当該環は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換された５～１２員の飽和または部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、当該環は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、当該環は、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。

【０２６１】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、クバニル；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和

の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。
【０２６２】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。
【０２６３】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。
【０２６４】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、フェニルまたはナフチルであり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。
【０２６５】
いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、ナフチル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のＲ^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2A}は、クバニル；アダマンチル；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個

のR^{2C}によって置換される。

【０２６６】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、フェニルまたは３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、ナフチル；クバニル；アダマンチル；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。

【０２６７】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、C$_{1-6}$脂肪族鎖；クバニル；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、C$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、C$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。

【０２６８】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、C$_{1-6}$脂肪族鎖、クバニル、アダマンチル、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、C$_{1-6}$脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{2A}は、C$_{1-6}$脂肪族鎖、フェニル、または３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{2}個のR^{2C}によって置換される。

【０２６９】

いくつかの実施形態において、R^{2A}は、表１の化合物に示される基から選択される。

【０２７０】

上記で全体的に定義されるとおり、各R^{TA}は、独立して、ｒ^{3}個のR^{TC}で置換されたR^{A}またはR^{B}である。いくつかの実施形態において、各R^{T}は、独立して、R^{A}である。いくつかの実施形態において、各R^{T}は、独立して、ｒ^{3}個のR^{TC}で置換されたR^{B}である。

【０２７１】

いくつかの実施形態において、R^{TA}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_{2}$、－Ｏ

Ｒ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または重水素である。

【０２７２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０２７３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、オキソである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、重水素である。

【０２７４】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０２７５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、ハロゲン、－ＣＮ、または－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－ＯＲ、－ＳＲ、または－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TA}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）

$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０２７６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０２７７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０２７８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０２７９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０２８０】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。

【０２８１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換されたＣ$_{1-6}$脂

肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、r^3個のR^{TC}によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、r^3個のR^{TC}によって置換されたナフチルである。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、当該環は、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリールであり、ここで、当該環は、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、r^3個のR^{TC}によって置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、r^3個のR^{TC}によって置換された５～１２員の飽和または部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、当該環は、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、当該環は、r^3個のR^{TC}によって置換される。

【０２８２】

いくつかの実施形態において、R^{TA}は、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。

【０２８３】

いくつかの実施形態において、R^{TA}は、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。

【０２８４】

いくつかの実施形態において、R^{TA}は、フェニル；ナフチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。

【０２８５】

いくつかの実施形態において、R^{TA}は、フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立し

て選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の　飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。

【０２８６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、フェニルまたはナフチルであり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。

【０２８７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、ナフチル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。

【０２８８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、フェニルまたは３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、ナフチルまたは５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ３個のＲ^{ＴＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＡ}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{3}個のＲ^{ＴＣ}によって置換され

る。

【０２８９】

いくつかの実施形態において、R^{TA}は、C_{1-6}脂肪族鎖；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。

【０２９０】

いくつかの実施形態において、R^{TA}は、C_{1-6}脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、C_{1-6}脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^{TA}は、C_{1-6}脂肪族鎖、フェニル、または３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、そのそれぞれは、r^3個のR^{TC}によって置換される。

【０２９１】

いくつかの実施形態において、R^{TA}は、表１の化合物に示される基から選択される。

【０２９２】

上記で全体的に定義されるとおり、各R^Lは、独立して、r^4個のR^{LC}によって置換されたR^AまたはR^Bである。いくつかの実施形態において、各R^Lは、独立して、R^Aである。いくつかの実施形態において、各R^Lは、独立して、r^4個のR^{LC}によって置換されたR^Bである。

【０２９３】

いくつかの実施形態において、R^Lは、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または重水素である。

【０２９４】

いくつかの実施形態において、R^Lは、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０２９５】

いくつかの実施形態において、R^Lは、オキソである。いくつかの実施形態において、R^Lは、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^Lは、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-NO_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^Lは、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-S(O)_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-S(O)_2F$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-S(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-C(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^Lは、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-OC(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-N(R)C(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-N(R)C(NR)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-N(R)S(O)_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-N(R)S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-P(O)R_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-B(OR)_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、重水素である。

【０２９６】

いくつかの実施形態において、R^Lは、ハロゲン、－ＣＮ、$-NO_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、$-C(O)NR_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、$-OC(O)NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または$-B(OR)_2$である。

【０２９７】

いくつかの実施形態において、R^Lは、ハロゲン、－ＣＮ、または$-NO_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－ＯＲ、－ＳＲ、または$-NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、$-C(O)NR_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^Lは、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは$-OC(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、または$-N(R)S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－Ｐ（Ｏ）R_2または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０２９８】

いくつかの実施形態において、R^Lは、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または$-OC(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Lは、－ＳＲ、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Lは、$-NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、または$-N(R)S(O)_2R$である。

【０２９９】

いくつかの実施形態において、R^Lは、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、または

－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０３００】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３０１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３０２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換される。

【０３０３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換されたナフチルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、ここで、当該環は、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリールであり、ここで、当該環は、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換された５～１２員の飽和または部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環であり、ここで、当該環は、ｒ^{4}個のＲ^{ＬＣ}によって置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｌ}は、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和または部分不飽和の二環式複素環であり、ここで、当該環は、ｒ^{4}個のＲ^{ＴＬ}によって置換される。

【０３０４】

いくつかの実施形態において、R^Lは、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。

【０３０５】

いくつかの実施形態において、R^Lは、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^Lは、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。

【０３０６】

いくつかの実施形態において、R^Lは、フェニル；ナフチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^Lは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。

【０３０７】

いくつかの実施形態において、R^Lは、フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の　飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^Lは、ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。

【０３０８】

いくつかの実施形態において、R^Lは、フェニルまたはナフチルであり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^Lは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^Lは、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素

環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。

【０３０９】

いくつかの実施形態において、ＲＬは、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、ナフチル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。

【０３１０】

いくつかの実施形態において、ＲＬは、フェニルまたは３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、ナフチルまたは５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。

【０３１１】

いくつかの実施形態において、ＲＬは、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態において、ＲＬは、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖；フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。

【０３１２】

いくつかの実施形態において、ＲＬは、Ｃ$_{1-6}$脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環であり、そのそれぞれは、ｒ４個のＲＬＣによって置換される。いくつかの実施形態におい

て、R^Lは、C_{1-6}脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。いくつかの実施形態において、R^Lは、C_{1-6}脂肪族鎖、フェニル、または３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環であり、そのそれぞれは、r^4個のR^{LC}によって置換される。

【０３１３】

いくつかの実施形態において、R^Lは、表１の化合物に示される基から選択される。

【０３１４】

上記で全体的に定義されるとおり、R^Aの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、$-NO_2$、－ＯＲ、$-SF_5$、－ＳＲ、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、$-S(O)R$、$-S(O)NR_2$、$-S(O)(NR)R$、$-C(O)R$、$-C(O)OR$、$-C(O)NR_2$、$-C(O)N(R)OR$、$-OC(O)R$、$-OC(O)NR_2$、$-N(R)C(O)OR$、$-N(R)C(O)R$、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、$-P(O)(R)OR$、または$-B(OR)_2$である。

【０３１５】

いくつかの実施形態において、R^Aの各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、$-NO_2$、－ＯＲ、$-SF_5$、－ＳＲ、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、$-S(O)R$、$-S(O)NR_2$、$-S(O)(NR)R$、$-C(O)R$、$-C(O)OR$、$-C(O)NR_2$、$-C(O)N(R)OR$、$-OC(O)R$、$-OC(O)NR_2$、$-N(R)C(O)OR$、$-N(R)C(O)R$、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、$-P(O)(R)OR$、または$-B(OR)_2$である。

【０３１６】

いくつかの実施形態において、R^Aは、オキソである。いくつかの実施形態において、R^Aは、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-NO_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-SF_5$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-S(O)_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-S(O)_2F$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-S(O)R$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-S(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-S(O)(NR)R$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-C(O)R$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-C(O)OR$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-C(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-C(O)N(R)OR$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-OC(O)R$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-OC(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-N(R)C(O)OR$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-N(R)C(O)R$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-N(R)C(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-N(R)C(NR)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-N(R)S(O)_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-N(R)S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-P(O)R_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-P(O)(R)OR$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、$-B(OR)_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、重水素である。

【０３１７】

いくつかの実施形態において、R^Aは、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－$S(O)_2R$、－$S(O)_2NR_2$、－$S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０３１８】

いくつかの実施形態において、R^Aは、ハロゲン、－ＣＮ、または－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＯＲ、－ＳＲ、または－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－$S(O)_2R$、－$S(O)_2NR_2$、－$S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０３１９】

いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３２０】

いくつかの実施形態において、R^Aは、－$S(O)_2R$、－$S(O)_2NR_2$、または－$S(O)_2F$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－$S(O)_2NR_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０３２１】

いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３２２】

いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^Aは、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３２３】

いくつかの実施形態において、R^Aは、表１の化合物に示される基から選択される。

【０３２４】
上記で全体的に定義されるとおり、R^Bの各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；クバニル；アダマンチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。
【０３２５】
いくつかの実施形態において、R^Bは、C_{1-6}脂肪族鎖である。いくつかの実施形態において、R^Bは、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^Bは、ナフチルである。いくつかの実施形態において、R^Bは、クバニルである。いくつかの実施形態において、R^Bは、アダマンチルである。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、３～７員の飽和または部分不飽和の単環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、５～１２員の飽和または部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和または部分不飽和の二環式複素環である。
【０３２６】
いくつかの実施形態において、R^Bは、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。
【０３２７】
いくつかの実施形態において、R^Bは、フェニル；ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。
【０３２８】
いくつかの実施形態において、R^Bは、フェニル；ナフチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテ

ロアリール環；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。

【０３２９】

いくつかの実施形態において、R^Bは、フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の 飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、ナフチル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。

【０３３０】

いくつかの実施形態において、R^Bは、フェニルまたはナフチルである。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。

【０３３１】

いくつかの実施形態において、R^Bは、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、ナフチル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。

【０３３２】

いくつかの実施形態において、R^Bは、フェニルまたは３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、ナフチルまたは５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する８～１０員の二環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。

【０３３３】

いくつかの実施形態において、R^Bは、C_{1-6}脂肪族鎖；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環；窒素、

酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する７～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；ナフチル；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、C_{1-6}脂肪族鎖；フェニル；窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環；３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環；または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。

【０３３４】

いくつかの実施形態において、R^Bは、C_{1-6}脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または５～１２員の飽和もしくは部分不飽和の二環式炭素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、C_{1-6}脂肪族鎖、３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^Bは、C_{1-6}脂肪族鎖、フェニル、または３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式炭素環である。

【０３３５】

いくつかの実施形態において、R^Bは、表１の化合物に示される基から選択される。

【０３３６】

上記で全体的に定義されるとおり、R^{1C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３３７】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３３８】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ

$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、Ｃ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３３９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、オキソである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、重水素である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０３４０】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０３４１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（

Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０３４２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３４３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０３４４】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３４５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３４６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３４７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{1C}の各個は、独立して、任意選択により置

換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３４８】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３４９】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３５０】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{1C}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３５１】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３５２】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３５３】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３５４】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族）、または任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（C_{1-6}脂肪族）、またはC_{1-6}脂肪族であり、ここで、各C_{1-6}脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、ハロゲン、または１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、フッ素、塩素、－CH_3、－CHF_2、または－CF_3である。

【０３５５】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ

、－NO_2、－OR、－SR、－NR_2、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2$$NR_2$、－S（O）$_2$F、－S（O）R、－S（O）$NR_2$、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR_2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR_2、－N（R）C（NR）NR_2、－N（R）S（O）$_2$$NR_2$、－N（R）S（O）$_2$R、－P（O）$R_2$、－P（O）（R）OR、－B（OR）$_2$、または任意選択により置換された$C_{1-6}$脂肪族である。

【０３５６】

いくつかの実施形態において、R^{1C}の各個は、独立して、表１の化合物に示される基から選択される。

【０３５７】

上記で全体的に定義されるとおり、R^{2C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－CN、－NO_2、－OR、－SR、－NR_2、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2$$NR_2$、－S（O）$_2$F、－S（O）R、－S（O）$NR_2$、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR_2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR_2、－N（R）C（NR）NR_2、－N（R）S（O）$_2$$NR_2$、－N（R）S（O）$_2$R、－P（O）$R_2$、－P（O）（R）OR、－B（OR）$_2$、または$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３５８】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－CN、－NO_2、－OR、－SR、－NR_2、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2$$NR_2$、－S（O）$_2$F、－S（O）R、－S（O）$NR_2$、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR_2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR_2、－N（R）C（NR）NR_2、－N（R）S（O）$_2$$NR_2$、－N（R）S（O）$_2$R、－P（O）$R_2$、－P（O）（R）OR、－B（OR）$_2$、または$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３５９】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－CN、－NO_2、－OR、－SR、－NR_2、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2$$NR_2$、－S（O）$_2$F、－S（O）R、－S（O）$NR_2$、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR_2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR_2、－N（R）C（NR）NR_2、－N（R）S（O）$_2$$NR_2$、－N（R）S（O）$_2$R、－P（O）$R_2$、－P（O）（R）OR、または－B（OR）$_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{2C}$の各個は、独立して、$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３６０】

いくつかの実施形態において、R^{2C}は、オキソである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、重水素である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、

ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{2C}$は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、$R^{2C}$は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｓ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{2C}$は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{2C}$は、－Ｐ（Ｏ）$R_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{2C}$は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０３６１】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０３６２】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{2C}$の各個は、独立して、－Ｐ（Ｏ）$R_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０３６３】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３６４】
いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０３６５】
いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３６６】
いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３６７】
いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３６８】
いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３６９】
いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３７０】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３７１】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{2C}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３７２】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３７３】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３７４】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３７５】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族）、または任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（C_{1-6}脂肪族）、またはC_{1-6}脂肪族であり、ここで、各C_{1-6}脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、ハロゲン、または１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、フッ素、塩素、－CH_3、－CHF_2、または－CF_3である。

【０３７６】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または任意選択により置換された$C_{1-6}$脂肪族である。

【０３７７】

いくつかの実施形態において、R^{2C}の各個は、独立して、（ｉ）－Ｏ－（C_{1-6}脂肪族）、－ＯＨ、－Ｎ（C_{1-6}脂肪族）$_2$、及び－ＣＮから独立して選択される１個ま

たは２個の基と、（ｉｉ）ハロゲン及び重水素から独立して選択される１、２、または３個の原子とで任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、（ｉ）－Ｏ－（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）、－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）$_2$、及び－ＣＮから独立して選択される１個または２個の基と、（ｉｉ）１、２、または３個のハロゲン原子とで任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、－Ｏ－（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）、－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）$_2$、及び－ＣＮから独立して選択される１個または２個の基で任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、ハロゲン及び重水素から独立して選択される１、２、または３個の原子で任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、ハロゲンから独立して選択される１、２、または３個の原子で任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。

【０３７８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、または－ＣＮである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、オキソ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）またはＣ$_{1-3}$脂肪族である。

【０３７９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{2C}の各個は、独立して、表１の化合物に示される基から選択される。

【０３８０】

上記で全体的に定義されるとおり、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３８１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環か

ら選択される任意選択により置換された基である。

【０３８２】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TC}$の各個は、独立して、$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３８３】

いくつかの実施形態において、R^{TC}は、オキソである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、重水素である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TC}$は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、$R^{TC}$は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｓ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TC}$は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{TC}$は、－Ｐ（Ｏ）$R_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TC}$は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０３８４】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０３８５】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して

、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０３８６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３８７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０３８８】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３８９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０３９０】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立し

て選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３９１】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３９２】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３９３】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０３９４】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{TC}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３９５】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３９６】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３９７】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０３９８】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族）、または任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、ハロゲン、

－ＣＮ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）、またはＣ$_{1-6}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-6}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、ハロゲン、または１～３個のハロゲンで任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、フッ素、塩素、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、または－ＣＦ$_3$である。

【０３９９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、（ｉ）－Ｏ－（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）、－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）$_2$、及び－ＣＮから独立して選択される１個または２個の基と、（ｉｉ）ハロゲン及び重水素から独立して選択される１、２、または３個の原子とで任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、（ｉ）－Ｏ－（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）、－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）$_2$、及び－ＣＮから独立して選択される１個または２個の基と、（ｉｉ）１、２、または３個のハロゲン原子とで任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、－Ｏ－（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）、－ＯＨ、－Ｎ（Ｃ$_{1-6}$脂肪族）$_2$、及び－ＣＮから独立して選択される１個または２個の基で任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、ハロゲン及び重水素から独立して選択される１、２、または３個の原子で任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、ハロゲンから独立して選択される１、２、または３個の原子で任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。

【０４００】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、または－ＣＮである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、オキソ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）またはＣ$_{1-3}$脂肪族である。

【０４０１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族）、または任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、フッ素、塩素、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＦ$_3$、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、または－ＣＦ$_3$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、フッ素または－ＯＨである。

【０４０２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族）、または任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＣ}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により

置換される。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＦ$_3$、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、または－ＣＦ$_3$である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、または－ＣＨＦ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、重水素、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、または－ＣＨＦ$_2$である。

【０４０３】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族）、または任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＦ$_3$、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、または－ＣＦ$_3$である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、または－ＣＨＦ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、または－ＣＨＦ$_2$である。

【０４０４】

いくつかの実施形態において、R^{TC}の各個は、独立して、表１の化合物に示される基から選択される。

【０４０５】

上記で全体的に定義されるとおり、R^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４０６】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４０７】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TTC}$の各個は、独立して、$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４０８】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、オキソである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、重水素である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TTC}$は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、$R^{TTC}$は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｓ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TTC}$は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{TTC}$は、－Ｐ（Ｏ）$R_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TTC}$は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０４０９】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０４１０】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（

Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０４１１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４１２】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０４１３】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４１４】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４１５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{ＴＴＣ}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員

の単環式ヘテロアリール環である。

【０４１６】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC$_{1-6}$脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４１７】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC$_{1-6}$脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４１８】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４１９】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、C$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４２０】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、C$_{1-6}$脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４２１】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、C$_{1-6}$脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４２２】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４２３】

いくつかの実施形態において、R^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－CN、－NO$_2$、－OR、－SR、－NR$_2$、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2$NR$_2$、－S（O）$_2$F、－S（O）R、－S（O）NR$_2$、－S（O）（NR）R、－C（O）R、

－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。

【０４２４】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族）、または任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、フッ素、塩素、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＦ$_3$、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、または－ＣＦ$_3$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、フッ素または－ＯＨである。

【０４２５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族）、または任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＦ$_3$、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、または－ＣＦ$_3$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、または－ＣＨＦ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、重水素、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、または－ＣＨＦ$_2$である。

【０４２６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族）、または任意選択により置換されたＣ$_{1-3}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（Ｃ$_{1-3}$脂肪族）、またはＣ$_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各Ｃ$_{1-3}$脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－ＯＣＨ$_3$、－ＯＣＦ$_3$、－ＣＨ$_3$、－ＣＨＦ$_2$、または－ＣＦ$_3$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、または－ＣＨＦ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、－ＣＮ、－ＣＨ$_3$、または－ＣＨＦ$_2$である。

【０４２７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{TTC}の各個は、独立して、表１の化合物に示される基から選択される。

【０４２８】

上記で全体的に定義されるとおり、Ｒ^{11C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハ

ロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４２９】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４３０】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}の各個は、独立して、Ｃ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４３１】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、オキソである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、重水素である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}の各個は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{11C}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において

、R^{11C}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｐ（Ｏ）R_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０４３２】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）NR_2、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）R_2、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０４３３】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）NR_2、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）ＲまたはＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｐ（Ｏ）R_2または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０４３４】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）NR_2、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４３５】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）NR_2、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、－Ｓ（Ｏ）NR_2、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$または－Ｓ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０４３６】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４３７】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４３８】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４３９】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４４０】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたＣ$_{1-6}$脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４４１】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４４２】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、Ｃ$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{11C}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつ

かの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４４３】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４４４】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４４５】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４４６】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または任意選択により置換された$C_{1-6}$脂肪族である。

【０４４７】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族）、または任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、フッ素、塩素、－ＯＨ、－ＯＣH_3、－ＯＣF_3、－ＣH_3、－ＣHF_2、または－ＣF_3である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、フッ素または－ＯＨである。

【０４４８】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族）、または任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－ＯＣH_3、－ＯＣF_3、－ＣH_3、－ＣHF_2、または－ＣF_3である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態におい

て、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、－CH_3、または－CHF_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、重水素、－ＣＮ、－CH_3、または－CHF_2である。

【０４４９】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族）、または任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－OCH_3、－OCF_3、－CH_3、－CHF_2、または－CF_3である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、－CH_3、または－CHF_2である。いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、－ＣＮ、－CH_3、または－CHF_2である。

【０４５０】

いくつかの実施形態において、R^{11C}の各個は、独立して、表１の化合物に示される基から選択される。

【０４５１】

上記で全体的に定義されるとおり、R^{22C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４５２】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または$C_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４５３】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ

（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}の各個は、独立して、Ｃ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４５４】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、オキソである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、重水素である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}の各個は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０４５５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０４５６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{22C}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{2}

^{22C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｐ（Ｏ）R_2または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０４５７】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）NR_2、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４５８】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）NR_2、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、－Ｓ（Ｏ）NR_2、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$または－Ｓ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０４５９】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４６０】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４６１】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４６２】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテ

ロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４６３】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４６４】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４６５】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{22C}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４６６】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４６７】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４６８】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４６９】

いくつかの実施形態において、R^{22C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－CN、$-NO_2$、－OR、－SR、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、－S(O)R、$-S(O)NR_2$、－S(O)(NR)R、－C(O)R、－C(O)OR、$-C(O)NR_2$、－C(O)N(R)OR、－OC(O)R、$-OC(O)NR_2$、－N(R)C(O)OR、－N(R)C(O)R、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、－P(O)(R)OR、$-B(OR)_2$、または任意選択により

置換されたC1－6脂肪族である。

【０４７０】

いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC1－3脂肪族）、または任意選択により置換されたC1－3脂肪族である。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、ハロゲン、－ＯＨ、－Ｏ－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、フッ素、塩素、－ＯＨ、－ＯＣＨ3、－ＯＣＦ3、－ＣＨ3、－ＣＨＦ2、または－ＣＦ3である。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、フッ素または－ＯＨである。

【０４７１】

いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC1－3脂肪族）、または任意選択により置換されたC1－3脂肪族である。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、重水素、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－ＯＣＨ3、－ＯＣＦ3、－ＣＨ3、－ＣＨＦ2、または－ＣＦ3である。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、－ＣＨ3、または－ＣＨＦ2である。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、重水素、－ＣＮ、－ＣＨ3、または－ＣＨＦ2である。

【０４７２】

いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC1－3脂肪族）、または任意選択により置換されたC1－3脂肪族である。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－ＯＣＨ3、－ＯＣＦ3、－ＣＨ3、－ＣＨＦ2、または－ＣＦ3である。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、－ＣＨ3、または－ＣＨＦ2である。いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、－ＣＮ、－ＣＨ3、または－ＣＨＦ2である。

【０４７３】

いくつかの実施形態において、R22Cの各個は、独立して、表１の化合物に示される基から選択される。

【０４７４】

上記で全体的に定義されるとおり、RT1Cの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ2、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ2、－Ｓ（Ｏ）2Ｒ、－Ｓ（Ｏ）2ＮＲ2、－Ｓ（Ｏ）2Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ2、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ

）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４７５】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、またはＣ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４７６】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}の各個は、独立して、Ｃ$_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４７７】

いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、オキソである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、重水素である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}の各個は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、Ｒ^{Ｔ１Ｃ}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつか

の実施形態において、R^{T1C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{T1C}$は、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{T1C}$は、－Ｐ（Ｏ）$R_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{T1C}$は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}は、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０４７８】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。

【０４７９】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または－NO_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または－NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）ＲまたはＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{T1C}$の各個は、独立して、－Ｐ（Ｏ）$R_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０４８０】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４８１】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、$R^{T1C}$の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$または－Ｓ（Ｏ）$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{T1C}$の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。

【０４８２】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{T1C}$の各個は、独立して、－Ｎ

（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮR_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４８３】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。

【０４８４】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４８５】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４８６】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４８７】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４８８】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４８９】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族、または

窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４９０】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４９１】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０４９２】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－NO_2、－ＯＲ、－ＳＲ、－NR_2、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）$R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、－Ｂ（ＯＲ）$_2$、または任意選択により置換された$C_{1-6}$脂肪族である。

【０４９３】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族）、または任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、フッ素、塩素、－ＯＨ、－OCH_3、－OCF_3、－CH_3、－CHF_2、または－CF_3である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、フッ素または－ＯＨである。

【０４９４】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族）、または任意選択により置換されたC_{1-3}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（C_{1-3}脂肪族）、またはC_{1-3}脂肪族であり、ここで、各C_{1-3}脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、－OCH_3、－OCF_3、－CH_3、－CHF_2、または－CF_3である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、重水素、－ＣＮ、－CH_3、または－CHF_2である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、重水素、－ＣＮ、－CH_3、または－CHF_2である。

【０４９５】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（任意選択により置換された$Ｃ_{1-3}$脂肪族）、または任意選択により置換された$Ｃ_{1-3}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（$Ｃ_{1-3}$脂肪族）、または$Ｃ_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各$Ｃ_{1-3}$脂肪族は、１つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、－ＯＨ、－Ｏ－（$Ｃ_{1-3}$脂肪族）、または$Ｃ_{1-3}$脂肪族であり、ここで、各$Ｃ_{1-3}$脂肪族は、１～３個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、フッ素、塩素、－ＣＮ、－ＯＨ、$－ＯＣＨ_3$、$－ＯＣＦ_3$、$－ＣＨ_3$、$－ＣＨＦ_2$、または$－ＣＦ_3$である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、フッ素、または－ＯＨである。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、オキソ、－ＣＮ、$－ＣＨ_3$、または$－ＣＨＦ_2$である。いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、－ＣＮ、$－ＣＨ_3$、または$－ＣＨＦ_2$である。

【０４９６】

いくつかの実施形態において、R^{T1C}の各個は、独立して、表１の化合物に示される基から選択される。

【０４９７】

上記で全体的に定義されるとおり、R^{TLC}の各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－ＣＮ、$－ＮＯ_2$、$－ＯＲ$、$－ＳＲ$、$－ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）_2Ｒ$、$－Ｓ（Ｏ）_2ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）_2Ｆ$、$－Ｓ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｓ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ$、$－Ｃ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｃ（Ｏ）ＯＲ$、$－Ｃ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ$、$－ＯＣ（Ｏ）Ｒ$、$－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）_2ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）_2Ｒ$、$－Ｐ（Ｏ）Ｒ_2$、$－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ$、$－Ｂ（ＯＲ）_2$、または$Ｃ_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４９８】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、$－ＮＯ_2$、$－ＯＲ$、$－ＳＲ$、$－ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）_2Ｒ$、$－Ｓ（Ｏ）_2ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）_2Ｆ$、$－Ｓ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｓ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ$、$－Ｃ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｃ（Ｏ）ＯＲ$、$－Ｃ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ$、$－ＯＣ（Ｏ）Ｒ$、$－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）_2ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）_2Ｒ$、$－Ｐ（Ｏ）Ｒ_2$、$－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ$、$－Ｂ（ＯＲ）_2$、または$Ｃ_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０４９９】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、$－ＮＯ_2$、$－ＯＲ$、$－ＳＲ$、$－ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）_2Ｒ$、$－Ｓ（Ｏ）_2ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）_2Ｆ$、$－Ｓ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｓ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ$、$－Ｃ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｃ（Ｏ）ＯＲ$、$－Ｃ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ$、$－ＯＣ（Ｏ）Ｒ$、$－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）_2ＮＲ_2$、$－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）_2Ｒ$、$－Ｐ（Ｏ）Ｒ_2$、$－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ$、または$－Ｂ（ＯＲ）_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、$Ｃ_{1-6}$脂肪族、フェニル、窒素、

酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０５００】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、オキソである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、重水素である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-NO_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-S(O)_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-S(O)_2F$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-S(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-C(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-OC(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-N(R)C(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-N(R)C(NR)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-N(R)S(O)_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-N(R)S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-P(O)R_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、$-B(OR)_2$である。

【０５０１】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、$-NO_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、$-S(O)NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、$-C(O)NR_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、$-OC(O)NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または$-B(OR)_2$である。

【０５０２】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または$-NO_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または$-NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、$-S(O)NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、$-C(O)NR_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは$-OC(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、または$-N(R)S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、$-P(O)R_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。

【０５０３】
いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。
【０５０４】
いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、$R^{TLC}$の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、－Ｓ（Ｏ）$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$または－Ｓ（Ｏ）$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TLC}$の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。
【０５０５】
いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、$R^{TLC}$の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$$NR_2$である。いくつかの実施形態において、$R^{TLC}$の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。
【０５０６】
いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、－NR_2、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。
【０５０７】
いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。
【０５０８】
いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である

。

【０５０９】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC$_{1-6}$脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５１０】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０５１１】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、C$_{1-6}$脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５１２】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、C$_{1-6}$脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５１３】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、C$_{1-6}$脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５１４】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５１５】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－CN、－NO_2、－OR、－SR、－NR_2、－S（O）$_2$R、－S（O）$_2$$NR_2$、－S（O）$_2$F、－S（O）R、－S（O）$NR_2$、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR_2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR_2、－N（R）C（NR）NR_2、－N（R）S（O）$_2$$NR_2$、－N（R）S（O）$_2$R、－P（O）$R_2$、－P（O）（R）OR、－B（OR）$_2$、または任意選択により置換されたC$_{1-6}$脂肪族である。

【０５１６】

いくつかの実施形態において、R^{TLC}の各個は、独立して、ハロゲン、－CN、－OH、－O－（任意選択により置換されたC$_{1-3}$脂肪族）、または任意選択により置換さ

れたC1－3脂肪族である。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、ハロゲン、－OH、－O－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、1～3個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、フッ素、塩素、－OH、－OCH3、－OCF3、－CH3、－CHF2、または－CF3である。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、フッ素または－OHである。

【0517】

いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－CN、－OH、－O－（任意選択により置換されたC1－3脂肪族）、または任意選択により置換されたC1－3脂肪族である。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－CN、－OH、－O－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、1つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－CN、－OH、－O－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、1～3個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、重水素、フッ素、塩素、－CN、－OH、－OCH3、－OCF3、－CH3、－CHF2、または－CF3である。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、重水素、－CN、フッ素、または－OHである。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、重水素、－CN、－CH3、または－CHF2である。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、重水素、－CN、－CH3、または－CHF2である。

【0518】

いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－CN、－OH、－O－（任意選択により置換されたC1－3脂肪族）、または任意選択により置換されたC1－3脂肪族である。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－CN、－OH、－O－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、1つ以上のハロゲン原子で任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－CN、－OH、－O－（C1－3脂肪族）、またはC1－3脂肪族であり、ここで、各C1－3脂肪族は、1～3個のハロゲンで任意選択により置換される。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、フッ素、塩素、－CN、－OH、－OCH3、－OCF3、－CH3、－CHF2、または－CF3である。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、－CN、フッ素、または－OHである。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、オキソ、－CN、－CH3、または－CHF2である。いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、－CN、－CH3、または－CHF2である。

【0519】

いくつかの実施形態において、RTLCの各個は、独立して、表1の化合物に示される基から選択される。

【0520】

上記で全体的に定義されるとおり、RLCの各個は、独立して、オキソ、重水素、ハロゲン、－CN、－NO2、－OR、－SR、－NR2、－S（O）2R、－S（O）2NR2、－S（O）2F、－S（O）R、－S（O）NR2、－S（O）（NR）R、－C（O）R、－C（O）OR、－C（O）NR2、－C（O）N（R）OR、－OC（O）R、－OC（O）NR2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、－N（R）C（O）NR2、－N（R）C（NR）NR2、－N（R）S（O）2NR2、－N（R）S（O）2R、－P（O）R2、－P（O）（R）OR、－B（OR）2、またはC1－6脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される1～2個のヘテロ原子を有する3～7員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、

及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０５２１】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、$-NO_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、$-S(O)NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、$-C(O)NR_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、$-OC(O)NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、$-B(OR)_2$、またはC_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０５２２】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、オキソ、ハロゲン、－ＣＮ、$-NO_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、$-NR_2$、$-S(O)_2R$、$-S(O)_2NR_2$、$-S(O)_2F$、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、$-S(O)NR_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、$-C(O)NR_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、$-OC(O)NR_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、$-N(R)C(O)NR_2$、$-N(R)C(NR)NR_2$、$-N(R)S(O)_2NR_2$、$-N(R)S(O)_2R$、$-P(O)R_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または$-B(OR)_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０５２３】

いくつかの実施形態において、R^{LC}は、オキソである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、重水素である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、ハロゲンである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－ＣＮである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-NO_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－ＳＲである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-S(O)_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-S(O)_2F$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-S(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-C(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－ＯＣ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-OC(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-N(R)C(O)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-N(R)C(NR)NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-N(R)S(O)_2NR_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-N(R)S(O)_2R$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、$-P(O)R_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{LC}は

、－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。
【０５２４】
いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、－ＮＯ$_2$、－ＯＲ、－ＳＲ、－ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$、－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲ、または－Ｂ（ＯＲ）$_2$である。
【０５２５】
いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、ハロゲン、－ＣＮ、または－ＮＯ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＳＲ、または－ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ）ＯＲである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－ＯＣ（Ｏ）Ｒまたは－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｐ（Ｏ）Ｒ$_2$または－Ｐ（Ｏ）（Ｒ）ＯＲである。
【０５２６】
いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－ＯＲ、－ＯＣ（Ｏ）Ｒ、または－ＯＣ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆ、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（ＮＲ）ＮＲ$_2$、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。
【０５２７】
いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｆである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）Ｒ、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）（ＮＲ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｓ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－ＳＲ、－Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒ、－Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$、または－Ｓ（Ｏ）Ｒである。
【０５２８】
いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲまたは－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＮＲ$_2$または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$ＮＲ$_2$である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）ＯＲ、－Ｎ（Ｒ）Ｃ（Ｏ）Ｒ、または－Ｎ（Ｒ）Ｓ（Ｏ）$_2$Ｒである。
【０５２９】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、または－N（R）C（O）NR_2である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－NR_2、－N（R）C（O）OR、または－N（R）C（O）Rである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、－NR_2、－N（R）C（O）OR、－N（R）C（O）R、または－N（R）S（O）$_2$Rである。

【０５３０】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５３１】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５３２】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５３３】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０５３４】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、R^{LC}は、フェニルである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５３５】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５３６】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、C_{1-6}脂肪族またはフェ

ニルである。いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５３７】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５３８】

いくつかの実施形態において、R^{LC}の各個は、独立して、表１の化合物に示される基から選択される。

【０５３９】

上記で全体的に定義されるとおり、Ｒの各個は、独立して、水素、またはC_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基であるか、あるいは同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される０～３個のヘテロ原子を有する４～７員の飽和環、部分不飽和環、またはヘテロアリール環を形成する。

【０５４０】

いくつかの実施形態において、Ｒは、水素、またはC_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される０～３個のヘテロ原子を有する４～７員の飽和環、部分不飽和環、またはヘテロアリール環を形成する。

【０５４１】

いくつかの実施形態において、Ｒは、水素である。いくつかの実施形態において、Ｒは、C_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。いくつかの実施形態において、Ｒは、水素、C_{1-6}脂肪族、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５４２】

いくつかの実施形態において、Ｒは、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒは、任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、Ｒは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５４３】

いくつかの実施形態において、Ｒは、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族、また

は窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、Ｒは、任意選択により置換されたフェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５４４】

いくつかの実施形態において、Ｒは、任意選択により置換されたC_{1-6}脂肪族または任意選択により置換されたフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する任意選択により置換された５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５４５】

いくつかの実施形態において、Ｒは、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環、ならびに窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環から選択される任意選択により置換された基である。

【０５４６】

いくつかの実施形態において、Ｒは、C_{1-6}脂肪族である。いくつかの実施形態において、Ｒは、フェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和または部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、Ｒは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５４７】

いくつかの実施形態において、Ｒは、C_{1-6}脂肪族、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環である。いくつかの実施形態において、Ｒは、フェニル、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５４８】

いくつかの実施形態において、Ｒは、C_{1-6}脂肪族またはフェニルである。いくつかの実施形態において、Ｒは、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５４９】

いくつかの実施形態において、Ｒは、フェニル、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～２個のヘテロ原子を有する３～７員の飽和もしくは部分不飽和の単環式複素環、または窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～４個のヘテロ原子を有する５～６員の単環式ヘテロアリール環である。

【０５５０】

いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する４～７員の飽和環、部分不飽和環、またはヘテロアリール環を形成する。いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素以外の追加のヘテロ原子を有しない４～７員の飽和、部分不飽和またはヘテロアリール環を形成する。

【０５５１】

いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒に

なって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される０～３個のヘテロ原子を有する４～７員の飽和環を形成する。いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される０～３個のヘテロ原子を有する４～７員の部分不飽和環を形成する。いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される０～３個のヘテロ原子を有する４～７員のヘテロアリール環を形成する。

【０５５２】

いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する４～７員の飽和環を形成する。いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する４～７員の部分不飽和環を形成する。いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素に加えて、窒素、酸素、及び硫黄から独立して選択される１～３個のヘテロ原子を有する４～７員のヘテロアリール環を形成する。

【０５５３】

いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素以外の追加のヘテロ原子を有しない４～７員の飽和環を形成する。いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素以外の追加のヘテロ原子を有しない４～７員の部分不飽和環を形成する。いくつかの実施形態において、同じ窒素上の２つのＲ基は、それらの介在原子と一緒になって、当該窒素以外の追加のヘテロ原子を有しない４～７員のヘテロアリール環を形成する。

【０５５４】

いくつかの実施形態において、Ｒは、表１の化合物に示される基から選択される。

【０５５５】

上記で全体的に定義されるとおり、ｎは、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｎは、０である。いくつかの実施形態において、ｎは、１である。いくつかの実施形態において、ｎは、２である。いくつかの実施形態において、ｎは、３である。いくつかの実施形態において、ｎは、４である。いくつかの実施形態において、ｎは、５である。いくつかの実施形態において、ｎは、０または１である。いくつかの実施形態において、ｎは、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、ｎは、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、ｎは、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｎは、１または２である。いくつかの実施形態において、ｎは、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、ｎは、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｎは、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｎは、２または３である。いくつかの実施形態において、ｎは、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｎは、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｎは、３または４である。いくつかの実施形態において、ｎは、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｎは、４または５である。いくつかの実施形態において、ｎは、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５５６】

上記で全体的に定義されるとおり、ｍは、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｍは、０である。いくつかの実施形態において、ｍは、１である。いくつかの実施形態において、ｍは、２である。いくつかの実施形態において、ｍは、３である。いくつかの実施形態において、ｍは、４である。いくつかの実施形態において、ｍは、５である。いくつかの実施形態において、ｍは、０または１である。いくつかの実施形態において、ｍは、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、ｍは、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、ｍは、０、１、２、３

、または４である。いくつかの実施形態において、ｍは、１または２である。いくつかの実施形態において、ｍは、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、ｍは、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｍは、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｍは、２または３である。いくつかの実施形態において、ｍは、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｍは、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｍは、３または４である。いくつかの実施形態において、ｍは、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｍは、４または５である。いくつかの実施形態において、ｍは、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５５７】

上記で全体的に定義されるとおり、ｑは、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｑは、０である。いくつかの実施形態において、ｑは、１である。いくつかの実施形態において、ｑは、２である。いくつかの実施形態において、ｑは、３である。いくつかの実施形態において、ｑは、４である。いくつかの実施形態において、ｑは、５である。いくつかの実施形態において、ｑは、０または１である。いくつかの実施形態において、ｑは、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、ｑは、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、ｑは、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｑは、１または２である。いくつかの実施形態において、ｑは、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、ｑは、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｑは、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｑは、２または３である。いくつかの実施形態において、ｑは、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｑは、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｑは、３または４である。いくつかの実施形態において、ｑは、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｑは、４または５である。いくつかの実施形態において、ｑは、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５５８】

上記で全体的に定義されるとおり、p^1は、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^1は、０である。いくつかの実施形態において、p^1は、１である。いくつかの実施形態において、p^1は、２である。いくつかの実施形態において、p^1は、３である。いくつかの実施形態において、p^1は、４である。いくつかの実施形態において、p^1は、５である。いくつかの実施形態において、p^1は、０または１である。いくつかの実施形態において、p^1は、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、p^1は、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、p^1は、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^1は、１または２である。いくつかの実施形態において、p^1は、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、p^1は、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^1は、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^1は、２または３である。いくつかの実施形態において、p^1は、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^1は、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^1は、３または４である。いくつかの実施形態において、p^1は、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^1は、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５５９】

上記で全体的に定義されるとおり、p^2は、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^2は、０である。いくつかの実施形態において、p^2は、１である。いくつかの実施形態において、p^2は、２である。いくつかの実施形態において、p^2は、３である。いくつかの実施形態において、p^2は、４である。いくつかの実施形態において、p^2は、５である。いくつかの実施形態において、p^2は、０または１である。いくつかの実施形態において、p^2は、０、１、または２である。いくつかの実

施形態において、p^2は、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、p^2は、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^2は、１または２である。いくつかの実施形態において、p^2は、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、p^2は、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^2は、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^2は、２または３である。いくつかの実施形態において、p^2は、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^2は、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^2は、３または４である。いくつかの実施形態において、p^2は、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^2は、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５６０】

上記で全体的に定義されるとおり、p^3は、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^3は、０である。いくつかの実施形態において、p^3は、１である。いくつかの実施形態において、p^3は、２である。いくつかの実施形態において、p^3は、３である。いくつかの実施形態において、p^3は、４である。いくつかの実施形態において、p^3は、５である。いくつかの実施形態において、p^3は、０または１である。いくつかの実施形態において、p^3は、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、p^3は、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、p^3は、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^3は、１または２である。いくつかの実施形態において、p^3は、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、p^3は、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^3は、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^3は、２または３である。いくつかの実施形態において、p^3は、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^3は、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^3は、３または４である。いくつかの実施形態において、p^3は、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^3は、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５６１】

上記で全体的に定義されるとおり、p^4は、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^4は、０である。いくつかの実施形態において、p^4は、１である。いくつかの実施形態において、p^4は、２である。いくつかの実施形態において、p^4は、３である。いくつかの実施形態において、p^4は、４である。いくつかの実施形態において、p^4は、５である。いくつかの実施形態において、p^4は、０または１である。いくつかの実施形態において、p^4は、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、p^4は、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、p^4は、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^4は、１または２である。いくつかの実施形態において、p^4は、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、p^4は、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^4は、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^4は、２または３である。いくつかの実施形態において、p^4は、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、p^4は、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^4は、３または４である。いくつかの実施形態において、p^4は、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、p^4は、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５６２】

上記で全体的に定義されるとおり、r^1は、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^1は、０である。いくつかの実施形態において、r^1は、１である。いくつかの実施形態において、r^1は、２である。いくつかの実施形態において、r^1は、３である。いくつかの実施形態において、r^1は、４である。いくつかの実施形態において、r^1は、５である。いくつかの実施形態において、r^1は、０または１

である。いくつかの実施形態において、r^1は、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、r^1は、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、r^1は、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^1は、１または２である。いくつかの実施形態において、r^1は、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、r^1は、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^1は、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^1は、２または３である。いくつかの実施形態において、r^1は、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^1は、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^1は、３または４である。いくつかの実施形態において、r^1は、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^1は、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５６３】

上記で全体的に定義されるとおり、r^2は、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^2は、０である。いくつかの実施形態において、r^2は、１である。いくつかの実施形態において、r^2は、２である。いくつかの実施形態において、r^2は、３である。いくつかの実施形態において、r^2は、４である。いくつかの実施形態において、r^2は、５である。いくつかの実施形態において、r^2は、０または１である。いくつかの実施形態において、r^2は、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、r^2は、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、r^2は、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^2は、１または２である。いくつかの実施形態において、r^2は、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、r^2は、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^2は、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^2は、２または３である。いくつかの実施形態において、r^2は、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^2は、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^2は、３または４である。いくつかの実施形態において、r^2は、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^2は、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５６４】

上記で全体的に定義されるとおり、r^3は、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^3は、０である。いくつかの実施形態において、r^3は、１である。いくつかの実施形態において、r^3は、２である。いくつかの実施形態において、r^3は、３である。いくつかの実施形態において、r^3は、４である。いくつかの実施形態において、r^3は、５である。いくつかの実施形態において、r^3は、０または１である。いくつかの実施形態において、r^3は、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、r^3は、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、r^3は、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^3は、１または２である。いくつかの実施形態において、r^3は、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、r^3は、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^3は、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^3は、２または３である。いくつかの実施形態において、r^3は、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、r^3は、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^3は、３または４である。いくつかの実施形態において、r^3は、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^3は、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５６５】

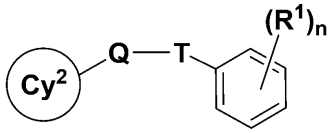
上記で全体的に定義されるとおり、r^4は、０、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、r^4は、０である。いくつかの実施形態において、r^4は、１である。いくつかの実施形態において、r^4は、２である。いくつかの実施形態において、r^4は、３である。いくつかの実施形態において、r^4は、４である。いくつかの実

施形態において、ｒ^{4}は、５である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、０または１である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、０、１、または２である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、０、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、０、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、１または２である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、１、２、または３である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、１、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、１、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、２または３である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、２、３、または４である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、２、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、３または４である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、３、４、または５である。いくつかの実施形態において、ｒ^{4}は、表１の化合物に表される値から選択される。

【０５６６】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｉの化合物を提供し、式中、Ｃｙ^{1}は、ｎ個のＲ^{1}で置換されたフェニルであり、式ＩＩの化合物：

【化７３２】



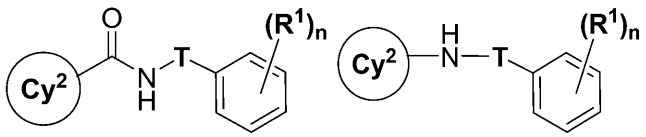
ＩＩ

またはその薬学的に許容される塩を形成し、式中、Ｃｙ^{2}、Ｑ、Ｒ^{1}、Ｔ及びｎのそれぞれは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０５６７】

いくつかの実施形態において、本開示は、式ＩＩの化合物を提供し、式中、Ｑは、－Ｃ（Ｏ）ＮＨ－または－ＮＨ－であり、式ＩＩＩもしくはＩＶの化合物：

【化７３３】



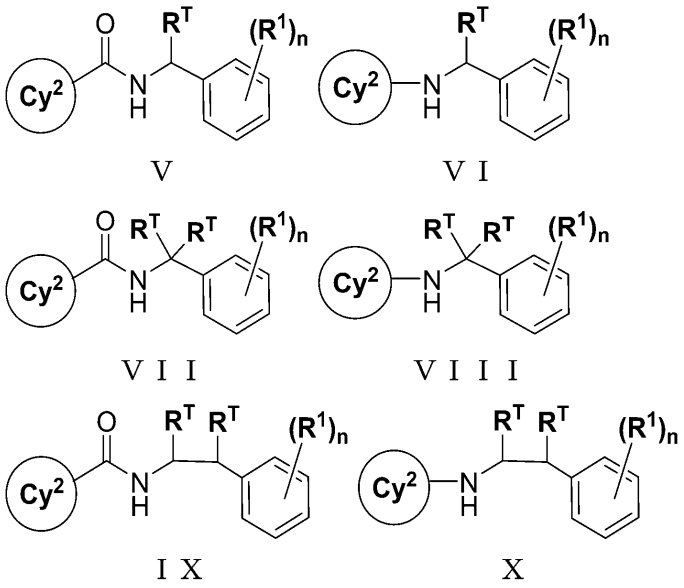
ＩＩＩ　　ＩＶ

またはその薬学的に許容される塩を形成し、Ｃｙ^{2}、Ｒ^{1}、Ｔ及びｎのそれぞれは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０５６８】

いくつかの実施形態において、本開示は、式ＩＩＩまたはＩＶの化合物を提供し、式中、Ｔは、本明細書の実施形態から選択され、式Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、もしくはＸの化合物：

【化７３４】

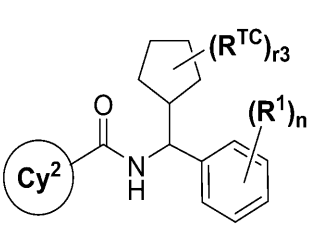


またはその薬学的に許容される塩を形成し、Ｃｙ^{2}、Ｒ^{1}、Ｒ^{Ｔ}及びｎのそれぞれは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

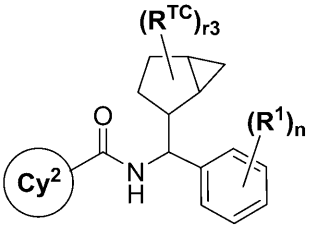
【０５６９】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｖの化合物を提供し、式中、Ｒ^{Ｔ}は、本明細書の実施形態から選択され、式ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、もしくはＸＩＸの化合物：

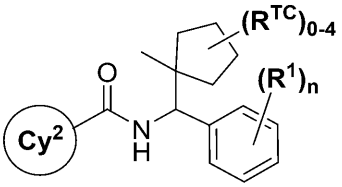
【化７３５】



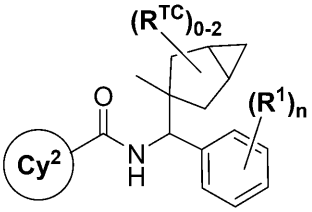
ＸＩ



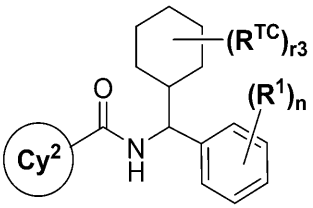
ＸＩＩ



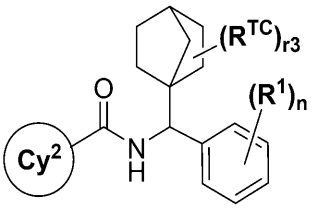
ＸＩＩＩ



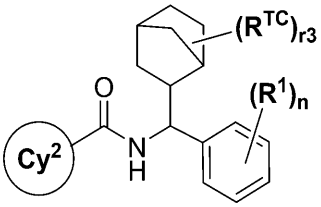
ＸＩＶ



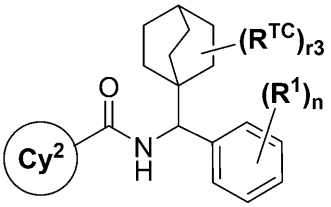
ＸＶ



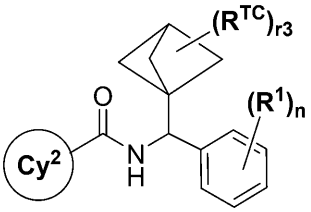
ＸＶＩ



ＸＶＩＩ



ＸＶＩＩＩ



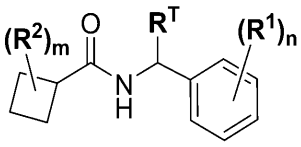
ＸＩＸ

またはその薬学的に許容される塩を形成し、Ｃｙ^{2}、Ｒ^{1}、Ｒ^{ＴＣ}、ｎ及びｒ^{3}のそれぞれは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

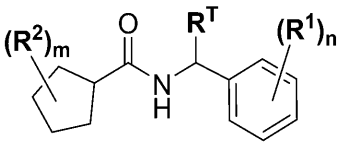
【０５７０】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｖの化合物を提供し、式中、Ｃｙ^{2}は、本明細書の実施形態から選択され、式ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、もしくはＸＸＶの化合物：

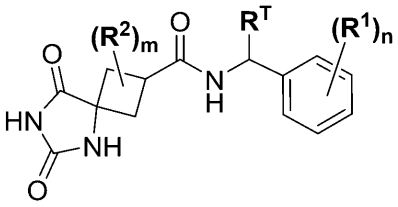
【化７３６】



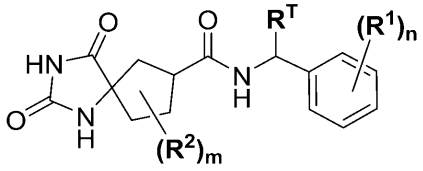
ＸＸ



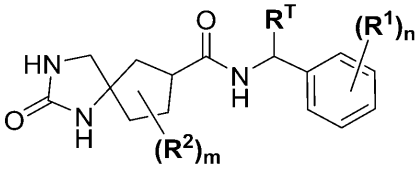
ＸＸＩ



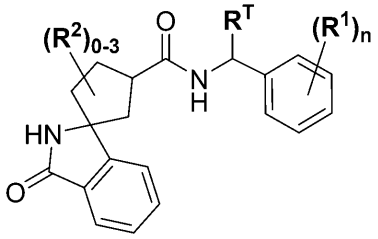
ＸＸＩＩ



ＸＸＩＩＩ



ＸＸＩＶ



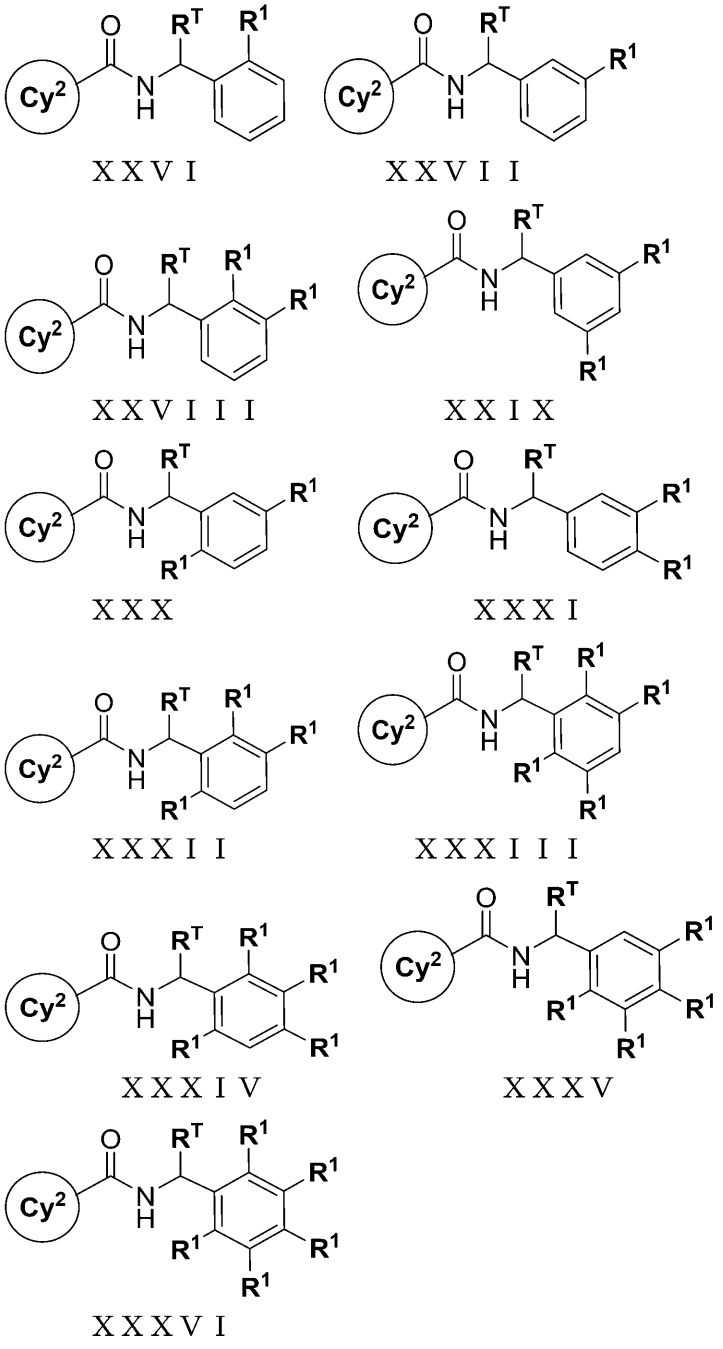
ＸＸＶ

またはその薬学的に許容される塩を形成し、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{Ｔ}、ｎ及びｍのそれぞれは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０５７１】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｖの化合物を提供し、式中、ｎ及びＲ^{1}の位置（複数可）は、本明細書のＣｙ^{1}の実施形態から選択され、式ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、及びＸＸＸＶＩの化合物：

【化７３７】



ＸＸＶＩ ＸＸＶＩＩ

ＸＸＶＩＩＩ ＸＸＩＸ

ＸＸＸ ＸＸＸＩ

ＸＸＸＩＩ ＸＸＸＩＩＩ

ＸＸＸＩＶ ＸＸＸＶ

ＸＸＸＶＩ

またはその薬学的に許容される塩を形成し、Ｃｙ^{2}、Ｒ^{1}、及びＲ^{Ｔ}のそれぞれは、本明細書の実施形態ならびにクラス及びサブクラスで定義されるとおりである。

【０５７２】

いくつかの実施形態において、本開示は、式Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、Ｘ、ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、ＸＩＸ、ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、ＸＸＶ、ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、またはＸＸＸＶＩの化合物を提供し、式中、Ｌ^{1}は、共有結合であり、Ｒ^{2}は、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－Ｒ^{2Ａ}、－Ｎ（Ｈ）－Ｒ^{2Ａ}、－ＣＨ$_{2}$－Ｒ^{2Ａ}、または－Ｒ^{2Ａ}である。

【０５７３】

いくつかの実施形態において、本開示は、Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、Ｘ、ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、Ｘ

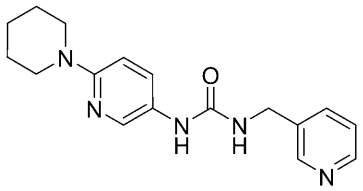
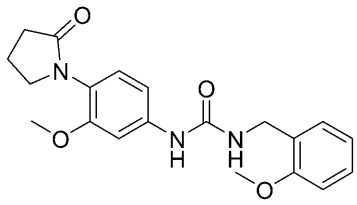
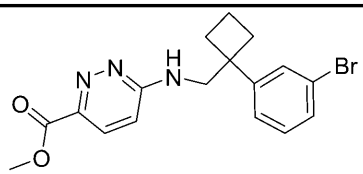
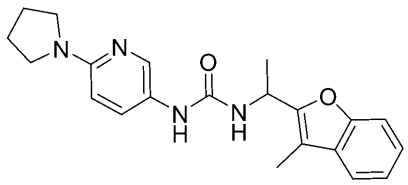
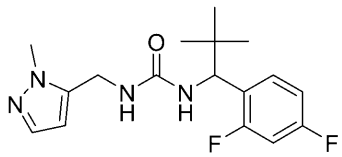
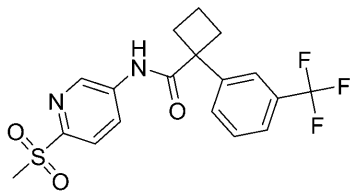
ＶＩＩＩ、ＸＩＸ、ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、ＸＸＶ、ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、またはＸＸＸＶＩの化合物を提供し、式中、L^1は、共有結合であり、R^2は、－Ｎ（Ｈ）Ｃ（Ｏ）－R^{2A}である。いくつかの実施形態において、本開示は、Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、Ｘ、ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、ＸＩＸ、ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、ＸＸＶ、ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、またはＸＸＸＶＩの化合物を提供し、式中、L^1は、共有結合であり、R^2は、－Ｎ（Ｈ）－R^{2A}である。いくつかの実施形態において、本開示は、Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、Ｘ、ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、ＸＩＸ、ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、ＸＸＶ、ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、またはＸＸＸＶＩの化合物を提供し、式中、L^1は、共有結合であり、R^2は、$-CH_2-R^{2A}$である。いくつかの実施形態において、本開示は、Ｉ、ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、Ｘ、ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、ＸＩＸ、ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、ＸＸＶ、ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、またはＸＸＸＶＩの化合物を提供し、式中、L^1は、共有結合であり、R^2は、－R^{2A}である。

【０５７４】

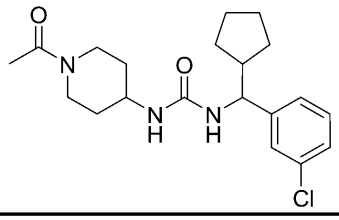
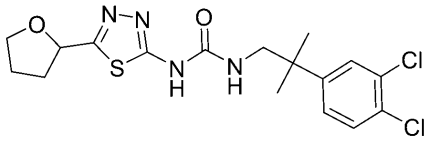
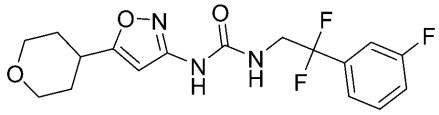
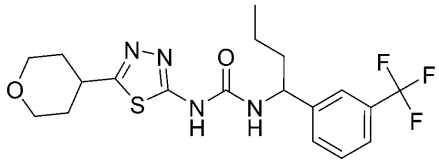
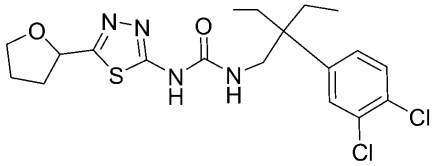
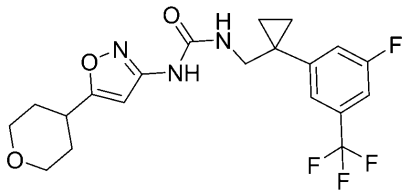
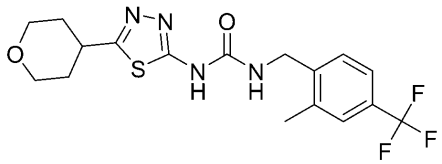
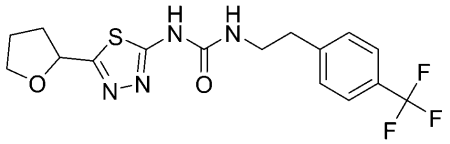
本開示の化合物の例としては、本明細書の表及び例示に列挙される化合物、またはその薬学的に許容される塩、立体異性体、もしくは立体異性体の混合物が挙げられる。いくつかの実施形態において、本開示は、以下の表１に示されるものから選択される化合物、またはその薬学的に許容される塩、立体異性体、もしくは立体異性体の混合物を提供する。いくつかの実施形態において、本開示は、以下の表１に記載される化合物、またはその薬学的に許容される塩を提供する。いくつかの実施形態において、本開示は、以下の表１に記載される化合物を提供する。

【表１－１】

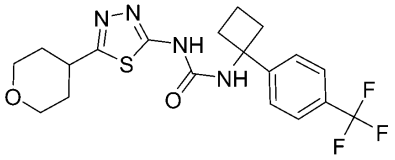
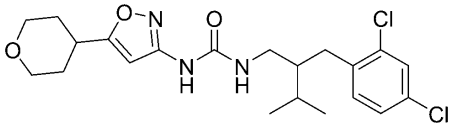
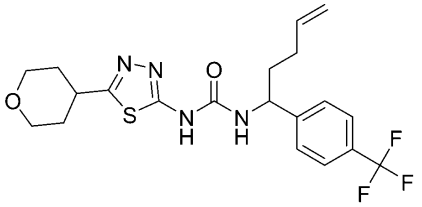
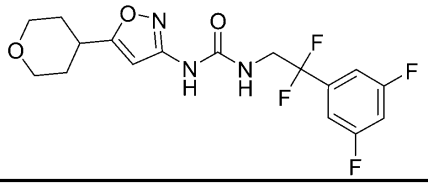
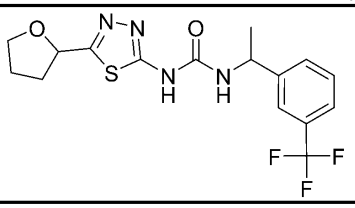
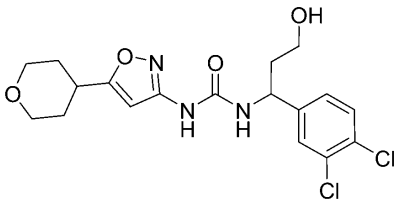
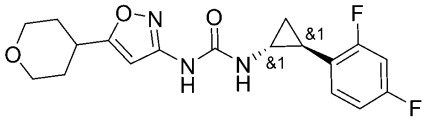
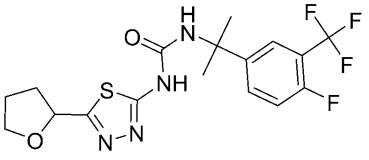
表 1.生物活性データを伴う本開示の代表的な化合物。

実施例番号	構造	^{1}H NMR	MS	ADP-Glo IC50	MCF 10A IC50
I-1				E	
I-2				E	
I-3			378.2	D	
I-4				E	
I-5				D	
I-6				E	B

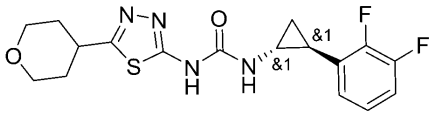
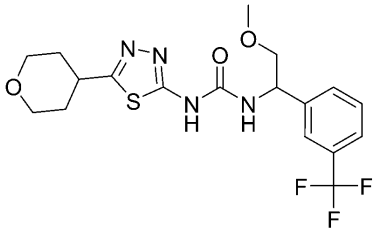
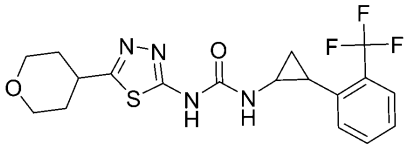
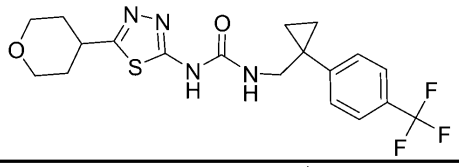
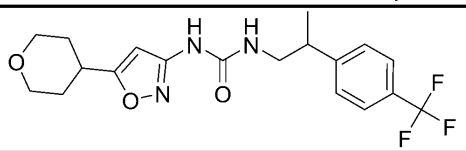
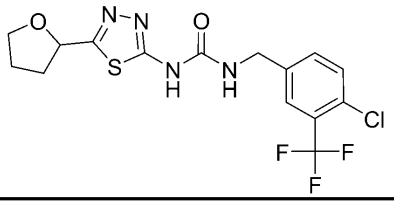
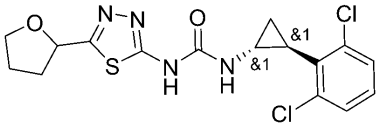
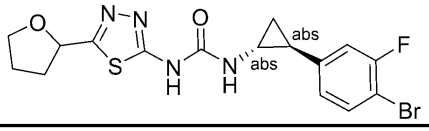
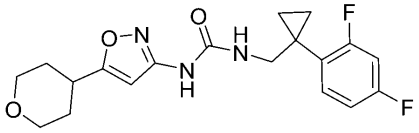
【表１－２】

I-7				E	
I-8				E	
I-9				E	
I-10				E	
I-11				E	
I-12				E	
I-13				E	
I-14				E	

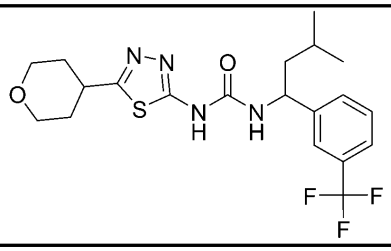
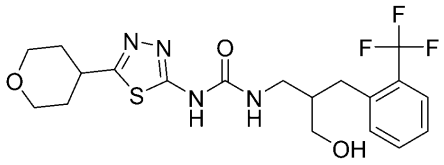
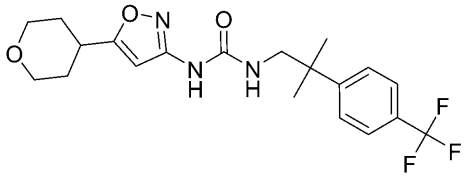
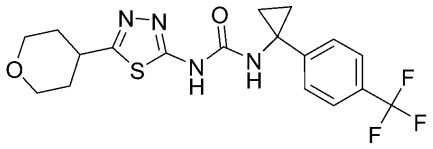
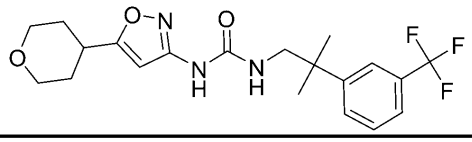
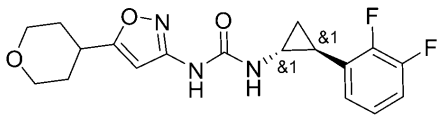
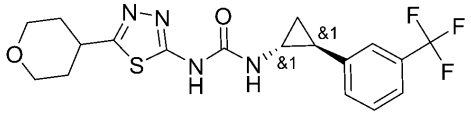
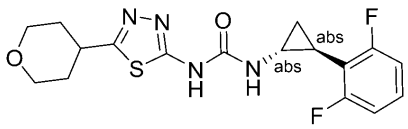
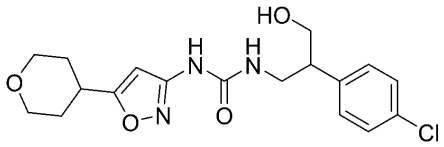
【表１－３】

I-15				E	
I-16				E	
I-17				E	
I-18				E	
I-19				E	
I-20				E	
I-21				E	
I-22				E	

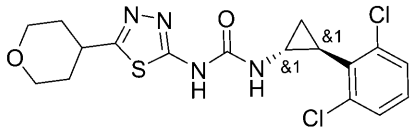
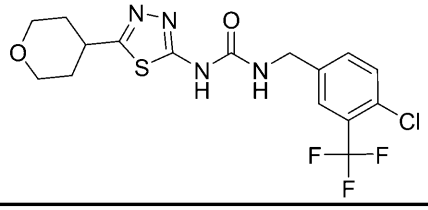
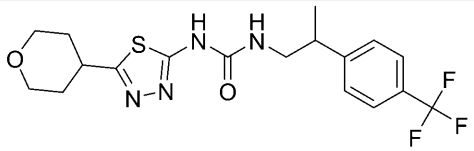
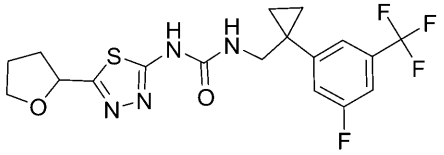
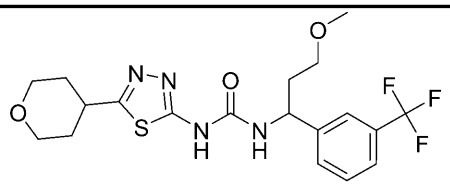
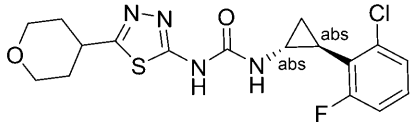
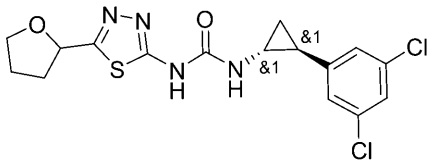
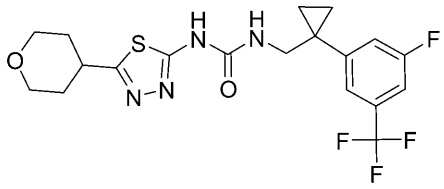
【表１－４】

I-23				E	
I-24				E	
I-25				E	
I-26				E	
I-27				E	
I-28				E	
I-29				E	
I-30				E	
I-31				E	

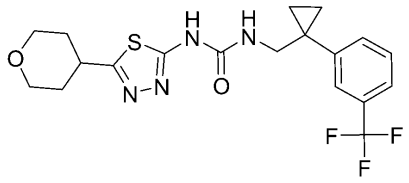
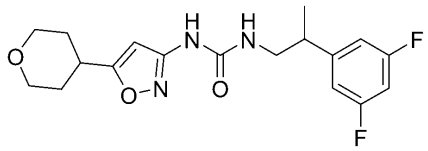
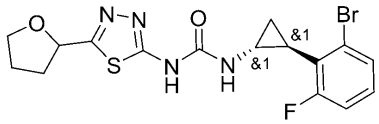
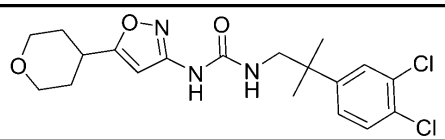
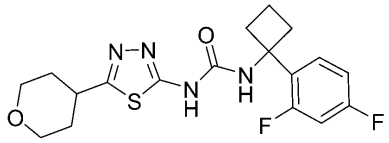
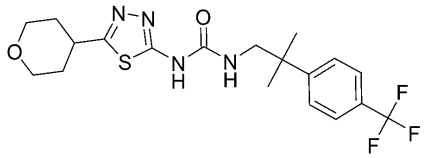
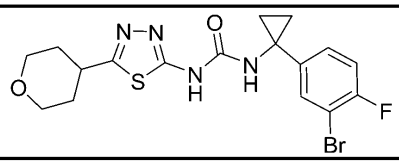
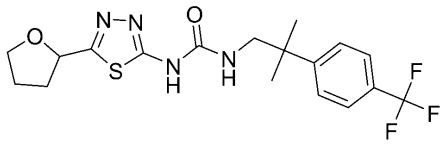
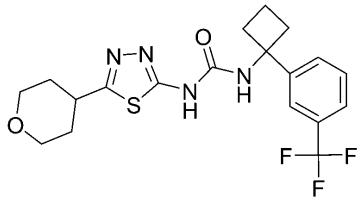
【表１－５】

I-32				E	
I-33				E	
I-34				E	
I-35				E	
I-36				E	
I-37				E	
I-38				E	
I-39				E	
I-40				E	

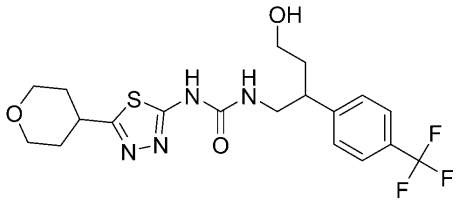
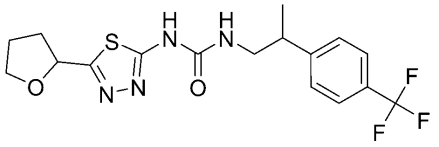
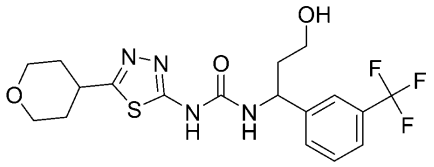
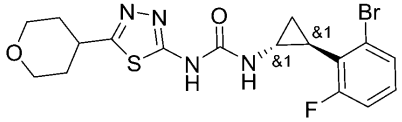
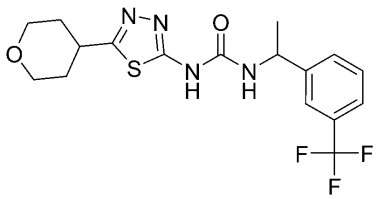
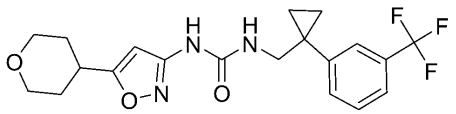
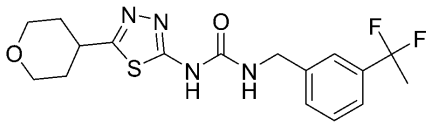
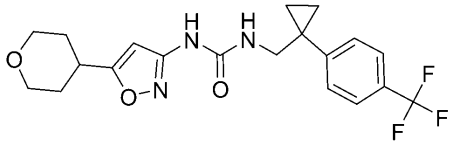
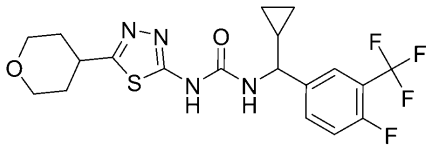
【表１－６】

I-41				E	
I-42				E	
I-43				E	
I-44				E	
I-45				E	
I-46				E	
I-47				E	
I-48				E	

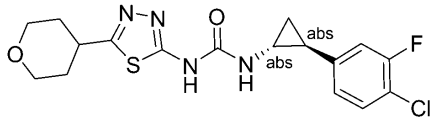
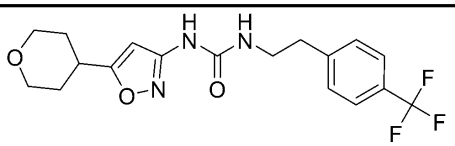
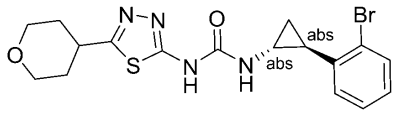
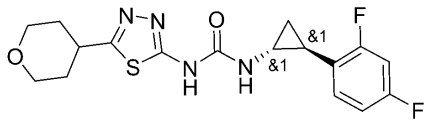
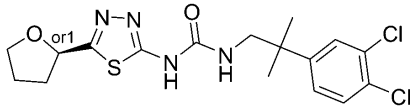
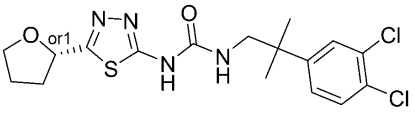
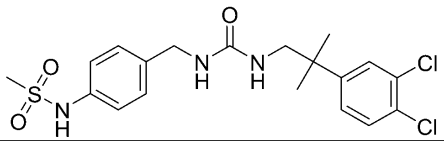
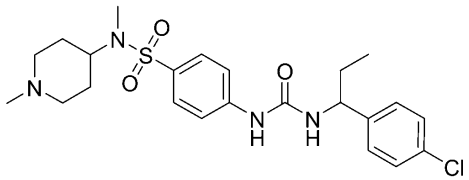
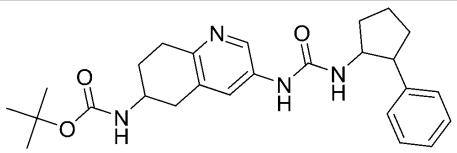
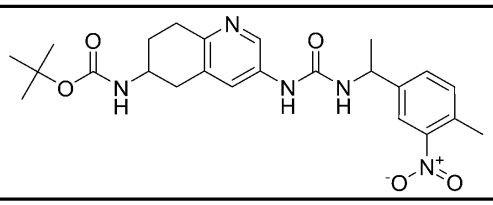
【表１－７】

I-49				E	
I-50				E	
I-51				E	
I-52				E	
I-53				E	
I-54				E	
I-55				E	
I-56				E	
I-57				E	

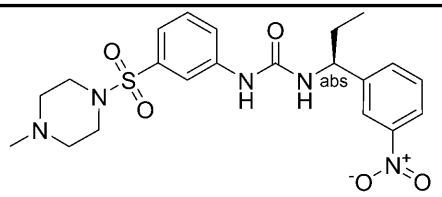
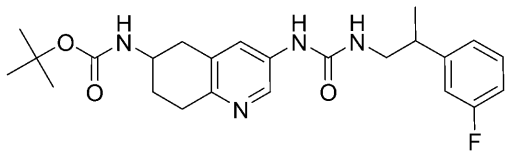
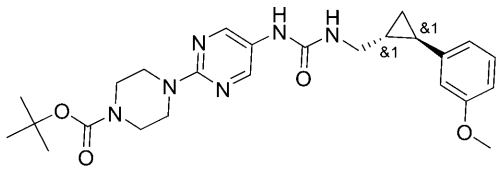
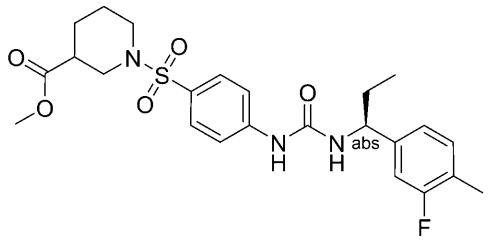
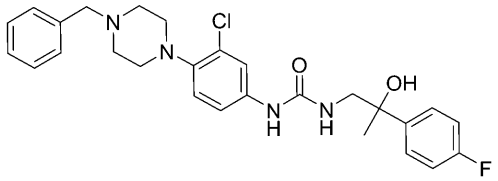
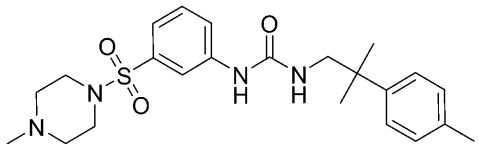
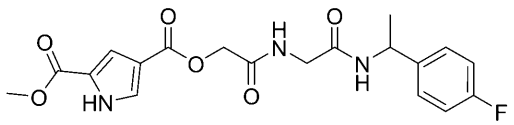
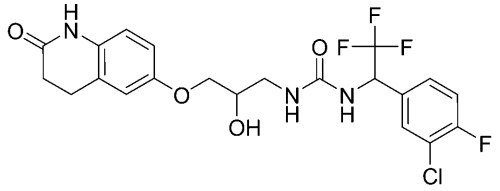
【表１－８】

I-58				E	
I-59				E	
I-60				E	
I-61				E	
I-62				E	
I-63				E	
I-64				E	
I-65				E	
I-66				E	

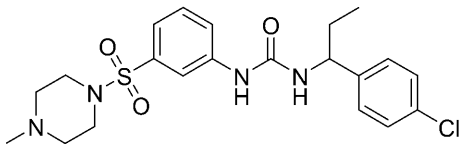
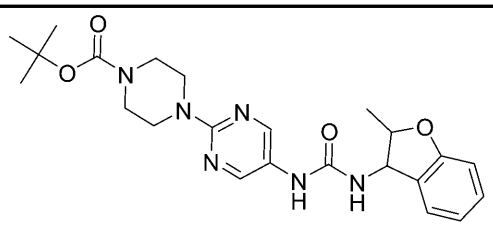
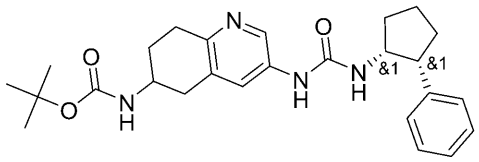
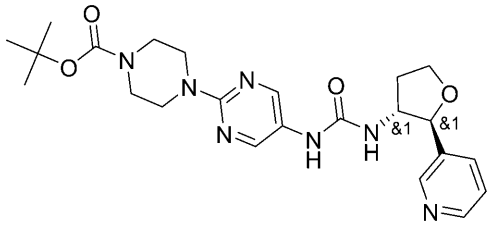
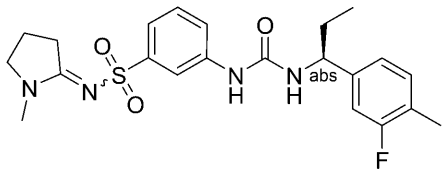
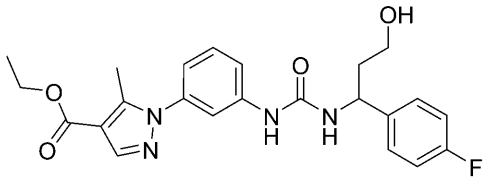
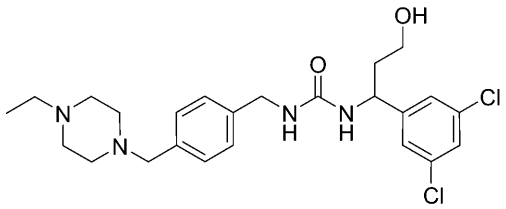
【表１－９】

I-67				E	
I-68				E	
I-69				E	
I-70				E	
I-71				E	
I-72				E	
I-73				E	
I-74				E	
I-75				E	
I-76				E	

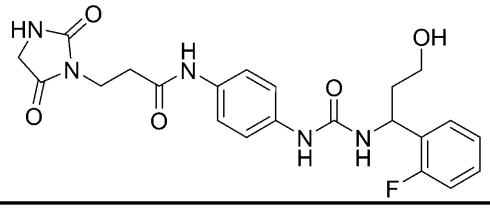
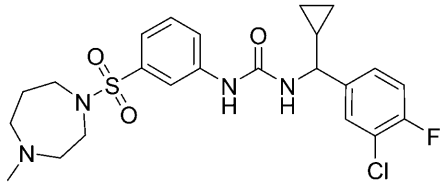
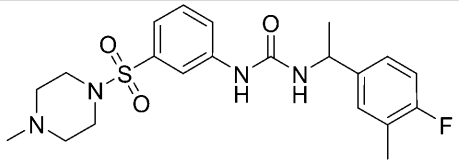
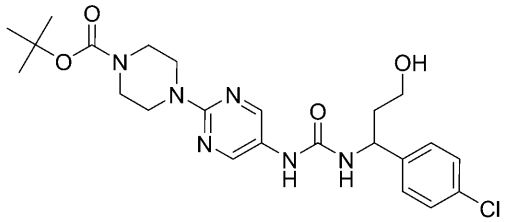
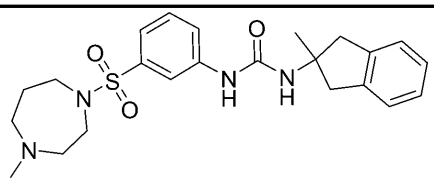
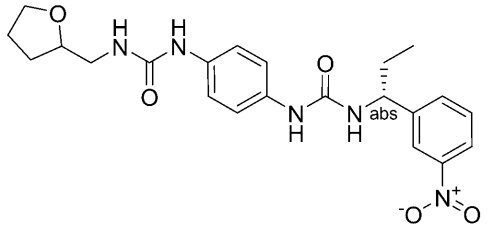
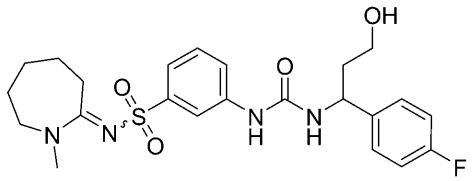
【表１－１０】

I-77				E	
I-78				E	
I-79				E	
I-80				D	
I-81				E	
I-82				E	
I-83				E	
I-84				E	

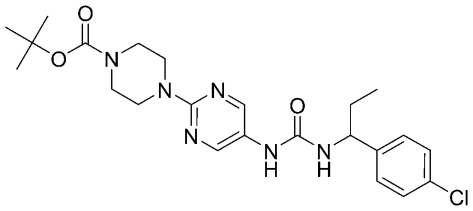
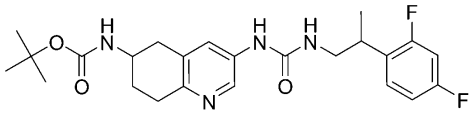
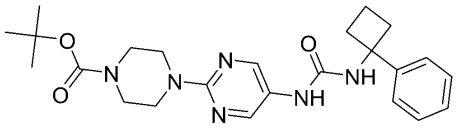
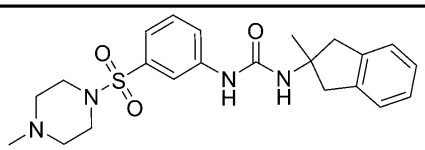
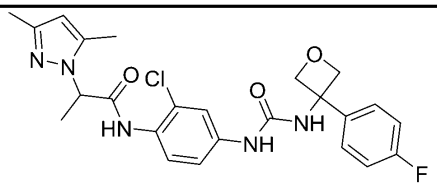
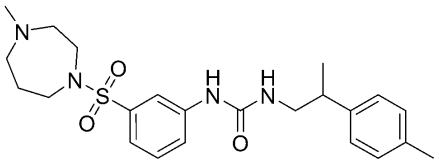
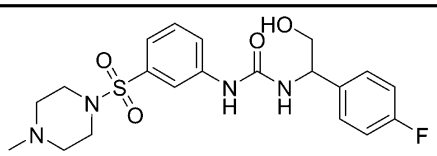
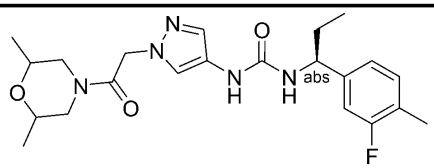
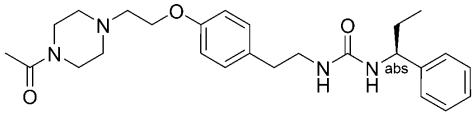
【表１－１１】

I-85				E	
I-86				E	
I-87				D	
I-88				E	
I-89				E	
I-90				E	
I-91				E	

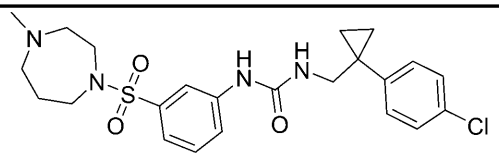
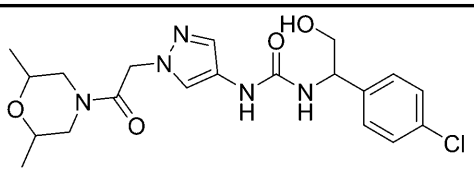
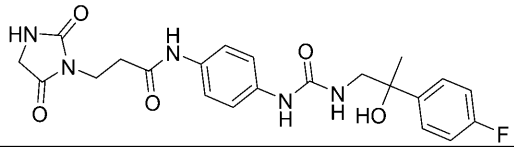
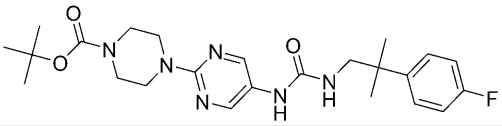
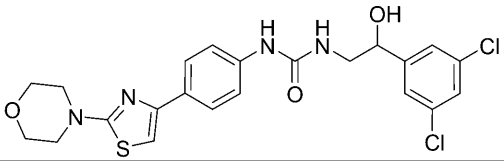
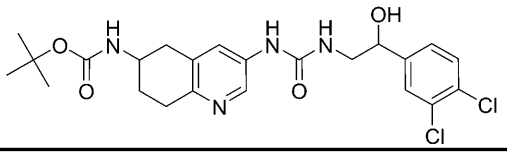
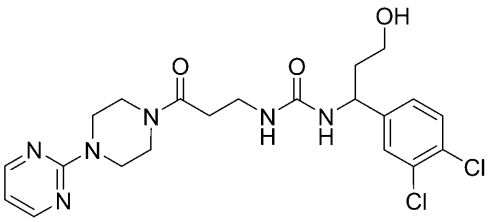
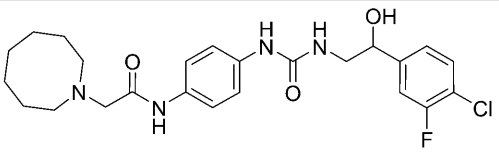
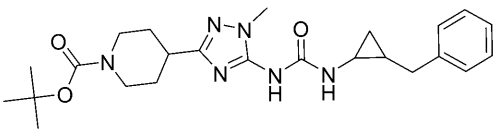
【表１－１２】

I-92				E	
I-93				E	
I-94				E	
I-95				E	
I-96				E	
I-97				E	
I-98				E	

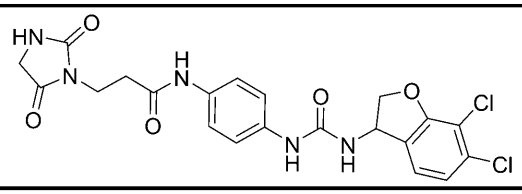
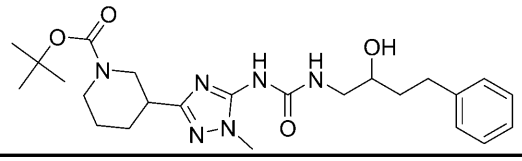
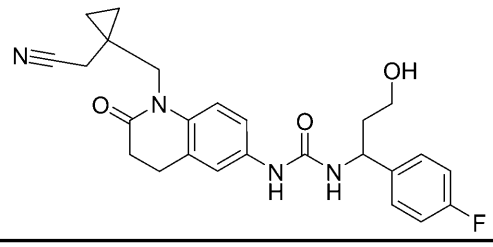
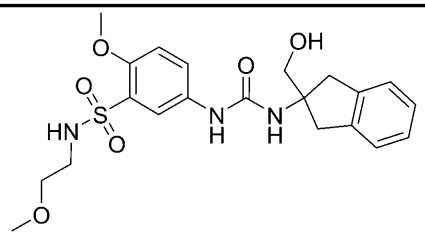
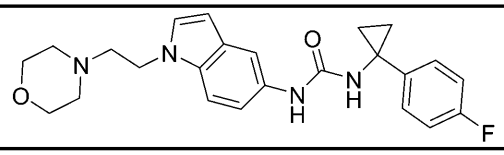
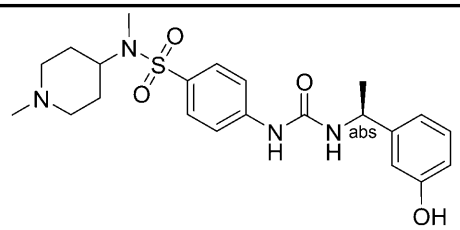
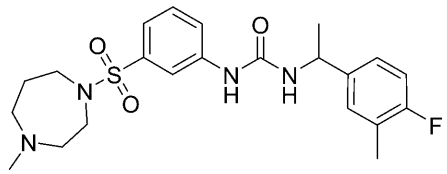
【表１－１３】

I-99				E	
I-100				E	
I-101				E	
I-102				E	
I-103				E	
I-104				E	
I-105				E	
I-106				E	
I-107				E	

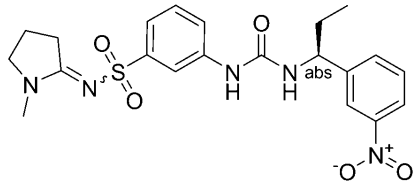
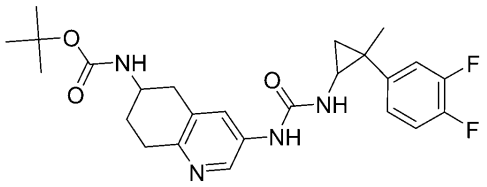
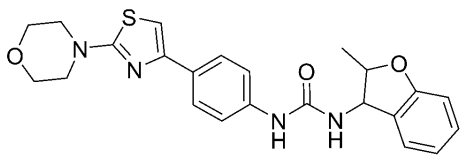
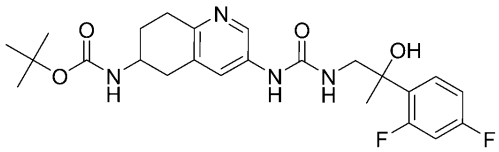
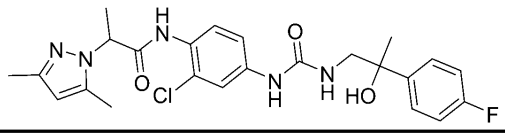
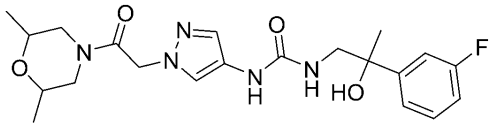
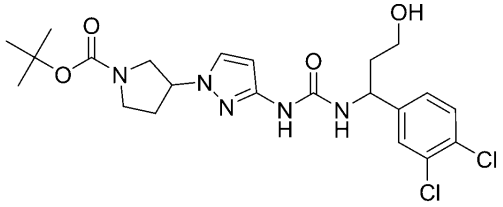
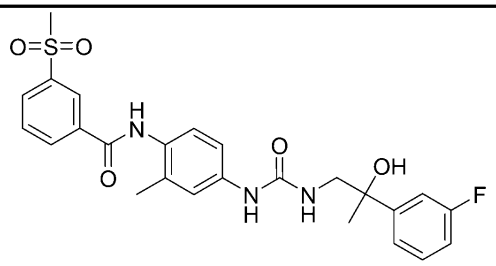
【表１－１４】

I-108				E	
I-109				E	
I-110				E	
I-111				D	
I-112				E	
I-113				E	
I-114				E	
I-115				E	
I-116				E	

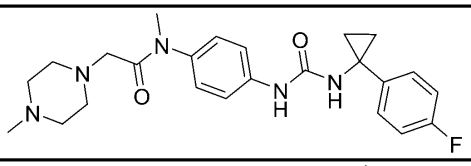
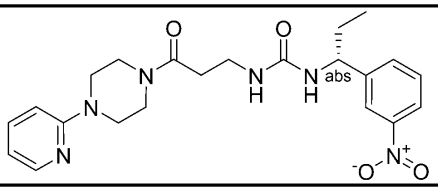
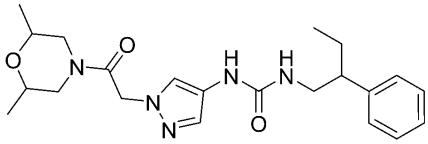
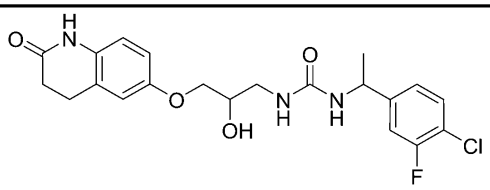
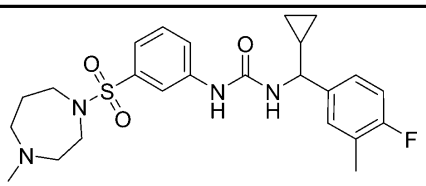
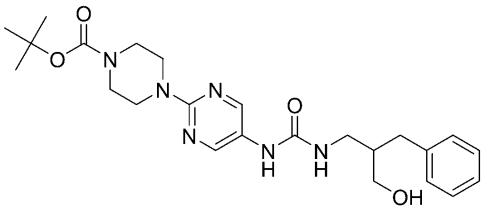
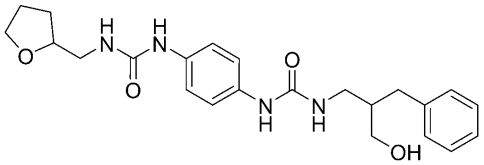
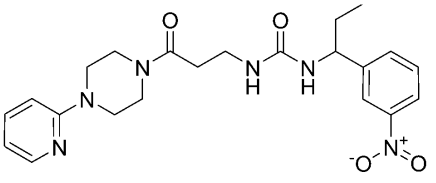
【表１－１５】

I-117				E	
I-118				E	
I-119				E	
I-120				E	
I-121				E	
I-122				E	
I-123				E	

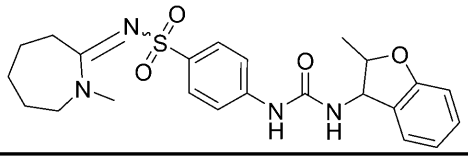
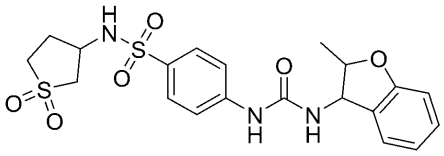
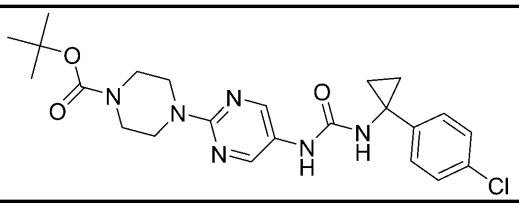
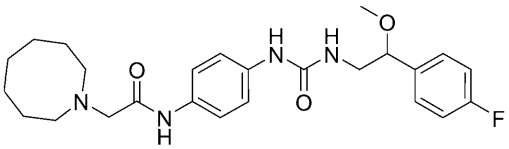
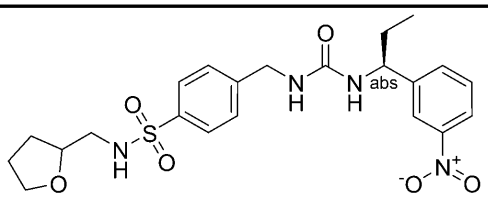
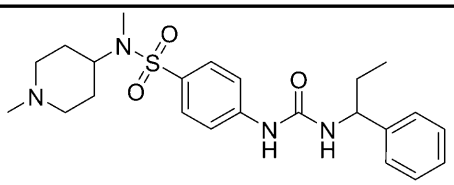
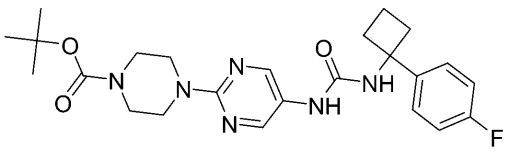
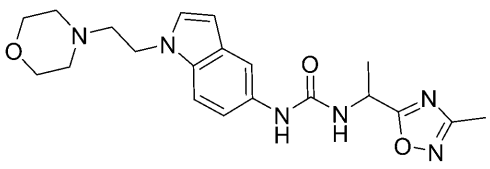
【表１－１６】

I-124				E	
I-125				E	
I-126				E	
I-127				E	
I-128				E	
I-129				E	
I-130				E	
I-131				E	

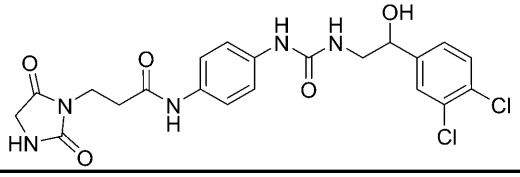
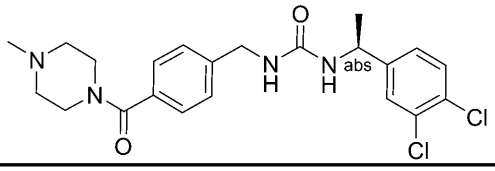
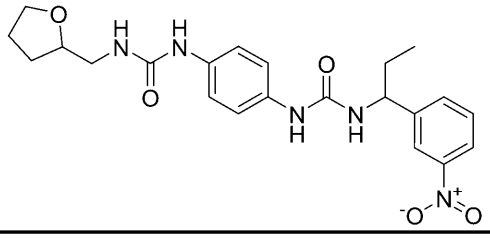
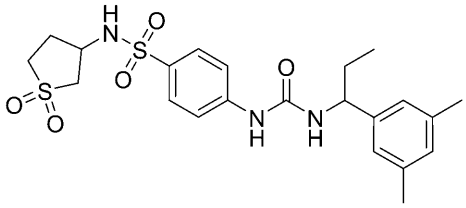
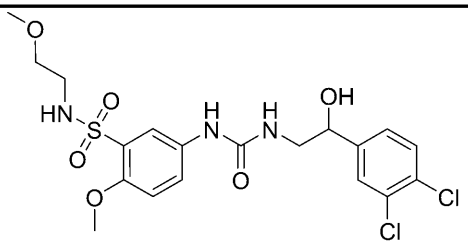
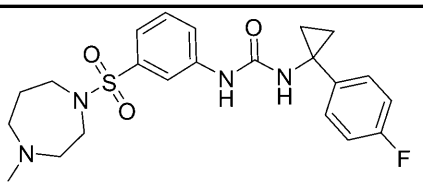
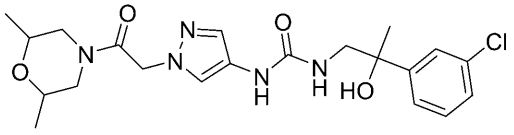
【表１－１７】

I-132				E	
I-133				E	
I-134				E	
I-135				E	
I-136				E	
I-137				E	
I-138				E	
I-139				E	

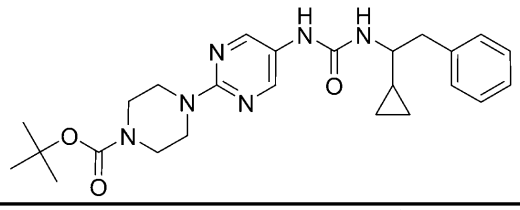
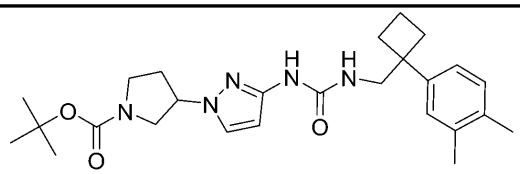
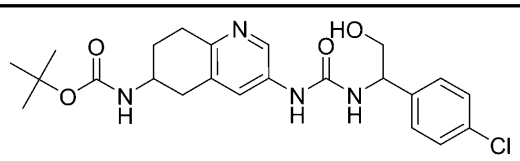
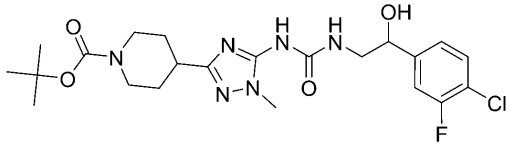
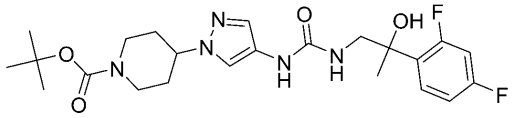
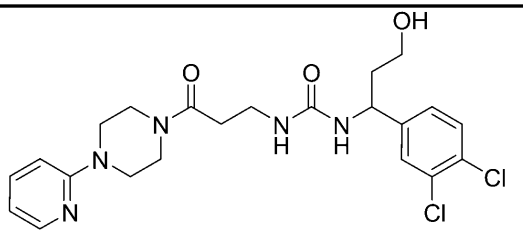
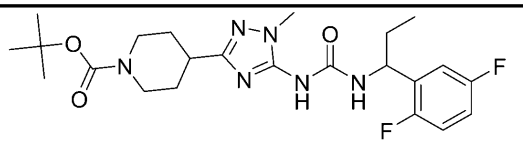
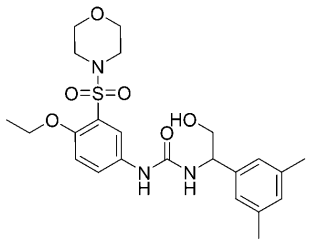
【表１－１８】

I-140				E	
I-141				E	
I-142				E	
I-143				E	
I-144				E	
I-145				E	
I-146				E	
I-147				E	

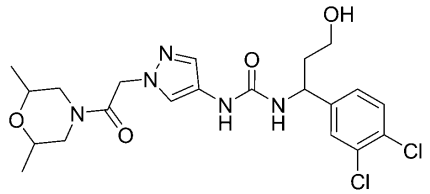
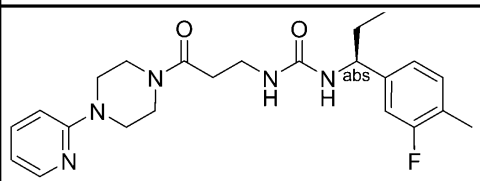
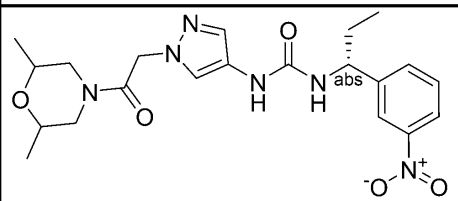
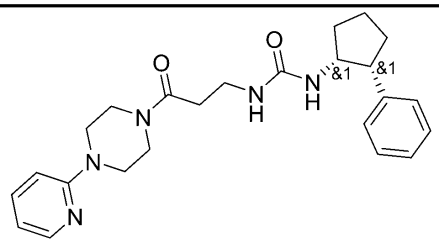
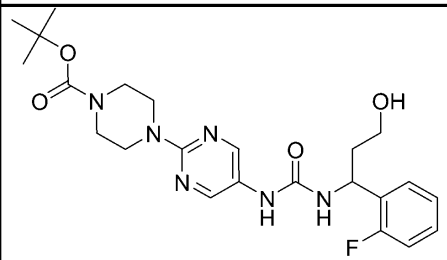
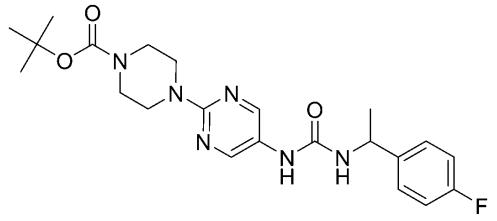
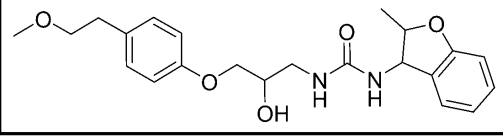
【表１－１９】

I-148				E	
I-149				E	
I-150				E	
I-151				E	
I-152				E	
I-153				E	
I-154				E	

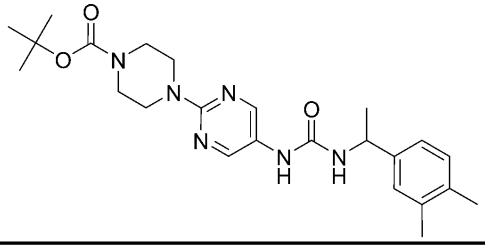
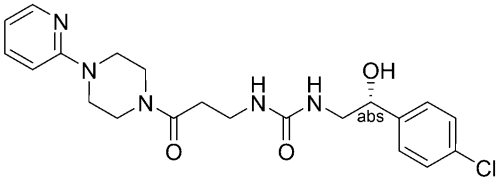
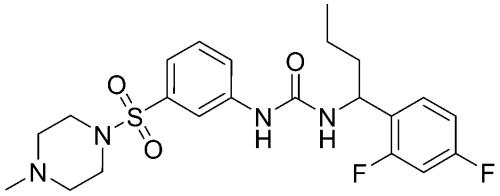
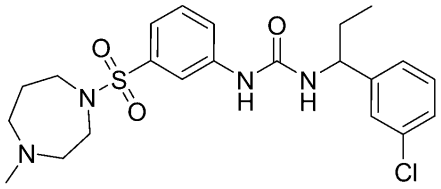
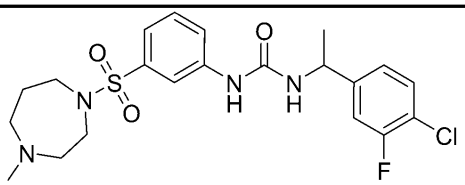
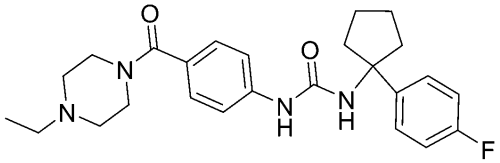
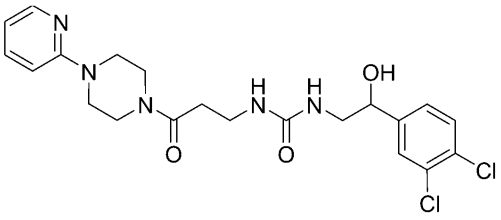
【表１－２０】

I-155				E	
I-156				E	
I-157				E	
I-158				E	
I-159				E	
I-160				E	
I-161				E	
I-162				E	

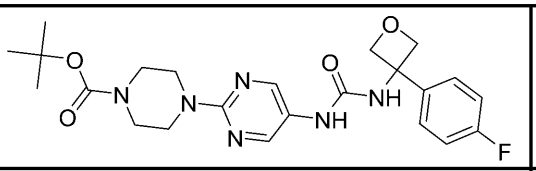
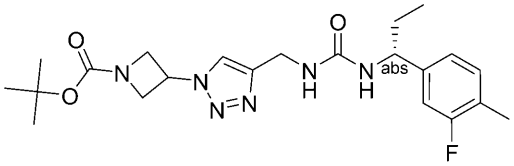
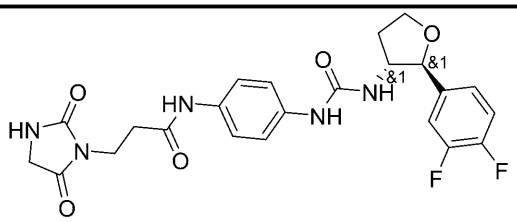
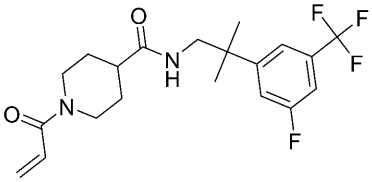
【表１－２１】

I-163				E	
I-164				E	
I-165				E	
I-166				E	
I-167				E	
I-168				E	
I-169				E	

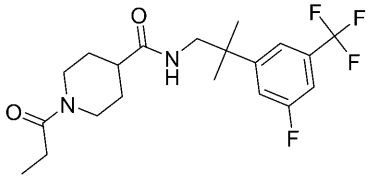
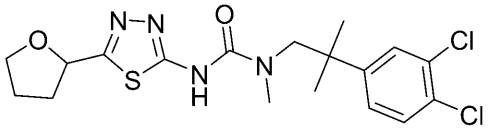
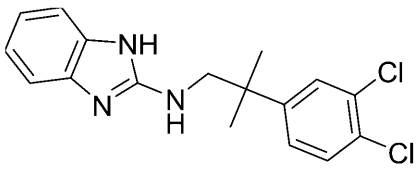
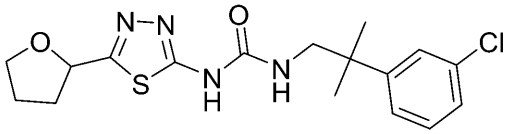
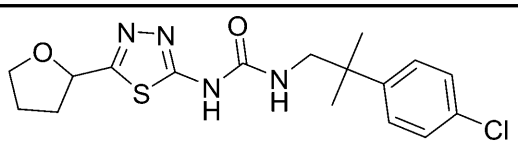
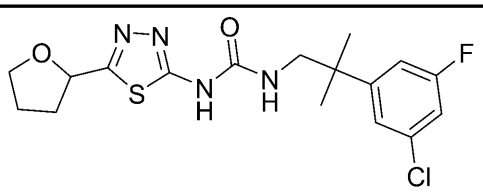
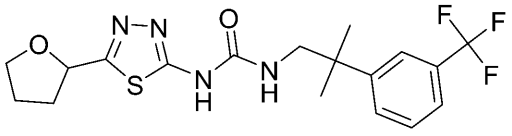
【表１－２２】

I-170				E	
I-171				E	
I-172				E	
I-173				E	
I-174				E	
I-175				E	
I-176				E	

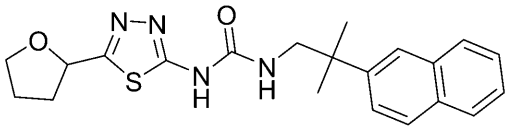
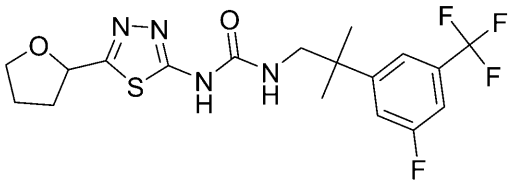
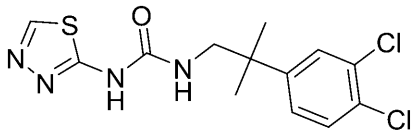
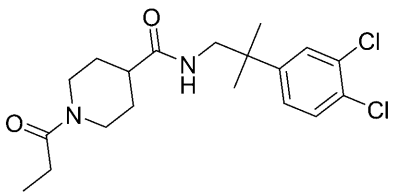
【表１－２３】

I-177				E	
I-178				E	
I-179				E	
I-180		(DMSO-d6, 400MHz): = 7.68 (t, J=6.4 Hz, 1H), 7.56-7.43 (m, 3H), 6.77 (dd, J=16.8, 10.4 Hz, 1H), 6.09 (d, J=2.4 Hz, 1H), 6.04 (d, J=2.4 Hz, 1H), 5.64 (dd, J=10.4, 2.4 Hz, 1H), 4.30 (d, J=12.8 Hz, 1H), 3.98 (d, J=12.8 Hz, 1H), 3.32-3.28 (m, 2H), 2.99 (t, J=12.4 Hz, 1H), 2.70-2.56 (m, 1H), 2.41-2.28 (m, 1H), 1.53 (d, J=12.4 Hz, 2H), 1.34 (s, 1H), 1.28 (s, 7H).	401.1	E	

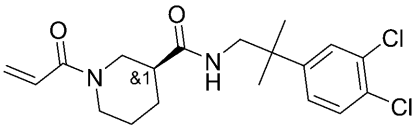
【表１－２４】

I-181		(DMSO-d6, 400MHz): = 7.66 (t, J=6.0 Hz, 1H), 7.56-7.43 (m, 3H), 4.27 (d, J=13.2 Hz, 1H), 3.78 (d, J=13.2 Hz, 1H), 3.33-3.28 (m, 2H), 2.92 (t, J=11.6 Hz, 1H), 2.37-2.23 (m, 3H), 1.66-1.43 (m, 2H), 1.39-1.14 (m, 8H), 0.96 (t, J=7.2 Hz, 3H).	403.1	E	
I-182				E	
I-183				E	
I-184				E	
I-185				E	
I-186				E	
I-187				E	

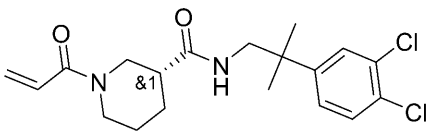
【表１－２５】

I-188				E	
I-189				E	
I-190				E	
I-191		(400 MHz, DMSO-d6): ppm 7.60-7.64 (m, 1H), 7.52-7.56 (m, 2H), 7.31-7.35 (m, 1H), 4.30 (d, J=12.8 Hz, 1H), 3.80 (d, J=13.6 Hz, 1H), 3.26 (d, J=6.0 Hz, 2H), 2.90-2.97 (m, 1H), 2.27-2.49 (m, 4H), 1.51-1.58 (m, 2H), 1.26-1.44 (m, 2H), 1.23 (s, 6H), 0.95-0.99 (m, 3H)	385	E	

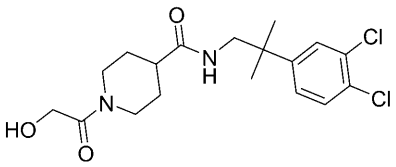
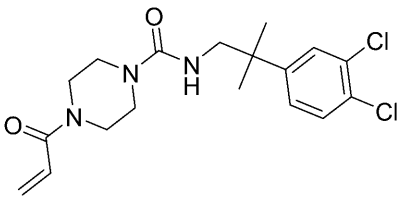
【表１－２６】

I-192		(400 MHz, DMSO-d6): 7.73-7.70 (m, 1H), 7.56-7.53 (m, 2H), 7.36-7.32 (m, 1H), 6.81-6.69 (m, 1H), 6.08-6.03 (m, 1H), 5.67-5.63 (m, 1H), 4.29-4.23 (m, 1H), 3.97-3.75 (m, 1H), 3.31-3.17 (m, 2H), 3.06-2.95 (m, 1H), 2.68-2.59 (m, 1H), 2.30-2.16 (m, 1H), 1.72-1.58 (m, 2H), 1.56-1.46 (m, 1H), 1.42-1.26 (m, 1H), 1.24 (s, 6H).	383	E	

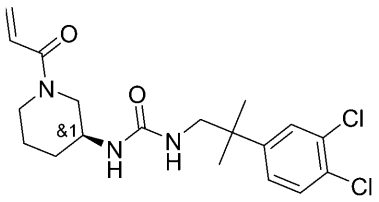
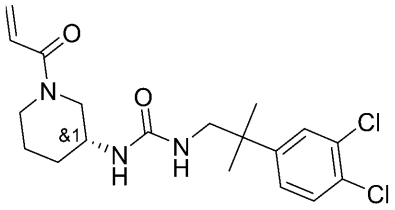
【表１－２７】

I-193		(400 MHz, DMSO-d6): 7.73-7.70 (m, 1H), 7.56-7.53 (m, 2H), 7.36-7.32 (m, 1H), 6.81-6.69 (m, 1H), 6.08-6.04 (m, 1H), 5.67-5.63 (m, 1H), 4.29-4.23 (m, 1H), 3.97-3.75 (m, 1H), 3.30-3.14 (m, 2H), 3.06-2.95 (m, 1H), 2.68-2.60 (m, 1H), 2.26-2.23 (m, 1H), 1.72-1.58 (m, 2H), 1.56-1.46 (m, 1H), 1.42-1.26 (m, 1H), 1.24 (s, 6H).	382.9	E	

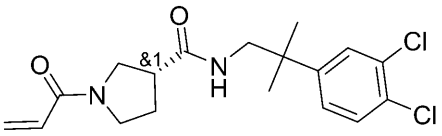
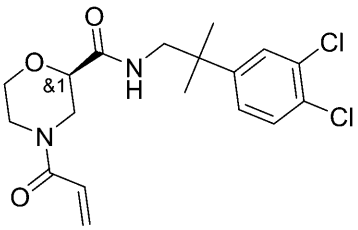
【表１－２８】

I-194		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.62-7.65 (m, 1H), 7.52-7.56 (m, 2H), 7.32-7.35(m, 1H), 4.45-4.49 (m, 1H), 4.25 (d, J=12.8 Hz, 1H), 3.97-4.13 (m, 2H), 3.63 (d, J=13.2 Hz, 1H), 3.24-3.27 (m, 2H), 2.86-2.93 (m, 1H), 2.54-2.70 (m, 1H), 2.29-2.42 (m, 1H), 1.53-1.58 (m, 2H), 1.27-1.49 (m, 1H), 1.26-1.34 (m, 1H), 1.23 (s, 6 H).	387.1	E	
I-195		(400 MHz, DMSO-d6) 7.55 - 7.51 (m, 2H), 7.34 - 7.31 (m, 1H), 6.83 - 6.76 (m, 1H), 6.44 - 6.41 (m, 1H), 6.13 - 6.09 (m, 1H), 5.70 - 5.67 (m, 1H), 3.44 (d, J=13.2 Hz, 4H), 3.23 (d, J=6.0 Hz, 6H), 1.21 (s, 6 H).	384	E	

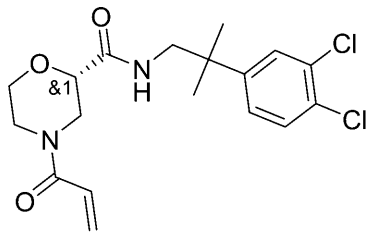
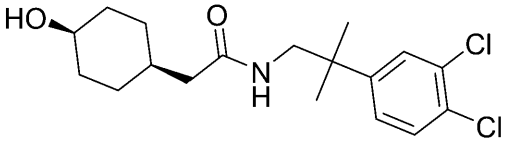
【表１－２９】

I-196		(400 MHz, DMSO-d6) 7.57 - 7.55 (m, 2H), 7.37 - 7.34 (m, 1H), 6.82 - 6.54 (m, 1H), 6.07 - 6.03 (m, 2H), 5.67 - 5.61 (m, 2H), 3.70 - 3.46 (m, 4H), 3.27 - 3.23 (m, 3H), 1.77 - 1.55 (m, 2H), 1.41 (d, J=6.40 Hz, 2H), 1.21 (s, 6H).	398.1	E	
I-197		(400 MHz, DMSO-d6) 7.57 - 7.55 (m, 2H), 7.37 - 7.34 (m, 1H), 6.82 - 6.54 (m, 1H), 6.07 - 6.03 (m, 2H), 5.67 - 5.61 (m, 2H), 3.70 - 3.46 (m, 4H), 3.27 - 3.23 (m, 3H), 1.77 - 1.55 (m, 2H), 1.41 (d, J=6.40 Hz, 2H), 1.21 (s, 6H).	398.1	E	

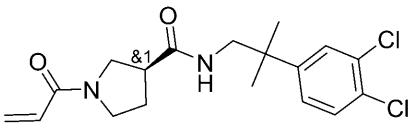
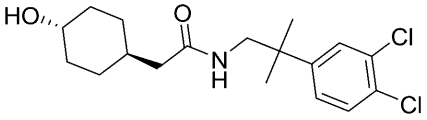
【表１－３０】

I-198		(400 MHz, DMSO-d6): 7.83 (br, 1H), 7.58-7.53 (m, 2H), 7.36-7.33 (m, 1H), 6.57-6.49 (m, 1H), 6.14-6.09 (m, 1H), 5.67-5.63 (m, 1H), 3.65-3.37 (m, 4H), 3.28-3.20 (m, 2H), 3.02-2.85 (m, 1H), 2.04-1.70 (m, 2H), 1.27-1.22 (m, 6H).	369.1	E	
I-199		(DMSO-d6, 400MHz): 7.70-7.47 (m, 3H), 7.36 (dd, J=8.4, 1.6 Hz, 1H), 6.88-6.64 (m, 1H), 6.13 (t, J=15.2 Hz, 1H), 5.72 (dd, J=10.4, 2.0 Hz, 1H), 4.40 (d, J=12.4 Hz, 1H), 4.10-3.78 (m, 4H), 3.55-3.42 (m, 2H), 3.34-3.12 (m, 4H), 2.99 (d, J=10.0 Hz, 1H), 2.72-2.56 (m, 1H), 1.24 (s, 6H).	385.1	E	

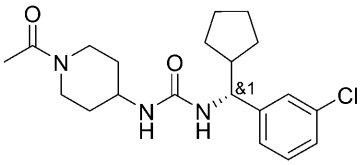
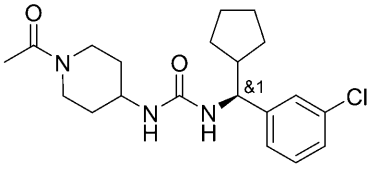
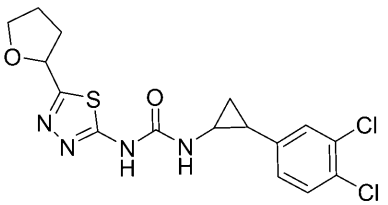
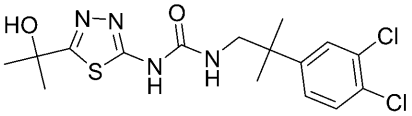
【表１－３１】

I-200		(DMSO-d6, 400MHz): 7.73-7.46 (m, 3H), 7.35 (d, J=7.6 Hz, 1H), 6.75 (d, J=10.4 Hz, 1H), 6.23-5.99 (m, 1H), 5.71 (d, J=10.0 Hz, 1H), 4.39 (d, J=12.0 Hz, 1H), 4.09-3.74 (m, 4H), 3.55-3.41 (m, 3H), 3.25-2.86 (m, 2H), 2.61 (s, 1H), 1.22 (s, 6H).	385.1	E	
I-201		(DMSO-d6, 400MHz): 7.66-7.47 (m, 3H), 7.33 (dd, J=8.4, 2.0 Hz, 1H), 3.79-3.69 (m, 4H), 3.29 (d, J=6.0 Hz, 2H), 1.92 (d, J=7.2 Hz, 2H), 1.67-1.43 (m, 3H), 1.40-1.27 (m, 1H), 1.40-1.27 (m, 2H), 1.26-1.20 (m, 7H), 1.20-1.10 (m, 3H).	358.1	E	

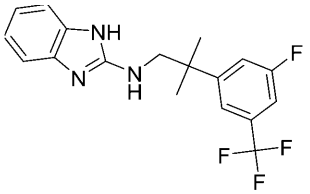
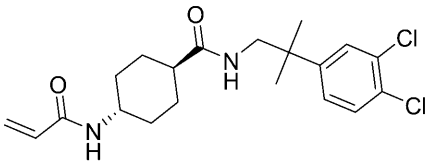
【表１－３２】

I-202		(400 MHz, DMSO-d6): 7.83 (br, 1H), 7.56-7.53 (m, 2H), 7.36-7.33 (m, 1H), 6.57-6.49 (m, 1H), 6.14-6.09 (m, 1H), 5.67-5.63 (m, 1H), 3.65-3.37 (m, 4H), 3.28-3.20 (m, 2H), 3.02-2.85 (m, 1H), 2.04-1.70 (m, 2H), 1.27-1.22 (m, 6H).	369.1	E	
I-203		(DMSO-d6, 400MHz): 7.69-7.46 (m, 3H), 7.32 (dd, J=8.4, 2.4 Hz, 1H), 3.33-3.17 (m, 3H), 1.85 (d, J=6.4 Hz, 2H), 1.71 (d, J=10.0 Hz, 2H), 1.38 (d, J=10.8 Hz, 3H), 1.23 (s, 6H), 1.10-0.93 (m, 2H), 0.85-0.68 (m, 2H).	358.1	E	

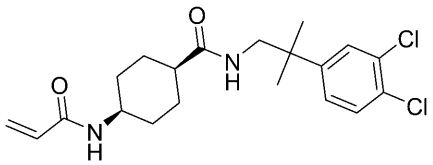
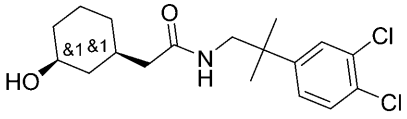
【表１－３３】

I-204		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.07-7.54 (m, 4H), 6.44 (s, 1H), 5.89 (s, 1H), 4.42 (s, 1H), 4.08 (s, 1H), 3.62-3.66 (m, 1H), 3.06 (d, J=8.4 Hz, 1H), 2.71 (s, 1H), 2.02-2.19 (m, 1H), 1.96 (s, 3H), 0.89-1.82 (m, 13H).	378.2	E	
I-205		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.18-7.39 (m, 4H), 6.41 (d, J=8.38 Hz, 1H), 5.85 (s, 1H), 4.42-4.47 (m, 1H), 4.11 (d, J=4.4 Hz, 1H), 3.68 (d, J=9.6 Hz, 1H), 3.04-3.12 (m, 1H), 2.70 (d, J=13.6 Hz, 1H), 2.04-2.18 (m, 1H), 1.98 (d, J=2.8 Hz, 3H), 1.06-1.85 (m, 13H).	378.2	D	B
I-206				E	
I-207				E	

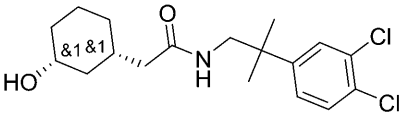
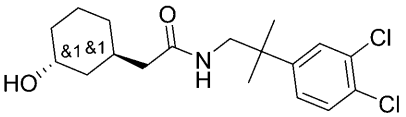
【表１－３４】

I-208				E	B
I-209		(400 MHz, DMSO-d6): ppm 7.94 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.50-7.57 (m, 3H), 7.31-7.35 (m, 1H), 6.12-6.22 (m, 1H), 6.01-6.10 (m, 1H), 5.53-5.57 (m, 1H), 3.46-3.55 (m, 1H), 3.25 (d, J=6.0 Hz, 2H), 2.01-2.11 (m, 1H), 1.80 (d, J=9.6 Hz, 2H), 1.60 (d, J=11.6 Hz, 2H), 1.27-1.41 (m, 2H), 1.22 (s, 6H), 1.06-1.18 (m, 2H).	397.1	E	

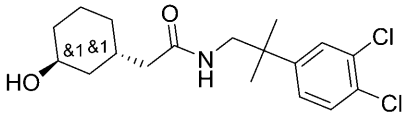
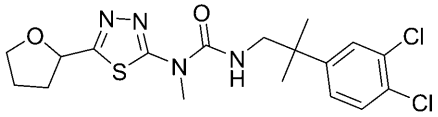
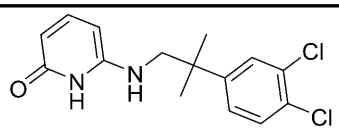
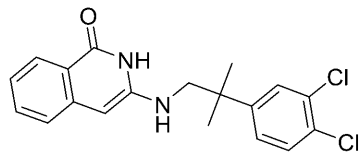
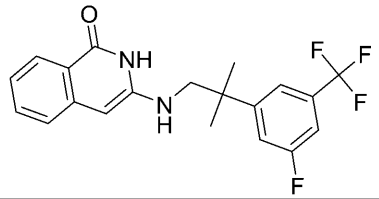
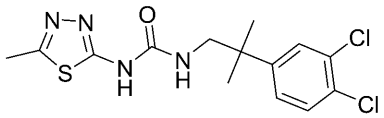
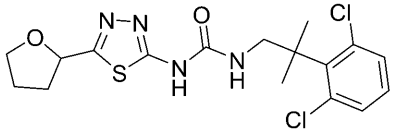
【表１－３５】

I-210		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.98 (d, J=7.2 Hz, 1H), 7.52-7.57 (m, 3H), 7.32-7.35 (m, 1H), 6.33-6.41 (m, 1H), 6.03-6.09 (m, 1H), 5.51-5.57 (m, 1H), 3.83 (s, 1H), 3.25 (d, J=6.0 Hz, 2H), 2.14-2.24 (m, 1H), 1.58-1.69 (m, 4H), 1.37-1.51 (m, 4 H), 1.24 (s, 6H).	397.1	E	
I-211		(400 MHz, DMSO-d6) 7.60-7.07 (m, 5H), 4.47 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.30-3.16 (m, 2H), 1.97-1.83 (m, 2H), 1.74 (s, 2H), 1.61-1.44 (m, 2H), 1.32-1.19 (m, 7H), 1.16-1.03 (m, 1H), 0.99-0.86 (m, 1H), 0.77-0.65 (m, 1H), 0.64-0.49 (m, 1H).	358.1	E	

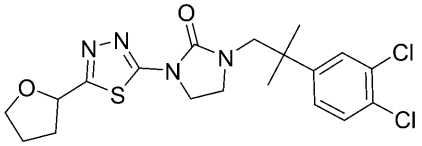
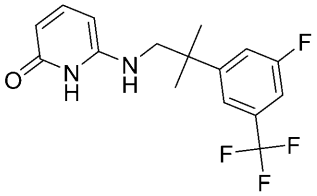
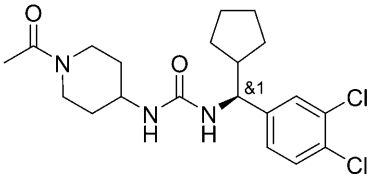
【表１－３６】

I-212		(400 MHz, DMSO-d6) 7.60-7.07 (m, 5H), 4.47 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.30-3.16 (m, 2H), 1.97-1.83 (m, 2H), 1.74 (s, 2H), 1.61-1.44 (m, 2H), 1.32-1.19 (m, 7H), 1.16-1.03 (m, 1H), 0.99-0.86 (m, 1H), 0.77-0.65 (m, 1H), 0.64-0.49 (m, 1H).	358.1	E	
I-213		(400 MHz, DMSO-d6) 7.52-7.48 (m, 3H), 7.36-7.30 (m, 1H), 4.26 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.76 (s, 1H), 3.33-3.29 (m, 1H), 3.25-3.15 (m, 1H), 1.99 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 1.87 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 1.54-1.37 (m, 3H), 1.36-1.16 (m, 9H), 1.11-0.99 (m, 1H), 0.82-0.69 (m, 1H).	358.1	E	

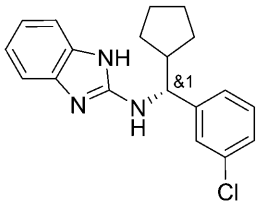
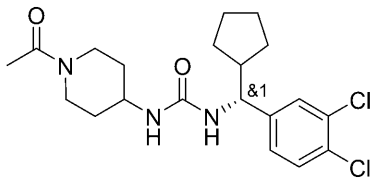
【表１－３７】

I-214		(400 MHz, DMSO-d6) 7.52-7.48 (m, 3H), 7.36-7.30 (m, 1H), 4.26 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.76 (s, 1H), 3.33-3.29 (m, 1H), 3.25-3.15 (m, 1H), 1.99 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 1.87 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 1.54-1.37 (m, 3H), 1.36-1.16 (m, 9H), 1.11-0.99 (m, 1H), 0.82-0.69 (m, 1H).	358.1	E	
I-215				E	
I-216				E	
I-217				D	
I-218				E	
I-219				E	
I-220				D	

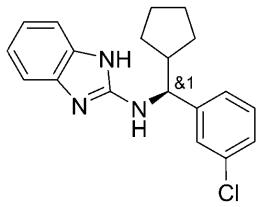
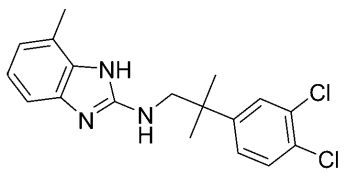
【表１－３８】

I-221				E	
I-222				E	
I-223		(DMSO-d6, 400MHz): 7.55 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 6.39 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.42 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 4.20-4.01 (m, 1H), 3.67 (dd, J = 14.0, 3.6 Hz, 1H), 3.60-3.44 (m, 1H), 3.14-2.99 (m, 1H), 2.77-2.61 (m, 1H), 2.10 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 1.97 (d, J = 2.4 Hz, 3H), 1.84-1.37 (m, 7H), 1.36-0.98 (m, 5H).	412.2	D	

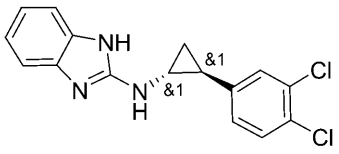
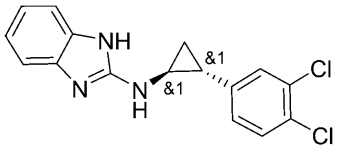
【表１－３９】

I-224		(400 MHz, CD3OD-d4) ppm 7.51 (s, 1H), 7.31-7.44 (m, 5H), 7.21-7.25 (m, 2H), 4.42-4.53 (m, 1H), 2.37-2.51 (m, 1H), 1.98-2.09 (m, 1H), 1.42-1.83 (m, 6H), 1.22-1.35 (m, 1H).	326.1	D	
I-225		(DMSO-d6, 400MHz): 7.55 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 6.40 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 4.42 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 4.20-4.03 (m, 1H), 3.67 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 3.57-3.41 (m, 1H), 3.17-2.99 (m, 1H), 2.76-2.62 (m, 1H), 2.18-2.05 (m, 1H), 1.97 (d, J = 2.4 Hz, 3H), 1.83-1.37 (m, 7H), 0.99-1.34 (m, 5H).	412.1	E	

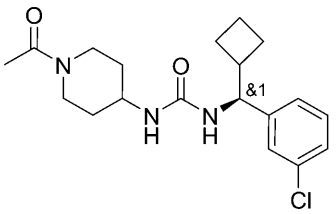
【表１－４０】

I-226		(400 MHz, CD3OD-d4): ppm 7.51 (s, 1H), 7.34-7.43 (m, 5H), 7.27-7.32 (m, 2H), 4.44 (d, J=9.6 Hz, 1H), 2.40-2.51 (m, 1H), 1.98-2.09 (m, 1H), 1.43-1.83 (m, 6H), 1.22-1.35 (m, 1H).	326.1	E	
I-227		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 12.54 (s, 2H), 8.56 (s, 1H), 7.73 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.41-7.61 (m, 2H), 7.16-7.22 (m, 1H), 7.06-7.13 (m, 1H), 7.01 (d, J=7.6 Hz, 1H), 3.73 (d, J=6.4 Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 1.37 (s, 6H).	348.1	E	

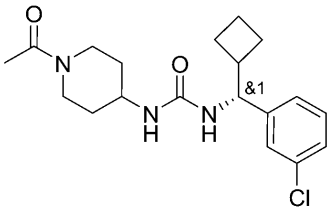
【表１－４１】

I-228		(400 MHz, DMSO-d6): 12.86 (s, 2H), 9.73 (s, 1H), 7.58 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.47-7.39 (m, 3H), 7.26-7.23 (m, 2H), 7.20-7.17 (m, 1H), 3.15 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 2.43-2.38 (m, 1H), 1.52-1.41 (m, 2H).	318.1	E	
I-229		(400 MHz, DMSO-d6): 12.87 (s, 2H), 9.73 (s, 1H), 7.58 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.46-7.39 (m, 3H), 7.26-7.23 (m, 2H), 7.20-7.17 (m, 1H), 3.15 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 2.43-2.38 (m, 1H), 1.52-1.41 (m, 2H).	318	E	

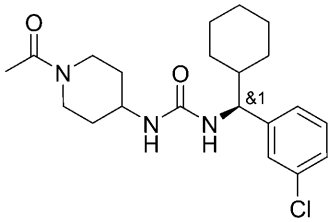
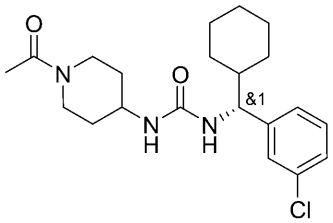
【表１－４２】

I-230		(400 MHz, DMSO-d6)7.35-7.28 (m, 1H), 7.24-7.21 (m, 2H), 7.18 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.29 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.84 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.58-4.50 (m, 1H), 4.16-4.06 (m, 1H), 3.72-3.61 (m, 1H), 3.59-3.49 (m, 1H), 3.36-3.32 (m, 1H), 3.13-3.00 (m, 1H), 2.75-2.64 (m, 1H), 2.01-1.86 (m, 4H), 1.83-1.60 (m, 7H), 1.30-1.02 (m, 2H).	364.1	E	

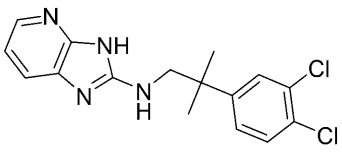
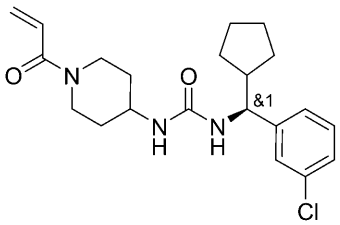
【表１－４３】

I-231		(400 MHz, DMSO-d6)7.35-7.28 (m, 1H), 7.24-7.21 (m, 2H), 7.18 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.29 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.84 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.58-4.50 (m, 1H), 4.16-4.06 (m, 1H), 3.72-3.61 (m, 1H), 3.59-3.49 (m, 1H), 3.36-3.32 (m, 1H), 3.13-3.00 (m, 1H), 2.75-2.64 (m, 1H), 2.01-1.86 (m, 4H), 1.83-1.60 (m, 7H), 1.30-1.02 (m, 2H).	364.1	E	

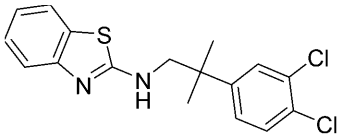
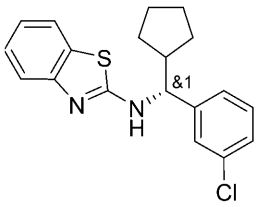
【表１－４４】

I-232		(400 MHz, DMSO-d6)7.36-7.29 (m, 1H), 7.28-7.21 (m, 2H), 7.15 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.82 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.48-4.39 (m, 1H), 4.10-4.06 (m, 1H), 3.72-3.61 (m, 1H), 3.59-3.51 (m, 1H), 3.14-3.01 (m, 1H), 3.72-3.64 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.75-1.64 (m, 7H), 1.31-0.82 (m, 8H).	392.2	E	
I-233		(400 MHz, DMSO-d6)7.36-7.29 (m, 1H), 7.28-7.21 (m, 2H), 7.15 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.82 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.48-4.39 (m, 1H), 4.10-4.06 (m, 1H), 3.72-3.61 (m, 1H), 3.59-3.51 (m, 1H), 3.14-3.01 (m, 1H), 3.72-3.64 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.75-1.64 (m, 7H), 1.31-0.82 (m, 8H).	392.2	E	

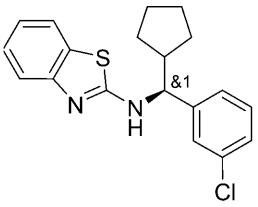
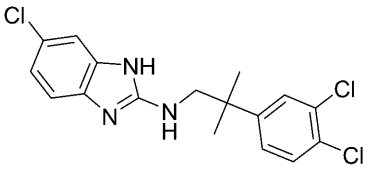
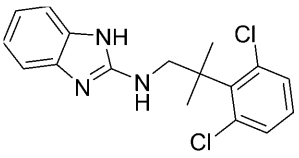
【表１－４５】

I-234		(400 MHz, DMSO-d6): 11.12-10.53 (m, 1H), 7.96-7.72 (m, 1H), 7.66 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.48-7.31 (m, 2H), 7.03-6.48 (m, 2H), 3.57 (s, 2H), 1.32 (s, 6H).	335	E	
I-235		(400 MHz, DMSO-d6): 7.34-7.19 (m, 4H), 6.82-6.75 (m, 1H), 6.39-6.36 (m, 1H), 6.10-6.05 (m, 1H), 5.82-5.80 (m, 1H), 5.67-5.62 (m, 1H), 4.46-4.41 (m, 1H), 4.10-4.20 (m, 1H), 3.91-3.86 (m, 1H), 3.60-3.52 (m, 1H), 3.15-3.11 (m, 1H), 2.86-2.74 (m, 1H), 2.16-2.05 (m, 1H), 1.77-1.43 (m, 7H), 1.35-1.08 (m, 5H).	390.2	D	

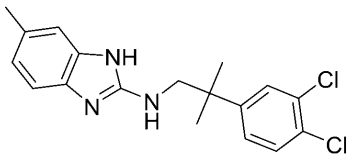
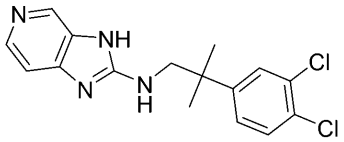
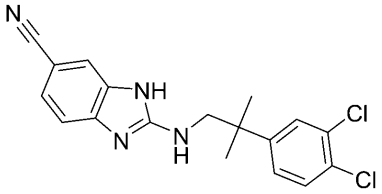
【表１－４６】

I-236		(400 MHz, DMSO-d6): 7.80-7.77 (m, 1H), 7.66-7.64 (m, 1H), 7.63-7.60 (m, 1H), 7.56-7.54 (m, 1H), 7.43-7.40 (m, 1H), 7.35-7.33 (m, 1H), 7.21-7.17 (m, 1H), 7.01-6.97 (m, 1H), 3.67-3.64 (m, 2H), 1.34 (s, 6H).	350.8	E	
I-237		(400 MHz, DMSO-d6): 8.61-8.59 (m, 1H), 7.65-7.63 (m, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.40-7.27 (m, 4H), 7.22-7.17 (m, 1H), 7.01-6.97 (m, 1H), 4.75-7.68 (m, 1H), 2.30-2.22 (m, 1H), 1.87-1.79 (m, 1H), 1.68-1.16 (m, 7H).	342.9	E	

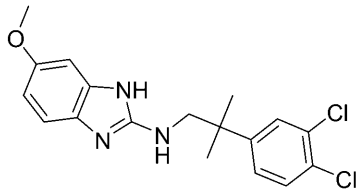
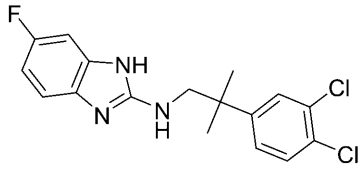
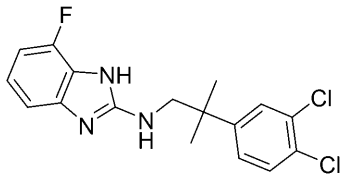
【表１－４７】

I-238		(400 MHz, DMSO-d6): 8.61-8.59 (m, 1H), 7.65-7.63 (m, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.42-7.27 (m, 4H), 7.22-7.17 (m, 1H), 7.01-6.97 (m, 1H), 4.75-7.68 (m, 1H), 2.30-2.22 (m, 1H), 1.90-1.79 (m, 1H), 1.68-1.16 (m, 7H).	342.9	E	
I-239		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 12.37-12.97 (m, 1H), 8.93 (s, 1H), 7.72 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.60 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.46-7.50 (m, 1H), 7.41 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.37 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.24-7.27 (m, 1H), 3.62 (d, J=6.4 Hz, 2H), 1.36 (s, 6H).	368	E	
I-240		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 12.44 (s, 1H), 8.79 (s, 1H), 7.47 (d, J=8.0 Hz, 2H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.22-7.30 (m, 3H), 4.09 (d, J=6.0 Hz, 2H), 1.76 (s, 6H).	334	D	

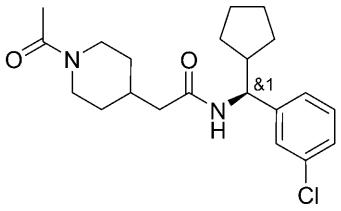
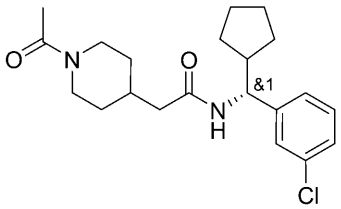
【表１－４８】

I-241		(400 MHz, DMSO-d6) 12.42 (s, 1H), 8.78-8.71 (m, 1H), 7.72 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.51-7.45 (m, 1H), 7.25 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.03 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.62 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.36 (s, 6H).	348.1	D	
I-242		(400 MHz, DMSO-d6): 14.40 (s, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.25 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.59-7.52 (m, 2H), 7.47-7.44 (m, 1H), 3.63-3.60 (m, 2H), 1.35 (s, 6H).	335.1	D	
I-243		(400 MHz, DMSO-d6): 13.94-11.92 (m, 1H), 9.21 (s, 1H), 7.80 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.73 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.67-7.64 (m, 1H), 7.61-7.56 (m, 1H), 7.54-7.47 (m, 2H), 3.67 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	359.1	D	

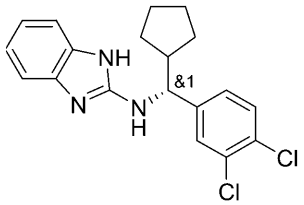
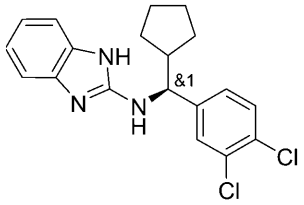
【表１－４９】

I-244		(400 MHz, DMSO-d6): 12.48 (s, 2H), 8.79-8.75 (m, 1H), 7.73 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.40 Hz, 1H), 7.51-7.48 (m, 1H), 7.28 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.83-6.81 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.63 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	364	D	
I-245		(400 MHz, DMSO-d6): 12.69 (s, 2H), 8.95 (s, 1H), 7.73 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.51-7.48 (m, 1H), 7.39-7.36 (m, 1H), 7.26-7.23 (m, 1H), 7.11-7.03 (m, 1H), 3.64 (d, J = 6.38 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	352.1	D	
I-246		(400 MHz, DMSO-d6): 13.13 (s, 2H), 9.01 (s, 1H), 7.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.59- 7.54 (m, 1H), 7.51-7.46 (m, 1H), 7.26-7.17 (m, 2H), 7.15-7.08 (m, 1H), 3.69 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	352.1	D	

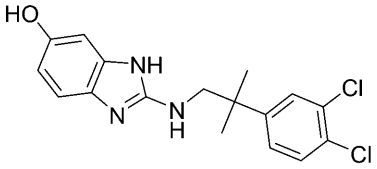
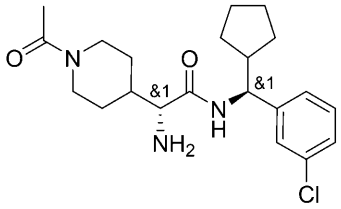
【表１－５０】

I-247		(400 MHz, DMSO-d6): 8.35-8.32 (m, 1H), 7.36-7.15 (m, 4H), 4.58-4.54 (m, 1H), 4.30-4.24 (m, 1H), 3.77-3.70 (m, 1H), 2.99-2.92 (m, 1H), 2.47-2.44 (m, 1H), 2.20-2.12 (m, 1H), 2.05-2.03 (m, 2H), 1.96 (s, 3H), 1.92-1.81 (m, 1H), 1.75-1.68 (m, 1H), 1.60-1.36 (m, 6H), 1.29-1.25 (m, 2H), 1.14-0.88 (m, 3H).	377.2	D	
I-248		(400 MHz, DMSO-d6): 8.35-8.32 (m, 1H), 7.47-7.24 (m, 4H), 4.58-4.54 (m, 1H), 4.30-4.24 (m, 1H), 3.77-3.70 (m, 1H), 2.99-2.92 (m, 1H), 2.47-2.44 (m, 1H), 2.20-2.12 (m, 1H), 2.05-2.03 (m, 2H), 1.96 (s, 3H), 1.92-1.81 (m, 1H), 1.75-1.68 (m, 1H), 1.62-1.36 (m, 6H), 1.30-1.25 (m, 2H), 1.14-0.88 (m, 3H).	377.2	E	

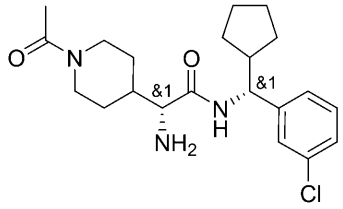
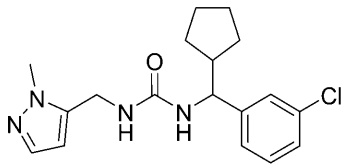
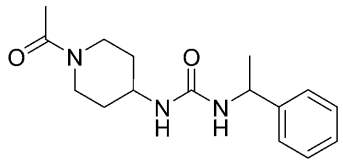
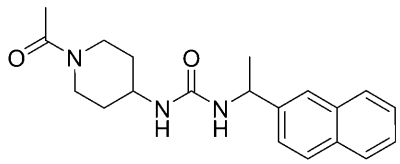
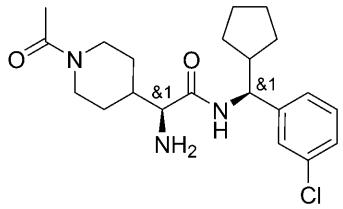
【表１－５１】

I-249		(400 MHz, DMSO-d6): 10.72 (s, 1H), 7.71 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.44-7.41 (m, 1H), 7.34 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.10-7.07 (m, 2H), 6.85-6.83 (m, 2H), 4.60-4.55 (m, 1H), 2.33-2.24 (m, 1H), 1.84 - 1.80 (m, 1H), 1.60-1.11 (m, 7H).	360.1	D	
I-250		(400 MHz, DMSO-d6): 10.72 (s, 1H), 7.71 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.44-7.41 (m, 1H), 7.34 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.10-7.07 (m, 2H), 6.85-6.83 (m, 2H), 4.60-4.55 (m, 1H), 2.33-2.24 (m, 1H), 1.84 - 1.80 (m, 1H), 1.60-1.11 (m, 7H).	360.1	D	

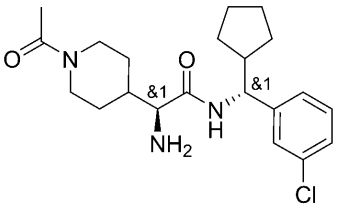
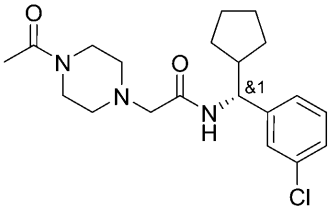
【表１－５２】

I-251		(400 MHz, DMSO-d6): 12.37 (s, 2H), 9.54 (s, 1H), 8.73-8.70 (m, 1H), 7.73 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.63-7.56 (m, 1H), 7.52-7.46 (m, 1H), 7.16 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.66-6.63 (m, 1H), 3.61 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 1.36 (s, 6 H).	350.1	D	
I-252		(400 MHz, DMSO-d6): 9.25-9.21 (m, 1H), 8.27 (br, 3H), 7.38-7.27 (m, 4H), 4.55-4.51 (m, 1H), 4.35-4.15 (m, 1H), 3.80-3.70 (m, 2H), 2.87-2.79 (m, 1H), 2.35-2.18 (m, 2H), 1.92-1.90 (m, 3H), 1.85-1.79 (m, 1H), 1.59-0.92 (m, 12H).	392.2	E	

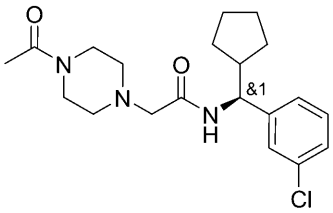
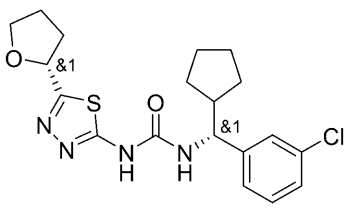
【表１－５３】

I-253		(400 MHz, DMSO-d6): 9.23-9.18 (m, 1H), 8.26-8.05 (m, 3H), 7.44-7.28 (m, 4H), 4.61-4.53 (m, 1H), 4.42-4.25 (m, 1H), 3.92-3.88 (m, 1H), 3.76-3.75 (m, 1H), 2.99-2.94 (m, 1H), 2.41-2.14 (m, 2H), 1.98 (s, 3H), 1.94-1.90 (m, 1H), 1.82-1.01 (m, 12H).	392.2	E	
I-254			347.34	D	
I-255			290.381	E	
I-256				E	
I-257				E	

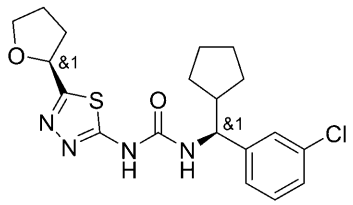
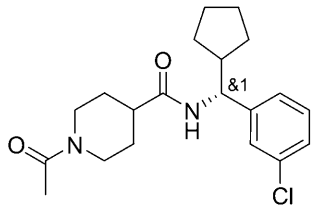
【表１－５４】

I-258		(400 MHz, DMSO-d6): 8.33-8.30 (m, 1H), 7.39-7.26 (m, 4H), 4.57-4.53 (m, 1H), 4.37-4.34 (m, 1H), 3.82-3.78 (m, 1H), 2.99-2.87 (m, 2H), 2.41-2.17 (m, 1H), 1.96 (s, 3H), 1.75-1.41 (m, 10H), 1.28-0.99 (m, 6H).	392.2	E	
I-259		(400 MHz, DMSO-d6): 9.17-9.13 (m, 1H), 8.23 (br, 3H), 7.38-7.27 (m, 4H), 4.58-4.52 (m, 1H), 4.29-4.26 (m, 1H), 3.80-3.74 (m, 2H), 2.89-2.80 (m, 1H), 2.35-2.18 (m, 2H), 1.94-1.91 (m, 3H), 1.85-1.76 (m, 1H), 1.61-1.02 (m, 12H).	392.2	E	

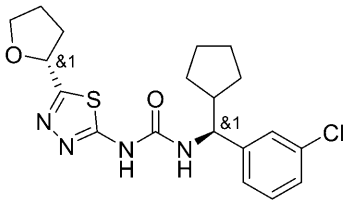
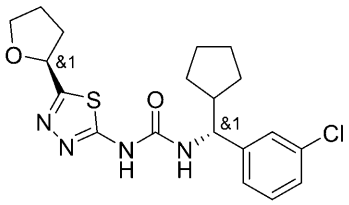
【表１－５５】

I-260		(400 MHz, DMSO-d6): 8.25-8.22 (m, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.36-7.27 (m, 3H), 4.58-4.53 (m, 1H), 3.46-3.40 (m, 4H), 3.02-2.91 (m, 1H), 2.45-2.27 (m, 5H), 1.98 (s, 3H), 1.82-1.71 (m, 1H), 1.60-1.43 (m, 4H), 1.28-1.21 (m, 2H), 1.15-1.04 (m, 1H).	378.2	E	
I-261		(400 MHz, DMSO-d6): 10.53 (br, 1H), 9.45-9.37 (m, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.38-7.29 (m, 3H), 4.90-4.41 (m, 5H), 4.10-3.97 (m, 3H), 3.39-3.02 (m, 3H), 2.28-2.18 (m, 1H), 1.78-1.70 (m, 1H), 1.62-1.44 (m, 4H), 1.35-1.26 (m, 2H), 1.15-1.06 (m, 1H).	378.2	E	

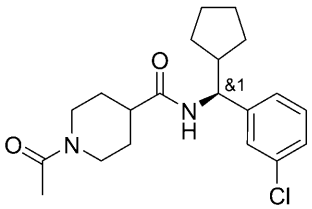
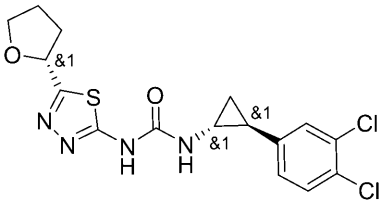
【表１－５６】

I-262		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.35-7.22 (m, 3H), 5.13-5.04 (m, 1H), 4.51-4.43 (m, 1H), 3.98-3.70 (m, 2H), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.10-1.88 (m, 4H), 1.74-1.63 (m, 1H), 1.61-1.39 (m, 4H), 1.35-1.20 (m, 2H), 1.16-1.02 (m, 1H).	407.1	E	
I-263		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.35-7.22 (m, 3H), 5.13-5.04 (m, 1H), 4.51-4.43 (m, 1H), 3.98-3.70 (m, 2H), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.10-1.88 (m, 4H), 1.74-1.63 (m, 1H), 1.61-1.39 (m, 4H), 1.35-1.20 (m, 2H), 1.16-1.02 (m, 1H).	407.1	E	

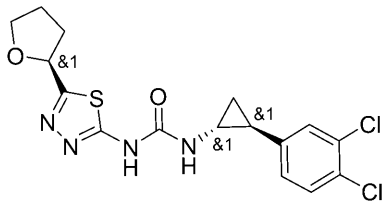
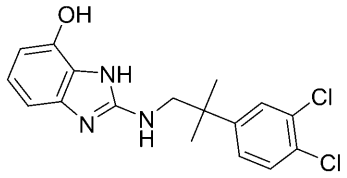
【表１－５７】

I-264		(400 MHz, DMSO-d6): 8.30-8.28 (m, 1H), 7.38-7.26 (m, 4H), 4.58-4.53 (m, 1H), 4.37-4.30 (m, 1H), 3.83-3.77 (m, 1H), 3.05-2.98 (m, 1H), 2.41-2.39 (m, 1H), 2.25-2.10 (m, 1H), 1.99-1.96 (m, 3H), 1.75-1.09 (m, 13H).	363	E	
I-265		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.35-7.22 (m, 3H), 5.13-5.04 (m, 1H), 4.51-4.43 (m, 1H), 3.98-3.70 (m, 2H), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.10-1.88 (m, 4H), 1.74-1.63 (m, 1H), 1.61-1.39 (m, 4H), 1.35-1.20 (m, 2H), 1.16-1.02 (m, 1H).	407.1	E	

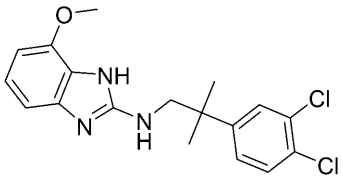
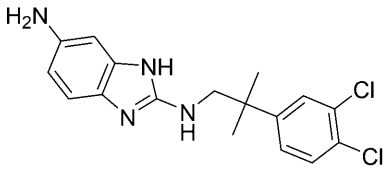
【表１－５８】

I-266		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.35-7.22 (m, 3H), 5.13-5.04 (m, 1H), 4.51-4.43 (m, 1H), 3.98-3.70 (m, 2H), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.10-1.88 (m, 4H), 1.74-1.63 (m, 1H), 1.61-1.39 (m, 4H), 1.35-1.20 (m, 2H), 1.16-1.02 (m, 1H).	407.1	D	
I-267		(400 MHz, DMSO-d6): 8.30-8.28 (m, 1H), 7.38-7.26 (m, 4H), 4.58-4.53 (m, 1H), 4.37-4.30 (m, 1H), 3.83-3.77 (m, 1H), 3.05-2.98 (m, 1H), 2.41-2.40 (m, 1H), 2.25-2.10 (m, 1H), 1.99-1.96 (m, 3H), 1.75-1.00 (m, 13H).	363	E	

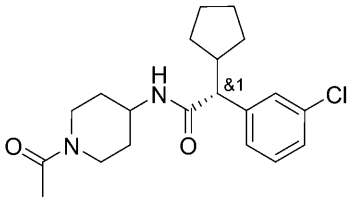
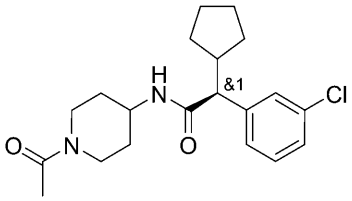
【表１－５９】

I-268		(400 MHz, CDCl3) 7.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.09-7.03 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 5.30-5.21 (m, 1H), 4.13-3.91 (m, 2H), 2.94 (s, 1H), 2.52-2.38 (m, 1H), 2.21-2.02 (m, 4H), 1.35-1.26 (m, 2H).	399	E	
I-269		(400 MHz, CDCl3) 7.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.09-7.03 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 5.30-5.21 (m, 1H), 4.13-3.91 (m, 2H), 2.94 (s, 1H), 2.52-2.38 (m, 1H), 2.21-2.02 (m, 4H), 1.35-1.26 (m, 2H).	399	D	

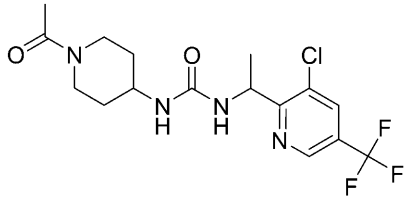
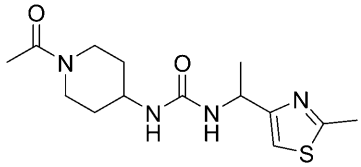
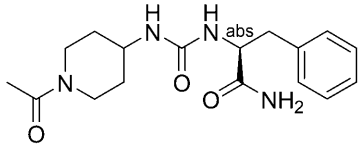
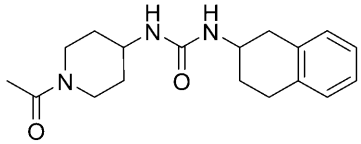
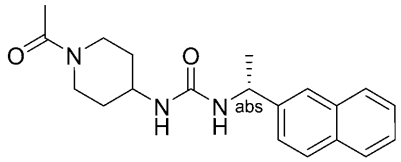
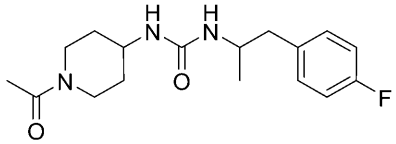
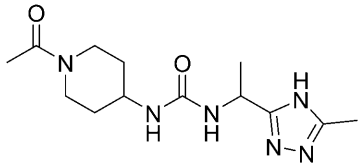
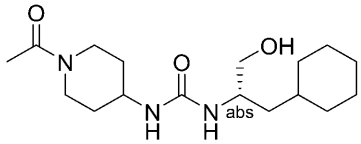
【表１－６０】

I-270		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 12.51 (s, 2H), 10.43 (s, 1H), 8.62 (d, J=4.4 Hz, 1H), 7.72 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.60 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.47-7.50 (m, 1H), 6.99-7.07 (m, 1H), 6.84 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.70 (d, J=8.0 Hz, 1H), 3.64 (d, J=6.4 Hz, 2H), 1.36 (s, 6H).	350.1	D	
I-271		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 12.31-12.92 (m, 2H), 8.63 (s, 1H), 7.71 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.59 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.46-7.49 (m, 1H), 7.15-7.22 (m, 1H), 7.00 (d, J=7.6 Hz, 1H), 6.91 (d, J=8.4 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.65 (d, J=6.4 Hz, 2H), 1.35 (s, 6H).	364.1	D	

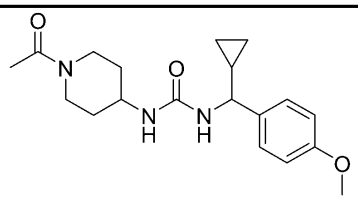
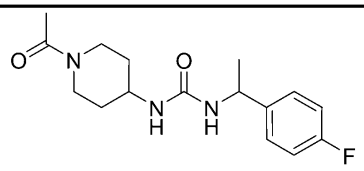
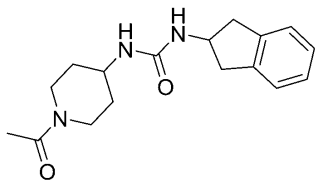
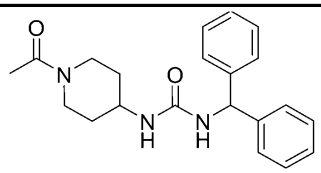
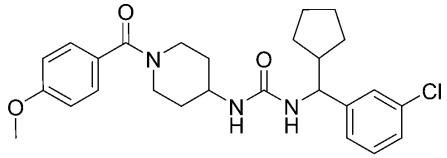
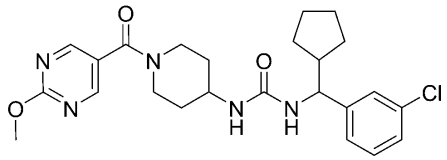
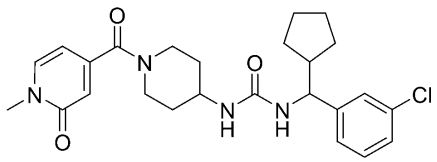
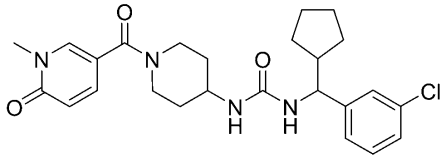
【表１－６１】

I-272		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 9.58-10.38 (m, 1H), 7.64 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.57 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.41-7.44 (m, 1H), 6.78 (d, J=8.0 Hz, 1H), 6.40 (d, J=2.0 Hz, 1H), 6.18 (d, J=7.6 Hz, 1H), 5.94 (s, 1H), 4.41 (s, 2H), 3.48 (d, J=6.0 Hz, 2H), 1.31 (s, 6H).	349.1	E	
I-273		(DMSO-d6, 400MHz): 8.02 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.36-7.25 (m, 3H), 4.23-4.06 (m, 1H), 3.82-3.59 (m, 2H), 3.15 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 3.12-3.01 (m, 1H), 2.80-2.62 (m, 1H), 2.48-2.38 (m, 1H), 2.34 (s, 1H), 1.98 (d, J = 7.6 Hz, 3H), 1.87-1.67 (m, 2H), 1.67-1.40 (m, 5H), 1.38-1.28 (m, 1H), 1.32 (dd, J = 12.4, 5.6 Hz, 1H), 1.27-1.07 (m, 3H), 1.36-1.04 (m, 1H), 0.99-0.84 (m, 1H).	363.1	E	

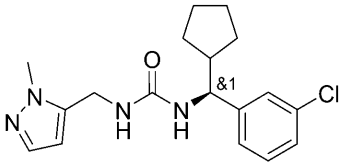
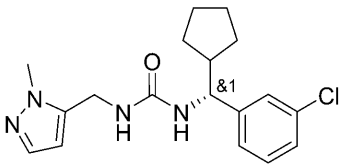
【表１－６２】

I-274				E	
I-275				E	
I-276				E	
I-277				E	
I-278				E	
I-279				E	
I-280				E	
I-281				E	

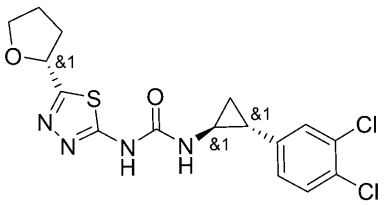
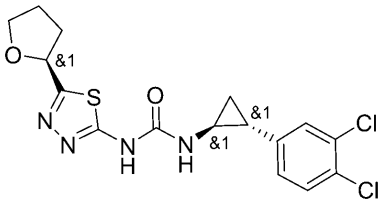
【表１－６３】

I-282				E	
I-283				E	
I-284				E	
I-285			352.45	E	
I-286				D	
I-287				E	
I-288				D	
I-289				E	

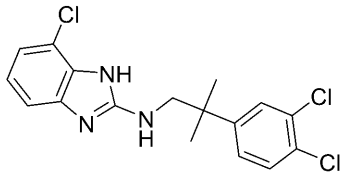
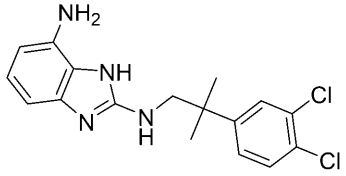
【表１－６４】

I-290		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.20 - 7.36 (m, 5 H), 6.64 (d, J=7.2 Hz, 1 H), 6.30 (s, 1 H), 6.05 (s, 1 H), 4.43 - 4.48 (m, 1 H), 4.22 (d, J=3.2 Hz, 2 H), 3.70 (s, 3 H), 2.07 - 2.18 (m, 1 H), 1.40 - 1.70 (m, 5 H), 1.23 - 1.37 (m, 2 H), 1.08 - 1.18 (m, 1 H).	347.1	E	
I-291		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.30 - 7.35 (m, 3 H), 7.21 - 7.27 (m, 2 H), 6.70 (d, J=7.6 Hz, 1 H), 6.34 (s, 1 H), 6.06 (s, 1 H), 4.41 - 4.49 (m, 1 H), 4.22 (d, J=3.2 Hz, 2 H), 3.71 (s, 3 H), 2.07 - 2.18 (m, 1 H), 1.40 - 1.68 (m, 5 H), 1.23 - 1.37 (m, 2 H), 1.05 - 1.19 (m, 1 H).	347.1	D	

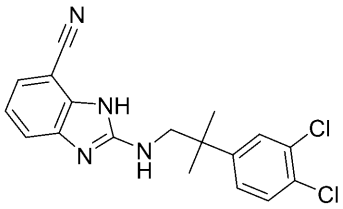
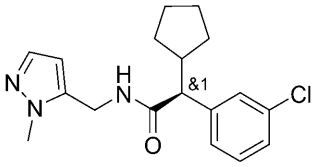
【表１－６５】

I-292		(400 MHz, CDCl3) 12.21 (s, 1H), 7.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.09-7.03 (m, 1H), 6.62 (s, 1H), 5.30-5.22 (m, 1H), 4.12-3.91 (m, 2H), 2.94 (s, 1H), 2.51-2.39 (m, 1H), 2.23-2.01 (m, 4H), 1.36-1.25 (m, 2H).	399	E	
I-293		(400 MHz, CDCl3) 12.21 (s, 1H), 7.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.09-7.03 (m, 1H), 6.62 (s, 1H), 5.30-5.22 (m, 1H), 4.12-3.91 (m, 2H), 2.94 (s, 1H), 2.51-2.39 (m, 1H), 2.23-2.01 (m, 4H), 1.36-1.25 (m, 2H).	399	E	

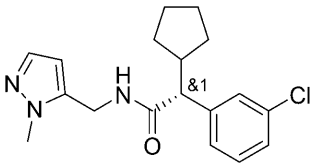
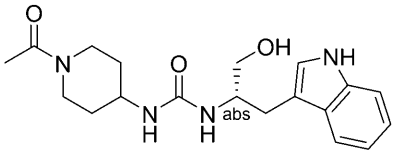
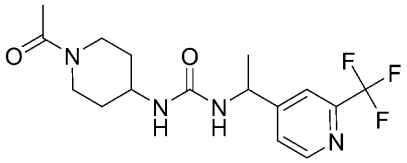
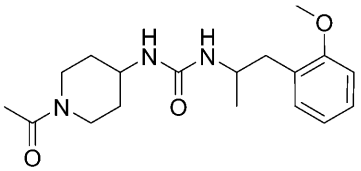
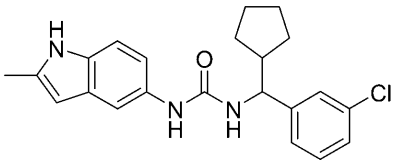
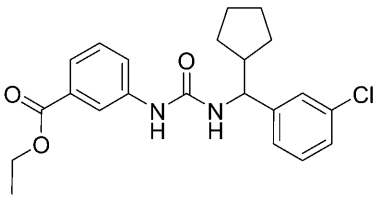
【表１－６６】

I-294		(400 MHz, DMSO-d6) 12.86 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 7.70 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.50-7.45 (m, 1H), 7.34 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.24-7.18 (m, 1H),3.70 (d, J = 4.0 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	368	D	
I-295		(400 MHz, DMSO-d6) 12.78 (s, 1H), 12.20 (m, 1H), 8.45-8.63 (m, 1H), 7.75 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.54-7.48 (m, 1H), 7.10-6.90 (m, 1H), 6.63 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.51 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 3.70 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 1.37 (s, 6H).	349.1	D	

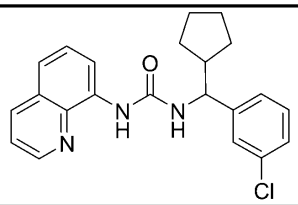
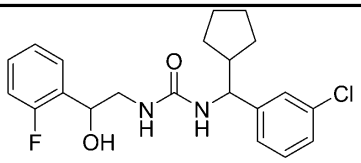
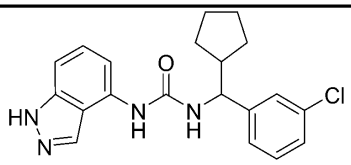
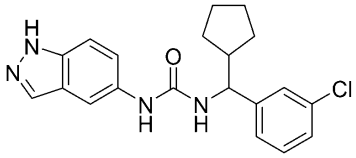
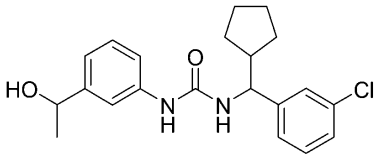
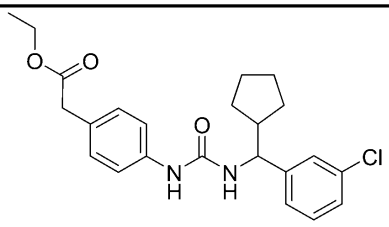
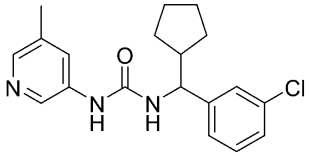
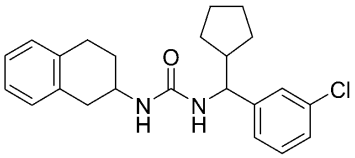
【表１－６７】

I-296		(400 MHz, DMSO-d6) 8.56 (s, 1H), 7.70 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.64-7.54 (m, 3H), 7.50-7.44 (m, 1H), 7.31-7.22 (m, 1H), 3.67 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	359.1	D	
I-297		(DMSO-d6, 400MHz): 8.53 (t, J=5.2 Hz, 1H), 7.56-7.18 (m, 5H), 6.00 (d, J=0.8 Hz, 1H), 4.49-4.15 (m, 2H), 3.65 (s, 3H), 3.24 (d, J=11.2 Hz, 1H), 2.48-2.45 (m, 1H), 1.80-1.67 (m, 1H), 1.66-1.39 (m, 4H), 1.38-1.26 (m, 1H), 1.24-1.10 (m, 1H), 1.01-0.84 (m, 1H).	332.2	E	

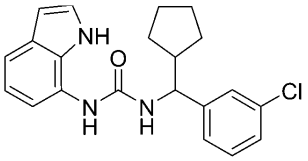
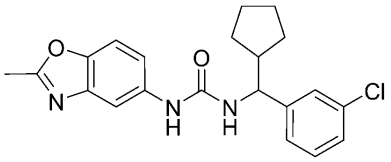
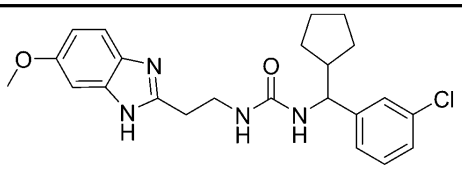
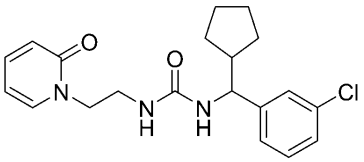
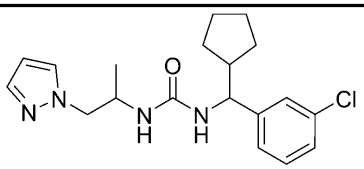
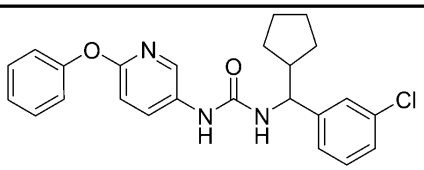
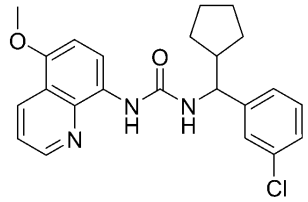
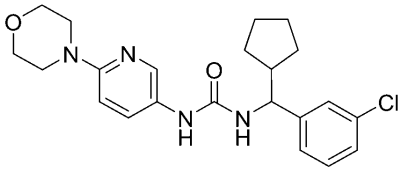
【表１－６８】

I-298		(DMSO-d6, 400MHz): 8.55 (t, J=5.6 Hz, 1H), 7.47-7.21 (m, 5H), 6.00 (d, J=1.6 Hz, 1H), 4.44-4.16 (m, 2H), 3.65 (s, 4H), 3.25 (d, J=11.2 Hz, 1H), 2.50-2.42 (m, 2H), 1.81-1.67 (m, 1H), 1.66-1.38 (m, 4H), 1.37-1.26 (m, 1H), 1.24-1.09 (m, 1H), 1.00-0.84 (m, 1H).	332.1	E	
I-299				E	
I-300				E	
I-301				E	
I-302				E	
I-303				E	

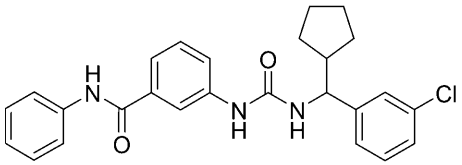
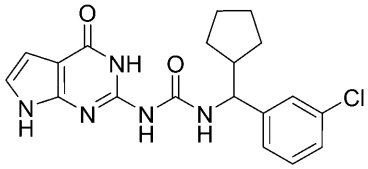
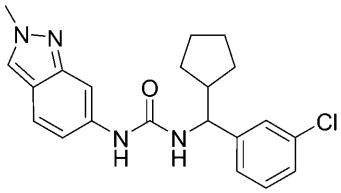
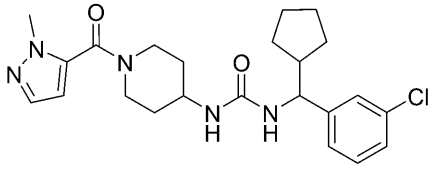
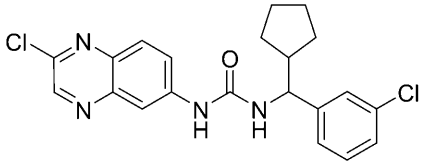
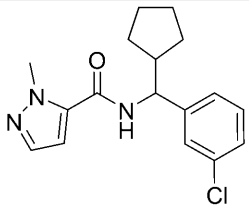
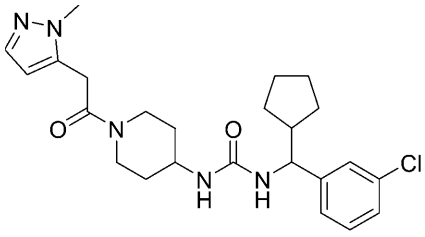
【表１－６９】

I-304				D	
I-305				E	
I-306				D	
I-307				D	
I-308				D	
I-309				D	
I-310				E	
I-311				D	

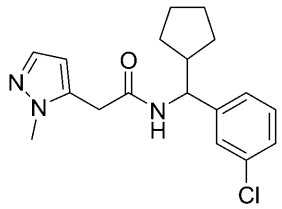
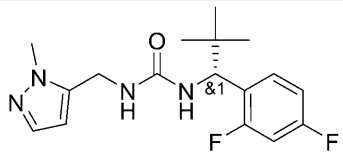
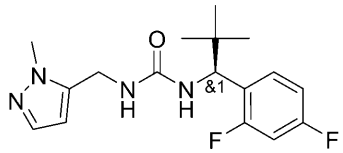
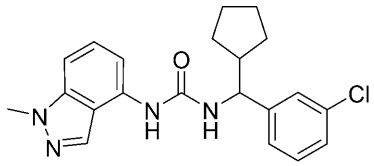
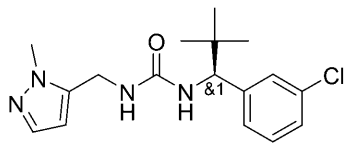
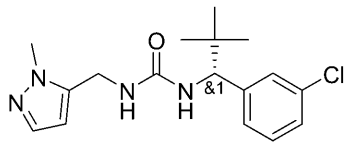
【表１－７０】

I-312				D	
I-313				D	
I-314				D	
I-315				E	
I-316				E	
I-317				D	
I-318				E	
I-319				D	

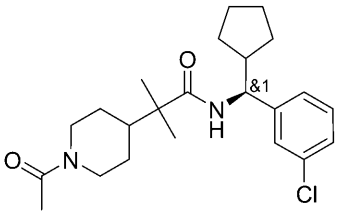
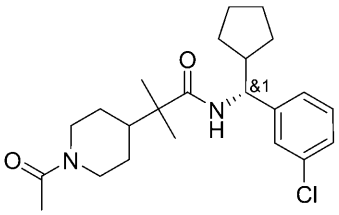
【表１－７１】

I-320				E	
I-321				D	
I-322				D	
I-323				D	
I-324				D	
I-325				E	
I-326				E	

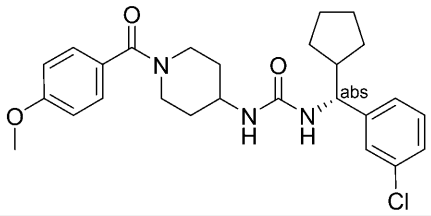
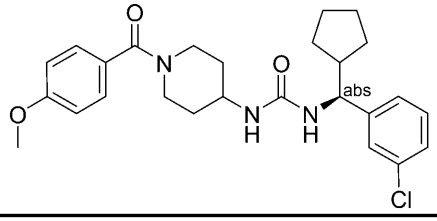
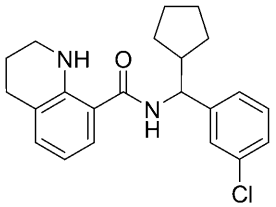
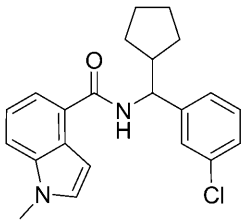
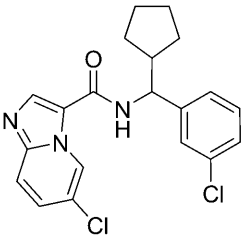
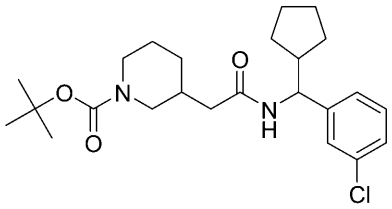
【表１－７２】

I-327				E	
I-328				E	
I-329				D	
I-330				D	
I-331		(400 MHz, DMSO-d6): 7.23-7.21 (m, 1H), 7.20-7.13 (m, 3H), 7.07-7.05 (m, 1H), 6.05-6.04 (m, 1H), 4.42 (s, 1H), 4.26-4.24 (m, 2H), 3.65 (s, 3H), 0.82 (s, 9H).	335.1	E	
I-332		(400 MHz, DMSO-d6): 7.35-7.34 (m, 1H), 7.32-7.24 (m, 3H), 7.18-7.16 (m, 1H), 6.17-6.15 (m, 1H), 4.54 (s, 1H), 4.38-4.36 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 0.93 (s, 9H).	335.2	E	

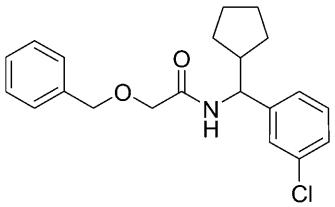
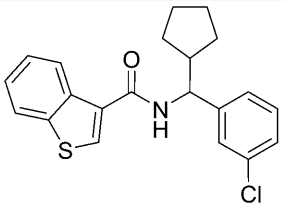
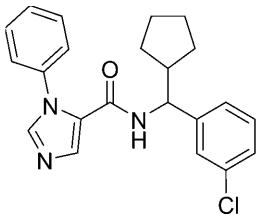
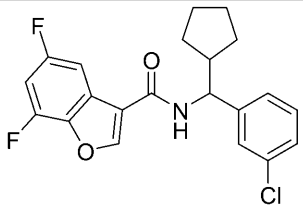
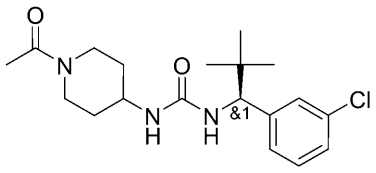
【表１－７３】

I-333		(400 MHz, DMSO-d6)7.86-7.78 (m, 1H), 7.40 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.35-7.22 (m, 3H), 4.52-4.31 (m, 2H), 3.89-3.70 (m, 1H), 2.93-2.78 (m, 1H), 2.39-2.23 (m, 2H), 1.94 (d, J = 8.0 Hz, 3H), 1.87-1.75 (m, 2H), 1.66-1.38 (m, 5H), 1.30-1.15 (m, 3H), 1.14-0.89 (m, 9H).	405.2	E	
I-334		(400 MHz, DMSO-d6)7.86-7.78 (m, 1H), 7.40 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.35-7.22 (m, 3H), 4.52-4.31 (m, 2H), 3.89-3.70 (m, 1H), 2.93-2.78 (m, 1H), 2.39-2.23 (m, 2H), 1.94 (d, J = 8.0 Hz, 3H), 1.87-1.75 (m, 2H), 1.66-1.38 (m, 5H), 1.30-1.15 (m, 3H), 1.14-0.89 (m, 9H).	405.2	E	

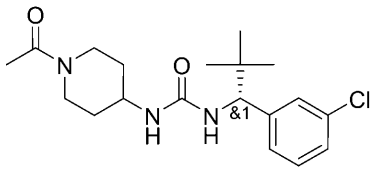
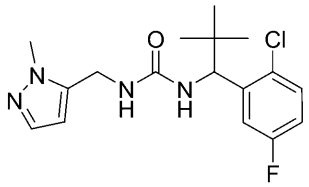
【表１－７４】

I-335				D	
I-336				D	
I-337				E	
I-338				E	
I-339				E	
I-340				E	

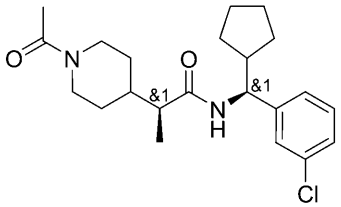
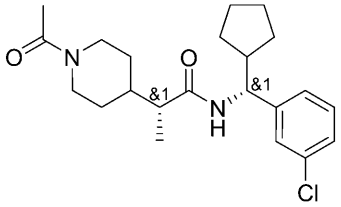
【表１－７５】

I-341				E	
I-342				E	
I-343				E	
I-344				E	
I-345		(400 MHz, メタノール-d4): 7.20-7.12 (m, 3H), 7.05-7.03 (m, 1H), 4.41-4.40 (m, 1H), 4.21-4.16 (m, 1H), 3.75-3.68 (m, 1H), 3.60-3.55 (m, 1H), 3.15-3.05 (m, 1H), 2.79-2.70 (m, 1H), 1.99-1.98 (d, J = 4.4, 3H), 1.88-1.70 (m, 2H), 1.31-1.09 (m, 2H), 0.81 (s, 9H).	366.1	E	

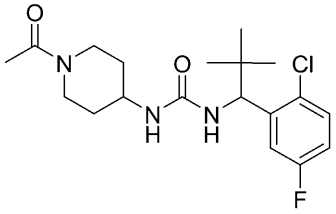
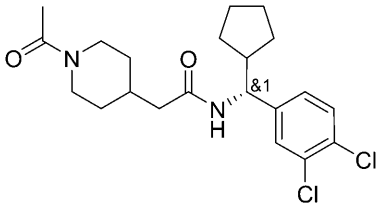
【表１－７６】

I-346		(400 MHz, メタノール-d6): 7.32-7.24 (m, 3H), 7.18-7.15 (m, 1H), 4.52 (s, 1H), 4.35-4.28 (m, 1H), 3.86-3.80 (m, 1H), 3.72-3.67 (m, 1H), 3.27-3.17 (m, 1H), 2.91-2.82 (m, 1H), 2.11-2.10 (d, J = 4.4, 3H), 2.00-1.82 (m, 2H), 1.42-1.21 (m, 2H), 0.93 (s, 9H).	366.1	E	
I-347		(400 MHz, メタノール-d4): 7.75-7.74 (m, 1H), 7.30-7.27 (m, 2H), 7.11-7.06 (m, 1H), 6.39-6.38 (m, 1H), 4.93-4.92 (m, 1H), 4.42 (s, 2H), 3.92 (s, 3H), 0.96 (s, 9H).	353.1	D	

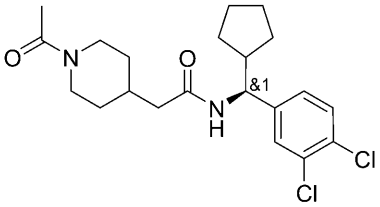
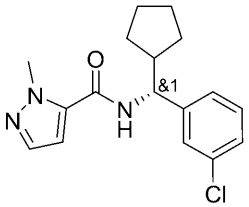
【表１－７７】

I-348		(400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.40-7.29 (m, 2H), 7.29-7.21 (m, 2H), 4.6-4.41 (m, 1H), 4.35-4.12 (m, 1H), 3.78-3.57 (m, 1H), 2.95-2.75 (m, 1H), 2.47-2.36 (m, 1H), 2.36-2.24 (m, 1H), 2.21-2.04 (m, 2H), 1.92 (d, J = 8.0 Hz, 3H), 1.79-1.39 (m, 7H), 1.31-1.08 (m, 3H), 1.03-0.79 (m, 5H).	391.2	E	
I-349		(400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.40-7.29 (m, 2H), 7.29-7.21 (m, 2H), 4.6-4.41 (m, 1H), 4.35-4.12 (m, 1H), 3.78-3.57 (m, 1H), 2.95-2.75 (m, 1H), 2.47-2.36 (m, 1H), 2.36-2.24 (m, 1H), 2.21-2.04 (m, 2H), 1.92 (d, J = 8.0 Hz, 3H), 1.79-1.39 (m, 7H), 1.31-1.08 (m, 3H), 1.03-0.79 (m, 5H).	391.2	E	

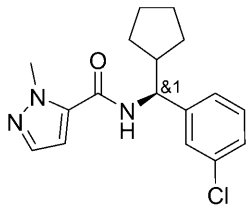
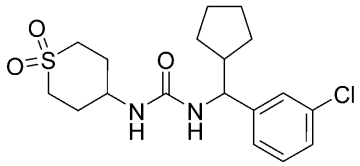
【表１－７８】

I-350		(400 MHz, メタノール-d4): 7.30-7.24 (m, 2H), 7.10-7.03 (m, 1H), 1.87-4.83 (m, 1H), 4.34-4.28 (m, 1H), 3.88-3.82 (m, 1H), 3.73-3.68 (m, 1H), 3.29-3.19 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.13-2.10 (d, J = 4.0, 3H), 2.04-1.83 (m, 2H), 1.45-1.23 (m, 2H), 0.95 (s, 9H).	384.1	E	
I-351		(400 MHz, DMSO-d6): 8.40 (d, J = 8.4 Hz 1H), 7.57～7.53 (m, 2H), 7.30～7.26 (m, 1H), 4.56～4.51 (m, 1H), 4.29～4.23 (m, 1H), 3.76～3.57 (m, 4H), 2.99～2.92 (m, 1H), 2.17～2.02 (m, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.88～1.72 (m, 2H), 1.61～1.40 (m, 5H), 1.30～1.22 (m, 2H), 1.10～1.00 (m, 2H).	411.1	E	

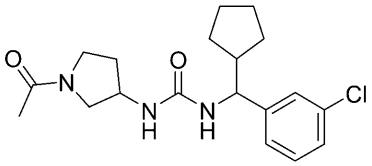
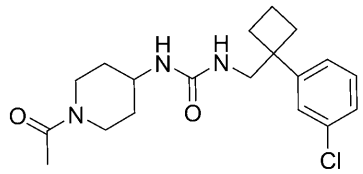
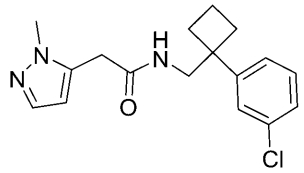
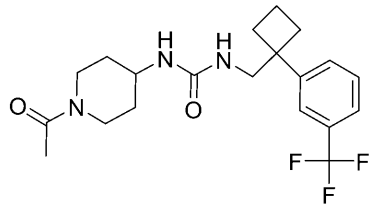
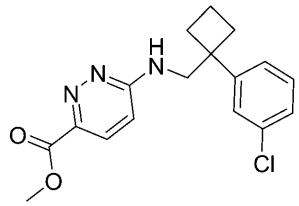
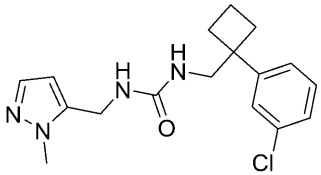
【表１－７９】

I-352		(400 MHz, DMSO-d6): 8.40 (d, J = 8.0 Hz 1H), 7.57～7.53 (m, 2H), 7.30～7.26 (m, 1H), 4.56～4.51 (m, 1H), 4.29～4.23 (m, 1H), 3.76～3.57 (m, 4H), 2.99～2.92 (m, 1H), 2.17～2.02 (m, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.88～1.72 (m, 2H), 1.61～1.40 (m, 5H), 1.30～1.22 (m, 2H), 1.10～1.00 (m, 2H).	411.2	E	
I-353		(400 MHz, DMSO-d6): 8.84 (d, J = 8.4 Hz 1H), 7.48～7.45 (m, 2H), 7.34～7.36 (m, 2H), 7.31～7.28 (m, 1H), 6.92 (d, J = 2.0 Hz 1H), 4.69～4.64 (m, 1H), 3.97 (s, 3H), 2.39～2.31 (m, 1H), 1.86～1.82 (m, 1H), 1.62～1.45 (m, 5H), 1.32～1.32 (m, 2H), 1.14～1.10 (m, 1H).	318.1	E	

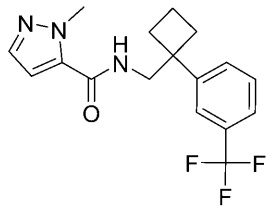
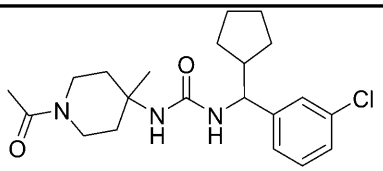
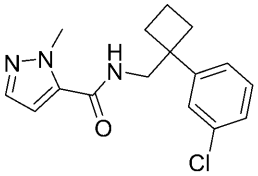
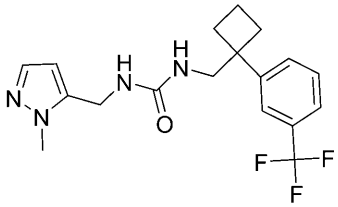
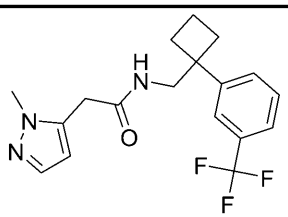
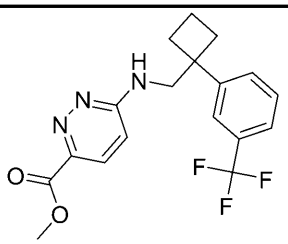
【表１－８０】

I-354		(400 MHz, CDCl3-d6): 7.37 (d, J = 2.0 Hz 1H), 7.23 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.20～7.17 (m, 1H), 7.17～7.13(m, 1H), 6.44 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.18～6.18 (m, 1H), 4.77～4.72 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 2.25～2.20 (m, 1H), 1.82～1.77 (m, 1H), 1.65～1.53 (m, 3H), 1.48～1.35 (m, 3H), 1.19～1.11 (m, 1H).	318.1	E	
I-355		(400 MHz, DMSO-d6): 7.34～7.20 (m, 4H), 6.36 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.04 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.45～4.40 (m, 1H), 3.50～3.47 (m, 2H), 3.20～3.15 (m, 1H), 3.01～2.96 (m, 2H), 2.16～1.98 (m, 3H), 1.84～1.77 (m, 2H), 1.67～1.41 (m, 5H), 1.33～1.23 (m, 2H), 1.14～1.08(m, 1H).	385.1	E	

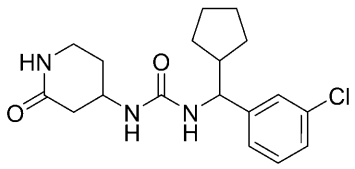
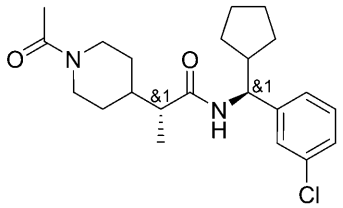
【表１－８１】

I-356		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.19 - 7.36 (m, 4 H), 6.57 (s, 1 H), 4.43 (d, J=8.0 Hz, 1 H), 3.96 - 4.32 (m, 1 H), 3.47 - 3.65 (m, 1 H), 3.23 - 3.46 (m, 2 H), 2.94 - 3.17 (m, 1 H), 1.94 - 2.18 (m, 2 H), 1.86 - 1.94 (m, 3 H), 1.02 - 1.81 (m, 9 H).	364.1	E	
I-357				E	
I-358				D	
I-359				E	
I-360				E	
I-361				E	

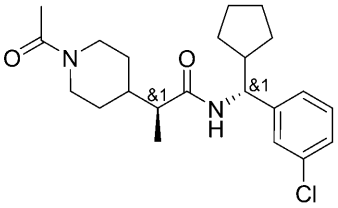
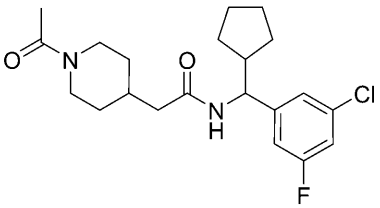
【表１－８２】

I-362				E	
I-363				D	
I-364				E	
I-365				E	
I-366				E	
I-367				E	

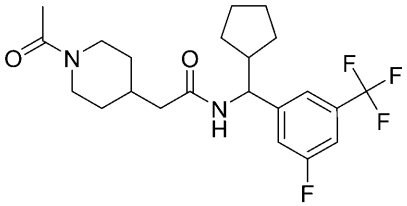
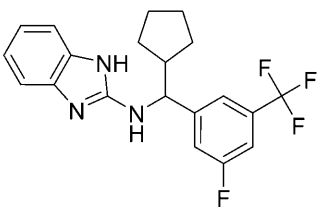
【表１－８３】

I-368		(400 MHz, DMSO-d6): 7.50 (d, 1H), 7.36～7.25 (m, 3H), 7.23～7.20 (m, 1H), 6.43 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 5.97～5.93 (m, 1H), 4.47～4.42 (m, 1H), 2.17～2.07 (m, 2H), 2.04～1.91 (m, 2H), 1.84～1.72 (m, 2H), 1.66～1.40 (m, 6H), 1.34～1.25 (m, 3H), 1.16～1.09 (m, 1H).	350.1	E	
I-369		(400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.40-7.29 (m, 2H), 7.29-7.21 (m, 2H), 4.6-4.50 (m, 1H), 4.40-4.27 (m, 1H), 3.85-3.73 (m, 1H), 3.02-2.87 (m, 1H), 2.38-2.46 (m, 1H), 2.21-2.03 (m, 2H), 1.96 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.76-1.44 (m, 8H), 1.30-1.19 (m, 2H), 1.11-0.83 (m, 6H).	391.2	E	

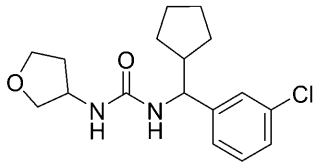
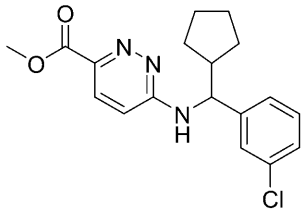
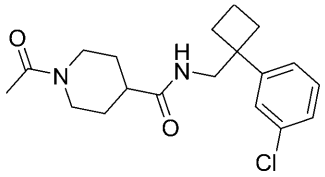
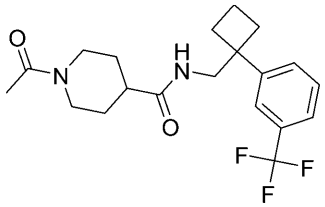
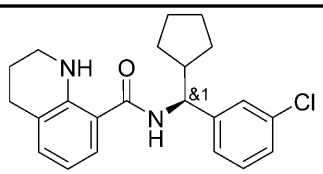
【表１－８４】

I-370		(400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.40-7.29 (m, 2H), 7.29-7.21 (m, 2H), 4.6-4.50 (m, 1H), 4.40-4.27 (m, 1H), 3.85-3.73 (m, 1H), 3.02-2.87 (m, 1H), 2.38-2.46 (m, 1H), 2.21-2.03 (m, 2H), 1.96 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.76-1.44 (m, 8H), 1.30-1.19 (m, 2H), 1.11-0.83 (m, 6H).	391.1	D	
I-371		(400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.280-7.21 (m, 2H), 7.15 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.63-4.53 (m, 1H), 4.35-4.20 (m, 1H), 3.77-3.66 (m, 1H), 3.01-2.89 (m, 1H), 2.47-2.42 (m, 1H), 2.21-2.02 (m, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.90-1.66 (m, 2H), 1.62-1.40 (m, 6H), 1.29-0.90 (m, 5H).	395.2	D	

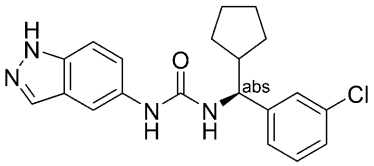
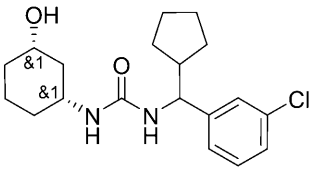
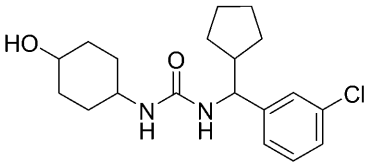
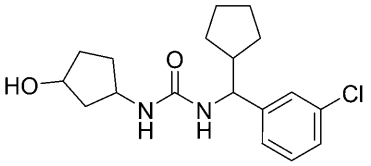
【表１－８５】

I-372		(400 MHz, DMSO-d6) 8.47-8.41 (m, 1H), 7.57-7.46 (m, 3H), 4.73-4.65 (m, 1H), 4.33-4.21 (m, 1H), 3.78-3.66 (m, 1H), 3.01-2.89 (m, 1H), 2.48-2.41 (m, 1H), 2.21-2.03 (m, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.90-1.69 (m, 2H), 1.62-1.40 (m, 6H), 1.31-0.90 (m, 5H).	429.2	D	
I-373		(400 MHz, DMSO-d6) 12.95 (s, 2H), 9.88 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.76-7.89 (m, 2H), 7.63 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.45-7.34 (m, 2H), 7.28-7.17 (m, 2H), 1.96-1.81 (m, 1H), 1.73-1.08 (m, 8H).	378.1	D	

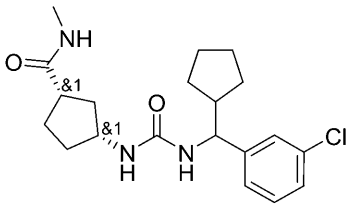
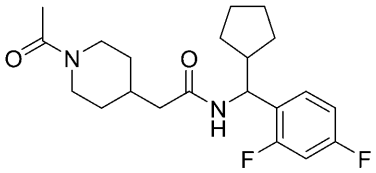
【表１－８６】

I-374		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.16 - 7.40 (m, 4 H), 6.39 (d, J=8.8 Hz, 1 H), 6.05 (d, J=7.2 Hz, 1 H) 4.41 - 4.46 (m, 1 H), 4.00 - 4.12 (m, 1 H), 3.61 - 3.78 (m, 3 H), 3.36 - 3.40(m, 1 H), 3.28 - 3.33 (m, 1 H), 1.96 - 2.19 (m, 2 H), 1.54 - 1.67 (m, 3 H), 1.39 - 1.51 (m, 2 H), 1.23 - 1.36 (m, 2 H), 1.05 - 1.19 (m, 1 H).	323.1	D	
I-375				E	
I-376				E	
I-377				E	
I-378				E	

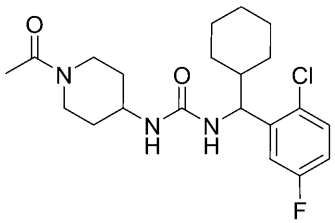
【表１－８７】

I-379				D	
I-380		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.36-7.16 (m, 4H), 6.31 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.72 (s, 1H), 4.50-4.38 (m, 1H), 3.76 (s, 2H), 2.15-2.05 (m, 1H), 1.65-1.09 (m, 16H).	351.1	E	
I-381		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.37-7.15 (m, 4H), 6.33 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.64 (s, 1H), 4.44-4.39 (m, 1H), 3.23 (d, J = 10.4 Hz, 2H), 2.16-2.05 (m, 1H), 173-1.05 (m, 16H).	351.1	E	
I-382		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.36-7.17 (m, 4H), 6.50-6.47 (m, 1H), 5.83 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.67 (s, 1H), 4.48-4.38 (m, 1H), 4.11-4.01 (m, 1H), 3.85 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 2.13-1.90 (m, 2H), 1.84-1.70 (m, 1H), 1.62-1.07 (m, 12H).	337.1	E	

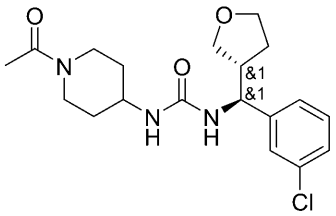
【表１－８８】

I-383		(400 MHz, DMSO-d6) 776 (m, 1H), 7.34-7.16 (m, 4H), 6.50-6.41 (m, 1H), 5.99-5.89 (m, 1H), 4.45-4.34 (m, 1H), 3.90-3.79 (m, 1H), 2.58-2.54 (m, 3H), 2.16-1.89 (m, 2H), 1.72-1.23 (m, 13H), 1.16-1.03 (m, 1H).	378.1	E	
I-384		(400 MHz, DMSO-d6) 8.43 (d, J = 8.0Hz, 1H), 7.49-7.39 (m, 1H), 7.18-7.00 (m, 2H), 4.88-4.78 (m, 1H), 4.30-4.19 (m, 1H), 3.76-3.66 (m, 1H), 3.01-2.88 (m, 1H), 2.48-2.39 (m, 1H),2.23-2.13 (m, 1H),2.07-1.99 (m, 2H), 1.95 (s, 3H), 1.90-1.70 (m, 2H), 1.61-1.39 (m, 6H), 1.33-1.22 (m, 2H), 1.11-0.88 (m, 3H).	379.2	E	

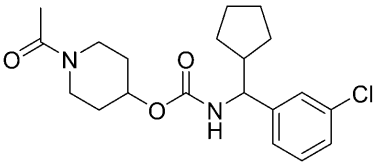
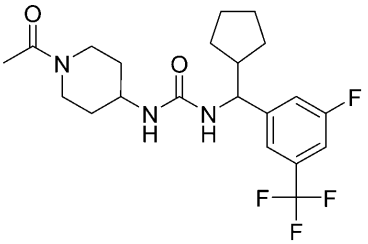
【表１－８９】

I-385		(400 MHz, DMSO-d6) 7.48-7.38 (m, 1H), 7.15-7.06 (m, 2H), 6.43 (d, J = 8.0Hz, 1H), 5.89 (d, J = 8.0Hz, 1H), 4.92-4.82 (m, 1H), 4.17-4.04 (m, 1H), 3.73-3.61 (m, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 3.12-3.03 (m, 1H), 2.77-2.64 (m, 1H), 1.97 (d, J = 8.0Hz, 3H), 1.75-1.55 (m, 7H), 1.37-1.10 (m, 8H).	410.1	E	

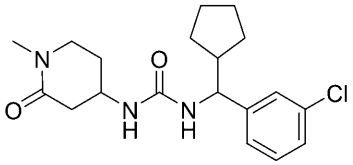
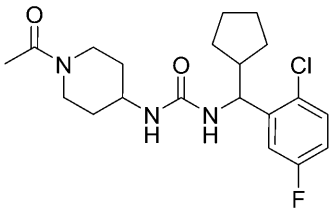
【表１－９０】

I-386		(DMSO-d6, 400MHz): 7.45-7.19 (m, 4H), 6.51 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.88 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.57 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 4.12 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.80-3.72 (m, 2H), 3.71-3.66 (m, 1H), 3.65-3.58 (m, 2H), 3.57-3.48 (m, 2H), 3.48-3.44 (m, 1H), 3.47-3.42 (m, 3H), 3.30-3.18 (m, 2H), 3.14-3.01 (m, 1H), 2.79-2.63 (m, 2H), 2.63-2.54 (m, 1H), 2.63-2.54 (m, 1H), 1.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 1.92-1.83 (m, 1H), 1.93-1.82 (m, 1H), 1.82-1.61 (m, 3H), 1.32-1.00 (m, 3H).	380.1	E	

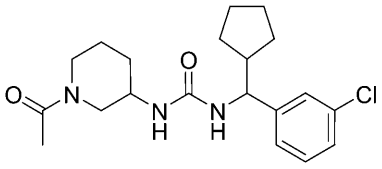
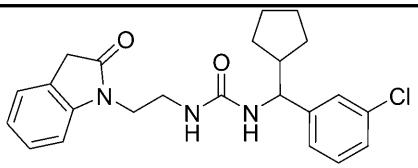
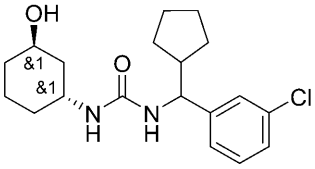
【表１－９１】

I-387		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.41-7.26 (m, 4H), 4.70-4.61 (m, 1H), 4.29-4.24 (m, 1H), 3.94-3.86 (m, 1H), 3.67-3.60 (m, 1H), 3.28-3.16 (m, 1H), 3.10-2.95 (m, 1H), 2.23-2.07 (m, 1H), 2.01-1.96 (m, 3H), 1.78-1.03 (m, 12H).	379.1	E	
I-388		(400 MHz, DMSO-d6) 7.53-7.38 (m, 3H), 8.57 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.97 (s, 1H), 4.59-4.50 (m, 1H), 4.16-4.04 (m, 1H), 3.76-3.60 (m, 1H), 3.13-3.00 (m, 1H), 2.77-2.44 (m, 1H), 2.20-2.05 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.79-1.11 (m, 13H).	430.1	D	

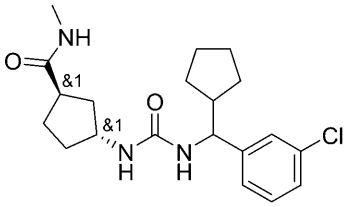
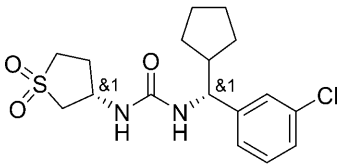
【表１－９２】

I-389		(400 MHz, MeOD-d6): 7.32～7.28 (m, 2H), 7.24～7.22 (m, 2H), 4.47～4.43 (m, 1H), 3.95～3.93 (m, 1H), 3.39～3.35 (m, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.89～2.89 (m, 1H), 2.26～2.18 (m, 2H), 2.09～1.99 (m, 1H), 1.86～1.51 (m, 6H), 1.45～1.37 (m, 2H), 1.22～1.18(m, 1H).	364.1	E	
I-390		(400 MHz, DMSO-d6) 7.45-7.39 (m, 1H), 7.20-7.14 (m, 1H), 7.13-7.07 (m, 1H), 6.44 (d, J = 8.0Hz, 1H), 5.87 (d, J = 8.0Hz, 1H), 4.96-4.89 (m, 1H), 4.16-4.05 (m, 1H), 3.73-3.63 (m, 1H), 3.56-3.45 (m, 1H), 3.13-3.00 (m, 1H),2.76-2.64 (m, 1H),2.21-2.11 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.83-1.03 (m, 12H).	396.1	E	

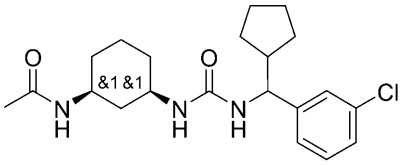
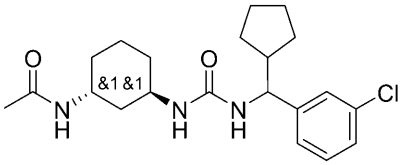
【表１－９３】

I-391		(400 MHz, DMSO-d6): 7.35～7.24 (m, 3H), 7.22～7.19 (m, 1H), 6.52～6.41 (m, 1H), 6.02～5.76 (m, 1H), 4.48～4.41 (m, 1H), 3.54～3.43 (m, 2H), 3.26～3.06 (m, 2H), 2.69～2.60 (m, 1H), 2.15～2.08 (m, 1H), 1.99～1.93 (m, 2H), 1.73～1.20 (m, 12H), 1.19～1.08(m, 1H).	378.2	E	
I-392				E	
I-393		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.35-7.17 (m, 4H), 6.36 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.71 (s, 1H), 4.49-4.35 (m, 1H), 3.55-3.45 (m, 2H), 2.14-2.06 (m, 1H), 1.99-1.84 (m, 1H), 1.73-1.40 (m, 8H), 1.35-1.23 (m, 2H), 1.21-1.07 (m, 2H), 1.06-0.84 (m, 3 H).	351.1	E	

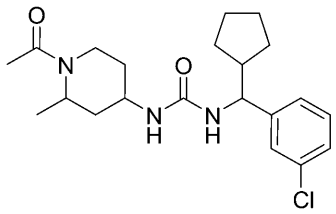
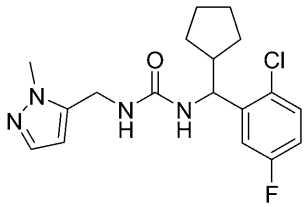
【表１－９４】

I-394		(400 MHz, DMSO-d6) 7.75-7.65 (m, 1H), 7.37-7.16 (m, 4H), 6.30 (d, J = 8.0Hz, 1H), 5.81 (d, J = 8.0Hz, 1H), 4.47-4.35 (m, 1H), 3.94-3.84 (m, 1H), 2.71-2.59 (m, 1H), 2.57-2.51 (m, 3H), 2.16-2.04 (m, 1H), 1.92-1.72 (m, 3H), 1.66-1.39 (m, 7H), 1.35-1.21 (m, 3H), 1.17-1.05 (m, 1H).	378.1	E	
I-395		(400 MHz, MeOD-d6): 7.32～7.28 (m, 2H), 7.25～7.20 (m, 2H), 4.49～4.40 (m, 2H), 3.45～3.32 (m, 2H), 3.27～3.08 (m, 2H), 2.96～2.85 (m, 1H), 2.53～2.43 (m, 1H), 2.23～2.05 (m, 2H), 1.88～1.79 (m, 1H), 1.70～1.55 (m, 3H), 1.45～1.37 (m, 2H), 1.21～1.15 (m, 1H).	371.1	E	

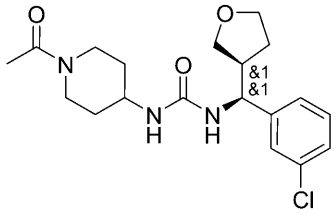
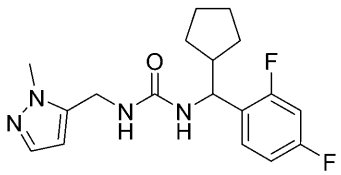
【表１－９５】

I-396		(400 MHz, MeOD-d6): 7.32～7.28 (m, 2H), 7.24～7.20 (m, 2H), 4.48～4.44 (m, 1H), 3.95～3.91 (m, 1H), 3.84 (s, 1H), 2.22～2.15 (m, 1H), 1.94 (d, J = 8.8 Hz, 3H), 1.88～1.74 (m, 1H), 1.78～1.48 (m, 11H), 1.46～1.35 (m, 3H), 1.25～1.15 (m, 1H).	392.2	E	
I-397		(400 MHz, MeOD-d6): 7.32～7.27 (m, 2H), 7.24～7.19 (m, 2H), 4.46～4.43 (m, 1H), 3.72～3.63 (m, 1H), 3.53～3.45 (m, 1H), 2.22～2.04 (m, 2H), 1.92～1.76 (m, 7H), 1.69～1.53 (m, 4H), 1.45～1.30 (m, 3H), 1.21～1.15 (m, 1H), 1.10～0.99 (m, 3H).	392.1	E	

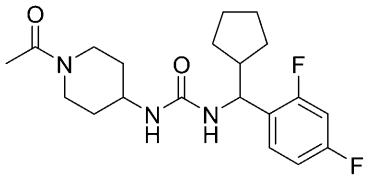
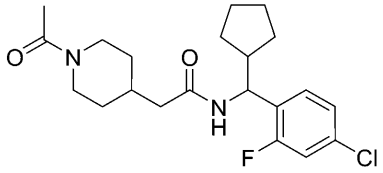
【表１－９６】

I-398		(400 MHz, メタノール-d6): 7.33-7.28 (m, 2H), 7.24-7.21 (m, 2H), 5.02-4.91 (m, 2H), 4.87-4.77 (m, 1H), 4.49-4.43 (m, 1H), 3.78-3.76 (m, 1H), 2.29-2.16 (m, 1H), 2.13 (s, 3H), 1.97-1.79 (m, 3H), 1.68-1.52 (m, 5H),1.47-1.18 (m, 7H).	392.1	E	
I-399		(400 MHz, DMSO-d6) 7.47-7.38 (m, 1H), 7.26 (d, J = 4.0Hz, 1H), 7.17-7.23 (m, 1H), 7.15-7.06 (m, 1H), 6.54 (d, J = 8.0Hz, 1H), 6.33-6.26 (m, 1H), 6.04 (d, J = 4.0Hz, 1H), 4.99-4.89 (m, 1H), 4.28-4.15 (m, 2H), 3.69 (s, 3H), 2.25-2.13 (m, 1H), 1.65-1.15 (m, 8H).	365	E	

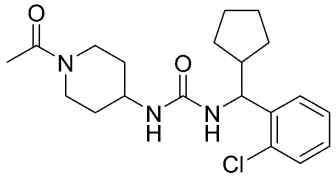
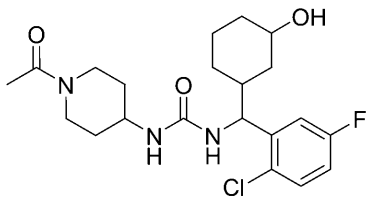
【表１－９７】

I-400		(DMSO-d6, 400MHz): = 7.47-7.21 (m, 4H), 6.51 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.87 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.54 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.22-4.05 (m, 1H), 3.78-3.70 (m, 2H), 3.68 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.61-3.53 (m, 2H), 3.52-3.45 (m, 1H), 3.15-3.01 (m, 1H), 2.79-2.64 (m, 1H), 2.61-2.54 (m, 1H), 1.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 1.83-1.67 (m, 2H), 1.65-1.55 (m, 1H), 1.51-1.38 (m, 1H), 1.32-1.03 (m, 2H).	380.1	E	
I-401		(400 MHz, DMSO-d6) 7.40-7.31 (m, 1H), 7.26 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.18-7.08 (m, 1H), 7.07-7.00 (m, 1H), 6.59 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.33-6.27 (m, 1H), 6.04 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 4.78-4.67 (m, 1H),4.30-4.14 (m, 2H), 3.69 (s, 3H), 2.21-2.09 (m, 1H), 1.73-1.04 (m, 8H).	349.1	E	

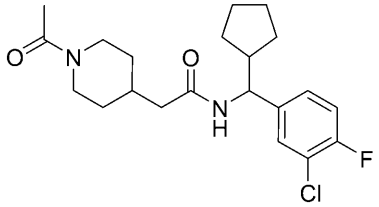
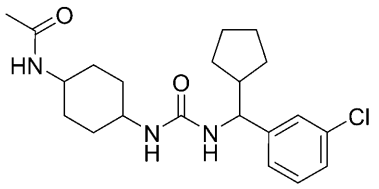
【表１－９８】

I-402		(400 MHz, DMSO-d6) 7.37-7.29 (m, 1H), 7.18-7.10 (m, 1H), 7.08-7.00 (m, 1H), 6.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.86 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.76-4.63 (m, 1H), 4.14-4.04 (m, 1H), 3.72-3.60 (m, 1H), 3.58-3.45 (m, 1H), 3.13-3.00 (m, 1H), 2.77-2.64 (m, 1H), 2.19-2.05 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.82-1.00 (m, 12H).	380.2	E	
I-403		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.45-7.37 (m, 1H), 7.35-7.29 (m, 1H), 7.28-7.24 (m, 1H), 4.87-4.79 (m, 1H), 4.32-4.21 (m, 1H), 3.77-3.67 (m, 1H), 3.01-2.88 (m, 1H), 2.49-2.40 (m, 1H), 2.24-2.00 (m, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.90-1.70 (m, 2H), 1.63-1.40 (m, 6H), 1.34-1.23 (m, 2H), 1.11-0.85 (m, 3H).	395	E	

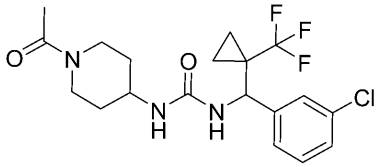
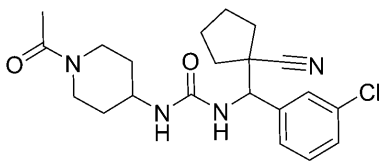
【表１－９９】

I-404		(400 MHz, DMSO-d6) 7.39-7.26 (m, 3H), 7.25-7.17 (m, 1H), 6.41 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.87 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.02-4.93 (m, 1H), 4.15-4.03 (m, 1H), 3.72-3.60 (m, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.13-3.00 (m, 1H), 2.77-2.64 (m, 1H), 2.25-2.10 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.82-1.01 (m, 12H).	378.1	E	
I-405		(400 MHz, DMSO-d6) 7.50-7.40 (m, 1H), 7.16-7.03 (m, 2H), 6.51-6.38 (m, 1H), 5.97-5.82 (m, 1H), 4.98-4.78 (m, 1H), 4.62-4.48 (m, 1H), 4.34-4.24 (m, 1H), 4.19-4.02 (m, 1H), 3.94-3.79 (m, 1H), 3.74-3.60 (m, 1H), 3.11-2.98 (m, 1H), 2.77-2.63 (m, 1H), 1.97 (d, J = 8.0 Hz, 3H), 1.90-0.8 (m, 13H).	426.1	E	

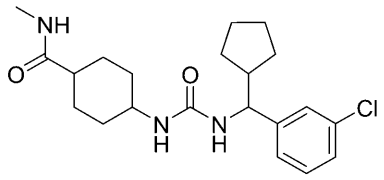
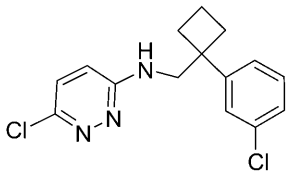
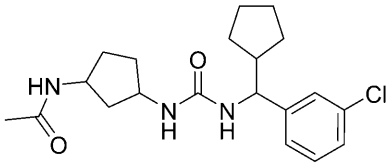
【表１－１００】

I-406		(400 MHz, DMSO-d6) 8.34 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.38-7.25 (m, 2H), 4.62-4.50 (m, 1H), 4.33-4.20 (m, 1H), 3.80-3.66 (m, 1H), 3.02-2.89 (m, 1H), 2.48-2.40 (m, 1H), 2.20-2.08 (m, 1H), 2.06-1.99 (m, 2H), 1.95 (s, 3H), 1.90-1.68 (m, 2H), 1.63-1.40 (m, 6H), 1.31-1.20 (m, 2H), 1.15-0.85 (m, 3H).	395.1	E	
I-407		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.15 - 7.20 (m, 2 H), 7.07 - 7.12 (m, 2 H), 4.29 - 4.38 (m, 1 H), 3.57 - 3.67 (m, 1 H), 3.45 - 3.56 (m, 1 H), 2.01 - 2.13 (m, 1 H), 1.83 (s, 3 H), 1.65 - 1.81 (m, 2 H), 1.38 - 1.61 (m, 11 H), 1.23 - 1.35 (m, 2 H), 1.02 - 1.12 (m, 1 H).	392.1	E	

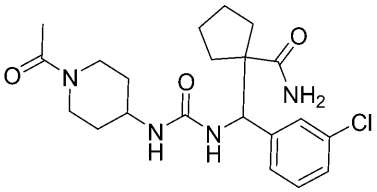
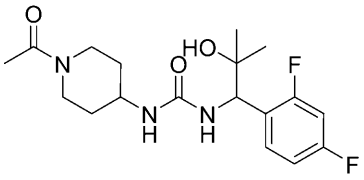
【表１－１０１】

I-408		(400 MHz, DMSO-d6): 7.27-7.39 (m, 4H), 6.66-6.69 (m, 1H), 6.11-6.14 (m, 1H), 4.98-5.02 (m, 1H), 4.07-4.13 (m, 1H), 3.53-3.70 (m, 2H), 3.09-3.13 (m, 1H), 2.74-2.78 (m, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.73-1.77 (m, 2H), 1.10-1.30 (m, 3H), 0.98-1.01 (m, 2H), 0.67-0.70 (m, 1H).	418.1	E	
I-409		(400 MHz, DMSO-d6): 7.48-7.38 (m, 4H), 6.86 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 6.09 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 483 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 4.10-4.04 (m, 1H), 3.69-3.52 (m, 2H), 3.14-3.06 (m, 1H), 2.80-2.72 (m, 1H), 2.07-1.64 (m, 12H), 1.52-1.05 (m, 3H).	403.1	E	

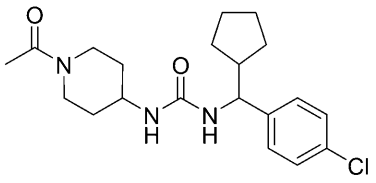
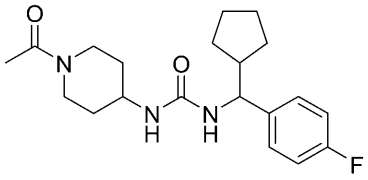
【表１－１０２】

I-410		(DMSO-d6, 400MHz): = 7.63 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.44-7.04 (m, 5H), 6.34 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.68 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.56-4.35 (m, 1H), 3.29-3.13 (m, 1H), 2.60-2.53 (m, 5H), 2.20-2.07 (m, 1H), 2.04-1.91 (m, 1H), 1.88-1.24 (m, 14H), 1.18-0.94 (m, 2H).	392.1	E	
I-411				E	
I-412		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.81 - 7.89 (m, 1 H), 7.19 - 7.36 (m, 4 H), 6.26 - 6.38 (m, 1 H), 5.83 - 5.90 (m, 1 H), 4.40 - 4.47 (m, 1 H), 4.03 - 4.14 (m, 1 H), 3.86 - 3.98 (m, 1 H), 1.87 - 2.18 (m, 3 H), 1.75 - 1.79 (m, 3 H), 1.14 - 1.67 (m, 12 H).	378.2	E	

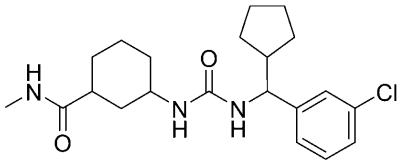
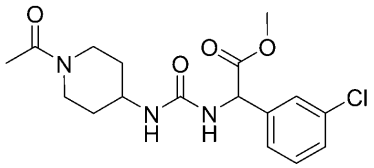
【表１－１０３】

I-413		(400 MHz, DMSO-d6): 7.32-7.25 (m, 3H), 7.18-7.11 (m, 1H), 6.99 (s, 1H), 6.70 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.35 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.89 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 4.10-4.04 (m, 1H), 3.69-3.63 (m, 1H), 3.54-3.46 (m, 1H), 3.12-3.02 (m, 1H), 2.77-2.67 (m, 1H), 1.97-1.43 (m, 13H), 1.27-1.05 (m, 2H).	421.1	E	
I-414		(400 MHz, DMSO-d6): 7.33-7.36 (m, 1H), 7.02-7.13 (m, 2H), 6.44-6.48 (m, 1H), 6.19-6.22 (m, 1H), 4.78-4.81 (m, 1H), 4.65 (s, 1H), 4.02-4.09 (m, 1H), 3.65-3.69 (m, 1H), 3.51-3.53 (m, 1H), 3.04-3.14 (m, 1H), 2.72-2.81 (m, 1H), 1.97-1.99 (m, 3H), 1.61-1.78 (m, 2H), 1.04-1.27 (m, 5H), 0.94 (s, 3H).	370.1	E	

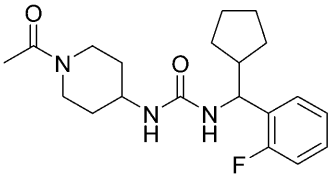
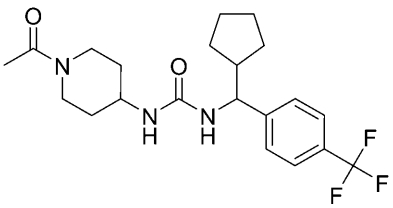
【表１－１０４】

I-415		(400 MHz, DMSO-d6) 7.36-7.31 (m, 2H), 7.28-7.22 (m, 2H), 6.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.81 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.48-4.38 (m, 1H), 4.15-4.04 (m, 1H), 3.73-3.61 (m, 1H), 3.58-3.46 (m, 1H), 3.1 - 3.00 (m, 1H), 2.7-2.64 (m, 1H), 2.14-2.04 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.74-1.07 (m, 12H).	378.1	E	
I-416		(400 MHz, DMSO-d6) 7.30-7.20 (m, 2H), 7.16-7.05 (m, 2H), 6.31 (d, J=8.0 Hz, 1H), 5.77 (d, J=8.0 Hz, 1H), 4.48-4.38 (m, 1H), 4.17-4.05 (m, 1H), 3.72-3.62 (m, 1H), 3.15-3.0 (m, 1H), 2.80-2.63 (m, 1H), 2.16-2.04 (m, 1H), 1.97 (d, J=3.00 Hz, 3H), 1.03 - 1.81 (m, 13H).	362.2	E	

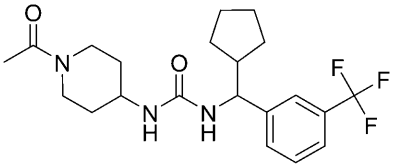
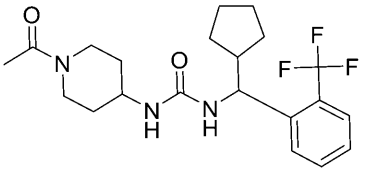
【表１－１０５】

I-417		(400 MHz, DMSO-d6) 7.71-7.52 (m, 1H), 7.36-7.15 (m, 4H), 6.42-6.28 (m, 1H), 5.96-5.64 (m, 1H), 4.49-4.36 (m, 1H), 3.31-3.20 (m, 1H), 2.56 - 2.51 (m, 3H). 2.32-1.98 (m, 2H), 1.77-0.91 (m, 16H).	391.2	E	
I-418		(400 MHz, DMSO-d6) 7.46-7.37 (m, 3H), 7.35-7.28 (m, 1H), 7.04-6.78 (m, 1H), 6.33 (s, 1H), 5.32 (s, 1H), 4.13-3.99 (m, 1H), 3.74-3.64 (m, 1H), 3.62 (s, 3H), 3.60-3.53 (m, 1H), 3.18-3.04 (m, 1H), 2.85-2.72 (m, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.84-1.63 (m, 2H), 1.32-1.01 (m, 2H).	368.1	E	

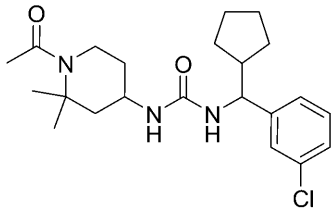
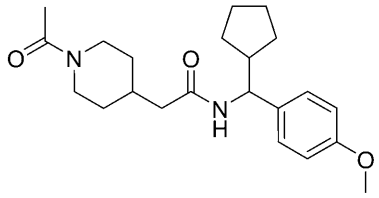
【表１－１０６】

I-419		(400 MHz, DMSO-d6) 7.34-7.21 (m, 2H), 7.18-7.08 (m, 2H), 6.41 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.95 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.80-4.72 (m, 1H), 4.14-4.03 (m, 1H), 3.72-3.60 (m, 1H), 3.58-3.47 (m, 1H), 3.15-3.02 (m, 1H), 2.80-2.66 (m, 1H), 2.20-2.06 (m, 1H), 1.97 (d, J=4.0 Hz, 3H), 1.80-1.08 (m, 12H).	362.2	E	
I-420		(400 MHz, DMSO-d6) 7.65 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.45 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 6.45 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.86 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.56-4.46 (m 1H), 4.16-4.05 (m, 1H), 3.73-3.60 (m, 1H), 3.58-3.64 (m, 1H), 3.14-3.00 (m, 1H), 2.76-2.65 (m, 1H), 2.20-2.05(m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.74-1.06 (m, 12H).	412.2	E	

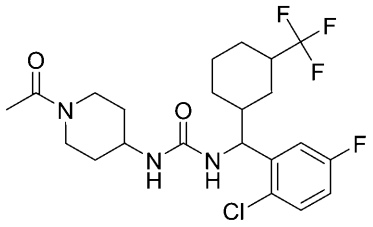
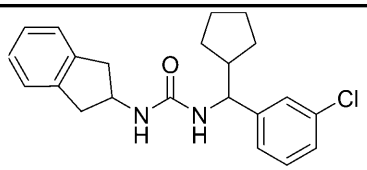
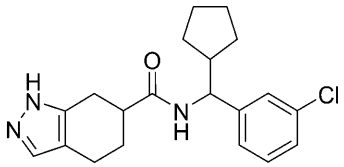
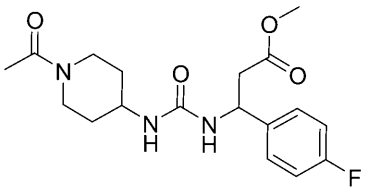
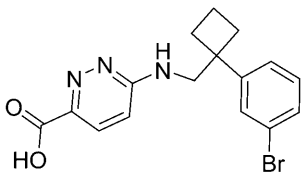
【表１－１０７】

I-421		(400 MHz, DMSO-d6) 7.61-7.49 (m, 4H), 6.46 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.58-4.48 (m, 1H), 4.16-4.06 (m, 1H), 3.73-3.60 (m, 1H), 3.59-3.46 (m, 1H), 3.14-2.98 (m, 1H), 2.76-2.62 (m, 1H), 2.19-2.08 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.81-1.39 (m, 7H), 1.33-1.05 (m, 5H).	412.1	E	
I-422		(400 MHz, DMSO-d6) 7.70-7.62 (m, 2H), 7.57 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.46-7.39 (m, 1H), 6.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.79 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.05-4.95 (m, 1H), 4.17-4.04 (m, 1H), 3.74-3.60 (m, 1H), 3.57-3.49 (m, 1H), 3.13-3.00 (m, 1H), 2.76-2.63 (m, 1H), 2.24-2.13 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.73-1.06 (m, 12H).	412.2	D	

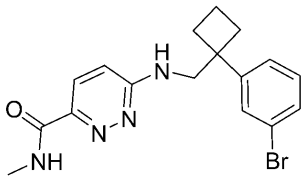
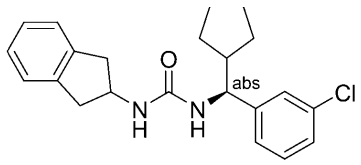
【表１－１０８】

I-423		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.19 - 7.37 (m, 4 H), 6.37 - 6.41 (m, 1 H), 5.78 (d, J=7.6 Hz, 1 H), 4.39 - 4.45 (m, 1 H), 3.50 - 3.65 (m, 2 H), 3.08 - 3.17 (m,1 H), 2.05 - 2.18 (m, 1 H), 1.95 (d, J=3.2 Hz, 3 H), 1.00 - 1.76 (m, 18 H).	406.1	E	
I-424		(DMSO-d6, 400 MHz) 8.19 (1H, d, J=8.9 Hz), 7.24-7.16 (2H, m), 6.89-6.81 (2H, m), 4.57-4.47 (1H, m), 4.27 (1H, t, J=12.7 Hz), 3.72 (4H, s), 3.02-2.89 (1H, m), 2.51-2.41 (1H, m), 2.16 (1H, h, J=8.0 Hz), 2.13-1.98 (2H, m), 1.96 (3H, d, J=1.1 Hz), 1.87 (1H, s), 1.76-1.67 (1H, m), 1.66-1.36 (6H, m), 1.35-1.20 (2H, m), 1.12-1.01 (2H, m), 1.00-0.85 (1H, m)	373.2	E	

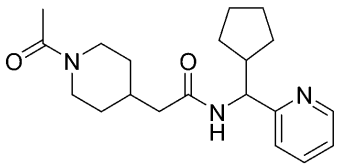
【表１－１０９】

I-425		(400 MHz, メタノール-d6): 7.48-7.45 (m, 1H), 7.32-7.23 (m, 2H), 6.54-6.39 (m, 1H), 5.91-5.89 (m, 1H), 5.25-4.93 (m, 1H), 4.25-4.10 (m, 1H), 3.70-3.66 (m, 1H), 3.12-3.03 (m, 1H), 2.76-2.67 (m, 1H), 2.25-2.14 (m, 1H), 1.98-1.97 (m, 3H), 1.80-1.63 (m, 6H), 1.39-1.00 (m, 8H).	378.2	E	
I-426				E	
I-427				E	
I-428				D	D
I-429				D	

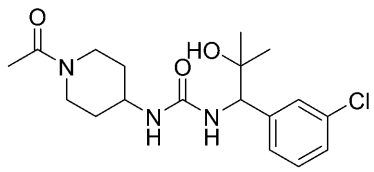
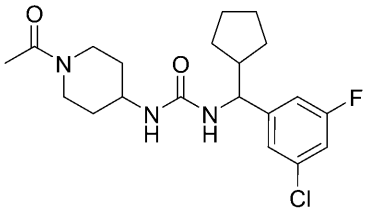
【表１－１１０】

I-430		(400 MHz, DMSO) δ 8.66 (q, J = 4.7 Hz, 1H), 7.64 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.32 (tt, J = 3.3, 1.6 Hz, 3H), 7.26 - 7.19 (m, 1H), 7.17 (dt, J = 7.7, 1.4 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 2.76 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.35 - 2.18 (m, 4H), 2.08 (dt, J = 11.2, 8.5 Hz, 1H), 1.80 (dtd, J = 11.1, 8.9, 4.4 Hz, 1H).	375.3	E	
I-431				E	

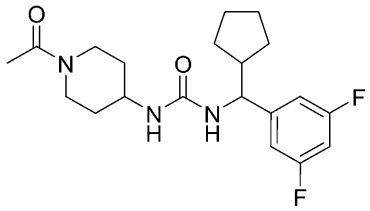
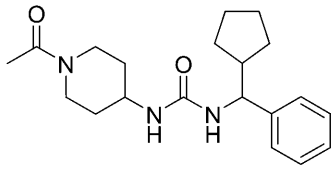
【表１－１１１】

I-432		(400 MHz, DMSO-d6) 8.50 (dd, J = 4.9, 1.8 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.73 (td, J = 7.7, 1.9 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.23 (ddd, J = 7.6, 4.8, 1.2 Hz, 1H), 4.73 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 4.27 (t, J = 13.0 Hz, 1H), 3.73 (t, J = 12.9 Hz, 1H), 3.02-2.89 (m, 1H), 2.46 (ddd, J = 12.7, 9.6, 2.8 Hz, 1H), 2.33 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 2.16-2.00 (m, 2H), 1.96 (d, J = 1.4 Hz, 3H), 1.87 (s, 1H), 1.78-1.62 (m, 1H), 1.62-1.37 (m, 6H), 1.36-1.20 (m, 2H), 1.19-1.10 (m, 1H), 1.09-0.99 (m, 1H), 0.93 (td, J = 12.3, 4.2 Hz, 1H)	344.15	E	

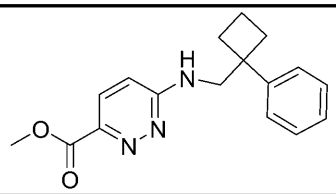
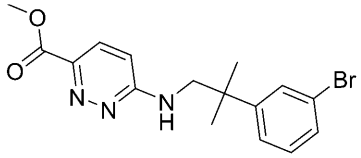
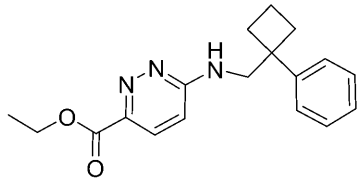
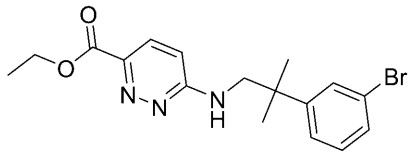
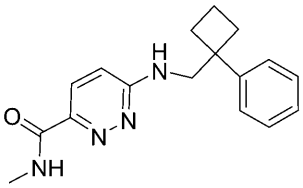
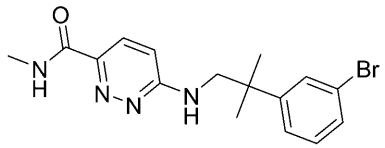
【表１－１１２】

I-433		(400 MHz, DMSO-d6) 7.34 - 7.19 (m, 4H), 6.59 (s, 1H), 4.46 (s, 1H), 4.05-3.91 (m, 2H), 3.71 - 3.59 (m, 1H), 3.57 - 3.48 (m, 1 H), 3.16-3.02 (m, 1H), 2.86-2.71 (m, 1H), 1.97 (d, J=4.0 Hz, 3H), 1.82-1.57 (m, 2H), 1.29-0.99 (m, 5H), 0.95 (s, 5H).	368.1	E	
I-434		(400 MHz, DMSO-d6) 7.26-7.21 (m, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.13-7.06 (m, 1H), 6.43 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.87 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.49-4.40 (m, 1H), 4.17-4.06 (m, 1H), 3.74-3.62 (m, 1H), 3.57-3.48 (m, 1H), 3.12-3.01 (m, 1H), 2.76-2.64 (m, 1H), 2.17-2.04 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.17 - 1.10 (m, 12H)	396.1	E	

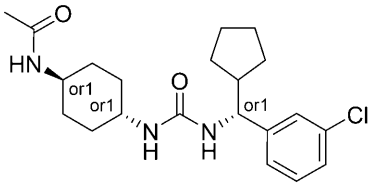
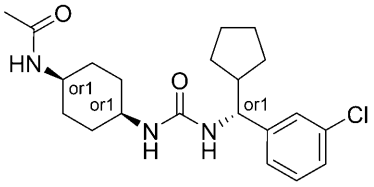
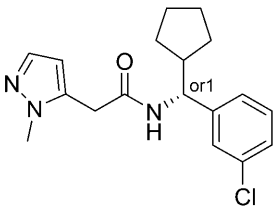
【表１－１１３】

I-435		(400 MHz, DMSO-d6) 7.07-6.90 (m, 3H), 6.38 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.84 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.52-4.40 (m, 1H), 4.16-4.06 (m, 1H), 3.73-3.63 (m, 1H), 3.58-3.49 (m, 1H), 3.13-3.01 (m, 1H), 2.75-2.65 (m, 1H), 2.16-2.05 (m, 1H), 1.97 (d, J =4.0 Hz, 3H), 1.74 - 1.10 (m, 12H).	380.2	E	
I-436		(400 MHz, DMSO-d6) 7.32-7.26 (m, 2H), 7.25-7.16 (m, 3H), 6.31 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.79 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.50-4.39 (m, 1H), 4.14-4.04 (m, 1H), 3.72-3.61 (m, 1H), 3.58-3.48 (m, 1H), 3.14-3.01 (m, 1H), 2.77-2.65 (m, 1H), 2.18-2.05 (m, 1H), 1.97 (d, J =4.0 Hz, 3H), 1.74 - 1.08 (m, 12H).	344.2	E	

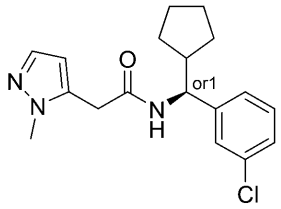
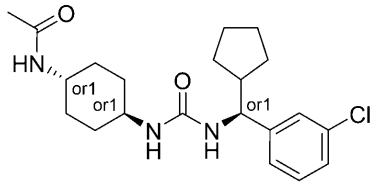
【表１－１１４】

I-437			298.38	E	
I-438			364.3	E	
I-439			312.39	E	
I-440			370.3	E	
I-441		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 8.69 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.12-7.32 (m, 6H), 6.81 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.83 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.21-2.39 (m, 4H), 2.03-2.15 (m, 1H), 1.75-1.86 (m, 1H).	297.1	E	
I-442			363.25	E	

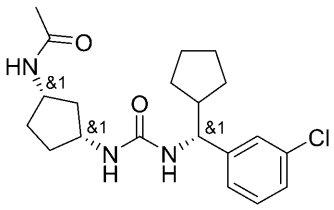
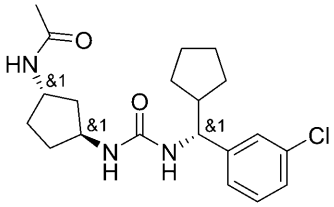
【表１－１１５】

I-443		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.27 - 7.34 (m, 2 H), 7.19 - 7.25 (m, 1 H), 7.19 - 7.25 (m, 1 H), 4.44 (d, J=9.6 Hz, 1 H), 3.47 - 3.73 (m, 2 H), 2.15- 2.22 (m, 1 H), 1.92 (s, 3 H), 1.82 (d, J=8.0 Hz, 1 H), 1.49 - 1.73 (m, 4 H), 1.18 - 1.41 (m, 10 H), 0.91 (d, J=7.2 Hz, 1 H)	392.1	D	
I-444		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.15 - 7.22 (m, 2 H), 7.07 - 7.14 (m, 2 H), 4.35 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 3.62 (s, 1 H), 3.52 (s, 1 H), 2.02 - 2.13 (m, 1 H), 1.83 (s, 3 H), 1.68 - 1.73 (m, 1 H), 1.40 - 1.61 (m, 12 H), 1.25 - 1.34 (m, 2 H), 1.03 - 1.14 (m, 1 H).	392.1	E	
I-445		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.19 - 7.47 (m, 5 H), 6.10 (br s, 1 H), 3.75 (br s, 3 H), 3.57 - 3.70 (m, 2 H), 2.30 (br d, J=8.0 Hz, 1 H), 1.08 - 1.98 (m, 8 H)	332.1	E	

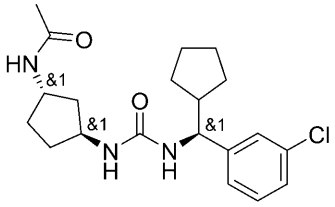
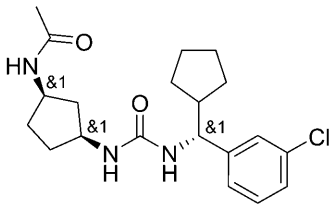
【表１－１１６】

I-446		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.20 - 7.39 (m, 5 H), 6.11 (s, 1 H), 4.56 (br d, J=10.4 Hz, 1 H), 3.75 (s, 3 H), 3.58 - 3.70 (m, 2 H), 2.24 - 2.36 (m, 1 H), 1.83 - 1.94 (m, 1 H), 1.49 - 1.74 (m, 4 H), 1.29 - 1.41 (m, 2 H), 1.06 - 1.20 (m, 1 H)	332.1	E	
I-447		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.27 - 7.33 (m, 2 H), 7.19 - 7.26 (m, 2 H), 4.42 - 4.51 (m, 1 H), 3.69 - 3.80 (m, 1 H), 3.64 (s, 1 H), 2.14 - 2.25 (m, 1 H), 1.95 (s, 3 H), 1.77 - 1.87 (m, 1 H), 1.50 - 1.76 (m, 12 H), 1.38 - 1.48 (m, 2 H), 1.17 - 1.26 (m, 1 H).	392.1	E	

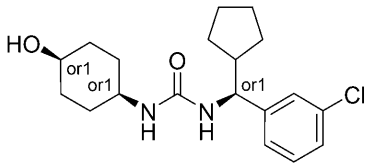
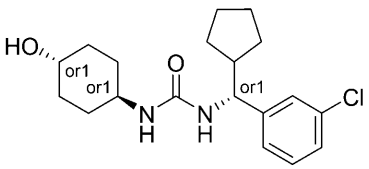
【表１－１１７】

I-448		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.27 - 7.33 (m, 2 H), 7.19 - 7.25 (m, 2 H), 4.44 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 4.17 - 4.28 (m, 1 H), 4.02 - 4.13 (m, 1 H), 2.14 - 2.25 (m, 1 H), 2.02 - 2.13 (m, 2 H), 1.92 (d, J=4.8 Hz, 3 H), 1.50 - 1.88 (m, 7 H), 1.37 - 1.49 (m, 4 H), 1.14-1.24 (m, 1 H).	378.1	E	
I-449		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.26 - 7.33 (m, 2 H), 7.20 - 7.26 (m, 2 H), 4.44 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 4.05 (d, J=4.8 Hz, 1 H), 3.90-3.95 (m, 1 H), 2.30 - 2.43 (m, 1 H), 2.12 - 2.27 (m, 1 H), 1.95 (d, J=6.8 Hz, 1 H), 1.92 (d, J=4.4 Hz, 3 H), 1.81-1.86 (m, 1 H), 1.47 - 1.76 (m, 6 H), 1.36 - 1.46 (m, 2 H), 1.26 - 1.34 (m, 2 H), 1.15 - 1.22 (m, 1 H).	378.1	E	

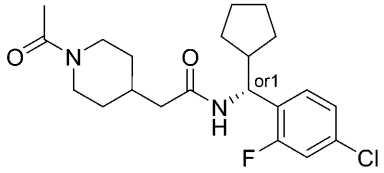
【表１－１１８】

I-450		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.27 - 7.34 (m, 2 H), 7.18 - 7.25 (m, 2 H), 4.44 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 4.18 - 4.25 (m, 1 H), 4.05 - 4.09 (m, 1 H), 2.15 - 2.25 (m, 1 H), 2.02 - 2.14 (m, 2 H), 1.92 (d, J=4.8 Hz, 3 H), 1.50 - 1.86 (m, 7 H), 1.29 - 1.47 (m, 4 H), 1.12 - 1.26 (m, 1 H).	378.1	E	
I-451		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.27 - 7.38 (m, 2 H), 7.18 - 7.26 (m, 2 H), 4.44 (d, J=9.6 Hz, 1 H), 4.00 - 4.12 (m, 1 H), 3.90-3.95 (m, 1 H), 2.28 - 2.45 (m, 1 H), 2.11 - 2.24 (m, 1 H), 1.94 - 2.00 (m, 1 H), 1.92 (d, J=4.4 Hz, 3 H), 1.81 - 1.86 (m, 1 H), 1.48 - 1.76 (m, 6 H), 1.12 - 1.47 (m, 5 H).	378.1	E	

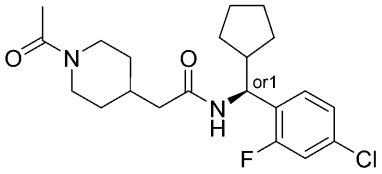
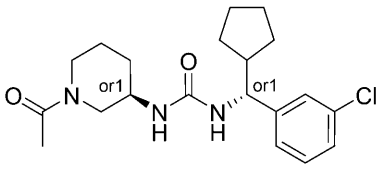
【表１－１１９】

I-452		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.17 - 7.37 (m, 4 H), 4.45 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 3.47 - 3.57 (m, 1 H), 3.36 - 3.46 (m, 1 H), 2.23 - 2.13 (m, 1 H), 1.79 - 1.95 (m, 4 H), 1.50 - 1.72 (m, 4 H), 1.29 - 1.44 (m, 5 H), 1.13 - 1.26 (m, 3 H)	351.1	D	
I-453		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.18 - 7.35 (m, 4 H), 4.44 (br d, J=8.8 Hz, 1 H), 3.52 (br s, 1 H), 3.40 (br s, 1 H), 2.13 - 2.24 (m, 1 H), 1.15 - 1.99 (m, 16 H)	351.1	E	

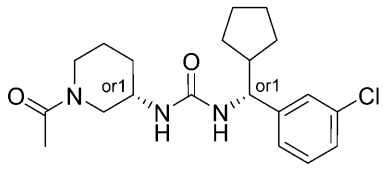
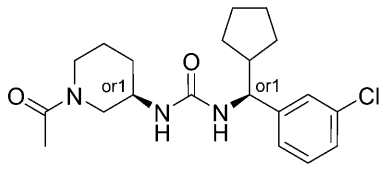
【表１－１２０】

I-454		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.44-7.37 (m, 1H), 7.36-7.30 (m, 1H), 7.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.89-4.77 (m, 1H), 4.36-4.18 (m, 1H), 3.82-3.66 (m, 2H), 3.02-2.87 (m, 1H), 2.48-2.40 (m, 1H), 2.26-2.10 (m, 1H), 2.09-1.99 (m, 2H), 1.95 (s, 3H), 1.90-1.71 (m, 2H), 1.64-1.39 (m, 5H), 1.35-1.22 (m, 2H), 1.10-0.86 (m, 3H).	395.1	E	

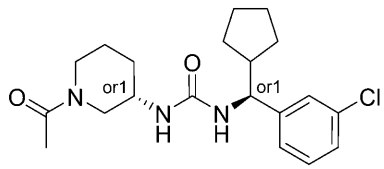
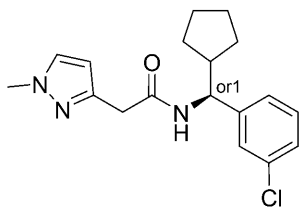
【表１－１２１】

I-455		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.44-7.37 (m, 1H), 7.36-7.30 (m, 1H), 7.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.89-4.77 (m, 1H), 4.36-4.18 (m, 1H), 3.82-3.66 (m, 2H), 3.02-2.87 (m, 1H), 2.48-2.40 (m, 1H), 2.26-2.10 (m, 1H), 2.09-1.99 (m, 2H), 1.95 (s, 3H), 1.90-1.71 (m, 2H), 1.64-1.39 (m, 5H), 1.35-1.22 (m, 2H), 1.10-0.86 (m, 3H).	395.1	E	
I-456		(400 MHz, DMSO-d6) 7.37-7.13 (m, 4H), 6.54-6.38 (m, 1H), 6.03-5.73 (m, 1H), 4.53-4.35 (m, 1H), 4.03-3.40 (m, 3H), 3.30-2.61 (m, 2H), 2.17-2.04 (m, 1H), 2.00-1.90 (m, 3H), 1.75-1.21 (m, 11H), 1.19-1.03 (m, 1H).	378.1	E	

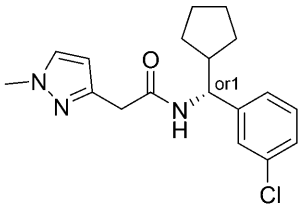
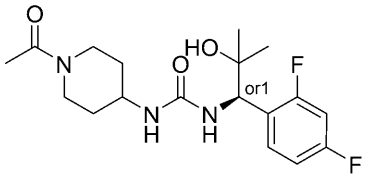
【表１－１２２】

I-457		(400 MHz, DMSO-d6) 7.39-7.15(m, 4H), 6.53 - 6.40 (m, 1H), 6.06-5.73 (m, 1H), 4.49-4.37 (m, 1H), 3.98-3.48 (m, 2H), 3.24-2.57 (m, 2H), 2.17-2.05 (m, 1H), 1.97 (s, 1H), 1.73 (s, 3H), 1.68-1.21 (m, 11H), 1.18-1.05 (m, 1H).	378.1	E	
I-458		(400 MHz, DMSO-d6) 7.39-7.15(m, 4H), 6.53 - 6.40 (m, 1H), 6.06-5.73 (m, 1H), 4.49-4.37 (m, 1H), 3.98-3.48 (m, 2H), 3.24-2.57 (m, 2H), 2.17-2.05 (m, 1H), 1.97 (s, 1H), 1.73 (s, 3H), 1.68-1.21 (m, 11H), 1.18-1.05 (m, 1H).	378.1	E	

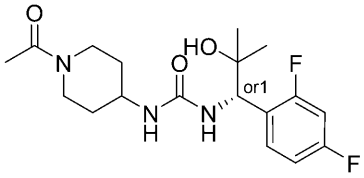
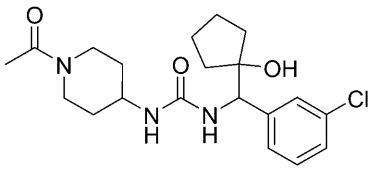
【表１－１２３】

I-459		(400 MHz, DMSO-d6) 7.37-7.13 (m, 4H), 6.54-6.38 (m, 1H), 6.03-5.73 (m, 1H), 4.53-4.35 (m, 1H), 4.03-3.40 (m, 3H), 3.30-2.61 (m, 2H), 2.17-2.04 (m, 1H), 2.00-1.90 (m, 3H), 1.75-1.21 (m, 11H), 1.19-1.03 (m, 1H).	378.1	E	
I-460		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.70 (d, J=2.0 Hz, 1 H), 7.20 - 7.40 (m, 4 H), 6.29 (d, J=2.0 Hz, 1 H), 4.60 (d, J=10.0 Hz, 1 H), 3.93 (s, 3 H), 3.57 - 3.72 (m, 2 H), 2.26 - 2.37 (m, 1 H), 1.83 - 1.96 (m, 1 H), 1.52 - 1.75 (m, 4 H), 1.32 - 1.46 (m, 2 H), 1.10 - 1.22 (m, 1 H)	332.1	E	

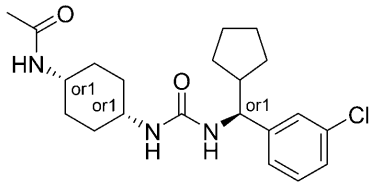
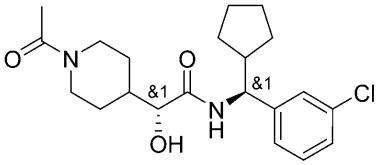
【表１－１２４】

I-461		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.53 (d, J=1.2 Hz, 1 H), 7.21 - 7.35 (m, 1 H), 7.21 - 7.35 (m, 3 H), 6.16 (d, J=1.6 Hz, 1 H), 4.60 (d, J=10.0 Hz, 1 H), 3.87 (s, 3 H), 3.50 - 3.61 (m, 2 H), 2.20 - 2.37 (m, 1 H), 1.78 - 1.96 (m, 1 H), 1.51 - 1.71 (m, 4 H), 1.34 - 1.44 (m, 2 H), 1.07 - 1.23 (m, 1 H)	332.1	E	
I-462		(400 MHz, DMSO-d6): 7.33-7.36 (m, 1H), 7.02-7.13 (m, 2H), 6.44-6.48 (m, 1H), 6.19-6.22 (m, 1H), 4.78-4.81 (m, 1H), 4.65 (s, 1H), 4.02-4.09 (m, 1H), 3.65-3.69 (m, 1H), 3.51-3.53 (m, 1H), 3.04-3.14 (m, 1H), 2.72-2.81 (m, 1H), 1.97-1.99 (m, 3H), 1.61-1.78 (m, 2H), 1.04-1.27 (m, 5H), 0.94 (s, 3H).	370.1	E	

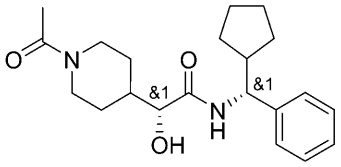
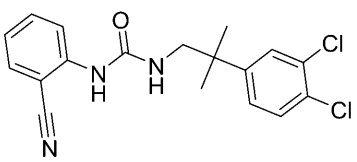
【表１－１２５】

I-463		(400 MHz, DMSO-d6): 7.33-7.36 (m, 1H), 7.02-7.13 (m, 2H), 6.44-6.48 (m, 1H), 6.19-6.22 (m, 1H), 4.78-4.81 (m, 1H), 4.65 (s, 1H), 4.02-4.09 (m, 1H), 3.65-3.69 (m, 1H), 3.51-3.53 (m, 1H), 3.04-3.14 (m, 1H), 2.72-2.81 (m, 1H), 1.97-1.99 (m, 3H), 1.61-1.78 (m, 2H), 1.04-1.27 (m, 5H), 0.94 (s, 3H).	370.1	E	
I-464		(DMSO-d6, 400MHz): 7.35 (s, 1H), 7.33-7.22 (m, 3H), 6.50 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 6.16 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.58-4.47 (m, 2H), 4.08 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.64 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 3.52 (s, 4H), 3.18-3.02 (m, 1H), 2.87-2.67 (m, 1H), 1.98 (d, J = 3.8 Hz, 3H), 1.43-1.86 (m, 9.2H), 1.33-0.98 (m, 3H).	394.1	E	

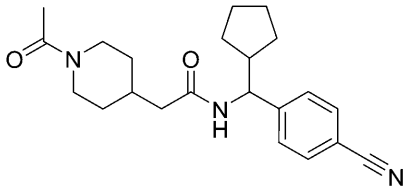
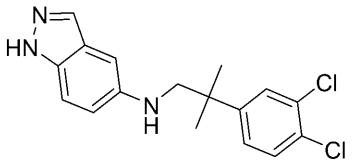
【表１－１２６】

I-465		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.27 - 7.32 (m, 2 H), 7.19 - 7.25 (m, 2 H), 4.45 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 3.59 (s, 1 H), 3.41 (s, 1 H), 2.11 - 2.28 (m, 1 H), 1.91 (s, 3 H), 1.79 - 1.85 (m, 1 H), 1.49 - 1.71 (m, 4 H), 1.14 - 1.46 (m, 10 H), 0.92 (s, 1 H).	392.1	E	
I-466		(400 MHz, DMSO-d6): 8.18-8.23 (m, 1H), 7.43-7.48 (m, 1H), 7.26-7.33 (m, 3H), 5.39-5.54 (m, 1H), 4.49-4.59 (m, 1H), 4.36-4.40 (m, 1H), 3.69-3.83 (m, 2H), 2.91-2.97 (m, 1H), 2.36-2.41 (m, 2H), 1.94-1.97 (m, 3H), 1.65-1.76 (m, 2H), 1.06-1.60 (m, 11H).	393.1	E	

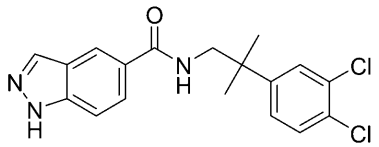
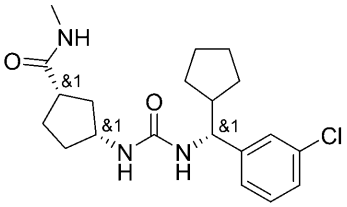
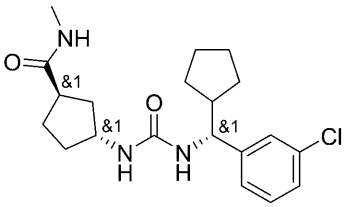
【表１－１２７】

I-467		(400 MHz, DMSO-d6): 8.04-8.10 (m, 1H), 7.20-7.36 (m, 5H), 5.36-5.54 (m, 1H), 4.49-4.59 (m, 1H), 4.36-4.40 (m, 1H), 3.69-3.83 (m, 2H), 2.91-2.97 (m, 1H), 2.36-2.41 (m, 2H), 1.94-1.97 (m, 3H), 1.65-1.76 (m, 2H), 1.06-1.60 (m, 11H).	359.1	E	
I-468		(400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (s, 1H), 8.03 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.70 - 7.50 (m, 4H), 7.42 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.08 (td, J = 7.6, 1.1 Hz, 1H), 6.81 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.37 (d, J = 6.0 Hz, 2H) 1.28 (s, 6H).	362	E	

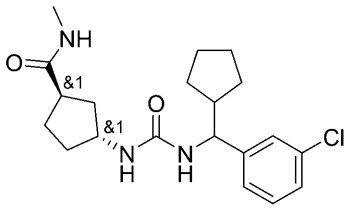
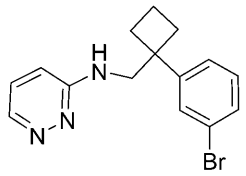
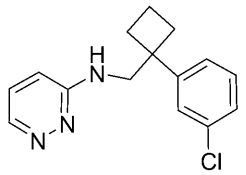
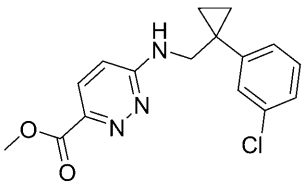
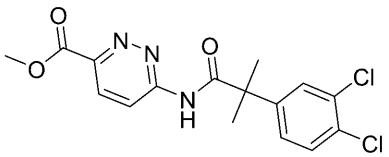
【表１－１２８】

I-469		(クロロホルム-d, 400 MHz) 7.63 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.41 (2H, dd, J=8.3, 3.2 Hz), 6.04 (1H, t, J=7.1 Hz), 4.80-4.70 (1H, m), 4.60 (1H, t, J=14.2 Hz), 3.78 (1H, t, J=13.6 Hz), 3.11-2.97 (1H, m), 2.60-2.46 (1H, m), 2.22 (1H, h, J=8.5 Hz), 2.15-2.05 (6H, m), 1.91-1.76 (2H, m), 1.71 (2H, d, J=18.0 Hz), 1.55 (3H, dd, J=19.3, 9.6 Hz), 1.42 (2H, hept, J=8.0, 7.2 Hz), 1.17-1.01 (3H, m)	368.15	E	
I-470		(400 MHz, DMSO-d6) 12.58 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.65 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.9, 2.1 Hz, 1H), 6.68 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 4.98 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.22 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	334.15	E	

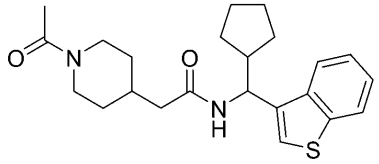
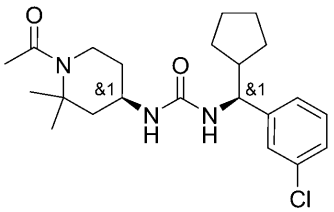
【表１－１２９】

I-471		(400 MHz, DMSO-d6) 13.25 (s, 1H), 8.31-8.21 (m, 2H), 8.19 (s, 1H), 7.76 (dd, J = 8.7, 1.5 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.41 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 3.49 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.33 (s, 6H).	362	E	
I-472		(400 MHz, DMSO-d6) 776 (m, 1H), 7.34-7.16 (m, 4H), 6.50-6.41 (m, 1H), 5.99-5.89 (m, 1H), 4.45-4.34 (m, 1H), 3.90-3.79 (m, 1H), 2.58-2.54 (m, 3H), 2.16-1.89 (m, 2H), 1.72-1.23 (m, 13H), 1.16-1.03 (m, 1H).	378.1	E	
I-473		(400 MHz, DMSO-d6) 776 (m, 1H), 7.34-7.16 (m, 4H), 6.50-6.41 (m, 1H), 5.99-5.89 (m, 1H), 4.45-4.34 (m, 1H), 3.90-3.79 (m, 1H), 2.58-2.54 (m, 3H), 2.16-1.89 (m, 2H), 1.72-1.23 (m, 13H), 1.16-1.03 (m, 1H).	378.1	E	

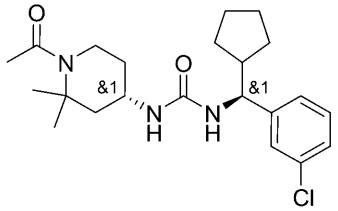
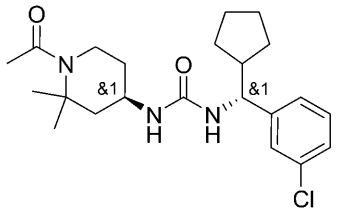
【表１－１３０】

I-474		(400 MHz, DMSO-d6) 776 (m, 1H), 7.34-7.16 (m, 4H), 6.50-6.41 (m, 1H), 5.99-5.89 (m, 1H), 4.45-4.34 (m, 1H), 3.90-3.79 (m, 1H), 2.58-2.54 (m, 3H), 2.16-1.89 (m, 2H), 1.72-1.23 (m, 13H), 1.16-1.03 (m, 1H).	378.1	E	
I-475			318.24	E	
I-476			274.33	E	
I-477			318.24	E	
I-478			368.25	E	

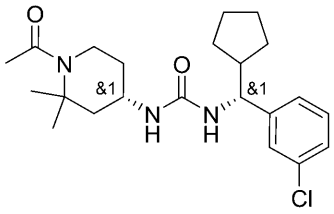
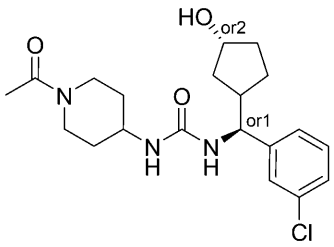
【表１－１３１】

I-479		(400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (s, 1H),7.958 (s, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.36 (m, 2H), 5.12 (m, 2H), 4.25 (m, 1H), 3.69 (s, 1H), 2.93 (s, 1H), 2.07-1.88 (m, 8H), 1.78-1.38 (m, 8H), 1.28-0.79 (m, 3H).	399.1	D	
I-480		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.16 - 7.21 (m, 2 H), 7.08 - 7.14 (m, 2 H), 4.30 - 4.38 (m, 1 H), 3.66 - 3.76 (m, 1 H), 3.49 - 3.57 (m, 1 H), 1.92 - 2.14 (m, 5 H), 1.66 - 1.78 (m, 1 H), 1.38 - 1.64 (m, 9 H), 1.16 - 1.35 (m, 7 H), 1.02 - 1.13 (m, 1 H).	406.2	D	

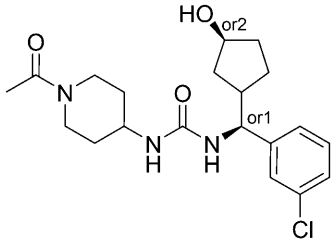
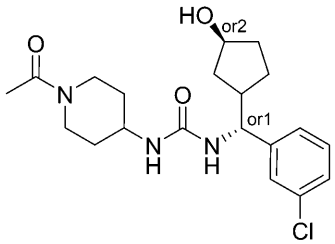
【表１－１３２】

I-481		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.28 - 7.33 (m, 2 H), 7.19 - 7.26 (m, 2 H), 4.45 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 3.77 - 3.91 (m, 1 H), 3.63 -3 .70 (m, 1 H) 2.10 - 2.26 (m, 2 H), 2.07 (s, 3 H), 1.78 - 1.89 (m, 1 H), 1.51 - 1.71 (m, 9 H), 1.27 - 1.50 (m, 7 H), 1.14 - 1.24 (m, 1 H).	406.1	E	
I-482		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.16 - 7.21 (m, 2 H), 7.08 - 7.14 (m, 2 H), 4.33 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 3.66 - 3.77 (m, 1 H), 3.51 - 3.58 (m, 1 H), 1.99 - 2.21 (m, 2 H), 1.95 (s, 3 H), 1.67 - 1.76 (m, 1 H), 1.39 - 1.62 (m, 9 H), 1.25 - 1.34 (m, 6 H), 1.19 (s, 1 H), 1.03 - 1.14 (m, 1 H).	406.2	E	

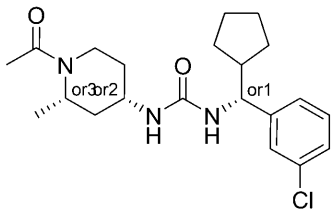
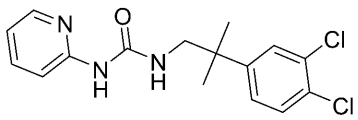
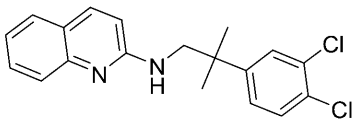
【表１－１３３】

I-483		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.27 - 7.34 (m, 2 H), 7.19 - 7.26 (m, 2 H), 4.45 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 3.78 - 3.88 (m, 1 H), 3.61 - 3.68 (m, 1 H), 2.14 - 2.25 (m, 1 H), 2.06 (s, 3 H), 1.79 - 1.88 (m, 1 H), 1.60 - 1.77 (m, 5 H), 1.56 (s, 5 H), 1.29 - 1.47 (m, 7 H), 1.13 - 1.25 (m, 1 H).	406.1	E	
I-484		(400 MHz, DMSO-d6) 7.35-7.15(m, 4H), 6.40 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.87 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.61-4.44 (m, 2H), 4.16-3.99 (m, 2H), 3.72-3.45 (m, 2H), 3.13-3.01 (m, 1H), 2.77-2.63 (m, 1H), 2.19-2.05 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.89 - 1.05 (m, 10H).	394.1	E	

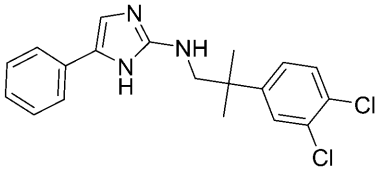
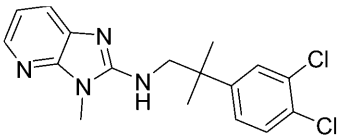
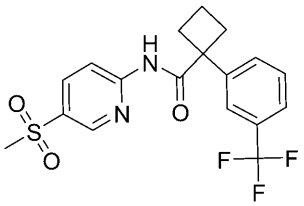
【表１－１３４】

I-485		(400 MHz, DMSO-d6) 7.35-7.18(m, 4H), 6.37 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.82 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.49-4.36 (m, 2H), 4.11 (s, 2H), 3.75-3.60 (m, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.15-3.00 (m, 1H), 2.79-2.63 (m, 1H), 2.43-2.26 (m, 1H), 1.97 (s, 3H), 1.79 - 1.06 (m, 10H).	394.1	E	
I-486		(400 MHz, DMSO-d6) 7.36-7.14(m, 4H), 6.36 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.56-4.43 (m, 2H), 4.16-3.92 (m, 2H), 3.75-3.61 (m, 1H), 3.57-3.53 (m, 1H), 3.12-3.02 (m, 1H), 2.77-2.63 (m, 1H), 2.17-2.05 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.80 - 1.46 (m, 7H), 1.27-1.01 (m, 3H).	394.1	E	

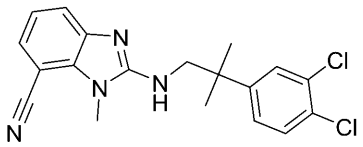
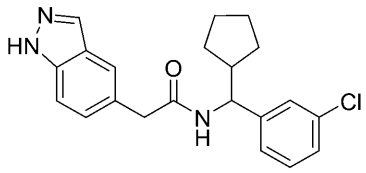
【表１－１３５】

I-487		(400 MHz, メタノール-d6): 7.34-7.19 (m, 4H), 6.44-6.42 (m, 1H), 5.93-5.91 (m, 1H), 4.49-4.43 (m, 1H), 4.13-3.62 (m, 2H), 3.47-3.37 (m, 2H), 2.14-2.06 (m, 1H), 1.97 (s, 3H), 1.80-1.44 (m, 9H), 1.39-1.18 (m, 3H), 1.16-1.11 (m, 3H).	392.1	E	
I-488		(400 MHz, DMSO-d6) 9.18 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.98 - 7.92 (m, 1H), 7.68 - 7.56 (m, 3H), 7.42 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.89 (ddd, J = 7.3, 5.0, 1.0 Hz, 1H), 3.42 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 1.30 (s, 6H).	338	E	
I-489		(400 MHz, DMSO-d6) 7.78 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.61 - 7.51 (m, 2H), 7.51 - 7.40 (m, 3H), 7.12 (ddd, J = 8.0, 6.6, 1.6 Hz, 1H), 6.84 - 6.72 (m, 2H), 3.71 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 1.36 (s, 6H).	345	D	

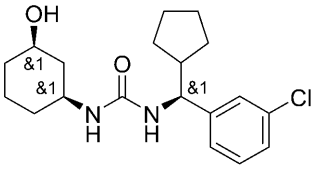
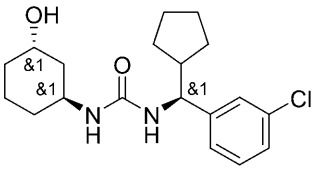
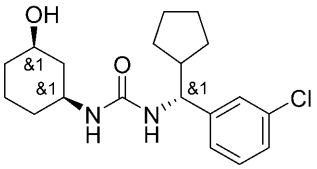
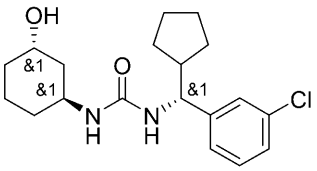
【表１－１３６】

I-490		(400 MHz, DMSO-d6) 10.19 (s, 1H), 7.65 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.5 Hz, 3H), 7.43 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 7.12 - 7.04 (m, 1H), 6.98 (s, 1H), 5.46 (s, 1H), 3.45 (s, 2H), 1.32 (s, 6H).	360.05	E	
I-491		(400 MHz, DMSO-d6) 7.85 (dd, J = 5.0, 1.4 Hz, 1H), 7.66 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.43 (ddd, J = 8.5, 5.1, 1.9 Hz, 2H), 6.94 (dd, J = 7.7, 5.0 Hz, 1H), 6.79 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 3.65 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 3.53 (s, 3H), 1.34 (s, 6H).	349.05	E	
I-492		(400 MHz, DMSO-d6) 10.90 (s, 1H), 8.77 (dd, J = 2.2, 1.1 Hz, 1H), 8.32 - 8.24 (m, 2H), 7.91 (s, 1H), 7.75 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.66 - 7.56 (m, 2H), 3.24 (s, 3H), 2.92 (dt, J = 12.2, 8.3 Hz, 2H), 2.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 1.93 - 1.78 (m, 2H).	399.05	E	

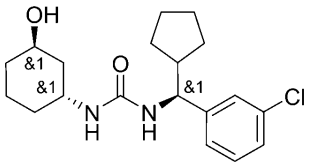
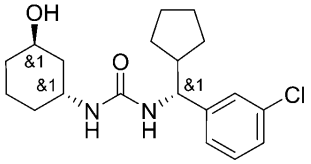
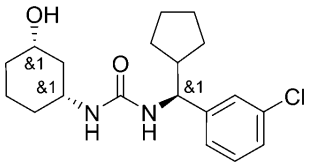
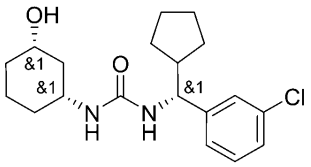
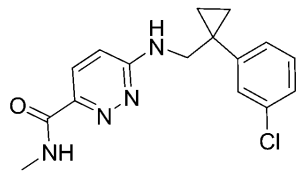
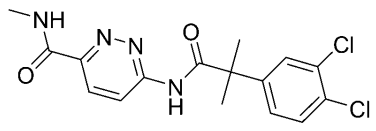
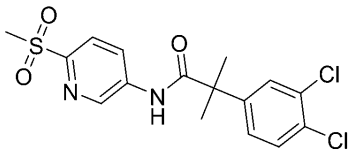
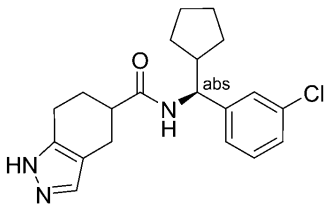
【表１－１３７】

I-493		(400 MHz, DMSO-d6)7.66 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.50-7.38 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.07 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.83 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 3.64 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.33 (s, 6H).	373.15	D	
I-494		(400 MHz, d6-DMSO) 12.96 (br s, 1H), 8.57 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.43 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 1.6, 1.6 Hz, 1H), 7.34 - 7.20 (m, 4H), 4.55 (app t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.54 (d, J = 14.0 Hz, 1H), 3.48 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 2.25 - 2.12 (m, 1H), 1.75 - 1.66 (m, 1H), 1.58 - 1.37 (m, 4H), 1.30 - 1.21 (m, 2H), 1.13 - 1.02 (m, 1H).	368.4	D	

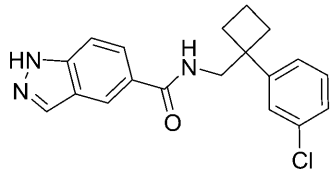
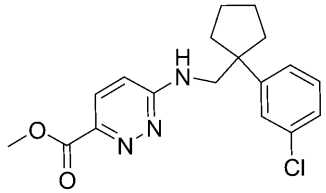
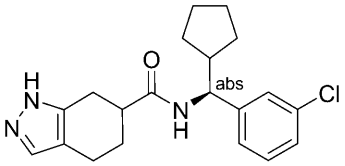
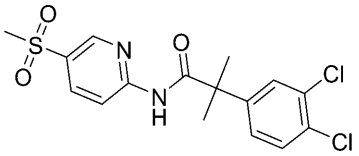
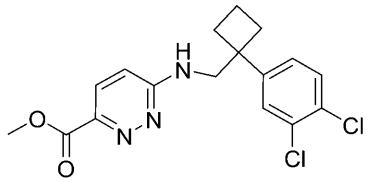
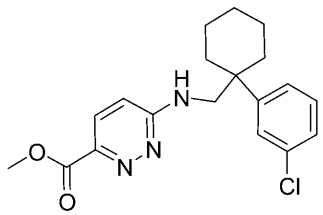
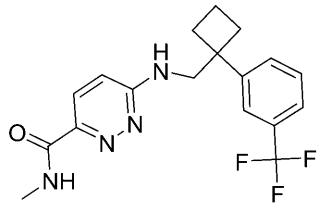
【表１－１３８】

I-495		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.11-7.41 (m, 4H), 4.46 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.85-4.01 (m, 2H), 2.12-2.29 (m, 1H), 1.20-1.82 (m, 16H).	351.1	E	
I-496		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.19-7.34 (m, 4H), 4.46 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.86-3.97 (m, 2H), 2.14-2.24 (m, 1H), 1.51-1.83 (m, 12H), 1.30-1.45 (m, 3H), 1.16-1.25 (m, 1H), 1.16-1.25 (m, 1H).	351.1	E	
I-497		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.13-7.48 (m, 4H), 4.47 (s, 1H), 3.92 (s, 2H), 2.20 (s, 1H), 1.22-1.94 (m, 16H).	351.1	E	
I-499		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.12-7.14 (m, 1H), 6.97-7.35 (m, 3H), 4.35 (s, 1H), 3.81 (s, 2H), 2.07 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 1.07-1.69 (m, 16H).	351.1	E	

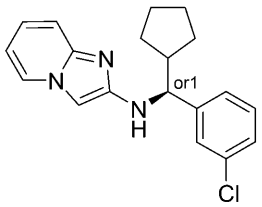
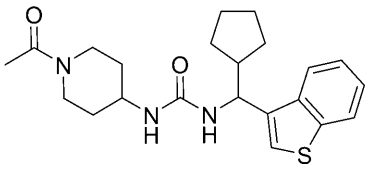
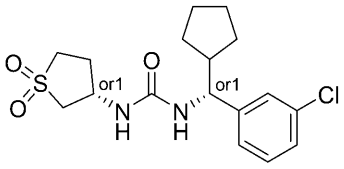
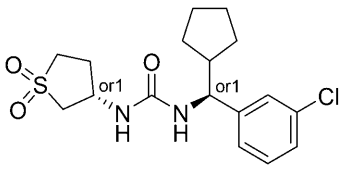
【表１－１３９】

I-500		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.09-7.58 (m, 4H), 4.45 (d, J=8.8 Hz, 1H), 3.48-3.67 (m, 2H), 2.03-2.26 (m, 1H), 1.06-1.86 (m, 16H).	351.1	E	
I-501		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.14-7.50 (m, 4H), 4.47 (s, 1H), 3.59 (s, 2H), 0.91-2.31 (m, 17H).	351.1	E	
I-502		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.06-7.61 (m, 4H), 7.06-7.61 (m, 1H), 4.45 (d, J=8.0 Hz, 2H), 0.93-2.21 (m, 17H).	351.1	E	
I-503		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 7.07-7.22 (m, 4H), 4.32 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.29-3.52 (m, 2H), 1.93-2.10 (m, 2H), 1.39-1.78 (m, 7H), 1.16-1.35 (m, 4H), 0.88-1.11 (m, 4H).	351.1	E	
I-504			317.29	E	
I-505			367.3	E	
I-506			387.21	E	
I-507				E	

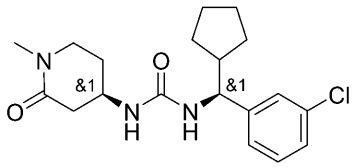
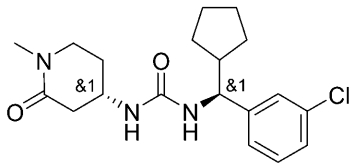
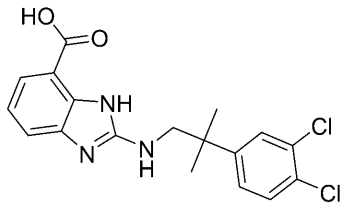
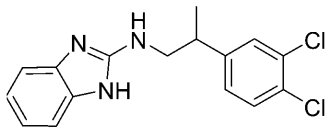
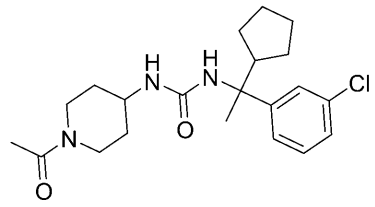
【表１－１４０】

I-508				E	
I-509			346.29	D	
I-510				E	
I-511				E	
I-512			366.35	E	
I-513			360.34	E	
I-514		(400 MHz, DMSO-d6) 8.65 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.41-7.53 (m, 4H), 7.30 (s, 1H), 6.77 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.89 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.77 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.34-2.44 (m, 2H), 2.23-2.33 (m, 2H), 2.06-2.19 (m, 1H), 1.75-1.89 (m, 1H).	365.1	E	

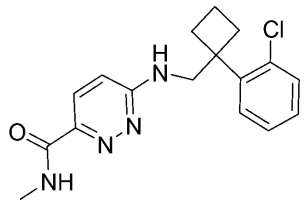
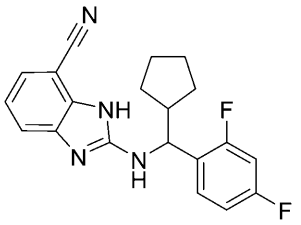
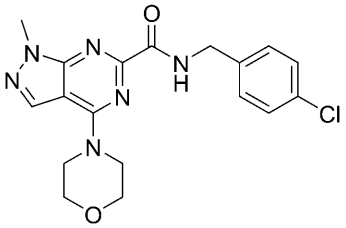
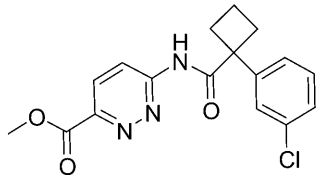
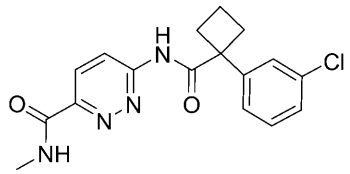
【表１－１４１】

I-515		(400 MHz, メタノール-d4) ppm 8.40 - 8.64 (m, 1 H), 8.16-8.21 (m, 1 H), 7.13 - 7.74 (m, 7 H), 4.11 (d, J=9.6 Hz, 1 H), 2.26 - 2.58 (m, 1 H), 1.94 - 2.16 (m, 1 H), 1.39 - 1.76 (m, 6 H), 1.14 - 1.35 (m, 1 H).	326.1	E	
I-516		(400 MHz, DMSO-d6) 7.99-7.88 (m, 2H),7.51 (s, 1H), 7.42-7.29 (m, 2H), 6.22 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.76(d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.01-4.89 (m, 1H), 4.16-4.01 (m, 1H), 3.71-3.61 (m, 2H), 3.15-3.01 (m, 1H), 2.79-2.64 (m, 1H), 1.96 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.80-1.42 (m, 10H), 1.23-1.05 (m, 3H).	400.1	E	
I-517		(400 MHz, DMSO-d6) 7.38-7.17 (m, 4H), 6.66 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.26 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.49-4.40 (m, 1H), 4.36-4.24 (m, 1H), 4.06 (s, 1H), 3.22-3.17 (m, 1H), 3.15-3.09 (m, 1H), 2.88-2.78 (m, 1H), 2.41-2.26 (m, 1H), 2.20-2.08 (m, 1H), 2.05-1.93 (m, 1H), 1.73-1.41 (m, 5H), 1.35-1.25 (m, 2H), 1.17-1.05 (m, 1H).	371	D	
I-518		(400 MHz, DMSO-d6) 7.38-7.17 (m, 4H), 6.66 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.28 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.46-4.36 (m, 1H), 4.33-4.20 (m, 1H), 3.24-3.15 (m, 1H), 3.13-3.02 (m, 1H), 2.91-2.81 (m, 1H), 2.36-2.25 (m, 1H), 2.19-2.05 (m, 1H), 2.03-1.88 (m, 1H), 1.71-1.37 (m, 6H), 1.34-1.23 (m, 2H), 1.16-0.99 (m, 1H).	371	E	

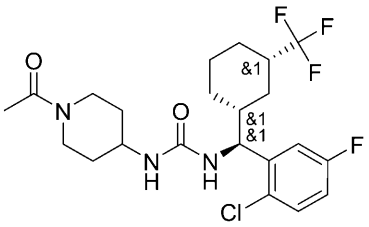
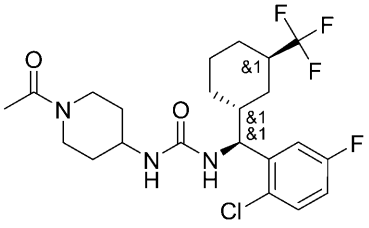
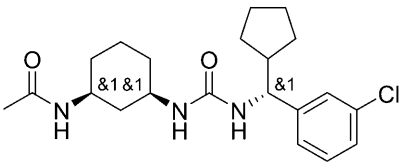
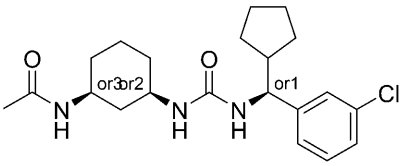
【表１－１４２】

I-519		(400 MHz, DMSO-d6) 7.38-7.14 (m, 4H), 6.42 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.96 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.50-4.35 (m, 1H), 3.84-3.70 (m, 1H), 3.28-3.14 (m, 2H), 2.79 (s, 3H), 2.48-2.38 (m, 1H), 2.18-1.99 (m, 2H), 1.90-1.80 (m, 1H), 1.66-1.40 (m, 6H), 1.36-1.22 (m, 2H), 1.18-1.06 (m, 1H).	364	D	
I-520		(400 MHz, DMSO-d6) 7.37-7.17 (m, 4H), 6.41 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.93 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.48-4.38 (m, 1H), 3.81-3.70 (m, 1H), 3.26-3.16 (m, 2H), 2.79 (s, 3H), 2.45-2.35 (m, 1H), 2.18-1.97 (m, 2H), 1.96-1.84 (m, 1H), 1.70-1.42 (m, 6H), 1.36-1.22 (m, 2H), 1.16-1.05 (m, 1H).	364	E	
I-521		(400 MHz, DMSO-d6) 10.65 (s, 1H), 7.67 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.31 (s, 1H), 3.62 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	378.1	D	
I-522		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 7.70 - 7.43 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 8.3, 2.0 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 6.85 (d, J = 11.7 Hz, 2H), 6.55 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 3.45 (h, J = 6.9 Hz, 2H), 3.16 (p, J = 7.1 Hz, 1H), 1.24 (d, J = 7.0 Hz, 3H).	320.05	E	
I-523			414.47	E	

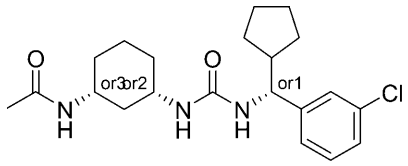
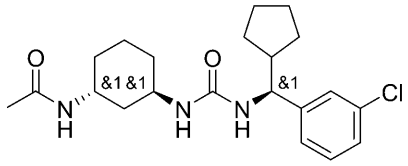
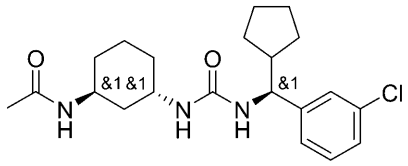
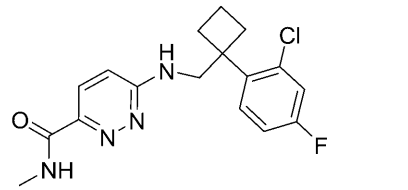
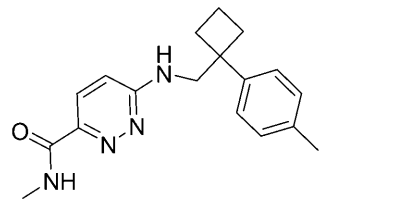
【表１－１４３】

I-524		(400 MHz, メタノール-d6): 8.68-8.66 (m, 1H), 8.47 (br, 1H), 7.84-7.81 (m, 1H), 7.36-7.11 (m, 5H), 4.25-4.06 (m, 2H), 2.78-2.77 (m, 3H), 2.45-2.33 (m, 4H), 2.23-2.08 (m, 1H), 1.90-1.79 (m, 1H).	331	D	
I-525		(400 MHz, dmso) 11.15 (br. s, 1H), 7.92 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.64 - 7.53 (m, 1H), 7.35 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.22 - 7.15 (m, 1H), 7.11 - 7.05 (m, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.96 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.41 - 2.30 (m, 1H), 1.86 - 1.75 (m, 1H), 1.71 - 1.33 (m, 6H), 1.24 - 1.13 (m, 1H). ベンゾイミダゾールから観察された互変異性体ピーク。	353.3	D	
I-526				E	
I-527			346.29	E	
I-528			345.29	E	

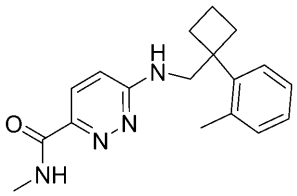
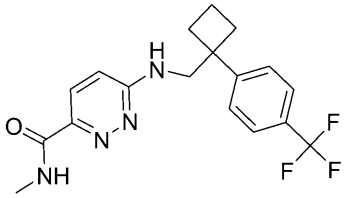
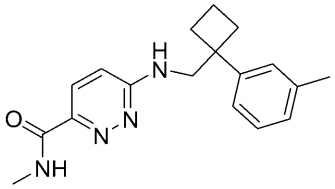
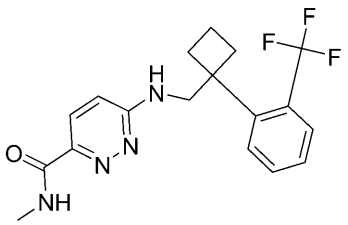
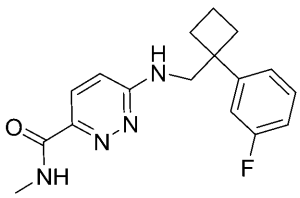
【表１－１４４】

I-529		(400 MHz, メタノール-d6): 7.48-7.45 (m, 1H), 7.32-7.29 (m, 1H), 7.18-7.13 (m, 1H), 6.40-6.37 (m, 1H), 5.91-5.87 (m, 1H), 5.25-5.21 (m, 1H), 4.11-4.08 (m, 1H), 3.68-3.54 (m, 2H), 3.16-3.06 (m, 1H), 2.76-2.60 (m, 2H), 2.25-2.14 (m, 1H), 1.98-1.97 (m, 3H), 1.89-1.00 (m, 13H).	478.1	E	
I-530		(400 MHz, メタノール-d6): 7.48-7.45 (m, 1H), 7.32-7.13 (m, 2H), 6.54-6.37 (m, 1H), 5.89-5.87 (m, 1H), 5.25-4.93 (m, 1H), 4.25-4.10 (m, 1H), 3.67-3.51 (m, 2H), 3.12-3.03 (m, 1H), 2.76-2.67 (m, 1H), 2.25-2.14 (m, 1H), 1.98-1.97 (m, 3H), 1.86-1.63 (m, 6H), 1.37-1.00 (m, 7H).	478.1	E	
I-531		(400 MHz, DMSO-d6) 7.77-7.61 (m, 1H), 7.37-7.15 (m, 4H), 6.31 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.49-4.33 (m, 1H), 3.54-3.42 (m, 2H), 2.18-2.03 (m, 1H), 1.96-0.80 (m, 19H).	392.1	E	
I-532		(400 MHz, DMSO-d6) 7.70 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.38-7.11 (m, 4H), 6.29 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.68 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.50-4.34 (m, 1H), 3.51-3.39 (m, 2H), 2.17-2.04 (m, 1H), 1.96-1.87 (m, 1H), 1.76 (s, 3H), 1.70-1.41 (m, 8H), 1.31-1.14 (m, 4H), 0.99-0.84 (m, 3H).	392.1	E	

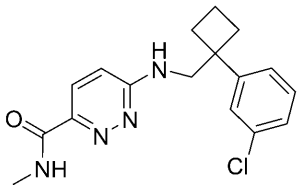
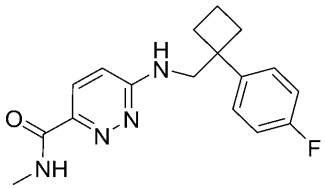
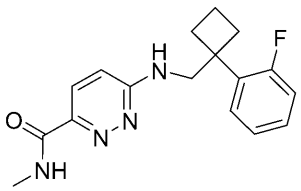
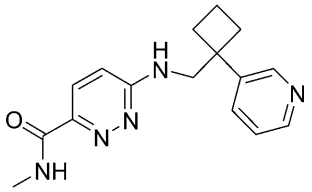
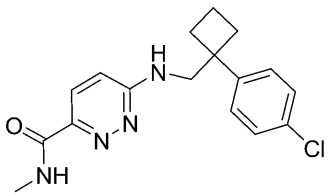
【表１－１４５】

I-533		(400 MHz, DMSO-d6) 7.68 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.34-7.17 (m, 4H), 6.30 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.46-4.36 (m, 1H), 3.50-3.41 (m, 2H), 2.16-2.03 (m, 1H), 1.89-1.80 (m, 1H), 1.77-1.43 (m, 12H), 1.35-1.19 (m, 4H), 0.97-0.84 (m, 2H).	392.1	E	
I-534		(400 MHz, DMSO-d6) 7.80-7.64 (m, 1H), 7.40-7.11 (m, 4H), 6.37 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.96 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.54-4.37 (m, 1H), 3.94-3.65 (m, 2H), 2.18-1.99 (m, 1H), 1.84-1.73 (m, 3H), 1.64-1.13 (m, 16H), 1.67-1.10 (m, 1H).	392.1	E	
I-535		(400 MHz, DMSO-d6) 7.79-7.64 (m, 1H), 7.36-7.15 (m, 4H), 6.36 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.94 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.49-4.40 (m, 1H), 3.89-3.69 (m, 2H), 2.17-2.04 (m, 1H), 1.78 (d, J = 8.0Hz, 3H), 1.63-1.13 (m, 16H).	392.1	E	
I-536		(400 MHz, DMSO-d6): 8.96 (br, 1H), 8.68 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.54-7.44 (m, 1H), 7.31-7.22 (m, 2H), 7.16-7.07 (m, 1H), 4.12-3.99 (m, 2H), 2.77 (d, J = 4.4 Hz, 3H), 2.46-2.33 (m, 4H), 2.25-2.15 (m, 1H), 1.85-1.73 (m, 1H).	348.9	E	
I-537		(400 MHz, メタノール-d4) 7.55-8.17 (m, 2H), 7.03-7.18 (m, 4H), 3.92 (s, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.36-2.53 (m, 4H), 2.24 (s, 4H), 1.91-2.07 (m, 1H)	311.1	E	

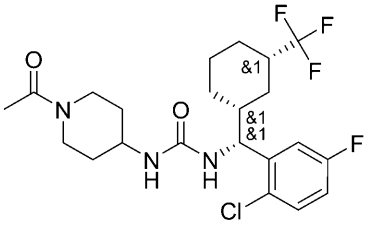
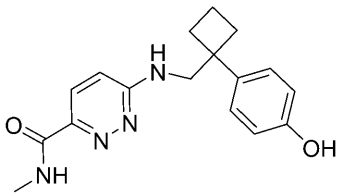
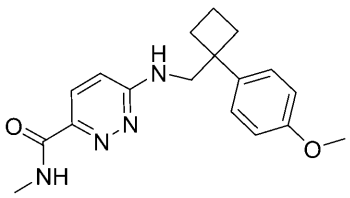
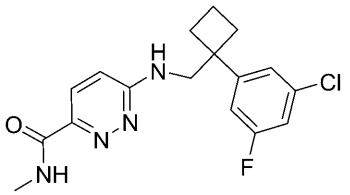
【表１－１４６】

I-538		(400 MHz, メタノール-d4) 7.59-8.19 (m, 2H), 6.90-7.13 (m, 4H), 4.05 (s,2H), 2.92 (s, 3H), 2.43-2.65 (m, 4H), 2.25-2.36 (m, 4H), 1.92-2.06 (m, 1H).	311.1	E	
I-539		(400 MHz, DMSO-d6) 8.69 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.64 (d, J = 8.8 Hz, 3H), 7.39 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.24 (s, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.90 (d, J=6.0 Hz, 2H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.24-2.41 (m, 4H), 2.08-2.19 (m, 1H), 1.77-1.88 (m, 1H).	365.1	E	
I-540		(400 MHz, メタノール-d4) 8.10 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.63 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 6.94-7.19 (m, 4H), 3.93 (s, 2H), 2.92 (s, 3H), 2.37-2.55 (m, 4H), 2.19-2.32 (m, 4H), 1.92-2.06 (m, 1H).	311.1	E	
I-541		(400 MHz, DMSO-d6) 8.68 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.56-7.65 (m, 2H), 7.42-7.52 (m, 1H), 7.27-7.39 (m, 2H), 7.15 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.04 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.75 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.31-2.49 (m, 4H), 2.04-2.20 (m, 1H), 1.68-1.85 (m, 1H).	365.1	E	
I-542		(400 MHz, DMSO-d6) 8.71-8.69 (m, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.35-7.29 (m, 1H), 7.25-7.21 (m, 1H), 7.05-6.94 (m, 3H), 6.85-6.81 (m, 1H), 3.88-3.85 (m, 2H), 2.79-2.77 (m, 3H), 2.35-2.22 (m, 4H), 2.15-2.04 (m, 1H), 1.85-1.77 (m, 1H).	314.9	E	

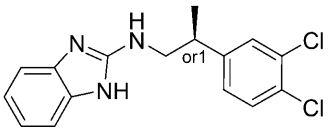
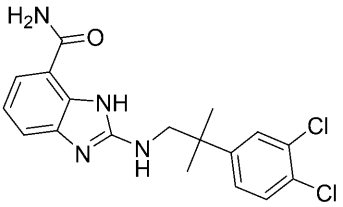
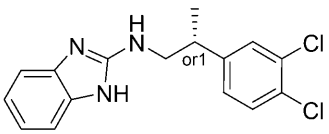
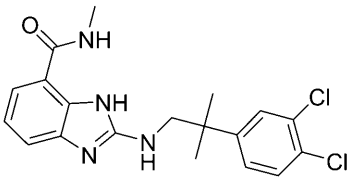
【表１－１４７】

I-543		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 8.65 (d, J=4.4 Hz, 1H), 7.85 (d, J=9.6 Hz, 1H), 7.27 - 7.36 (m, 2H), 7.17 - 7.26 (m, 3H), 3.90 (d, J=5.2 Hz, 2H), 2.79 (d, J=4.8 Hz, 3H), 2.26 - 2.39 (m, 4H), 2.06 - 2.20 (m, 1H), 1.77 - 1.88 (m, 1H).	331	E	
I-544		(400 MHz,DMSO-d6): 8.75～8.65 (m, 1H), 7.67～7.60 (m, 1H), 7.26～7.16 (m, 3H), 7.14～7.05 (m, 2H), 6.84～6.76 (m, 1H), 3.83 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.36～2.20 (m, 4H), 2.13～2.04 (m, 1H), 1.85～1.75 (m, 1H), 1.89～1.78 (m, 1H).	314.9	E	
I-545		(400 MHz,DMSO-d6): 8.75～8.67 (m, 1H), 7.65～7.55 (m, 1H), 7.33～7.25 (m, 1H), 7.22～7.14 (m, 1H), 7.13～7.00 (m, 3H), 6.78 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 4.00～3.93 (m, 2H), 2.77 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.40～2.28 (m, 4H), 2.21～2.06 (m, 1H), 1.89～1.78 (m, 1H).	315	E	
I-546		(400MHz, D2O) = 8.67 (s, 1H), 8.56 (d, J=5.8 Hz, 1H), 8.47 (br d, J=8.0 Hz, 1H), 8.07 - 7.86 (m, 2H), 7.47 (d, J=9.6 Hz, 1H), 3.95 (s, 2H), 2.82 (s, 3H), 2.52 - 2.31 (m, 4H), 2.25 - 2.11 (m, 1H), 1.99 - 1.89 (m, 1H)	298.1	E	
I-547		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 8.65 (d, J=4.4 Hz, 1H), 7.86 (d, J=9.2 Hz, 1H), 7.27 - 7.38 (m, 3H), 7.22 - 7.27 (m, 2H), 3.88 (d, J=5.2 Hz, 2H), 2.79 (d, J=4.4 Hz, 3H), 2.21 - 2.35 (m, 4H), 2.06 - 2.17 (m, 1H), 1.71 - 1.88 (m, 1H).	331	E	

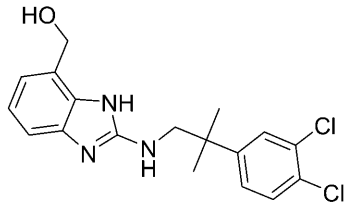
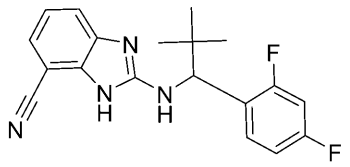
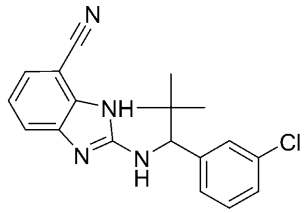
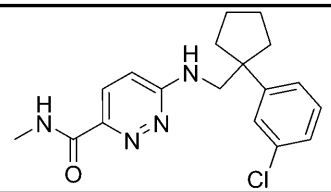
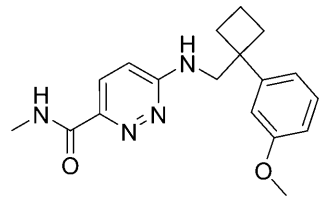
【表１－１４８】

I-548		(400 MHz, DMSO-d6): 7.49-7.45 (m, 1H), 7.17-7.12 (m, 2H), 6.56-6.53 (m, 1H), 5.92-5.90 (m, 1H), 5.05-4.93 (m, 1H), 4.12-4.10 (m, 1H), 3.72-3.65 (m, 2H), 3.12-3.03 (m, 1H), 2.76-2.67 (m, 1H), 2.25-2.20 (m, 1H), 1.99-1.97 (m, 3H), 1.80-1.65 (m, 6H), 1.40-0.98 (m, 8H).	478.1	E	
I-549		(400 MHz, DMSO-d6): 9.15 (s, 1H), 8.68-8.70 (m, 1H), 7.61-7.64 (m, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.97-7.00 (m, 2H), 6.80-6.83 (m, 1H), 6.66-6.69 (m, 2H), 3.74-3.78 (m, 2H), 2.77-2.79 (m, 3H), 2.22-2.26 (m, 4H), 2.17-2.21 (m, 1H), 1.77-1.79 (m, 1H).	313.1	E	
I-550		(400 MHz, DMSO-d6): 9.60-9.70 (m, 1H), 8.55-8.65 (m, 1H), 7.90-7.99 (m, 1H), 7.70-7.79 (m, 1H), 7.09-7.20 (m, 2H), 6.70-6.83 (m, 2H), 3.90 (s, 2H), 3.67 (s, 3H), 2.78-2.80 (m, 3H), 2.25-2.33 (m, 4H), 2.12-2.17 (m, 1H), 1.81-2.01 (m, 1H).	327.1	E	
I-551		(400 MHz, DMSO-d6): 8.94 (br, 1H), 8.65 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.22-7.18 (m, 1H), 7.15-7.04 (m, 2H), 3.92 (d, J = 5.2 Hz, 2H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.37-2.25 (m, 4H), 2.17-2.07 (m, 1H), 1.86-1.74 (m, 1H).	348.9	D	

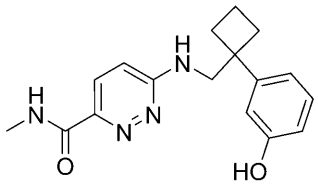
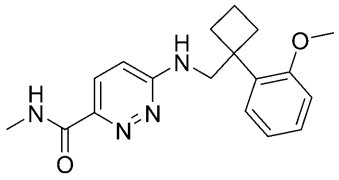
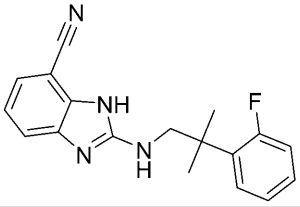
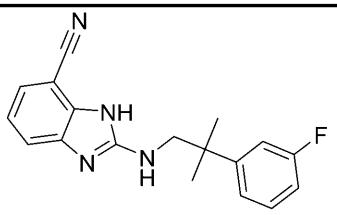
【表１－１４９】

I-552		(400 MHz, クロロホルム-d) 7.30- 7.19 (m, 4H), 7.07 (dd, J = 5.9, 3.2 Hz, 2H), 6.90 (dd, J = 8.2, 2.2 Hz, 1H), 4.88 (s, 1H), 3.67 (dd, J = 13.1, 5.8 Hz, 1H), 3.38 (dd, J = 13.1, 8.9 Hz, 1H), 3.02 (dq, J = 8.8, 6.7 Hz, 1H), 1.21 (d, J = 7.0 Hz, 3H).	320.05	D	
I-553		(400 MHz, DMSO-d6) 10.84 (s, 1H), 9.21 (s, 1H), 7.66 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.61 - 7.50 (m, 2H), 7.46 - 7.37 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 7.7, 1.2 Hz, 1H), 6.97 - 6.86 (m, 2H), 3.60 (dd, J = 14.3, 6.2 Hz, 2H), 1.34 (d, J = 6.7 Hz, 6H).	377.25	D	
I-554		(400 MHz, クロロホルム-d) 7.27 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 7.27 - 7.22 (m, 2H), 7.07 (dd, J = 5.8, 3.2 Hz, 2H), 6.94 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 4.79 (s, 1H), 3.71 (dd, J = 13.1, 5.8 Hz, 1H), 3.40 (dd, J = 13.0, 8.9 Hz, 1H), 3.04 (dt, J = 9.0, 6.6 Hz, 1H), 1.24 (d, J = 7.0 Hz, 3H).	320.05	D	
I-555		(400 MHz, DMSO-d6) 7.69 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.47 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.36 (s, 2H), 3.63 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 3.54 (dd, J = 16.9, 11.1 Hz, 1H), 2.87 (d, J = 4.1 Hz, 3H), 1.36 (s, 6H).	391.15	E	

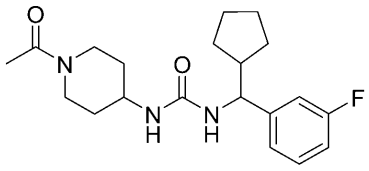
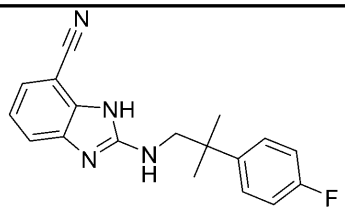
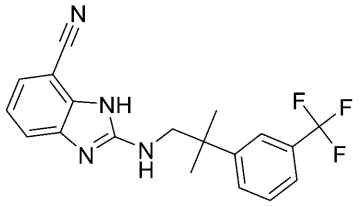
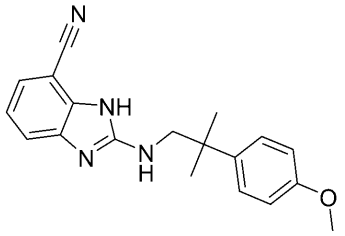
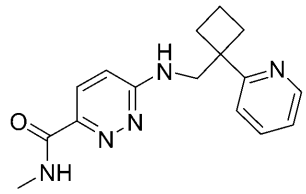
【表１－１５０】

I-556		(400 MHz, DMSO-d6) 10.47 (s, 1H), 7.67 (dd, J = 6.7, 2.2 Hz, 1H), 7.58 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 8.6, 2.3 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 21.9, 7.7 Hz, 1H), 6.81 (dt, J = 14.6, 7.5 Hz, 1H), 6.71 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.39 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 5.20 (t, J = 5.4 Hz, 1H), 4.73 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 4.63 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 3.59 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 3.53 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 1.33 (d, J = 1.3 Hz, 6H).	364.1	D	
I-557		(400 MHz, dmso) 11.01 (br. s, 1H), 7.86 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 15.2, 8.5 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 7.7, 0.8 Hz, 1H), 7.27 - 7.17 (m, 2H), 7.11 (app. td, J = 8.3, 2.2 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 0.96 (s, J = 4.4 Hz, 9H). 一部ギ酸塩	341.2	D	
I-558		(400 MHz, dmso) 11.19 (br. s, 1H), 8.03 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.41 - 7.35 (m, 3H), 7.34 - 7.28 (m, 1H), 7.24 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.72 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 0.95 (s, 9H). 一部ギ酸塩	339.2	D	D
I-559			345.34	E	
I-560		(400 MHz, DMSO-d6) 8.73-8.64 (m, 1H), 7.62 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.24-7.11 (m, 2H), 6.87-6.66 (m, 4H), 3.81 (d, J = 4.0 Hz, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.77 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 2.36-2.19 (m, 4H), 2.14-1.99 (m, 1H), 1.84-1.72 (m, 1H).	327.1	E	

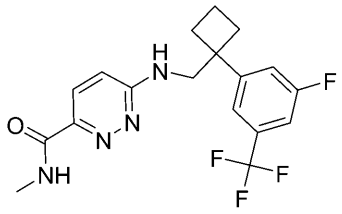
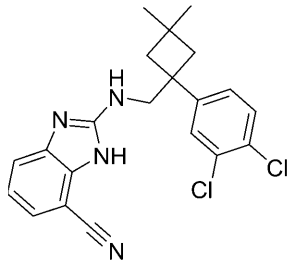
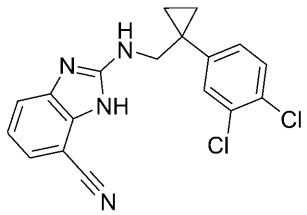
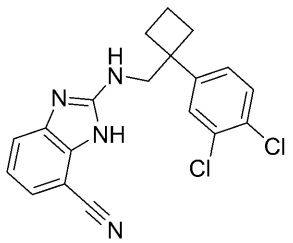
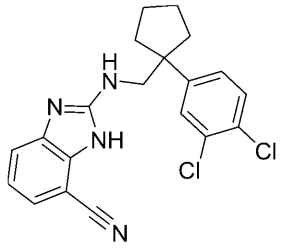
【表１－１５１】

I-561		(400 MHz, DMSO-d6) 9.22 (s, 1H), 8.73-8.64 (m, 1H), 7.62 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.23-7.11 (m, 1H), 7.10-7.02 (m, 1H), 6.90-6.76 (m, 1H), 6.63-6.53 (m, 3H), 3.78 (d, J = 4.0 Hz, 2H), 2.77 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 2.31-2.16 (m, 4H), 2.12-1.97 (m, 1H), 1.84-1.71(m, 1H).	313.1	E	
I-562		(400 MHz,DMSO-d6): 8.70～8.67 (m, 1H), 7.60 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.17～7.10 (m, 1H), 7.07～7.01 (m, 1H), 7.00～6.95 (m, 1H), 6.93～6.89 (m, 1H), 6.87～6.81 (m, 3H), 6.78～6.71 (m, 1H), 3.94～3.86 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 2.36～2.20 (m, 4H), 2.15～2.01 (m, 1H), 1.81～1.70 (m, 1H).	327.1	E	
I-563		(400 MHz, DMSO-d6) 10.95 (s, 1H), 7.47 - 7.21 (m, 4H), 7.21 - 7.10 (m, 2H), 7.06 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.70 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.41 (s, 6H).	309.15	E	
I-564		(400 MHz, DMSO-d6) 10.96 (s, 1H), 7.43 - 7.33 (m, 2H), 7.33 - 7.22 (m, 3H), 7.13 - 6.99 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.57 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	309.15	E	

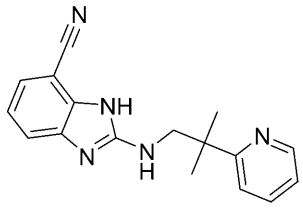
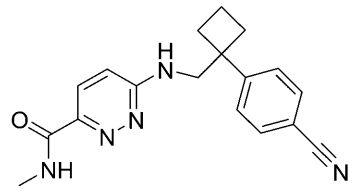
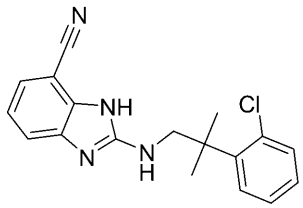
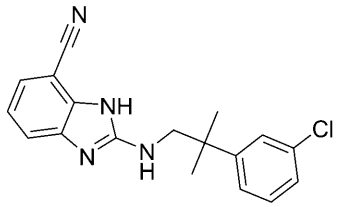
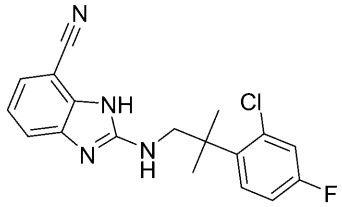
【表１－１５２】

I-565		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.35-7.29 (m, 1H), 7.08-6.98 (m, 3H), 6.35-6.33 (d, 1H), 5.80-5.79 (d, 1H), 4.48-4.43 (m, 1H), 4.11-4.10 (m, 1H), 3.67-3.65 (m, 1H), 3.55-3.51 (m, J=4.0 Hz, 1H), 3.10-3.02 (m, 1H), 2.73-2.66 (m, 1H), 2.14-2.08 (m, 1H), 1.97 (s, 3H), 1.72-1.44 (m, 7H), 1.33-1.07 (m, 5H).	362.1	E	
I-566		(400 MHz, DMSO-d6) 10.96 (s, 1H), 7.54 -7.44 (m, 2H), 7.35 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 7.9, 1.1 Hz, 1H), 7.20 - 7.09 (m, 2H), 7.04 (s, 1H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.55 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	309.15	E	
I-567		(400 MHz, DMSO-d6) 10.95 (s, 1H), 7.82 - 7.73 (m, 2H), 7.61 - 7.52 (m, 2H), 7.34 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.62 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.39 (s, 6H).	359.15	E	
I-568		(400 MHz, DMSO-d6) 8.30 (s, 1H), 7.54 (dd, J = 17.0, 7.8 Hz, 2H), 7.42 - 7.34 (m, 2H), 7.21 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 6.92 - 6.84 (m, 2H), 3.70 (s, 3H), 3.59 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	321.15	E	
I-569		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 8.69 (d, J=4.4 Hz, 1H), 8.51-8.53 (m, 1H), 7.67-7.72 (m, 1H), 7.63 (d, J=9.2 Hz, 1H), 7.31 (d, J=7.6 Hz, 1H), 7.14 - 7.24 (m, 2H), 6.81 (d, J=8.8 Hz, 1H), 3.95 (d, J=5.2 Hz, 2H), 2.78 (d, J=4.8 Hz, 3H), 2.36 - 2.44 (m, 2H), 2.24 - 2.31 (m, 2H), 2.01 - 2.14 (m, 1H), 1.76 - 1.86 (m, 1H).	298.1	E	

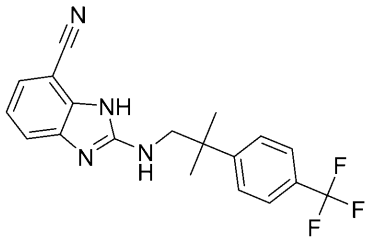
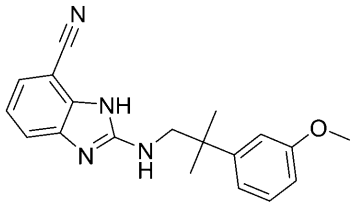
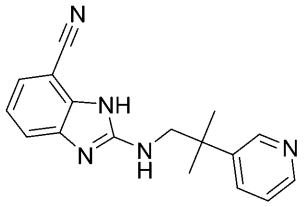
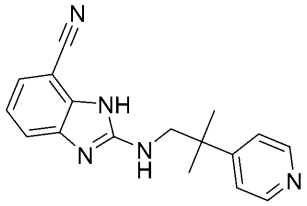
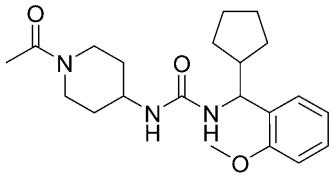
【表１－１５３】

I-570		(400 MHz, DMSO-d6) 8.66-8.64 (m, 1H), 7.63-7.61 (m, 1H), 7.42-7.40 (m, 1H), 7.34-7.28 (m, 3H), 6.80-6.77 (m, 1H), 3.93-3.90 (m, 2H), 2.79-2.77 (m, 3H), 2.39-2.27 (m, 4H), 2.14-2.11 (m, 1H), 1.85-1.77 (m, 1H).	383	D	
I-571		(400 MHz, DMSO-d6) 10.98 (s, 1H), 7.60 - 7.47 (m, 2H), 7.36 - 7.18 (m, 4H), 6.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.58 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 2.31 (d, J = 12.5 Hz, 2H), 2.14 (d, J = 12.4 Hz, 2H), 1.20 (s, 3H), 0.93 (s, 3H).	399.05	D	
I-572		(400 MHz, DMSO-d6) 11.05 (s, 1H), 7.61 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.37 - 7.30 (m, 3H), 7.26 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.61 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 1.07 - 1.02 (m, 2H), 0.93 - 0.84 (m, 2H).	357.05	E	
I-573		(400 MHz, DMSO-d6) 10.96 (s, 1H), 7.53 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.21 - 7.13 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.70 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.39 - 2.19 (m, 4H), 2.11 (q, J = 9.1, 8.6 Hz, 1H), 1.81 (ddq, J = 13.5, 9.0, 4.1 Hz, 1H).	371.1	C	C
I-574		(400 MHz, DMSO-d6) 10.88 (s, 1H), 7.59 - 7.50 (m, 2H), 7.40 - 7.30 (m, 2H), 7.24 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.05 - 6.83 (m, 2H), 3.55 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.10 - 1.97 (m, 2H), 1.90 - 1.75 (m, 4H), 1.64 (d, J = 3.4 Hz, 2H).	385.05	D	

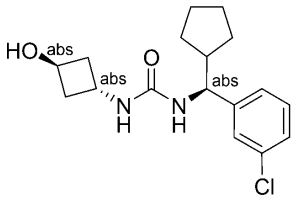
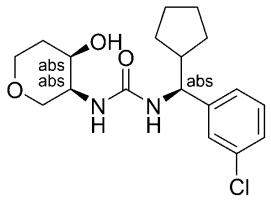
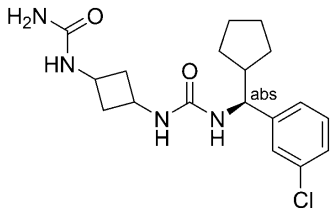
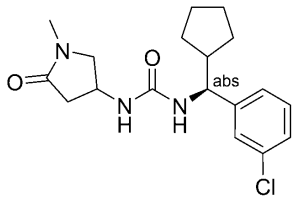
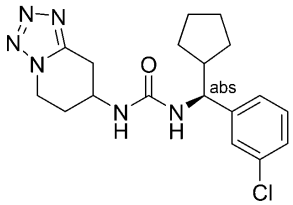
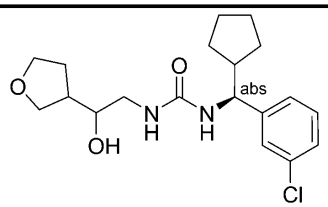
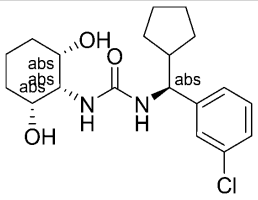
【表１－１５４】

I-575		(400 MHz, DMSO-d6) 8.57 (ddd, J = 4.8, 1.9, 0.9 Hz, 1H), 7.77 (td, J = 7.7, 1.9 Hz, 1H), 7.49 (dd, J = 8.0, 1.1 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 3.5 Hz, 1H), 7.25-7.22 (m, 1H), 7.17-6.98 (m, 3H), 6.93 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.71 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 1.36 (s, 6H).	292.15	E	
I-576		(400 MHz, DMSO-d6): 8.66-8.64 (m, 1H), 8.12 (br, 1H), 7.80-7.73 (m, 3H), 7.42-7.39 (m, 2H), 7.14-7.12 (m, 1H), 3.93-3.91 (m, 2H), 2.80-2.78 (m, 3H), 2.37-2.26 (m, 3H), 2.19-2.08 (m, 1H), 1.90-1.76 (m, 1H).	322.1	E	
I-577		(400 MHz, DMSO-d6) 10.90 (s, 1H), 7.50 (dd, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.39 - 7.22 (m, 4H), 6.93 (dt, J = 15.6, 6.8 Hz, 2H), 3.91 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 1.51 (s, 6H).	325.05	E	
I-578		(400 MHz, DMSO-d6) 10.97 (s, 1H), 7.49 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.43 (dt, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.36 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 7.31 - 7.22 (m, 2H), 7.10 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.58 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	325.05	D	
I-579		(400 MHz, DMSO-d6) 10.90 (s, 1H), 7.51 (dd, J = 9.0, 6.3 Hz, 1H), 7.43 - 7.32 (m, 2H), 7.28 - 7.15 (m, 2H), 6.98 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.89 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 1.50 (s, 6H).	343.05	E	

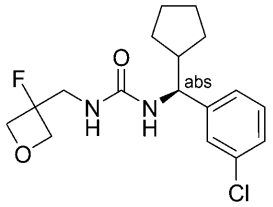
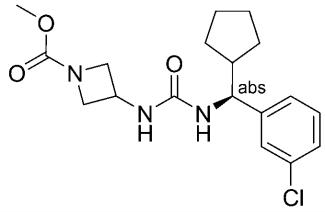
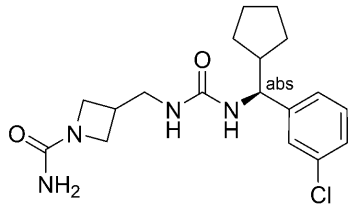
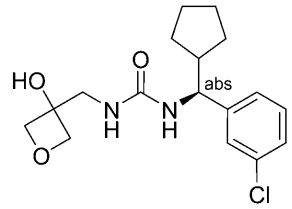
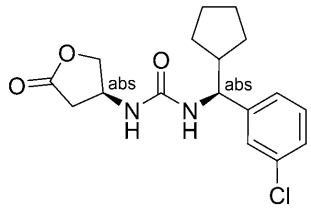
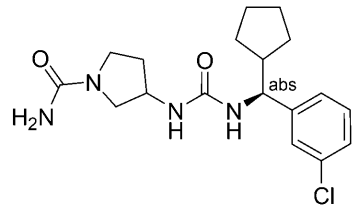
【表１－１５５】

I-580		(400 MHz, DMSO-d6) 10.94 (s, 1H), 7.69 (s, 4H), 7.35 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.61 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.38 (s, 6H).	359.15	E	
I-581		(400 MHz, DMSO-d6) 10.94 (s, 1H), 7.34 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.28 - 7.20 (m, 2H), 7.06 - 6.95 (m, 3H), 6.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.2, 2.4 Hz, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.57 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.33 (s, 6H).	321.1	E	
I-582		(400 MHz, DMSO-d6) 10.96 (s, 1H), 8.69 (dd, J = 2.6, 0.9 Hz, 1H), 8.41 (dd, J = 4.7, 1.6 Hz, 1H), 7.86 (ddd, J = 8.1, 2.6, 1.6 Hz, 1H), 7.40 - 7.30 (m, 2H), 7.26 - 7.12 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.60 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.38 (s, 6H).	292.1	E	
I-583		(400 MHz, DMSO-d6) 10.95 (s, 1H), 8.53 - 8.44 (m, 2H), 7.48 - 7.41 (m, 2H), 7.35 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.11 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.60 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	292.05	E	
I-584		(400 MHz, DMSO-d6): 7.12-7.19 (m, 2H), 6.88-6.97 (m, 2H), 6.17-6.20 (m, 1H), 5.91-5.94 (m, 1H), 4.81-4.86 (m, 1H), 4.07-4.13 (m, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.64-3.70 (m, 1H), 3.52-3.55 (m, 1H), 3.04-3.13 (m, 1H), 2.69-2.78 (m, 1H), 2.14-2.25 (m, 1H), 1.97-1.99 (m, 3H), 1.05-1.80 (m, 12H).	374.1	E	

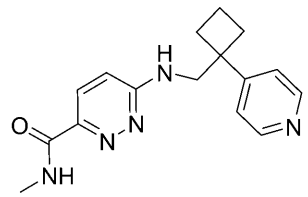
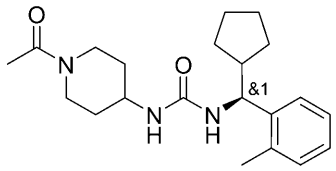
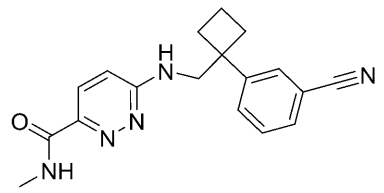
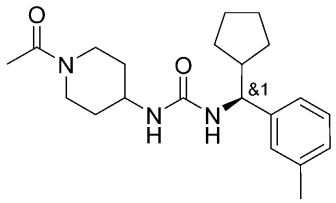
【表１－１５６】

I-585				E	
I-586				E	
I-587				E	
I-588				E	
I-589				D	
I-590				E	
I-591				E	

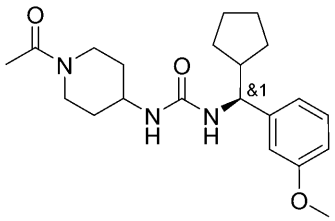
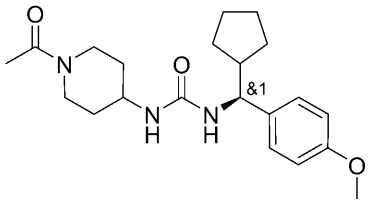
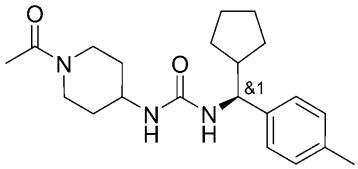
【表１－１５７】

I-592				E	
I-593				E	
I-594				D	
I-595				E	
I-596				E	
I-597				E	

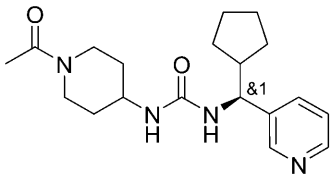
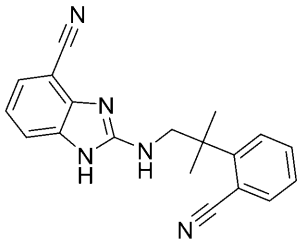
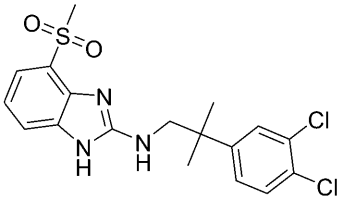
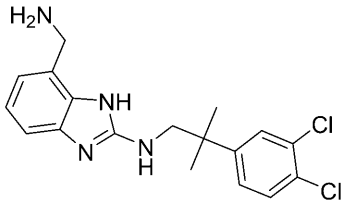
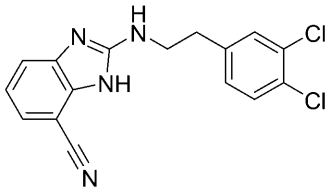
【表１－１５８】

I-598		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 8.69 (d, J=4.4 Hz, 1 H), 8.45 (d, J=5.6 Hz, 2 H), 7.64 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 7.26 (s, 1 H), 7.18 - 7.22 (m, 2 H), 6.83 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 3.90 (d, J=6.0 Hz, 2 H), 2.78 (d, J=4.8 Hz, 3 H), 2.32 - 2.38 (m, 2 H), 2.22 - 2.31 (m, 2 H), 2.06 - 2.17 (m, 1 H), 1.77 - 1.87 (m, 1 H).	298.1	E	
I-599		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.20 - 7.24 (m, 1 H), 7.13 - 7.18 (m, 1 H), 7.04 - 7.11 (m, 2 H), 6.33 (s, 1 H), 4.72 (br d, J=8.8 Hz, 1 H), 4.05-4.12 (m, 1 H), 3.62 - 3.67 (m, 1 H), 3.47 - 3.57 (m, 1 H), 3.01 - 3.15 (m, 1 H), 2.65 - 2.80 (m, 1 H), 2.34 (s, 3 H), 2.11-2.22 (m, 1 H), 1.97 (d, J=4.4 Hz, 3 H), 0.99 - 1.83 (m, 13 H).	358.1	E	
I-600		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 8.67 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.58-7.68 (m, 3H), 7.44-7.55 (m, 2H), 7.24 (s, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.89 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.24-2.38 (m, 4H), 2.07-2.19 (m, 1H), 1.76-1.88 (m, 1H).	322.1	E	
I-601		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.14 - 7.24 (m, 1 H), 6.98 - 7.10 (m, 3 H), 6.35 (s, 1 H), 4.41 (d, J=8.4 Hz, 1 H), 4.00 - 4.17 (m, 1 H), 3.67 - 3.73 (m, 1 H), 3.00 - 3.20 (m, 1 H), 2.65 - 2.83 (m, 1 H), 2.28 (s, 3 H), 2.05-2.14 (m, 1 H), 1.97 (d, J=3.2 Hz, 3 H), 1.35 - 1.87 (m, 8 H), 1.02 - 1.35 (m, 6 H).	358.2	E	

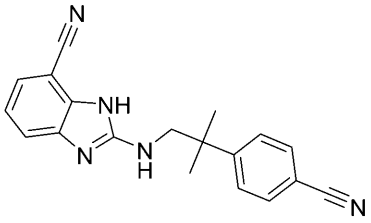
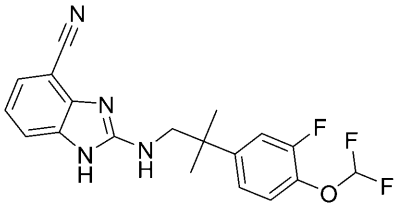
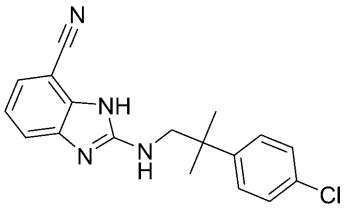
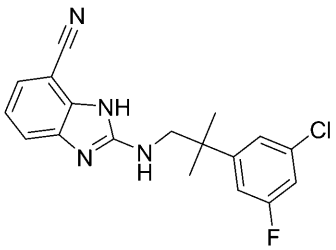
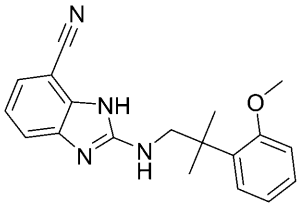
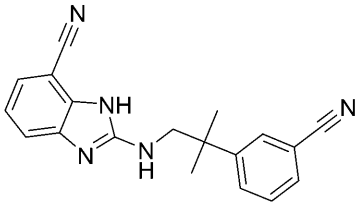
【表１－１５９】

I-602		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.19-7.23 (m, 1H), 6.74-6.86 (m, 3H), 6.29 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.78 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.41-4.46 (m, 1H), 4.04-4.18 (m, 1H), 3.63-3.78 (m, 4H), 3.49-3.60 (m, 1H), 3.04-3.12 (m, 1H), 2.66-2.77 (m, 1H), 2.05-2.17 (m, 1H), 1.98 (d, J = 3.2 Hz, 3H), 1.41-1.78 (m, 7H), 1.08-1.39 (m, 5H).	374.1	E	
I-603		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.15 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.85 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.23 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.75 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.37-4.42 (m, 1H), 4.04 - 4.20 (m, 1H), 3.62-3.76 (m, 4H), 3.50-3.59 (m, 1H), 3.04-3.12 (m, 1H), 2.66-2.79 (m, 1H), 2.04-2.16 (m, 1H), 1.98 (d, J = 3.2 Hz, 3H), 1.42-1.80 (m, 7H), 1.05-1.36 (m, 5H).	374.1	E	
I-604		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.07 - 7.13 (m, 4 H), 6.27 (d, J=9.2 Hz, 1 H), 5.79 (s, 1 H), 4.40 (s, 1 H), 4.09 (d, J=3.6 Hz, 1 H), 3.66 (s, 1 H), 3.02 - 3.14 (m, 1 H), 2.65 - 2.78 (m, 1 H), 2.26 (s, 3 H), 2.04 - 2.17 (m, 1 H), 1.97 (d, J=3.2 Hz, 3 H), 1.40 - 1.81 (m, 7 H), 1.01 - 1.38 (m, 6 H).	358.1	E	

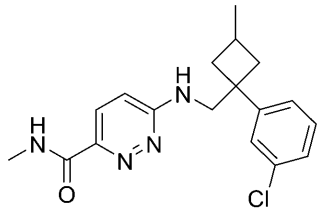
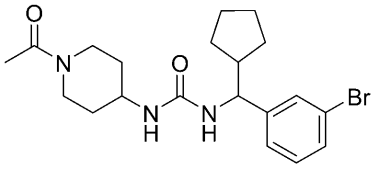
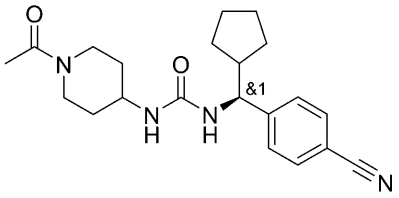
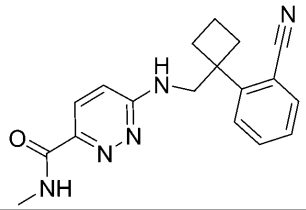
【表１－１６０】

I-605		(400 MHz, DMSO-d6) 8.52-8.34 (m, 2H), 7.76-7.58 (m, 1H), 7.36-7.26 (m, 1H), 6.43 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.85 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.52-4.41 (m, 1H), 4.18-4.04 (m, 1H), 3.73-3.60 (m, 1H), 3.59-3.49 (m, 1H), 3.13-3.00 (m, 1H), 2.77-2.63 (m, 1H), 2.23-2.08 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.78-1.43 (m, 7H), 1.34-1.05 (m, 5H).	345.1	E	
I-606		(400 MHz, DMSO-d6) 13.84 (s, 1H), 10.38 (s, 1H), 8.16 (dd, J = 7.9, 1.3 Hz, 1H), 7.79 (td, J = 7.8, 1.1 Hz, 2H), 7.70 (dd, J = 8.0, 1.3 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.3, 7.4, 1.3 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 7.08 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 4.50 (s, 2H), 1.39 (s, 6H).	316.1	E	
I-607		(400 MHz, クロロホルム-d)7.62-7.56 (m, 1H), 7.49 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 8.1, 2.8 Hz, 2H), 7.28 (s, 2H), 7.27-7.18 (m, 2H), 4.81 (s, 1H), 3.69 (d, J = 5.5 Hz, 2H), 1.42 (s, 6H).	412.05	D	
I-608		(400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (s, 2H), 7.68 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 8.6, 2.3 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (dt, J = 15.0, 7.4 Hz, 3H), 4.12 (s, 2H), 3.58 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	363.05	E	
I-609		(400 MHz, DMSO-d6) 11.30 (s, 1H), 7.61 -7.54 (m, 2H), 7.36 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.31-7.24 (m, 2H), 6.93 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.58 (q, J = 6.7 Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.0 Hz, 2H).	331.05	E	

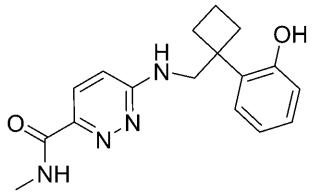
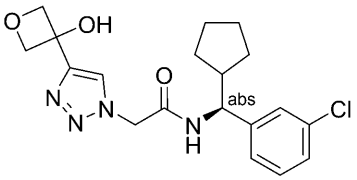
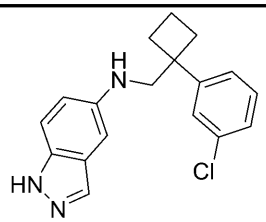
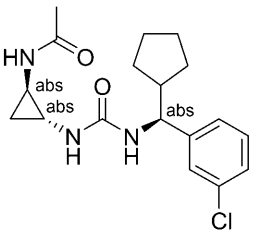
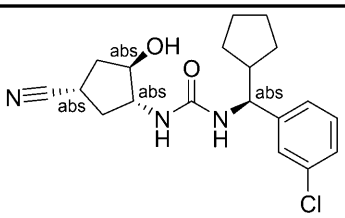
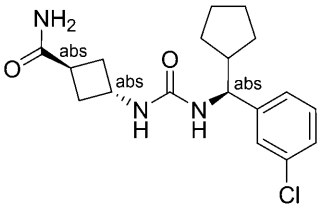
【表１－１６１】

I-610		(400 MHz, DMSO-d6)10.97 (s, 1H), 7.80 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.67 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.35 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.60 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	316.15	E	
I-611		(400 MHz, DMSO-d6)7.53-7.45 (m, 1H), 7.39-7.34 (m, 1H), 7.32 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 7.27-7.19 (m, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.57 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	375.1	E	
I-612		(400 MHz, DMSO-d6) 10.94 (s, 1H), 7.52 - 7.44 (m, 2H), 7.42 - 7.32 (m, 3H), 7.25 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.03 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.56 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	325.05	E	
I-613		(400 MHz, DMSO-d6) 10.98 (s, 1H), 7.35 (dd, J = 4.2, 2.5 Hz, 2H), 7.33 - 7.26 (m, 1H), 7.30 - 7.22 (m, 2H), 7.13 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.58 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	343.05	D	
I-614		(400 MHz, DMSO-d6) 10.84 (s, 1H), 7.32 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.26 - 7.18 (m, 3H), 6.99 (dd, J = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 6.89 (q, J = 7.8, 7.1 Hz, 2H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 3.87 - 3.75 (m, 5H), 1.38 (s, 6H).	321.1	E	
I-615		(400 MHz, DMSO-d6) 10.98 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.81 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.53 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 6.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.58 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.36 (s, 6H).	316.2	E	

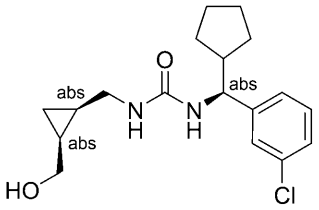
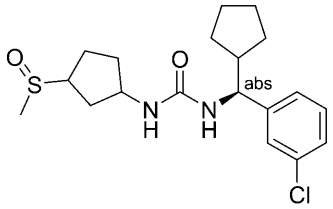
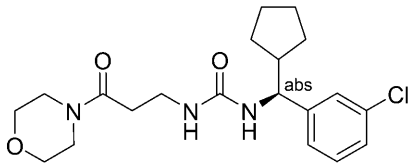
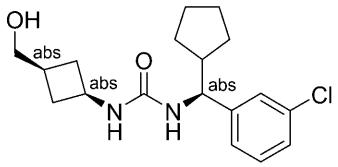
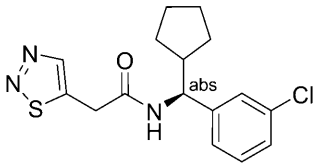
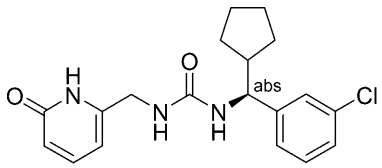
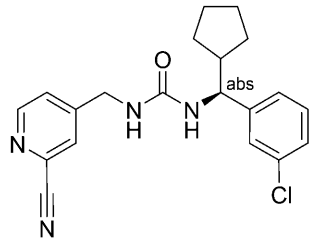
【表１－１６２】

I-616		(400 MHz, クロロホルム-d) 7.90 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.40 - 7.29 (m, 2H), 7.26 (d, J = 15.3 Hz, 2H), 6.54 (dd, J = 9.3, 3.6 Hz, 1H), 4.75 (s, 1H), 3.74 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 3.04 (d, J = 5.1 Hz, 3H), 2.66-2.56 (m, 2H), 2.53 - 2.16 (m, 1H), 2.08 - 1.83 (m, 2H), 1.14 (dd, J = 30.5, 6.7 Hz, 3H).	345.15	E	
I-617		(400 MHz, d6-DMSO) 7.42 (br s, 1H), 7.40 - 7.36 (m, 1H), 7.27 - 7.22 (m, 1H), 6.39 (br s, 0.5H), 6.37 (br s, 0.5H), 5.82 (br s, 0.5 H), 5.82 (br s, 0.5 H), 4.43 (d, J = 8.6 Hz, 0.5 H), 4.41 (d, J = 8.6 Hz, 0.5 H), 4.18 - 4.04 (m, 1H), 3.75 - 3.60 (m, 1H), 3.58 - 3.43 (m, 1H), 3.14 - 2.99 (m, 1H), 2.77 - 2.62 (m, 1H), 2.18 - 2.03 (m, 1H), 2.01 (s, 1.5 H) 1.91 (s, 1.5 H), 1.84 - 1.37 (m, 8H), 1.35 - 1.18 (m, 3H), 1.16 - 1.05 (m, 2H). 約 5% の不純物を含有。	422.2	E	
I-618		(400 MHz, DMSO-d6) 7.78-7.76 (m, 2H), 7.46-7.43 (m, 2H), 6.46-6.44 (m, 1H), 5.86-5.84 (m, 1H), 4.53-4.48 (m, 1H), 4.10 (s, 1H), 3.66 (s, 1H), 3.10-3.03 (m, 1H), 2.72-2.69 (m, 1H), 2.12-2.10 (m, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.72-1.10 (m, 13H).	369.1	E	
I-619		(400 MHz, MeOD) 8.10-8.07 (m, 1H), 7.67-7.63 (m, 2H), 7.48-7.36 (m, 3H), 4.14 (s, 2H), 2.93 (s, 3H), 2.68-2.56 (m, 4H), 2.38-2.33 (m, 1H), 2.03-2.00-1.77 (m, 1H).	322	E	

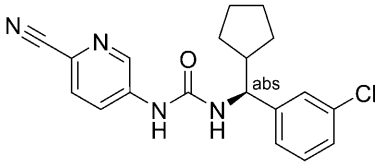
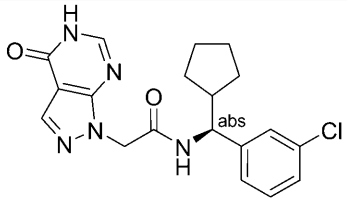
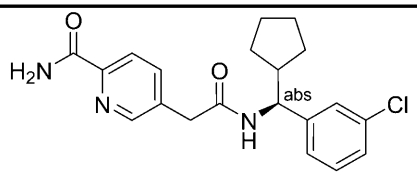
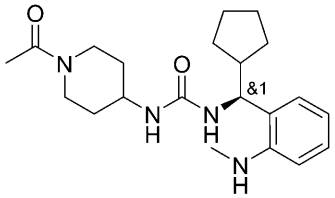
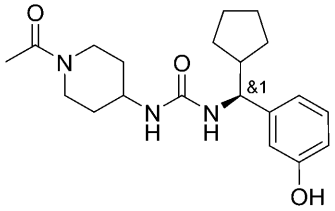
【表１－１６３】

I-620		(400 MHz,DMSO-d6): 9.28 (s, 1H), 8.66 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.06 (br, 1H), 7.00～6.90 (m, 2H), 6.80～6.76 (m, 1H), 6.75～6.68 (m, 2H), 3.70 (s, 2H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.35～2.25 (m, 4H), 2.15～2.00 (m, 1H), 1.80～1.70 (m, 1H).	313.1	E	
I-621				E	
I-622			312.29	D	
I-623			350.4	E	
I-624			362.45	D	
I-625			350.35	D	

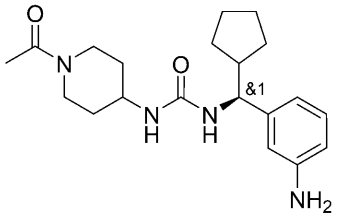
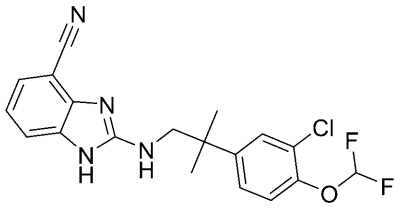
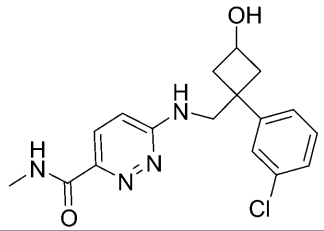
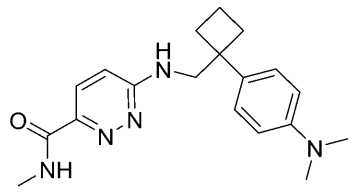
【表１－１６４】

I-626			337.39	E	
I-627			383.36	E	
I-628				E	
I-629				E	
I-630				D	
I-631				D	
I-632				D	

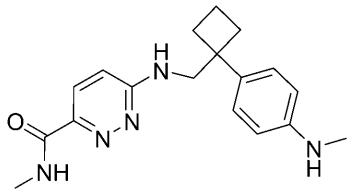
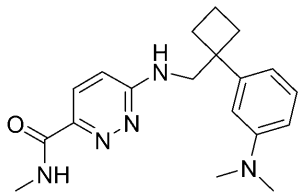
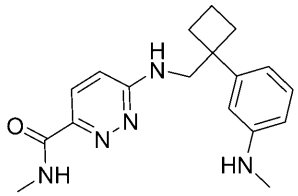
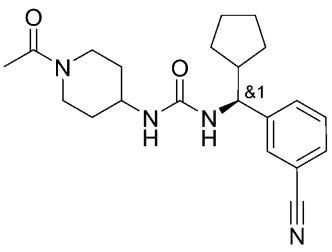
【表１－１６５】

I-633				D	
I-634				E	
I-635				D	
I-636		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.01 - 7.12 (m, 2 H), 6.47 - 6.63 (m, 2 H), 6.10 (br d, J=9.29 Hz, 1 H), 5.81 (br d, J=7.78 Hz, 1 H), 5.46 - 5.70 (m, 1 H), 4.52 (br t, J=9.29 Hz, 1 H), 4.10 (br s, 1 H), 3.66 (br s, 1 H), 3.56 - 3.59 (m, 1 H), 3.11 (br t, J=11.04 Hz, 1 H), 2.68 - 2.77 (m, 4 H), 2.37 - 2.44 (m, 1 H), 1.98 (d, J=3.01 Hz, 3 H), 1.47 - 1.76 (m, 8 H), 0.84 - 1.36 (m, 4 H)	373.2	E	
I-637		(400 MHz,DMSO-d6): 9.25 (s, 1H), 7.10～7.00 (m, 1H), 6.68～6.55 (m, 3H), 6.21 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.76 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.40～4.30 (m, 1H), 4.15～4.05 (m, 1H), 3.70～3.60 (m, 1H), 3.57～3.50 (m, 1H), 3.15～3.00 (m, 1H), 2.75～2.65 (m, 1H), 2.15～2.05 (m, 1H), 1.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 1.80～1.05 (m, 12H).	382	E	

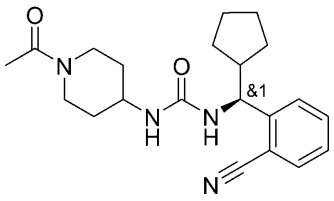
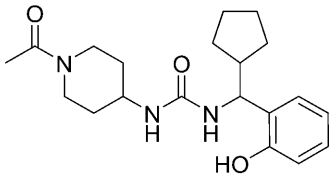
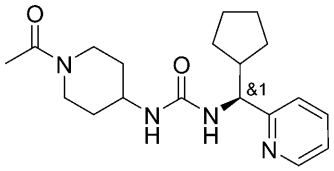
【表１－１６６】

I-638		(400 MHz, DMSO-d6): 6.94-6.90 (m, 1H), 6.42-6.37 (m, 3H), 6.12-6.09 (m, 1H), 5.77-5.74 (m, 1H), 4.95 (br, 2H), 4.30-4.25 (m, 1H), 4.11-4.07 (m, 1H), 3.69-3.64 (m, 1H), 3.57-3.50 (m, 1H), 3.13-3.05 (m, 1H), 2.77-2.67 (m, 1H), 2.13-2.04 (m, 1H), 1.98-1.97 (d, J = 4.4, 3H), 1.74-1.03 (m, 12H).	359.1	E	
I-639		(400 MHz, DMSO-d6) 10.97 (s, 1H), 7.64 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.6, 2.4 Hz, 1H), 7.36 - 7.29 (m, 2H), 7.27-7.22 (m, 1H), 7.11 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.57 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	391.1	E	
I-640			347.15	E	
I-641		(DMSO-d6, 400MHz): 8.69 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.09 (s, 1H), 7.03 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.84 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.67 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 3.75 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 2.84 (s, 6H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.35-2.14 (m, 4H), 2.09-1.95 (m, 1H), 1.83-1.71 (m, 1H).	340.1	E	

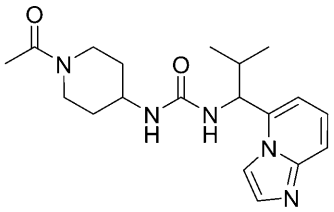
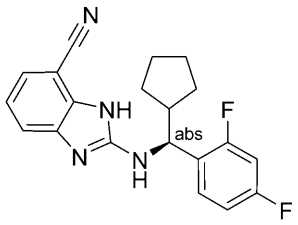
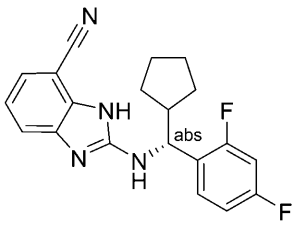
【表１－１６７】

I-642		(DMSO-d6, 400MHz): 8.69 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.12-7.03 (m, 1H), 6.95 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.84 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 6.47 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 5.41 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 3.72 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.64 (d, J = 4.4 Hz, 3H), 2.29-2.12 (m, 4H), 2.08-1.95 (m, 1H), 1.85-1.70 (m, 1H).	326.1	E	
I-643		(DMSO-d6, 400MHz): 8.68 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.10 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 6.82 (s, 1H), 6.56-6.46 (m, 3H), 3.80 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 2.84 (s, 6H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.36-2.19 (m, 4H), 2.13-1.99 (m, 1H), 1.86-1.73 (m, 1H).	340.2	E	
I-644		(DMSO-d6, 400MHz): = 8.70 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.64 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.12 (s, 1H), 7.01 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.49-6.26 (m, 3H), 5.51 (q, J = 4.8 Hz, 1H), 3.78 (d, J = 5.2 Hz, 2H), 2.79 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.64 (d, J = 5.2 Hz, 4H), 2.35-2.16 (m, 4H), 2.11-1.96 (m, 1H), 1.86-1.69 (m, 1H).	326.1	E	
I-645		(400 MHz,DMSO-d6): 7.70～7.65 (m, 2H), 7.62～7.57 (m, 1H), 7.54～7.49 (m, 1H), 6.45 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 5.87 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.51～4.43 (m, 1H), 4.15～4.07 (m, 1H), 3.72～3.62 (m, 1H), 3.12～3.01 (m, 1H), 2.75～2.63 (m, 1H), 2.19～2.06 (m, 1H), 1.97 (d, J = 3.2 Hz, 3H), 1.80～1.05 (m, 13H).	369	E	

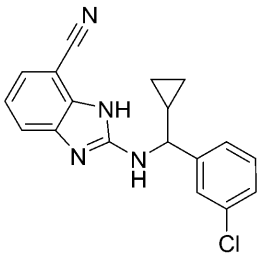
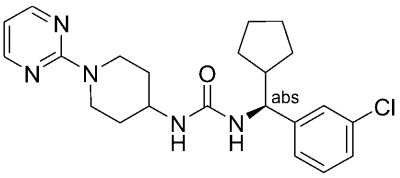
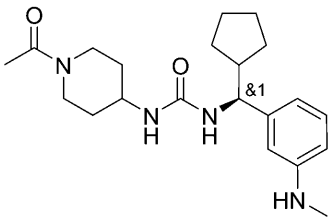
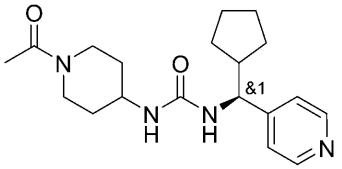
【表１－１６８】

I-646		(400 MHz,DMSO-d6): 7.77～7.65 (m, 2H), 7.48～7.37 (m, 2H), 6.56 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.93 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.75～4.67 (m, 1H), 4.15～4.05 (m, 1H), 3.72～3.60 (m, 1H), 3.12～3.00 (m, 1H), 2.76～2.64 (m, 1H), 2.20～2.10 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 1.82～1.05 (m, 13H).	369.1	E	
I-647		(400 MHz, DMSO-d6): 9.54 (s, 1H), 7.00-7.12 (m, 2H), 6.72-6.78 (m, 2H), 6.22-6.26 (m, 1H), 6.01-6.04 (m, 1H), 4.66-4.72 (m, 1H), 4.07-4.10 (m, 1H), 3.66-3.68 (m, 1H), 3.54-3.55 (m, 1H), 3.05-3.18 (m, 1H), 2.70-2.78 (m, 1H), 2.30-2.37 (m, 1H), 1.97-2.00 (m, 3H), 1.00-1.90 (m, 12H).	360.1	E	
I-648		(400 MHz, DMSO-d6) 8.53-8.44 (m, 1H), 7.76-7.66 (m, 1H), 7.30-7.17 (m, 2H), 6.30 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 6.08 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.65-4.55 (m, 1H), 4.13-4.01 (m, 1H), 3.71-3.60 (m, 1H), 3.59-3.49 (m, 1H), 3.14-3.02 (m, 1H), 2.82-2.65 (m, 1H), 2.28-215 (m, 1H), 1.97 (d, J = 4.0 Hz, 3H), 1.81-1.61 (m, 2H), 1.54-1.07 (m, 10H).	345.1	E	

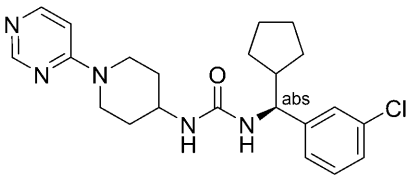
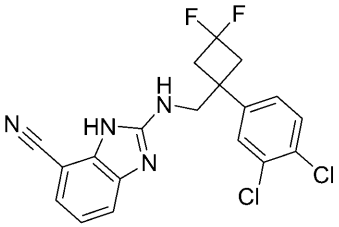
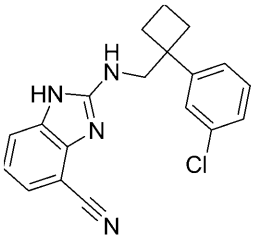
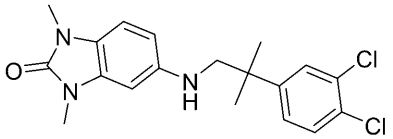
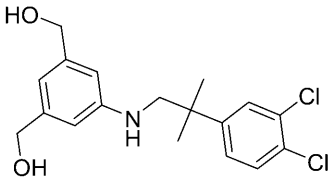
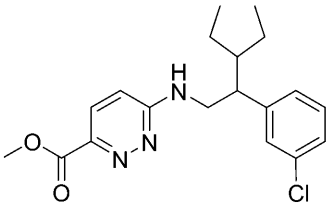
【表１－１６９】

I-649		(400 MHz, dmso) 8.04 (s, 1H), 7.63 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 8.9, 7.0 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.46 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.00 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.91 (dd, J = 8.1, 6.9 Hz, 1H), 4.17 - 4.04 (m, 1H), 3.73 - 3.61 (m, 1H), 3.61 - 3.50 (m, 1H), 3.15 - 3.01 (m, 1H), 2.79 - 2.67 (m, 1H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 1.97 (app. d, J = 3.5 Hz, 3H), 1.86 - 1.61 (m, 2H), 1.32 - 1.00 (m, 2H), 0.94 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.88 (d, J = 6.7 Hz, 3H). 一部ギ酸塩	358.2	E	
I-650		(400 MHz, dmso) 11.11 (br. s, 1H), 7.90 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.59 (td, J = 8.6, 6.8 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.19 (ddd, J = 10.6, 9.5, 2.6 Hz, 1H), 7.08 (td, J = 8.4, 2.4 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 4.96 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 2.40 - 2.30 (m, J = 7.4 Hz, 1H), 1.86 - 1.77 (m, 1H), 1.70 - 1.34 (m, 6H), 1.25 - 1.13 (m, 1H).	353.2	C	D
I-651		(400 MHz, dmso) 11.13 (br (s), 1H), 7.90 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.59 (td, J = 8.5, 6.8 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.22 - 7.15 (m, 1H), 7.08 (td, J = 8.4, 2.3 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 4.96 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 2.41 - 2.28 (m, 1H), 1.87 - 1.75 (m, 1H), 1.50 (ddd, J = 51.2, 37.0, 22.5 Hz, 6H), 1.25 - 1.13 (m, 1H).	353.2	E	

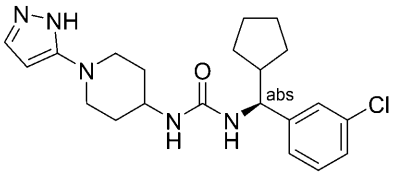
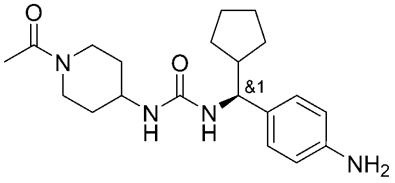
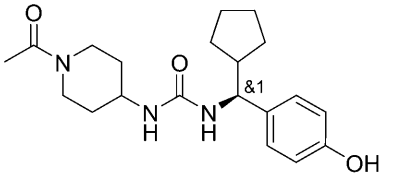
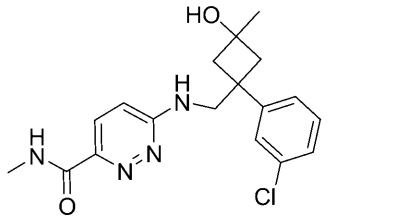
【表１－１７０】

I-652		(400 MHz, DMSO-d6) 11.36-11.05 (m, 1H), 8.04 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.47-7.43 (m, 1H), 7.40-7.34 (m, 2H), 7.33-7.28 (m, 1H), 7.24 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.95-6.87 (m, 1H), 4.38-4.26 (m, 1H), 1.26-1.21 (m, 1H), 0.61-0.43 (m, 4H).	323	E	
I-653		(DMSO-d6, 400MHz): 8.33 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 7.40-7.17 (m, 4H), 6.58 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 6.38 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.52-4.32 (m, 3H), 3.71-3.52 (m, 1H), 3.15-2.98 (m, 2H), 2.17-2.06 (m, 1H), 1.87-1.71 (m, 2H), 1.69-1.38 (m, 5H), 1.36-1.05 (m, 5H).	414.1	E	
I-654		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 7.35-7.45 (m, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.26 (d, J=7.6 Hz, 2H), 6.57 (d, J=7.6 Hz, 1H), 4.48 (s, 1H), 4.04-4.10 (m, 1H), 3.00-3.15 (m, 1H), 2.89 (s, 3H), 2.66-2.81 (m, 1H), 2.04-2.17 (m, 1H), 1.97 (d, J=3.2 Hz, 3H), 0.89-1.85 (m, 13H).	373.2	E	
I-655		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 8.45-8.49 (m, 2H), 7.22-7.27 (m, 2H), 6.43 (d, J=8.4 Hz, 1H), 5.87 (d, J=7.6 Hz, 1H), 4.44-4.49 (m, 1H), 4.09-4.14 (m, 1H), 3.65-3.70 (m, 1H), 3.48-3.58 (m, 1H), 3.01-3.13 (m, 1H), 2.67-2.75 (m, 1H), 2.06-2.19 (m, 1H). 1.98 (d, J=2.8 Hz, 3H), 1.53-1.83 (m, 5H). 1.05-1.50 (m, 7H).	345.2	E	

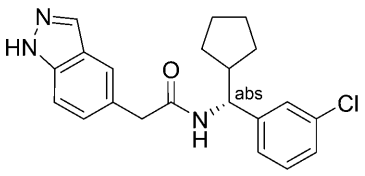
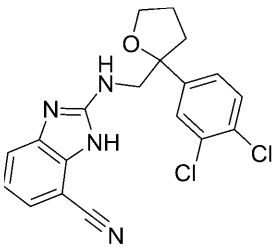
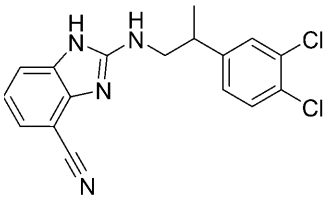
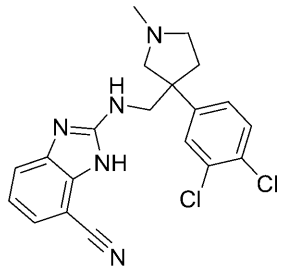
【表１－１７１】

I-656		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 8.43 (s, 1H), 8.11 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 7.14-7.34 (m, 4H), 6.79 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 6.36 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.81 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.37-4.42 (m, 1H), 4.15 (s, 2H), 3.56 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 2.94-3.09 (m, 2H), 2.00-2.15 (m, 1H), 1.68-1.83 (m, 2H), 1.36-1.66 (m, 5H), 1.03-1.32 (m, 5H).	414.1	D	
I-657		(400 MHz, DMSO-d6) 11.08 (s, 1H), 7.64 - 7.51 (m, 2H), 7.35 - 7.23 (m, 4H), 6.92 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.71 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 3.13 (q, J = 13.3 Hz, 2H), 2.95 (q, J = 13.5 Hz, 2H).	407.05	D	
I-658		(400 MHz, DMSO-d6) 10.97 (s, 1H), 7.33 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 7.27 - 7.09 (m, 5H), 6.90 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.69 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.38 - 2.29 (m, 1H), 2.29 - 2.21 (m, 3H), 2.17 - 2.02 (m, 1H), 1.81 (dq, J = 14.4, 9.2, 7.1 Hz, 1H).	337.1	B	B
I-659				E	
I-660				E	
I-661				E	

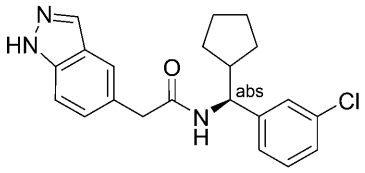
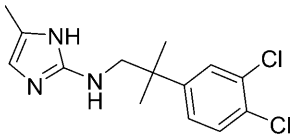
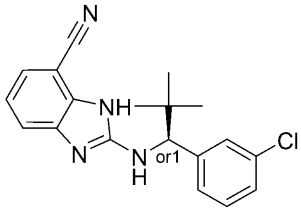
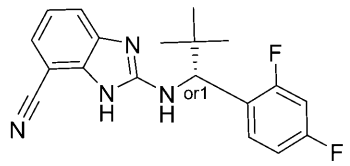
【表１－１７２】

I-662		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 11.74 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.17-7.38 (m, 4H), 6.35 (d, J=8.8 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.70 (s, 1H), 4.42-4.47 (m, 1H), 3.45 (d, J = 3.6 Hz, 3H), 2.70 (d, J = 8.8 Hz, 2 H), 2.06-2.17 (m, 1H), 1.24-1.88 (m, 12H), 1.08-1.19 (m, 1H).	402.1	D	
I-663		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 10.32 (s, 2H), 7.28-7.40 (m, 4H), 6.63 (s, 1H), 4.46 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.01-4.13 (m, 1H), 3.49-3.56 (m, 2H), 3.04-3.13 (m, 1H), 2.68-2.83 (m, 1H), 2.03-2.15 (m, 1H), 1.94-2.00 (m, 3H), 1.39-1.78 (m, 7H), 1.03-1.36 (m, 5H).	717.4	E	
I-664		(400 MHz, DMSO-d6) 9.19 (s, 1H), 7.01 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.67 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.16 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.73 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.32-4.36 (m, 1H), 4.07-4.12 (m, 1H), 3.64-3.69 (m, 1H), 3.48-3.59 (m, 1H), 3.01-3.15 (m, 1H), 2.66-2.78 (m, 1H), 2.03-2.14 (m, 1H), 1.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 1.40-1.82 (m, 7H), 1.02-1.35 (m, 5H).	360.1	E	
I-665		(400 MHz, DMSO-d6) 8.66 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.42 -6.97 (m, 5H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 4.83 (s, 1H), 3.80 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.56 -2.52 (m, 2H), 2.37- 2.26 (m, 2H), 1.39 (s, 3H).	361.15	E	

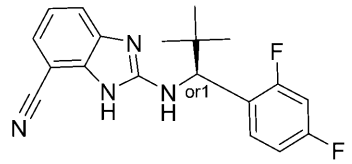
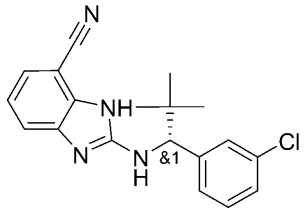
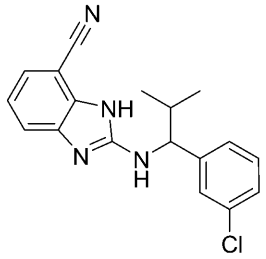
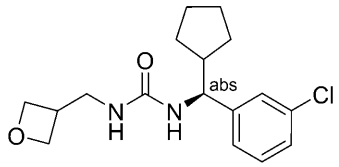
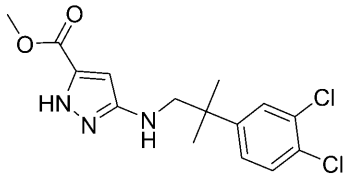
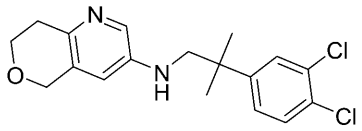
【表１－１７３】

I-666		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 12.96 (br s, 1H), 8.57 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.43 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 1.6, 1.6 Hz, 1H), 7.34 - 7.20 (m, 4H), 4.55 (app t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.54 (d, J = 14.0 Hz, 1H), 3.48 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 2.25 - 2.12 (m, 1H), 1.75 - 1.66 (m, 1H), 1.58 - 1.37 (m, 4H), 1.30 - 1.21 (m, 2H), 1.13 - 1.02 (m, 1H).	368.3	E	
I-667		(400 MHz, DMSO-d6) 10.91 (s, 1H), 7.69 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 8.4, 2.2 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.18 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.96 (dt, J = 8.0, 6.8 Hz, 1H), 3.86 (td, J = 7.7, 5.5 Hz, 1H), 3.67 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.33 - 2.23 (m, 1H), 2.10 - 1.92 (m, 2H), 1.74 (dt, J = 12.1, 7.3 Hz, 1H).	387.05	D	
I-668		(400 MHz, DMSO-d6) 11.16 (s, 1H), 7.61 - 7.53 (m, 2H), 7.42 - 7.17 (m, 4H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.64- 3.44 (m, 2H), 3.15 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 1.26 (d, J = 6.9 Hz, 3H).	345.05	D	
I-669		(400 MHz, DMSO-d6)11.07 (s, 1H), 7.59-7.51 (m, 2H), 7.33 (dd, J = 8.3, 2.4 Hz, 2H), 7.24 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.13 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.72-3.59 (m, 2H), 3.05 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 2.86 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 2.59 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 2.44 (dd, J = 9.1, 6.0 Hz, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.20 (ddd, J = 13.8, 8.1, 6.0 Hz, 1H), 2.05 (ddd, J = 13.6, 7.4, 3.5 Hz, 1H).	400.1	E	

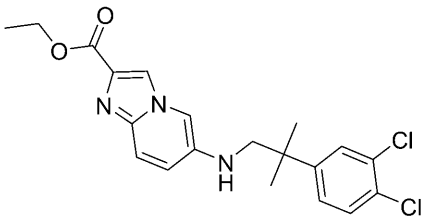
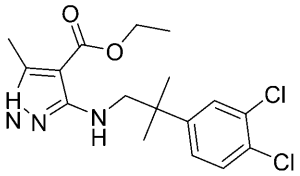
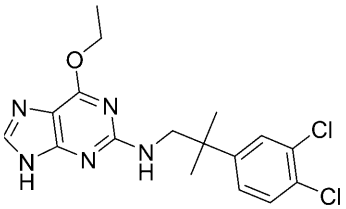
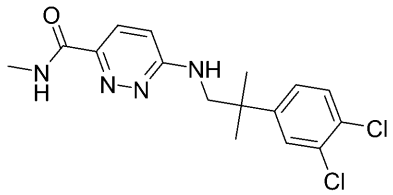
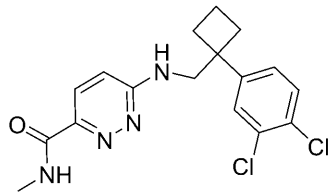
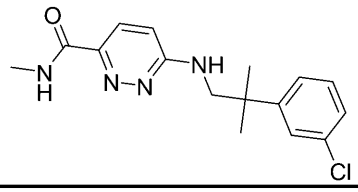
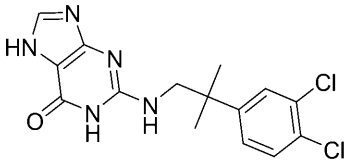
【表１－１７４】

I-670		(400 MHz, d6-DMSO) 12.96 (br s, 1H), 8.57 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.43 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 1.6, 1.6 Hz, 1H), 7.34 - 7.20 (m, 4H), 4.55 (app t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.54 (d, J = 14.0 Hz, 1H), 3.48 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 2.25 - 2.12 (m, 1H), 1.75 - 1.66 (m, 1H), 1.58 - 1.37 (m, 4H), 1.30 - 1.21 (m, 2H), 1.13 - 1.02 (m, 1H).	368.3	D	
I-671		(400 MHz, DMSO-d6)12.02 (s,1H), 8.28 (s, 1H), 7.63 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.24 (s, 1H), 6.36 (s, 1H), 3.34 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.29 (s, 6H).	297.95	E	
I-672		(400 MHz, dmso) 11.17 (br. s, 1H), 8.01 (br. s, 1H), 7.52 - 7.47 (m, 1H), 7.39 - 7.35 (m, 3H), 7.33 - 7.28 (m, 1H), 7.23 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.73 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 0.95 (s, 9H)	339.2	C	
I-673		(400 MHz, dmso) 7.88 (br. s, 1H), 7.55 (td, J = 8.8, 7.0 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 7.8, 1.0 Hz, 1H), 7.26 - 7.17 (m, 2H), 7.11 (td, J = 8.4, 2.4 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 0.96 (s, 9H). NHプロトンシグナルが１つ欠落;若干の脂肪族不純物	341.2	E	

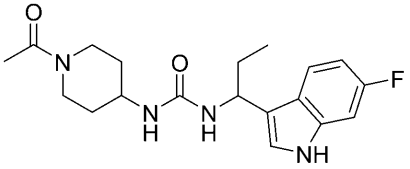
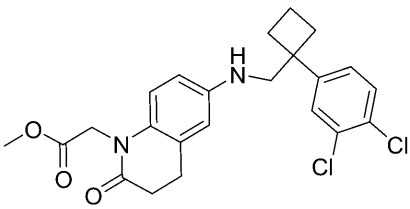
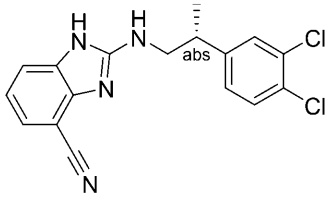
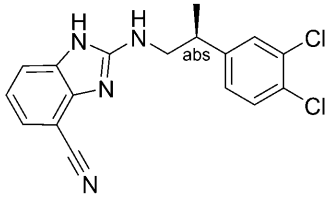
【表１－１７５】

I-674		(400 MHz, dmso) 7.93 (br. s, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 6.8 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 7.7, 1.0 Hz, 1H), 7.26 - 7.16 (m, 2H), 7.10 (td, J = 8.5, 2.6 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 0.96 (s, 9H). NHプロトンシグナルが 1 つ欠落;若干の脂肪族不純物	341.2	D	
I-675		(400 MHz, dmso) 11.13 (br. s, 1H), 8.00 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.52 - 7.47 (m, 1H), 7.40 - 7.34 (m, 3H), 7.33 - 7.27 (m, 1H), 7.24 (dd, J = 7.8, 0.8 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.73 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 0.95 (s, 9H). およそ 10.1%w/w のジエチルアミン。	339.2	E	
I-676		(400 MHz, DMSO-d6) 11.18 (s, 1H), 7.92 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.40-7.22 (m, 5H), 6.99-6.85 (m, 1H), 4.67-4.48 (m, 1H), 2.11-2.04 (m, 1H), 0.98 (d, J = 8.0 Hz, 3H), 0.79 (d, J = 8.0 Hz, 3H).	325	D	
I-677				D	
I-678				E	
I-679				D	

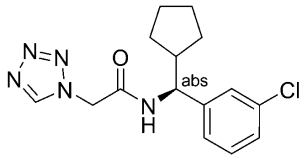
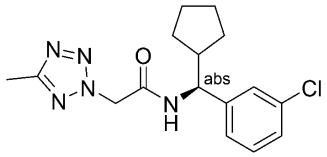
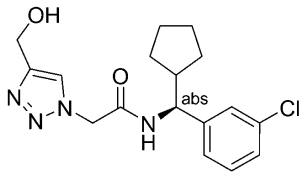
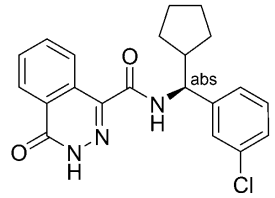
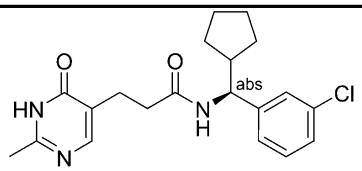
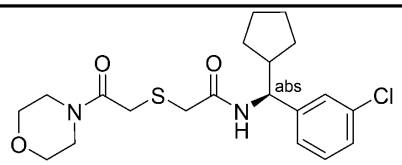
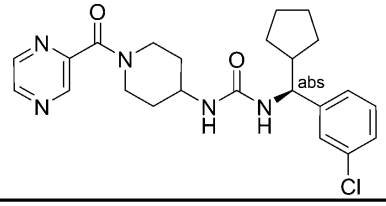
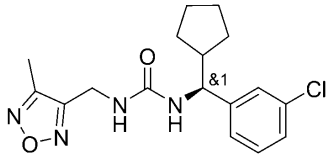
【表１－１７６】

I-680				E	
I-681				E	
I-682				E	
I-683				E	
I-684				D	
I-685				E	
I-686			352.3	E	

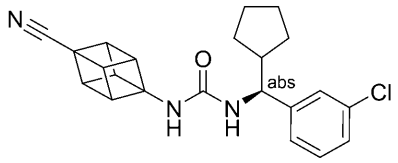
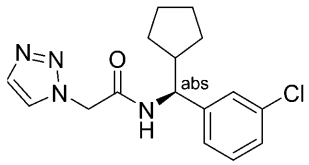
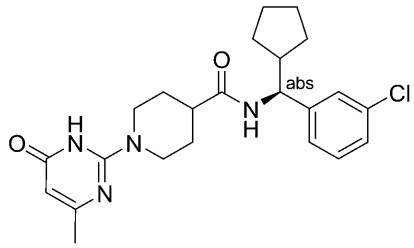
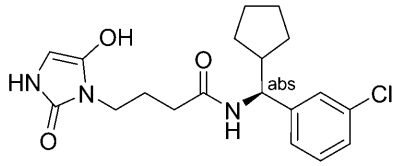
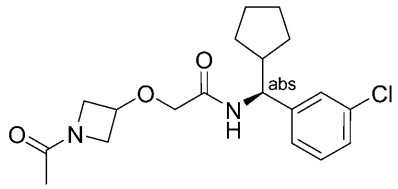
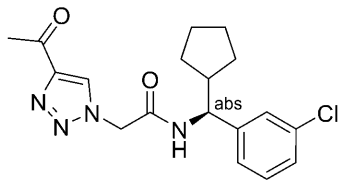
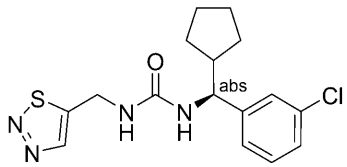
【表１－１７７】

I-687		(400 MHz, d6-DMSO) 10.97 (br s, 1H), 7.35 - 7.27 (m, 2H), 7.25 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.90 (app td, J = 9.2, 2.5 Hz, 1H), 5.97 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.79 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.79 (dt, J = 7.8, 7.2 Hz, 1H), 4.08 (dd, J = 15.4, 8.8 Hz, 1H), 3.73 - 3.52 (m, 2H), 3.17 - 3.03 (m, 1H), 2.82 - 2.69 (m, 1H), 1.98 (s, 1.5 H), 1.97 (s, 1.5 H) 1.91 - 1.62 (m, 4H), 1.31 - 1.00 (m, 2H), 0.84 (t, J = 7.3 Hz, 3H). アセチル部分が 2 つの別個のシングレットとして出現。	359.4	E	
I-688		(400 MHz, DMSO-d6) 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 8.3, 2.2 Hz, 1H), 6.61 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.41 - 6.31 (m, 2H), 5.27 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 4.53 (s, 2H), 3.65 (s, 3H), 2.68 (dd, J = 8.6, 5.8 Hz, 2H), 2.46 (dd, J = 8.6, 5.8 Hz, 4H), 2.26 (q, J = 8.9, 7.4 Hz, 4H), 2.08 (ddd, J = 16.6, 10.1, 5.6 Hz, 1H), 1.80 (s, 1H).	477.1	E	
I-689		(400 MHz, DMSO-d6) 11.17 (s, 1H), 7.61 - 7.53 (m, 2H), 7.42 - 7.16 (m, 4H), 6.92 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.50 (s, 2H), 3.15 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 1.26 (d, J = 6.9 Hz, 3H).	345.05	D	
I-690		(400 MHz, DMSO-d6) 11.16 (s, 1H), 7.61 - 7.53 (m, 2H), 7.37- 7.22 (m, 4H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.50 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 3.15 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 1.26 (d, J = 6.9 Hz, 3H).	345.05	D	

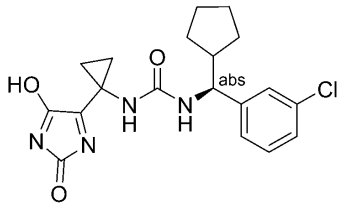
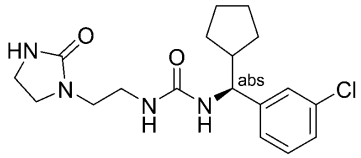
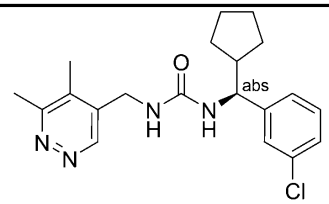
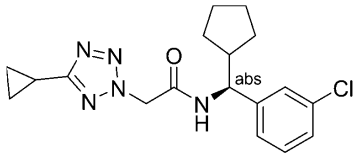
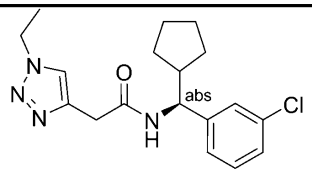
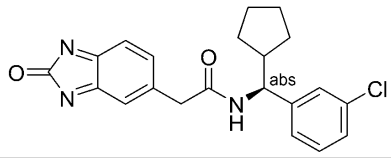
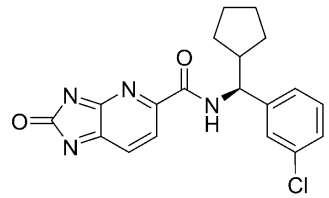
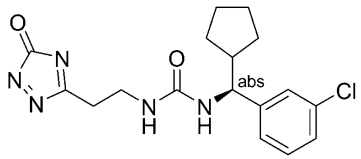
【表１－１７８】

I-691				E	
I-692				E	
I-693				E	
I-694				E	
I-695				E	
I-696				E	
I-697				D	
I-698				D	

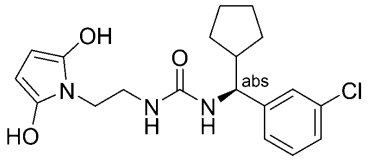
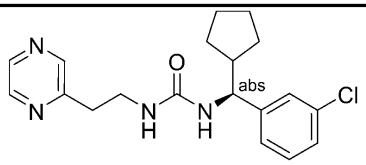
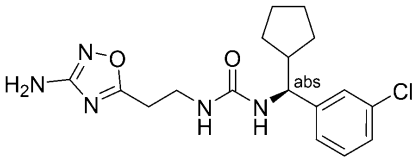
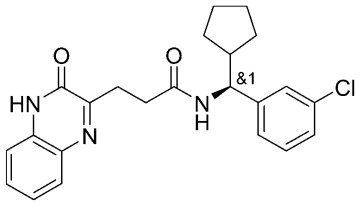
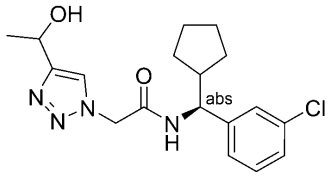
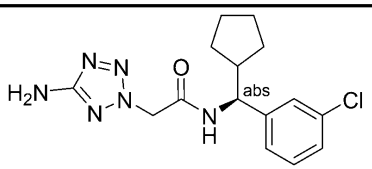
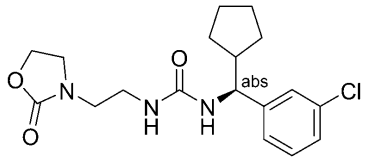
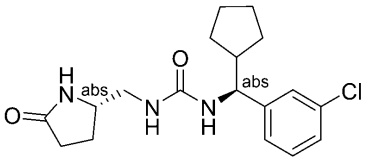
【表１－１７９】

I-699				E	
I-700				D	
I-701				E	
I-702				E	
I-703				E	
I-704				E	
I-705				D	

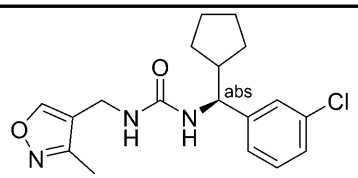
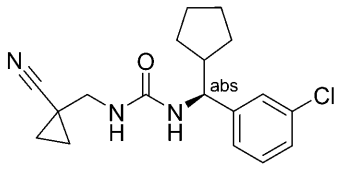
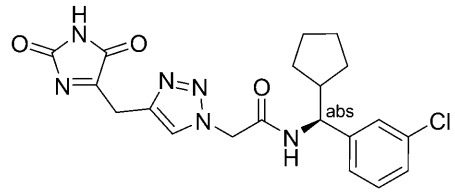
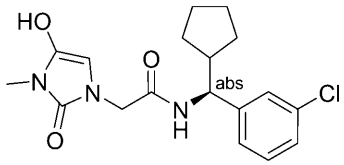
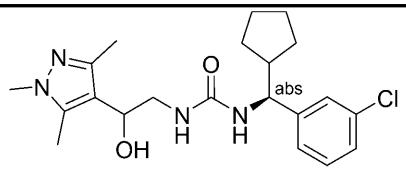
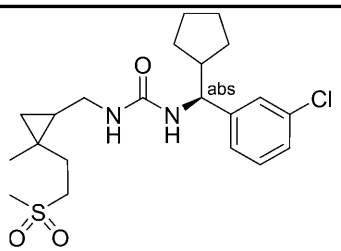
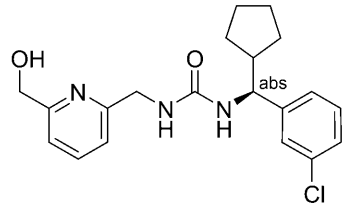
【表１－１８０】

I-706				E	
I-707				E	
I-708				D	
I-709				E	
I-710				D	
I-711				E	
I-712				E	
I-713				D	

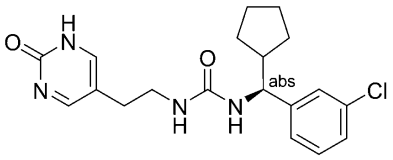
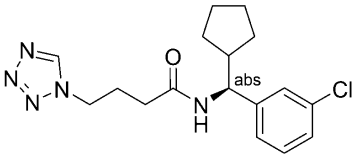
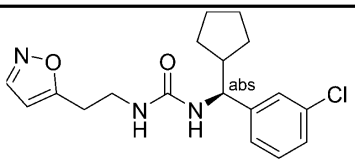
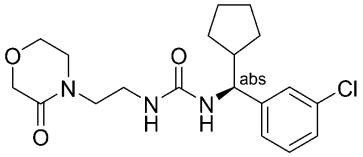
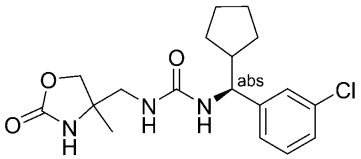
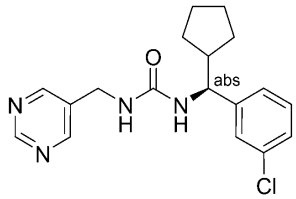
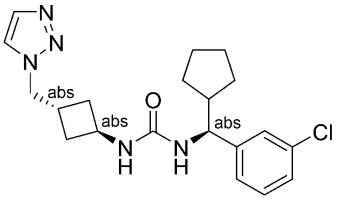
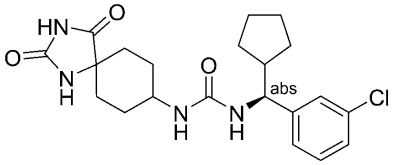
【表１－１８１】

I-714				E	
I-715				E	
I-716				E	
I-717				E	
I-718				E	
I-719				E	
I-720				E	
I-721				E	

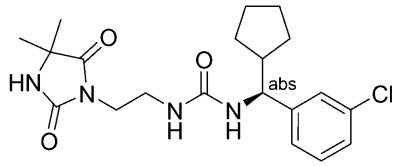
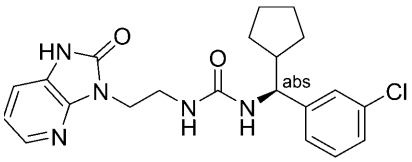
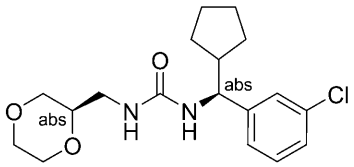
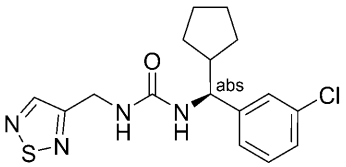
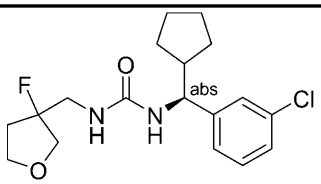
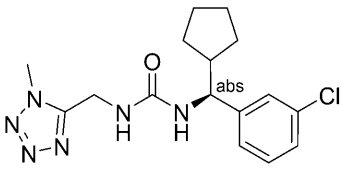
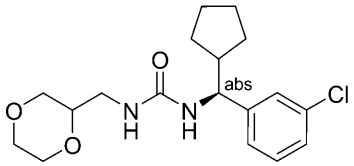
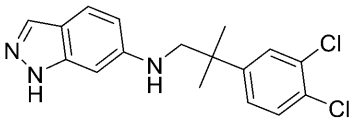
【表１－１８２】

I-722				D	
I-723				D	
I-724				E	
I-725				E	
I-726				E	
I-727				D	
I-728				D	

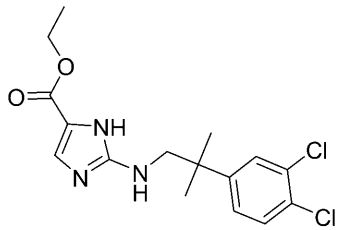
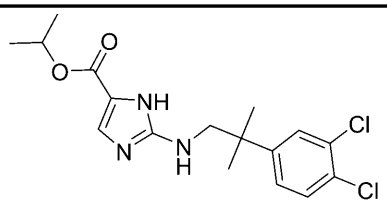
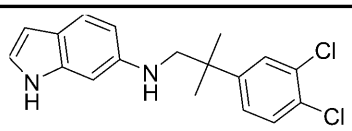
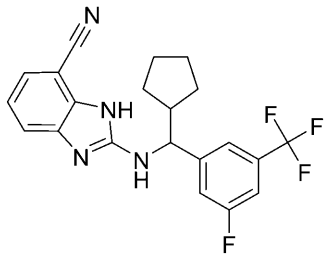
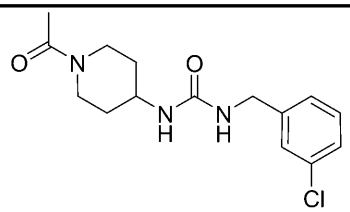
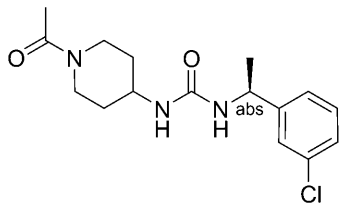
【表１－１８３】

I-729				D	
I-730				D	
I-731				E	
I-732				D	
I-733				D	
I-734				E	
I-735				D	
I-736				C	

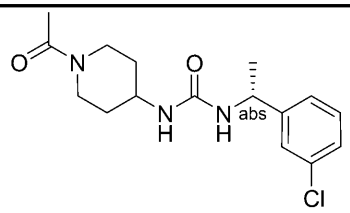
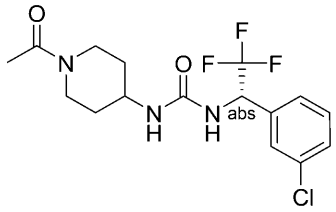
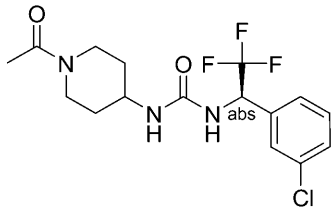
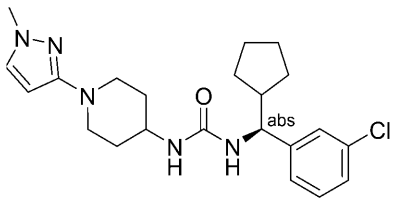
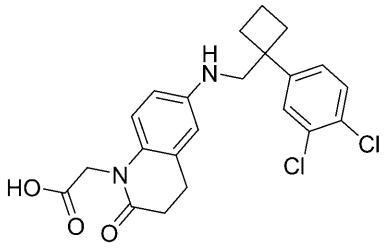
【表１－１８４】

I-737				E	
I-738				E	
I-739				E	
I-740				D	
I-741				D	
I-742				D	
I-743				E	
I-744			334.29	E	

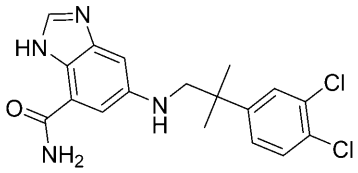
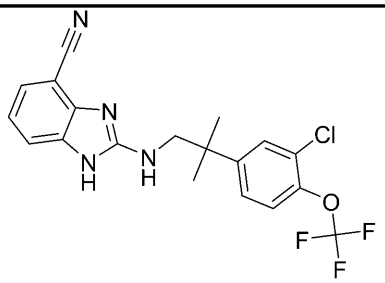
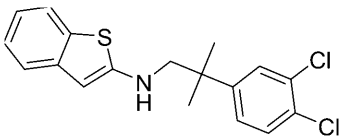
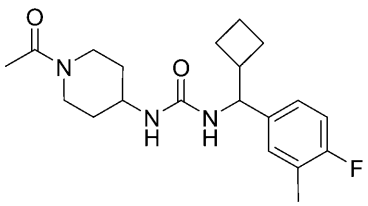
【表１－１８５】

I-745			356.3	E	
I-746			370.35	D	
I-747			333.29	E	
I-748		(400 MHz, dmso) 11.32 (br. s, 1H), 8.08 (br. d, J = 10.2 Hz, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.65 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.7, 0.9 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 4.74 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.40 - 2.29 (m, 1H), 1.89 - 1.78 (m, 1H), 1.69 - 1.39 (m, 5H), 1.38 - 1.26 (m, 1H), 1.26 - 1.15 (m, 1H). 一部ギ酸塩	403.2	C	
I-749				E	
I-750				E	

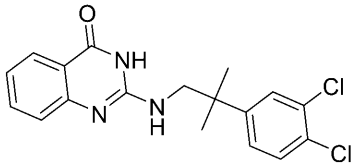
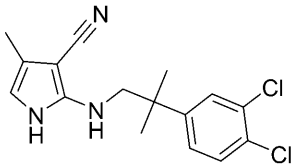
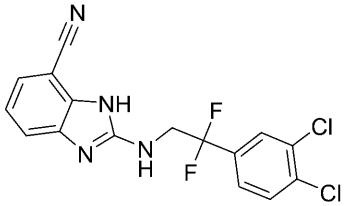
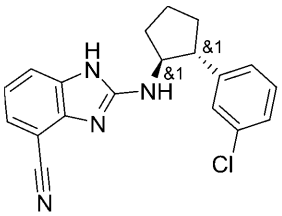
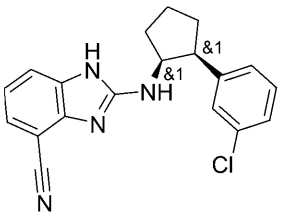
【表１－１８６】

I-751				E	
I-752				E	
I-753				E	
I-754		(DMSO-d6, 400MHz): 7.40 (s, 1H), 7.37-7.18 (m, 4H), 6.35 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.82 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.64 (s, 1H), 4.45 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 3.64 (s, 3H), 3.46 (d, J = 5.6 Hz, 4H), 2.71-2.71 (m, 1H), 2.73-2.70 (m, 1H), 2.67 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 2.21-2.02 (m, 1H), 1.87-1.22 (m, 13H), 1.15 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 1.20-1.04 (m, 1H).	416.1	E	
I-755		(400 MHz, DMSO-d6) 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 6.54 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.36 (dd, J = 8.7, 2.7 Hz, 1H), 6.30 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 5.14 (s, 1H), 4.16 (s, 2H), 3.31 (d, J = 3.7 Hz, 3H), 2.65 (dd, J = 8.7, 6.0 Hz, 2H), 2.40 (dd, J = 8.6, 5.9 Hz, 2H), 2.30 - 2.17 (m, 4H), 2.07 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 1.80 (s, 1H).	433.05	E	

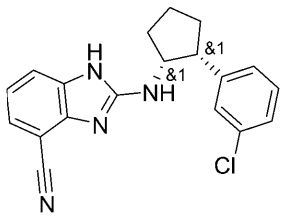
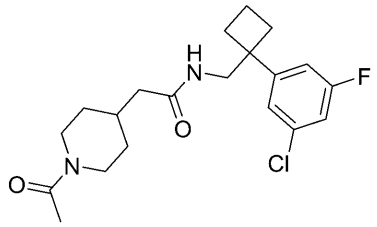
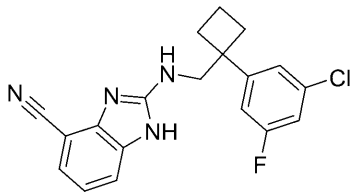
【表１－１８７】

I-756		(400 MHz, DMSO-d6) 12.31 (s, 1H), 9.21 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.64 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.45 - 7.41 (m, 1H), 7.33 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 5.44 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 3.24 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 1.38 (s, 6H).	377.05	D	
I-757		(400 MHz, DMSO-d6) 10.98 (s, 1H), 7.72 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.57 - 7.45 (m, 2H), 7.34 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.58 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 1.36 (s, 6H).	409.05	E	
I-758		(400 MHz, DMSO-d6) 7.64 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.51 (dt, J = 7.9, 0.9 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.27 (dt, J = 7.9, 1.0 Hz, 1H), 7.11 (ddd, J = 8.0, 7.2, 1.1 Hz, 1H), 6.91 (ddd, J = 8.3, 7.3, 1.2 Hz, 1H), 6.47 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 6.00 (s, 1H), 3.31 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 1.36 (s, 6H).	350.05	E	
I-759		(400 MHz, dmso) 7.09 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 7.03 - 7.01 (m, 1H), 6.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 5.79 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 4.50 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 4.16 - 4.06 (m, 1H), 3.72 - 3.61 (m, 1H), 3.60 - 3.48 (m, 1H), 3.13 - 3.01 (m, 1H), 2.77 - 2.65 (m, 1H), 2.46 (埋没した m, 1H), 2.20 (d, J = 1.7 Hz, 3H), 1.97 (s, 1.5H), 1.97 (s, 1.5H), 1.94 - 1.86 (m, 1H), 1.82 - 1.63 (m, 7H), 1.28 - 1.02 (m, 2H). CH3(アセチル)が２つのシングレットとして発現。	362.2	E	

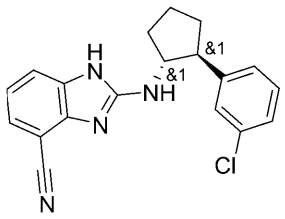
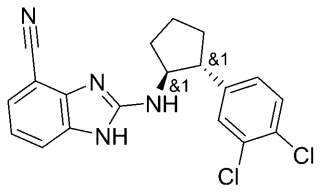
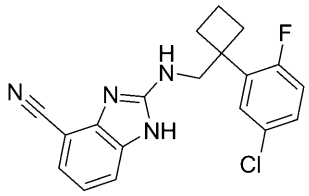
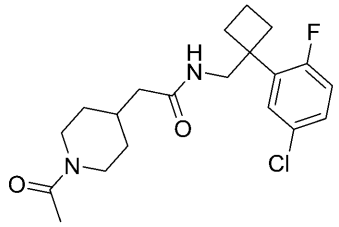
【表１－１８８】

I-760			362.25	E	
I-761			322.29	D	
I-762			367.2	E	
I-763		(400 MHz, DMSO-d6) 11.29 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.41 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 8.1, 5.3 Hz, 3H), 7.23 (dd, J = 6.0, 3.2 Hz, 2H), 6.89 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.14 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 3.10 (q, J = 9.3 Hz, 1H), 2.36 - 2.27 (m, 1H), 2.19 - 2.07 (m, 1H), 1.89 - 1.69 (m, 3H), 1.63 - 1.49 (m, 1H).	337.15	E	
I-764		(400 MHz, DMSO-d6) 11.18 (s, 1H), 7.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.34 - 7.28 (m, 3H), 7.26 - 7.19 (m, 2H), 6.89 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 4.23 - 4.05 (m, 1H), 3.10 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.35 - 2.31 (m, 1H), 2.14 (dd, J = 12.7, 7.1 Hz, 1H), 1.89 - 1.77 (m, 3H), 1.56 (dd, J = 12.5, 8.4 Hz, 1H).	337.05	E	

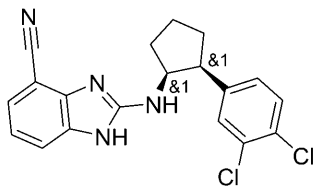
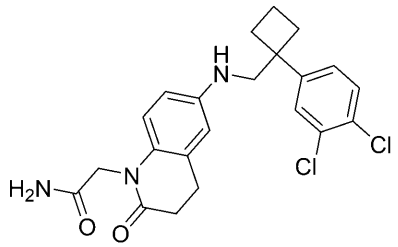
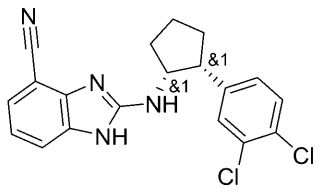
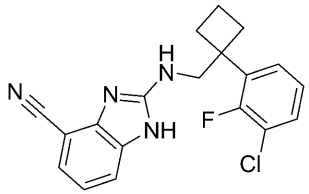
【表１－１８９】

I-765		(400 MHz, DMSO-d6) 10.84 (s, 1H), 7.31 - 7.25 (m, 2H), 7.25 - 7.16 (m, 3H), 7.18 - 7.07 (m, 2H), 6.87 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.53 - 4.44 (m, 1H), 3.39 (td, J = 8.7, 6.4 Hz, 1H), 2.19 - 2.01 (m, 3H), 1.92 (dq, J = 14.0, 7.5, 6.3 Hz, 1H), 1.74 (ddt, J = 13.6, 11.5, 4.5 Hz, 2H).	337.15	E	
I-766		(400 MHz, DMSO-d6) 7.70 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 7.22 (dt, J = 8.8, 2.1 Hz, 1H), 6.97 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 6.95 - 6.87 (m, 1H), 4.26 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 3.70 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 3.45 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 2.92 (ddd, J = 14.1, 12.2, 2.7 Hz, 1H), 2.43 (dd, J = 12.7, 2.8 Hz, 1H), 2.24-2.13 (m, 4H), 2.10 -1.98 (m, 1H), 1.95 (d, J = 11.1 Hz, 5H), 1.75 (dtd, J = 14.6, 7.2, 3.4 Hz, 2H), 1.43 (dd, J = 12.5, 4.3 Hz, 2H), 0.97 (td, J = 12.3, 4.1 Hz, 1H), 0.89 - 0.76 (m, 1H).	381.15	E	
I-767		(400 MHz, DMSO-d6) 10.99 (s, 1H), 7.32 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 7.9, 1.1 Hz, 1H), 7.18 (dt, J = 8.8, 2.2 Hz, 2H), 7.11 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.03 (dt, J = 9.7, 2.0 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.71 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 2.38 - 2.20 (m, 4H), 2.18 - 2.05 (m, 1H), 1.81 (dtd, J = 15.4, 9.1, 4.2 Hz, 1H).	355.05	C	

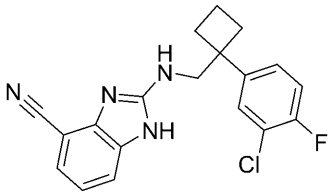
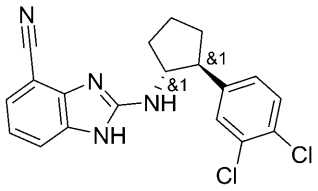
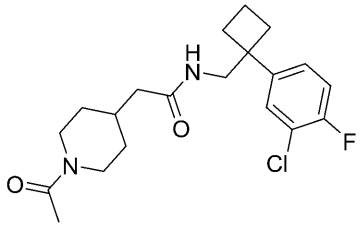
【表１－１９０】

I-768		(400 MHz, DMSO-d6) 10.85 (s, 1H), 7.28 (t, J = 3.7 Hz, 2H), 7.25 - 7.16 (m, 3H), 7.18 - 7.07 (m, 2H), 6.87 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.48 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 3.39 (td, J = 8.7, 6.5 Hz, 1H), 2.19 - 2.01 (m, 3H), 1.91 (ddd, J = 13.8, 9.6, 6.4 Hz, 1H), 1.74 (tdd, J = 14.7, 8.2, 4.0 Hz, 2H).	337.15	E	
I-769		(400 MHz, DMSO-d6) 11.17 (s, 1H), 7.62 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 19.4, 8.5 Hz, 2H), 7.39- 7.28 (m, 2H), 7.27 - 7.21 (m, 1H), 6.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.18 - 4.10 (m, 1H), 3.10 (q, J = 9.1, 8.7 Hz, 1H), 2.33 - 2.25 (m, 1H), 2.17- 2.06 (m, 1H), 1.90- 1.70 (m, 3H), 1.64 - 1.50 (m, 1H).	371.05	D	
I-770		(400 MHz, DMSO-d6) 11.02 (s, 1H), 7.31 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.28 - 7.22 (m, 2H), 7.22 - 7.07 (m, 3H), 6.89 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.79 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.39 - 2.28 (m, 4H), 2.26 - 2.08 (m, 1H), 1.85 (dt, J = 11.3, 5.6 Hz, 1H).	355.1	E	
I-771		(400 MHz, DMSO-d6) 7.76 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 7.28 (ddd, J = 8.7, 4.3, 2.7 Hz, 1H), 7.12 (dd, J = 10.5, 8.7 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 6.7, 2.7 Hz, 1H), 4.26 (d, J = 13.0 Hz, 1H), 3.69 (d, J = 13.4 Hz, 1H), 3.53 (dd, J = 6.3, 2.0 Hz, 2H), 2.91 (td, J = 13.5, 12.9, 2.7 Hz, 1H), 2.48 - 2.38 (m, 1H), 2.33 - 2.21 (m, 4H), 2.14 - 2.01 (m, 1H), 1.96 (s, 3H), 1.91 (dd, J = 7.2, 1.4 Hz, 2H), 1.85 - 1.74 (m, 1H), 1.69 (ddd, J = 11.2, 7.4, 3.8 Hz, 1H), 1.41 - 1.33 (m, 2H), 0.99 - 0.82 (m, 2H),	381.15	E	

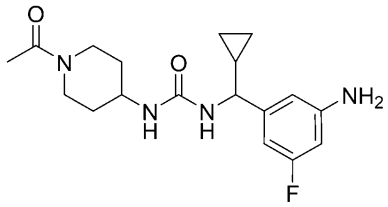
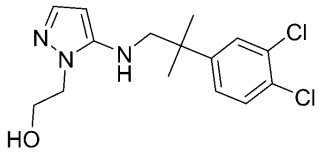
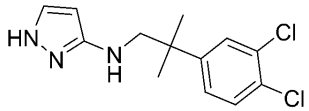
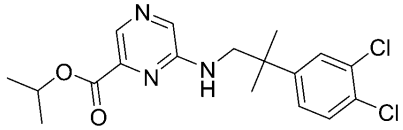
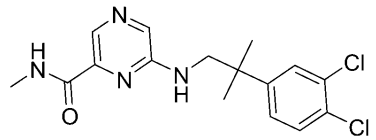
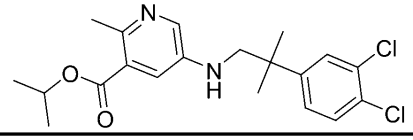
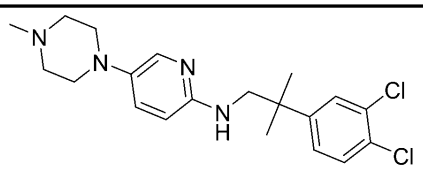
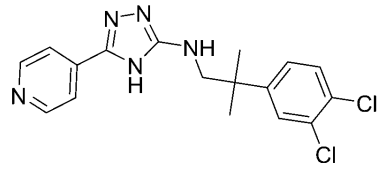
【表１－１９１】

I-772		(400 MHz, DMSO-d6) 11.17 (s, 1H), 7.62 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 19.9, 8.4 Hz, 2H), 7.39- 7.28 (m, 2H), 7.24 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.14 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.10 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 2.36 - 2.24 (m, 1H), 2.12 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.87 - 1.78 (m, 3H), 1.56 (s, 1H).	371.05	D	
I-773		(400 MHz, DMSO-d6) 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.18 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.50 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.38 (dd, J = 8.7, 2.6 Hz, 1H), 6.33 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 5.22 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 4.28 (s, 2H), 3.31 (s, 2H), 2.72 - 2.61 (m, 2H), 2.50 - 2.43 (m, 1H), 2.24 (t, J = 8.9 Hz, 4H), 2.08 (s, 2H) , 1.81 (d, J = 4.4 Hz, 1H).	432.05	E	
I-774		(400 MHz, DMSO-d6) 10.85 (s, 1H), 7.48 - 7.35 (m, 2H), 7.29 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.21 (ddd, J = 10.1, 8.1, 1.6 Hz, 2H), 7.12 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 6.88 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.53-4.42 (m, 1H), 3.46- 3.35 (m, 1H), 2.18 - 2.01 (m, 3H), 1.93 (dtt, J = 12.2, 8.3, 4.8 Hz, 1H), 1.73 (qq, J = 10.5, 7.4, 6.3 Hz, 2H).	371.05	D	
I-775		(400 MHz, DMSO-d6) 11.00 (s, 1H), 7.40 - 7.27 (m, 2H), 7.22 (dd, J = 7.9, 1.1 Hz, 1H), 7.19 - 7.06 (m, 3H), 6.89 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.81 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 2.35 (t, J = 9.9 Hz, 4H), 2.18 (q, J = 9.2 Hz, 1H), 1.85 (ddd, J = 13.9, 8.1, 4.3 Hz, 1H).	355.1	C	B

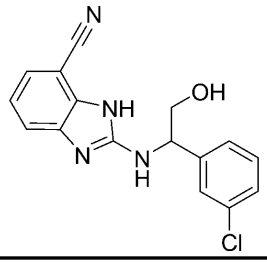
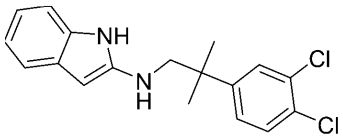
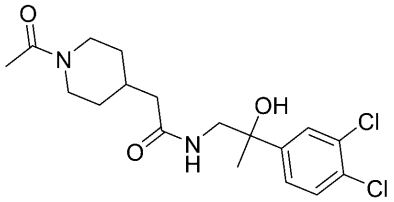
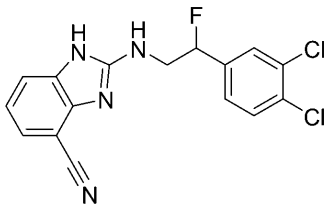
【表１－１９２】

I-776		(400 MHz, DMSO-d6) 10.96 (s, 1H), 7.37 (dd, J = 7.3, 2.3 Hz, 1H), 7.37 - 7.27 (m, 2H), 7.27 - 7.19 (m, 1H), 7.23 - 7.12 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.69 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.54 (s, 4H), 2.18 - 2.04 (m, 1H), 1.87 - 1.74 (m, 1H).	355.05	D	
I-777		(400 MHz, DMSO-d6) 10.85 (s, 1H), 7.48 - 7.39 (m, 2H), 7.29 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.21 (td, J = 8.4, 1.6 Hz, 2H), 7.12 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 6.88 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.47 (dd, J = 9.3, 5.5 Hz, 1H), 3.46- 3.35 (m, 1H), 2.08 (tt, J = 16.0, 4.7 Hz, 3H), 2.02 - 1.85 (m, 1H), 1.80 - 1.63 (m, 2H).	371.05	D	
I-778		(400 MHz, DMSO-d6) 7.68 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 7.33 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 7.2, 2.3 Hz, 1H), 7.08 (ddd, J = 8.6, 4.7, 2.3 Hz, 1H), 4.31 - 4.22 (m, 1H), 3.70 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 3.43 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 2.92 (ddd, J = 14.0, 12.1, 2.7 Hz, 1H), 2.44 (td, J = 12.6, 2.8 Hz, 1H), 2.19 (p, J = 5.6, 4.5 Hz, 4H), 2.10 - 1.98 (m, 1H), 1.95 (d, J = 13.8 Hz, 5H), 1.75 (ddq, J = 14.8, 6.9, 3.8, 3.4 Hz, 2H), 1.46 - 1.37 (m, 2H), 0.89 (dqd, J = 41.4, 12.2, 4.2 Hz, 2H).	381.15	E	

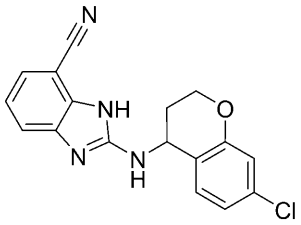
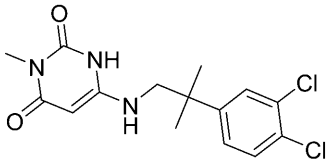
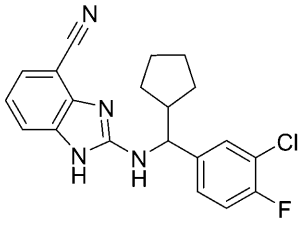
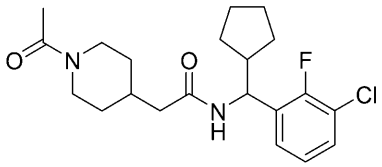
【表１－１９３】

I-779		(400 MHz, dmso) 6.31 (s, 1H), 6.27 - 6.12 (m, 3H), 5.85 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 5.34 (br. s, 2H), 4.16 - 4.06 (m, 1H), 3.97 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.72 - 3.63 (m, 1H), 3.54 (m (埋没), 1H), 3.14 - 3.03 (m, 1H), 2.78 - 2.65 (m, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.83 - 1.64 (m, 2H), 1.29 - 1.17 (m, 1H), 1.17 - 1.05 (m, 1H), 1.04 - 0.94 (m, 1H), 0.49 - 0.37 (m, 2H), 0.34 - 0.17 (m, 2H). 一部ギ酸塩	349.3	E	
I-780			328.29	E	
I-781			284.28	E	
I-782			382.31	E	
I-783			353.3	E	
I-784			395.3	E	
I-785			393.36	E	
I-786			362.3	D	

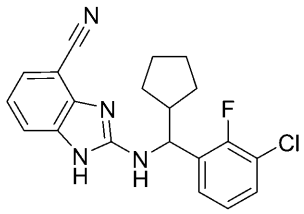
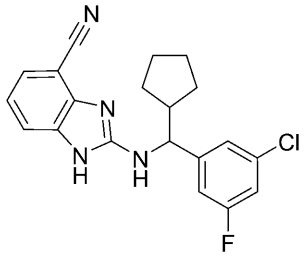
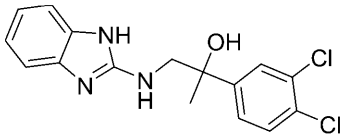
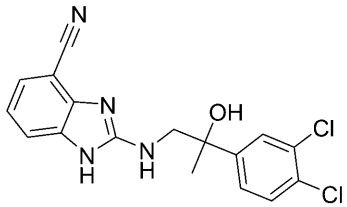
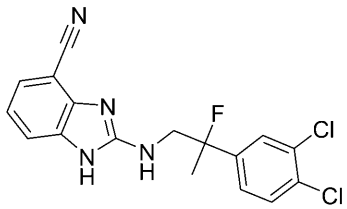
【表１－１９４】

I-787		(400 MHz, DMSO-d6) 11.17 (s, 1H), 7.82 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.42-7.34 (m, 3H), 7.33-7.28 (m, 1H), 7.25(d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.96-6.89 (m, 1H), 5.14-5.05 (m, 1H), 5.03-4.92 (m, 1H), 3.75-3.68 (m, 2H).	313	E	
I-788		(400 MHz, DMSO-d6) 12.29 (s, 1H), 7.86-7.57 (m, 3H), 7.57 - 7.39 (m, 2H), 7.38 - 7.16 (m, 2H), 7.03 (d, J = 51.0 Hz, 1H), 3.67 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.54 (d, J = 18.2 Hz, 1H), 1.37 (dd, J = 10.6, 7.3 Hz, 6H), 1.24 (s, 1H).	333.05	D	
I-789		(400 MHz, DMSO-d6)7.75-7.67 (m, 1H), 7.64 (dd, J = 5.5, 2.1 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 8.4, 1.4 Hz, 1H), 7.39 (dt, J = 8.4, 1.7 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 4.24 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 3.66 (t, J = 14.0 Hz, 1H), 3.54 (ddd, J = 13.4, 11.5, 7.1 Hz, 1H), 3.20 (ddd, J = 13.5, 10.7, 4.7 Hz, 1H), 2.94-2.80 (m, 1H), 2.45-2.35 (m, 1H), 2.01-1.86 (m, 5H), 1.65 (s, 1H), 1.41 (d, J = 1.9 Hz, 4H), 1.21 (t, J = 13.7 Hz, 1H), 0.83 (ddtd, J = 47.6, 24.7, 12.4, 4.3 Hz, 2H).	387.2	E	
I-790		(400 MHz, DMSO-d6)11.29 (s, 1H), 7.77 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.6, 2.1 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 6.96 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.91-5.72 (m, 1H), 3.89-3.72 (m, 2H).	349	E	

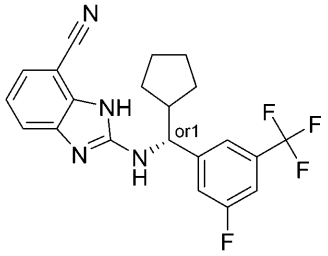
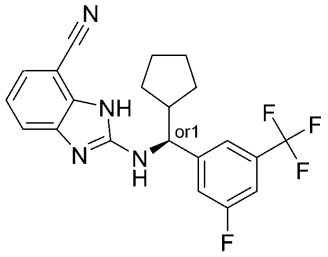
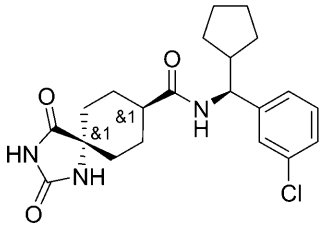
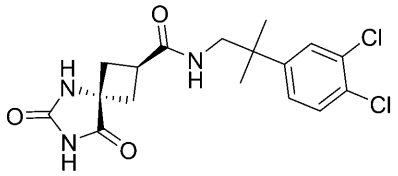
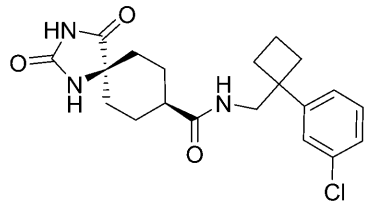
【表１－１９５】

I-791				E	
I-792			342.29	E	
I-793		(400 MHz, DMSO-d6) 10.98 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.68 (dd, J = 7.2, 2.1 Hz, 1H), 7.46 (ddd, J = 8.6, 4.8, 2.2 Hz, 1H), 7.42 - 7.32 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.60 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 2.36 - 2.24 (m, 1H), 2.08 (s, 1H), 1.91 - 1.78 (m, 0H), 1.70 - 1.25 (m, 3H), 1.16 (dq, J = 16.4, 8.1 Hz, 1H).	369.1	D	
I-794		(400 MHz, DMSO-d6) 8.42 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.48 - 7.42 (m, 1H), 7.36 (ddd, J = 8.0, 6.5, 1.7 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 4.86 (td, J = 10.2, 9.3, 2.5 Hz, 1H), 4.27 (t, J = 12.9 Hz, 1H), 3.73 (t, J = 12.5 Hz, 1H), 3.00 - 2.88 (m, 1H), 2.46 - 2.32 (m, 1H), 2.20 (h, J = 8.2 Hz, 1H), 2.11 - 1.99 (m, 2H), 1.96 (s, 3H), 1.91 - 1.73 (m, 2H), 1.66 - 1.40 (m, 6H), 1.31 (dt, J = 11.7, 4.5 Hz, 2H), 1.06 (dd, J = 12.5, 7.4 Hz, 2H), 0.97 - 0.85 (m, 1H).	395.1	D	

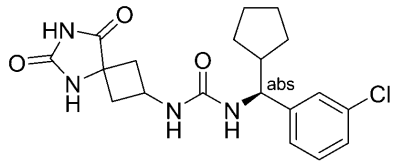
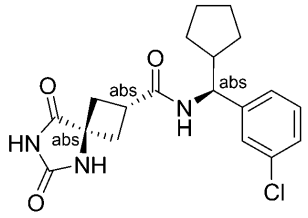
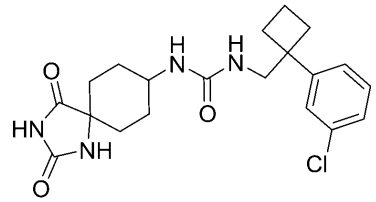
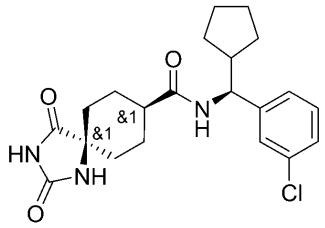
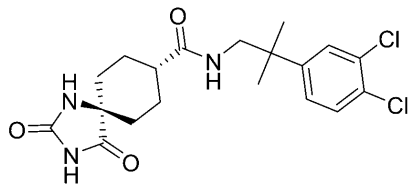
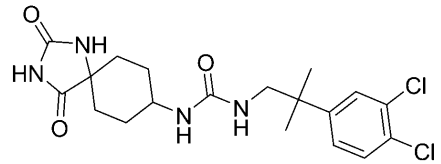
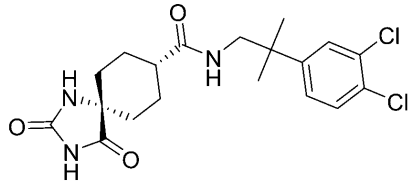
【表１－１９６】

I-795		(400 MHz, DMSO-d6) 7.97 (s, 1H), 7.53 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.29 - 7.18 (m, 2H), 6.93 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.01 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 2.42 - 2.29 (m, 1H), 2.08 (s, 1H), 1.89 - 1.34 (m, 6H), 1.21 (d, J = 9.4 Hz, 1H).	369.05	D	
I-796		(400 MHz, DMSO-d6) 11.27 (s, 1H), 8.01 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.44-7.35 (m, 2H), 7.34-7.21 (m, 3H), 6.93 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.63 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 2.28 (dd, J = 16.8, 8.3 Hz, 1H), 1.86-1.77 (m, 1H), 1.70-1.28 (m, 6H), 1.26-1.14 (m, 1H).	369.1	C	
I-797		(400 MHz, DMSO-d6)10.56 (s, 1H), 7.73 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 6.87 (s, 2H), 6.52 (s, 2H), 3.66-3.52 (m, 2H), 1.45 (s, 3H).	336.15	E	
I-798		(400 MHz, DMSO-d6)10.93 (s, 1H), 7.76 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 7.8, 1.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.93 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 5.92 (s, 1H), 3.62 (dd, J = 13.1, 5.9 Hz, 2H), 1.49 (s, 3H).	361.1	E	
I-799		(400 MHz, DMSO-d6)10.82 (s, 1H), 7.73 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.66 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 8.4, 2.2 Hz, 2H), 7.38 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.99-3.77 (m, 2H), 1.71 (d, J = 22.8 Hz, 3H).	363.15	D	

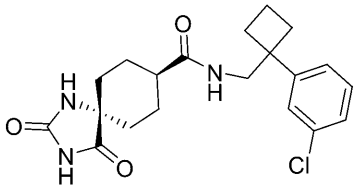
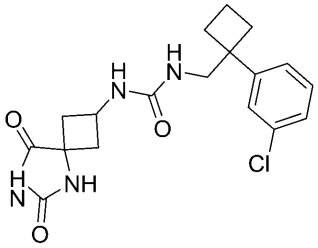
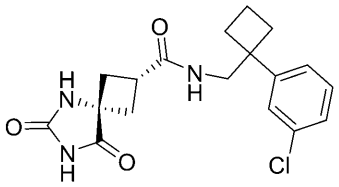
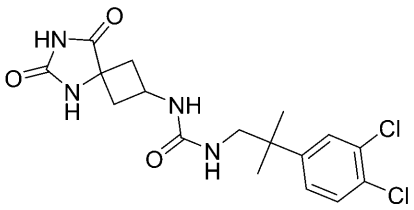
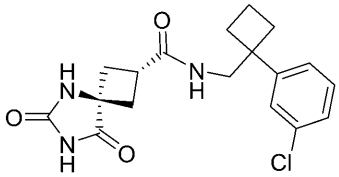
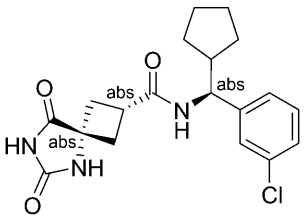
【表１－１９７】

I-800		(400 MHz, dmso) 11.28 (br. s, 1H), 8.05 (br. d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.65 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.74 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.40 - 2.29 (m, 1H), 1.90 - 1.76 (m, 1H), 1.70 - 1.40 (m, 5H), 1.38 - 1.27 (m, 1H), 1.26 - 1.16 (m, 1H).	403.1	C	D
I-801		(400 MHz, dmso) 11.30 (br. s, 1H), 8.06 (br. d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.65 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.8, 1.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 7.8, 0.9 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.74 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 2.39 - 2.28 (m, 1H), 1.90 - 1.79 (m, 1H), 1.69 - 1.40 (m, 5H), 1.37 - 1.27 (m, 1H), 1.27 - 1.16 (m, 1H).	403.1	D	
I-802				C	
I-803				E	
I-804				D	

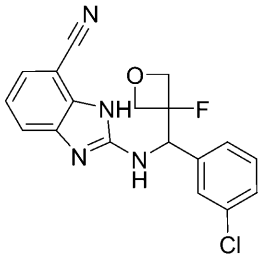
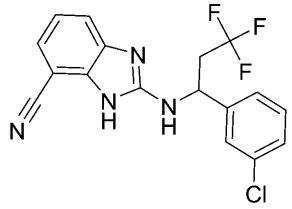
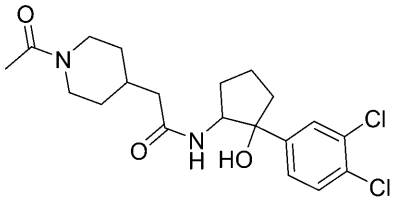
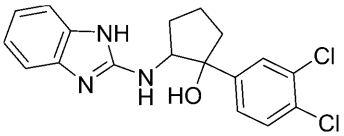
【表１－１９８】

I-805				E	
I-806				B	C
I-807				E	
I-808				D	
I-809				E	
I-810				E	
I-811				E	

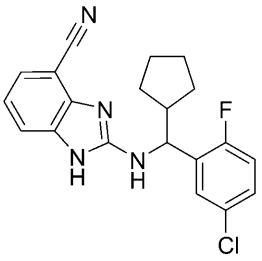
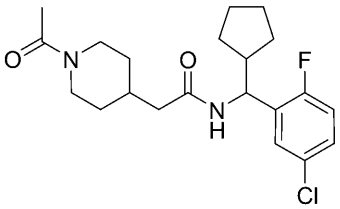
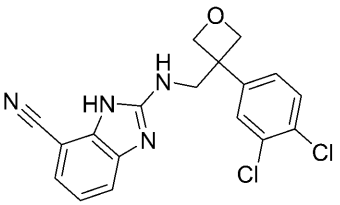
【表１－１９９】

I-812				E	
I-813				E	
I-814				E	
I-815				E	
I-816				E	
I-817				D	

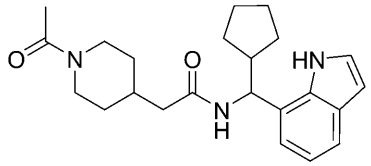
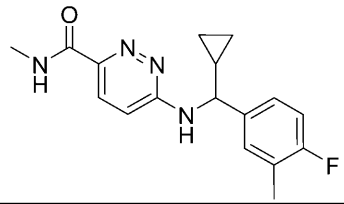
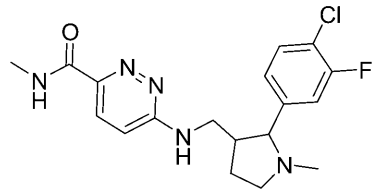
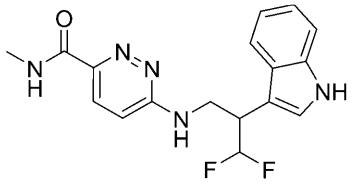
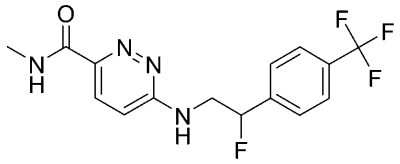
【表１－２００】

I-818		(400 MHz, DMSO-d6): 7.57-7.59 (m, 1H), 7.53-7.55 (m, 1H), 7.46-7.49 (m, 3H), 7.24-7.25 (m, 1H), 7.20-7.22 (m, 1H), 4.68-4.73 (m, 2H), 4.60-4.64 (m, 2H), 3.56-3.60 (m, 1H).	357	E	
I-819		(400 MHz, DMSO-d6) 8.02 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.54-7.45 (m, 1H), 7.44-7.32 (m, 3H), 7.28 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.00-6.92 (m, 1H), 5.40-5.25 (m, 1H), 3.14-2.72 (m, 2H).	365	E	
I-820		(400 MHz, DMSO-d6) 7.61 - 7.49 (m, 3H), 7.38 (td, J = 8.3, 2.0 Hz, 1H), 5.30 (s, 1H), 4.22 (d, J = 10.2 Hz, 2H), 3.61 (dd, J = 33.3, 13.7 Hz, 1H), 2.81 (q, J = 13.1, 12.5 Hz, 1H), 2.36 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 2.24 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 1.94 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 1.86 - 1.65 (m, 5H), 1.48 (t, J = 4.6 Hz, 2H), 1.33 (t, J = 12.1 Hz, 1H), 0.96 - 0.68 (m, 2H), 0.59 (dd, J = 14.4, 9.8 Hz, 1H).	413.1	E	
I-821		(400 MHz, DMSO-d6) 10.35 (s, 1H), 7.56 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.36 (dd, J = 8.5, 2.1 Hz, 1H), 7.13 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 - 6.78 (m, 3H), 6.58 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 4.22 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 2.26 (dt, J = 13.2, 4.7 Hz, 2H), 2.09 - 1.99 (m, 1H), 1.97- 1.81 (m, 2H), 1.75 -1.63 (m, 1H).	362.05	E	

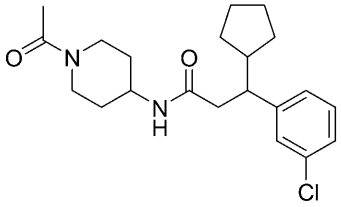
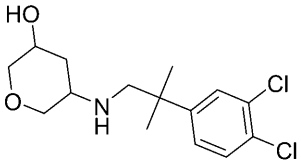
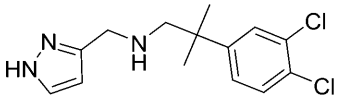
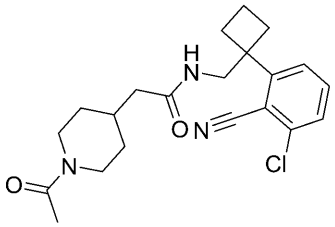
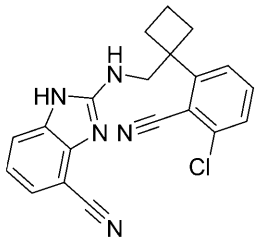
【表１－２０１】

I-822		(400 MHz, DMSO-d6) 11.22 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.36 (t, J = 10.5 Hz, 2H), 7.24 (t, J = 9.0 Hz, 2H), 6.93 (s, 1H), 5.00 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 2.34 (s, 1H), 1.81 (s, 1H), 1.64 (s, 2H), 1.50 (s, 4H), 1.23 (s, 1H).	369.05	B	
I-823		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (dd, J = 8.7, 2.8 Hz, 1H), 7.47 (dt, J = 6.0, 2.9 Hz, 1H), 7.33 (ddd, J = 8.8, 4.4, 2.7 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.86 (td, J = 9.3, 4.1 Hz, 1H), 4.27 (t, J = 11.4 Hz, 1H), 3.74 (t, J = 12.5 Hz, 1H), 3.01 - 2.90 (m, 1H), 2.48 - 2.42 (m, 1H), 2.16 (dt, J = 15.8, 7.7 Hz, 1H), 2.05 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.96 (s, 3H), 1.86 (td, J = 7.3, 3.6 Hz, 1H), 1.58 (s, 1H), 1.49 (s, 6H), 1.28 (dd, J = 14.1, 6.3 Hz, 2H), 1.15 - 0.99 (m, 2H), 0.97 - 0.87 (m, 1H).	395.15	D	
I-824		(400 MHz, DMSO-d6) 11.11 (s, 1H), 7.60 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.42 - 7.31 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.3, 2.2 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 4.86 - 4.76 (m, 4H), 3.93 (d, J = 6.2 Hz, 2H).	373	E	

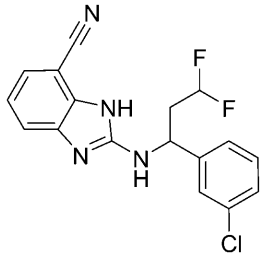
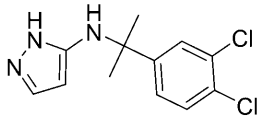
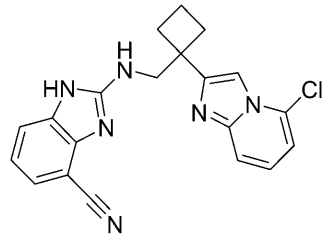
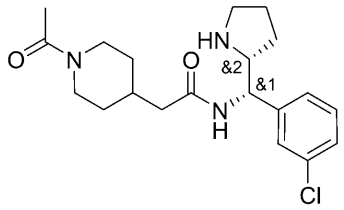
【表１－２０２】

I-825		(400 MHz, d6-DMSO) 10.99 (s, 1H), 8.41 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.31 (app t, J = 2.4 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.41 (dd, J = 3.0, 1.8 Hz, 1H), 5.14 - 5.04 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 1H), 2.99 - 2.86 (m, 1H), 2.55 - 2.30 (m, 2H), 2.13 - 1.99 (m, 2H), 1.95 (s, 1.5 H), 1.94 (s, 1.5 H), 1.92 - 1.81 (m, 1H), 1.80 - 1.69 (m, 1H), 1.68 - 1.22 (m, 8H), 1.20 - 0.82 (m, 3H). 欠落した1H は、溶媒の残留水の化学シフト(約 3.8-3.2)と重複した。アセチル(CH3)が 2 つのシングレットとして出現。	380.5	E	
I-826				E	
I-827				E	
I-828				E	
I-829				E	

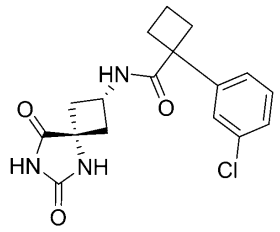
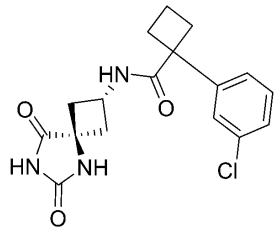
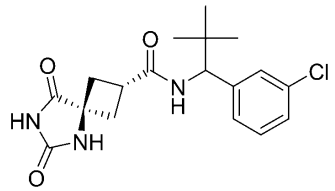
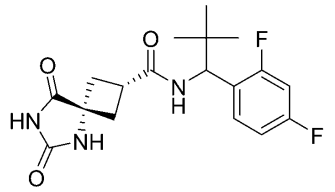
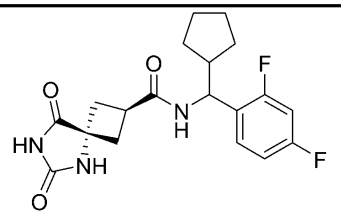
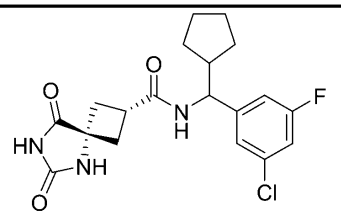
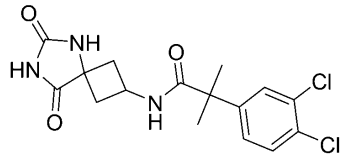
【表１－２０３】

I-830			377.1	E	
I-831			318.29	E	
I-832			298.89	E	
I-833		(400 MHz, DMSO-d6) 7.87 (t, J = 6.4 Hz, 1H), 7.61 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 8.1, 1.1 Hz, 1H), 7.13 (dd, J = 7.7, 1.2 Hz, 1H), 4.30- 4.20 (m, 1H), 3.82 - 3.47 (m, 3H), 2.91 (td, J = 13.7, 13.0, 2.7 Hz, 1H), 2.49 - 2.29 (m, 5H), 2.10 (dq, J = 11.0, 9.0 Hz, 1H), 1.96 (s, 3H), 1.89 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 1.84 - 1.62 (m, 2H), 1.47- 1.35 (m, 2H), 0.94 (qd, J = 12.2, 4.1 Hz, 1H), 0.81 (qd, J = 12.3, 4.3 Hz, 1H).	388.15	E	
I-834		(400 MHz, DMSO-d6) 11.03 (s, 1H), 7.58- 7.44 (m, 2H), 7.29 (dd, J = 7.7, 1.1 Hz, 1H), 7.21 (dq, J = 7.9, 1.7 Hz, 3H), 6.88 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.93 (d, J = 6.5 Hz, 2H), 2.47 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 2.46- 2.32 (m, 3H), 2.29 -2.13 (m, 1H), 1.84 (dt, J = 11.6, 9.2 Hz, 1H).	362.1	D	

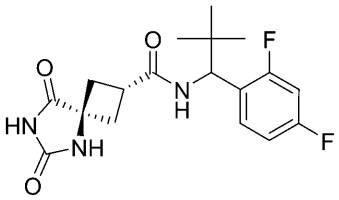
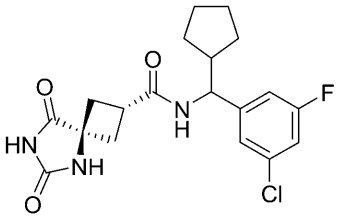
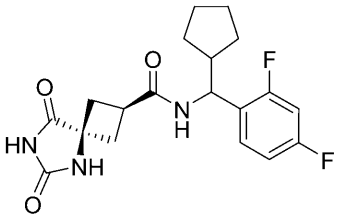
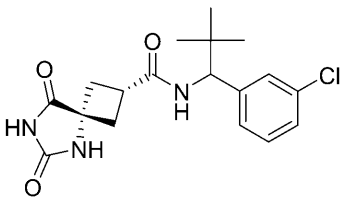
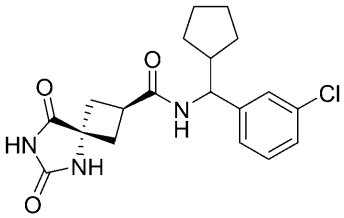
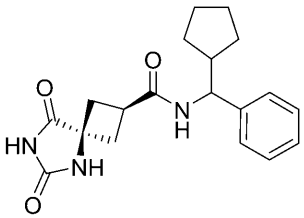
【表１－２０４】

I-835		(400 MHz, DMSO-d6) ppm 11.47 (s, 1H), 8.07 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.44-7.48 (m, 1H), 7.37-7.42 (m, 2H), 7.31-7.36 (m, 1H), 7.26-7.31 (m, 1H), 6.92-6.98 (m, 1H), 5.99-6.38 (m, 1H), 5.12-5.18 (m, 1H), 2.24-2.49 (m, 2H).	347	E	
I-836		(400 MHz, CDCN) 7.66 - 7.62 (m, 1H), 7.46 - 7.39 (m, 2H), 7.19 (br s, 1H), 5.16 (s, 1H), 4.80 (br s, 2H), 1.55 (s, 6H).	270.2	E	
I-837		(400 MHz, DMSO-d6)11.02 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.61 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.30 (ddd, J = 19.6, 14.0, 7.7 Hz, 3H), 7.14 (dd, J = 7.3, 1.0 Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.91 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.90 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.45-2.36 (m, 2H), 2.28 (dd, J = 16.2, 10.1 Hz, 2H), 2.06 (dd, J = 9.9, 7.6 Hz, 1H), 2.02-1.90 (m, 1H).	377.05	E	
I-838		(400 MHz, dmso) 8.30 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.35 - 7.21 (m, 3H), 4.58 (td, J = 8.7, 2.5 Hz, 1H), 4.27 (t, J = 11.4 Hz, 1H), 3.73 (t, J = 11.4 Hz, 1H), 3.21 (埋没した dd, J = 15.3, 7.4 Hz, 2H), 3.01 - 2.91 (m, 1H), 2.77 - 2.64 (m, 2H), 2.48 - 2.43 (埋没した m, 1H), 2.12 - 2.01 (m, 2H), 1.96 (s, 3H), 1.93 - 1.81 (m, 1H), 1.81 - 1.71 (m, 1H), 1.67 - 1.44 (m, 4H), 1.43 - 1.33 (m, 1H), 1.14 - 1.00 (m, 1H), 0.99 - 0.87 (m, 1H).	378.1	E	

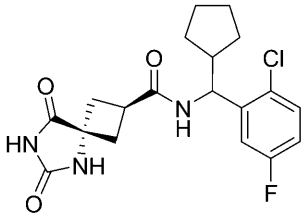
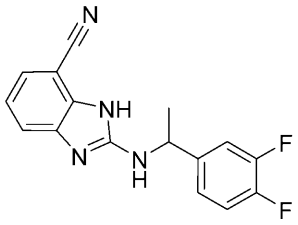
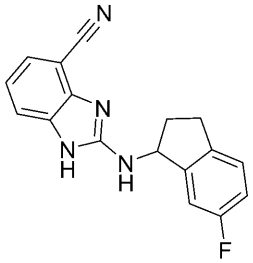
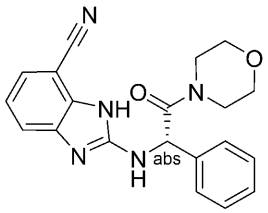
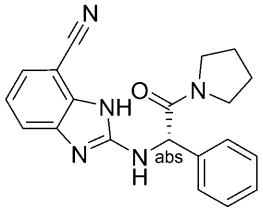
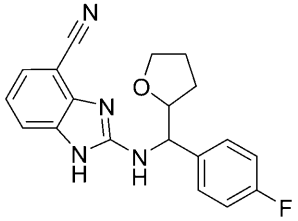
【表１－２０５】

I-839				E	
I-840				E	
I-841				E	
I-842				D	
I-843				D	
I-844				E	
I-845				E	

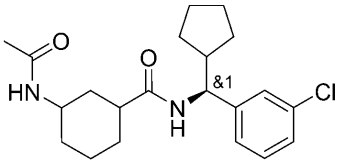
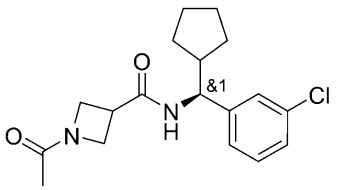
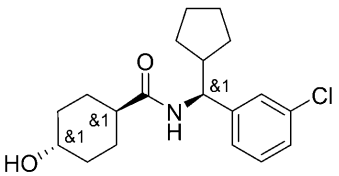
【表１－２０６】

I-846				D	
I-847				C	
I-848				D	
I-849				E	
I-850				D	
I-851				E	

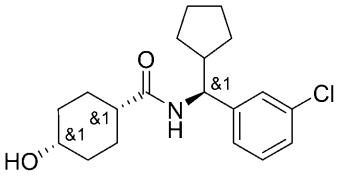
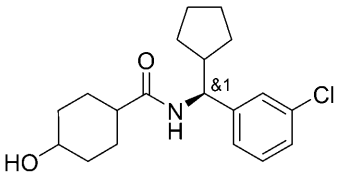
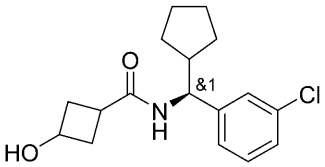
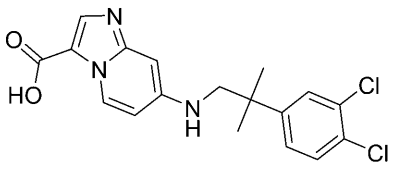
【表１－２０７】

I-852				D	
I-853				E	
I-854				E	
I-855				E	
I-856				E	
I-857				D	

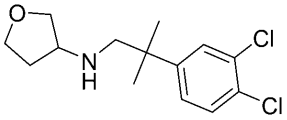
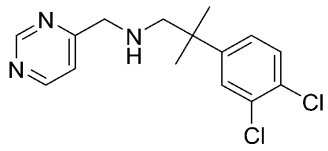
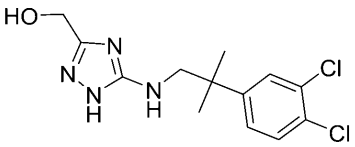
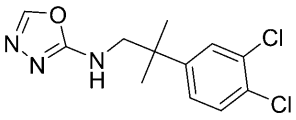
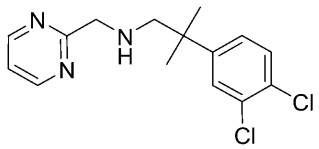
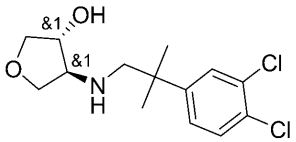
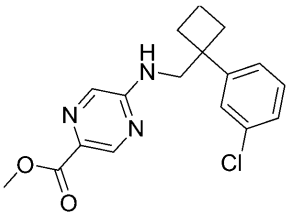
【表１－２０８】

I-858		(400 MHz, DMSO-d6) 8.31 - 8.02 (m, 1H), 7.79 - 7.55 (m, 1H), 7.36 (ddt, J = 8.7, 6.8, 1.8 Hz, 1H), 7.32 (dt, J = 6.4, 1.6 Hz, 1H), 7.29 - 7.23 (m, 2H), 4.55 (td, J = 9.0, 4.4 Hz, 1H), 3.97 - 3.44 (m, 1H), 2.45 - 2.41 (m, 1H), 2.30 - 2.08 (m, 2H), 1.82 (d, J = 9.4 Hz, 4H), 1.76 (d, J = 11.8 Hz, 2H), 1.65 - 1.60 (m, 1H), 1.60 - 1.36 (m, 7H), 1.34 - 1.21 (m, 3H), 1.16 - 0.97 (m, 2H).	377.2	E	
I-859		(400 MHz, DMSO-d6) 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.39 - 7.31 (m, 2H), 7.31 - 7.23 (m, 2H), 4.60 (td, J = 9.1, 4.9 Hz, 1H), 4.19 (dt, J = 30.5, 8.5 Hz, 1H), 4.10 - 3.84 (m, 2H), 3.74 (ddd, J = 36.1, 9.2, 5.8 Hz, 1H), 3.32 - 3.28 (m, 1H), 2.17 (h, J = 8.5 Hz, 1H), 1.72 (d, J = 6.4 Hz, 4H), 1.64 - 1.37 (m, 4H), 1.27 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 1.10 (t, J = 10.3 Hz, 1H).	335.15	E	
I-860		(400 MHz, DMSO-d6)8.12 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.36-7.29 (m, 1H), 7.26 (dt, J = 7.0, 1.8 Hz, 2H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.26 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.74 (s, 1H), 2.16 (tt, J = 9.7, 5.7 Hz, 2H), 1.85-1.67 (m, 3H), 1.66-1.33 (m, 9H), 1.36-1.21 (m, 3H), 1.16-1.02 (m, 1H).	336.05	E	

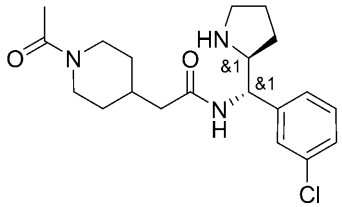
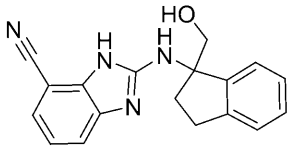
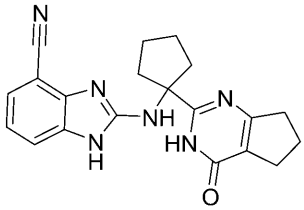
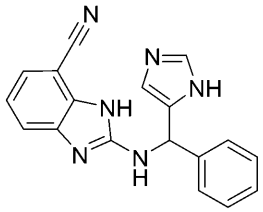
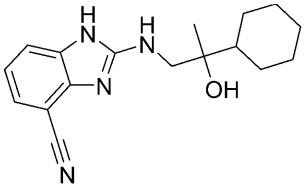
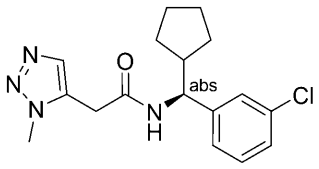
【表１－２０９】

I-861		(400 MHz, DMSO-d6)8.19 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.39-7.30 (m, 2H), 7.25 (ddt, J = 7.3, 5.6, 1.5 Hz, 2H), 4.55 (t, J = 9.2 Hz, 2H), 3.31 (ddd, J = 10.7, 6.4, 4.1 Hz, 1H), 2.22-2.01 (m, 2H), 1.90-1.77 (m, 2H), 1.71 (dtd, J = 12.6, 9.2, 7.7, 5.3 Hz, 2H), 1.62-1.51 (m, 3H), 1.51-1.32 (m, 3H), 1.27 (ddd, J = 12.5, 10.1, 4.0 Hz, 3H), 1.19-1.03 (m, 3H).	336.1	E	
I-862		(400 MHz, DMSO-d6)8.16 (dd, J = 28.7, 8.7 Hz, 1H), 7.40-7.29 (m, 2H), 7.26 (dt, J = 7.1, 1.8 Hz, 2H), 4.60-4.49 (m, 1H), 4.26 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.74 (s, 1H), 2.23-2.02 (m, 2H), 1.91-1.66 (m, 3H), 1.65-1.46 (m, 4H), 1.46-1.34 (m, 4H), 1.34-1.19 (m, 3H), 1.20-1.02 (m, 2H).	336.1	E	
I-863		(400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 7.37 - 7.30 (m, 2H), 7.26 (td, J = 8.8, 8.3, 1.7 Hz, 2H), 5.03 (dd, J = 19.1, 6.7 Hz, 1H), 4.55 (d, J = 18.6 Hz, 1H), 4.05 (dq, J = 117.6, 7.1 Hz, 1H), 2.46 - 1.98 (m, 4H), 1.97 - 1.81 (m, 2H), 1.74 - 1.64 (m, 1H), 1.61 - 1.37 (m, 4H), 1.31 - 1.19 (m, 2H), 1.14 - 1.00 (m, 1H) .	308.15	D	
I-864		(400 MHz, DMSO-d6) 12.39 (s, 1H), 8.80 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.67 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 6.73 (dd, J = 7.6, 2.4 Hz, 1H), 6.55 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 6.37 (s, 1H), 3.35 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H).	378.15	D	

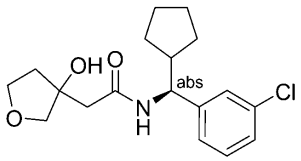
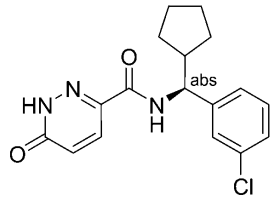
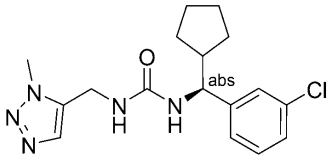
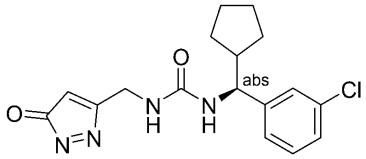
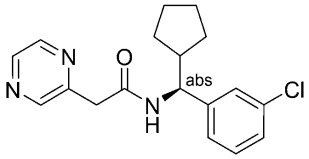
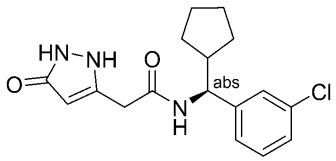
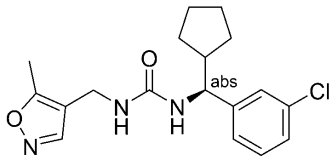
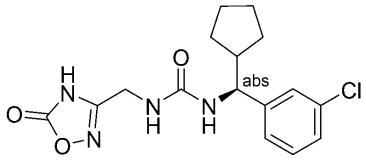
【表１－２１０】

I-865			288.33	E	
I-866			310.29	E	
I-867			315.24	D	
I-868			286.28	E	
I-869			310.29	E	
I-870			304.28	E	
I-871			332.29	E	

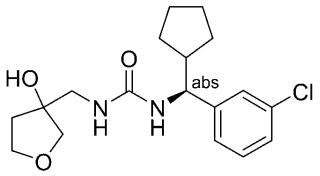
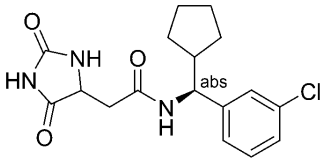
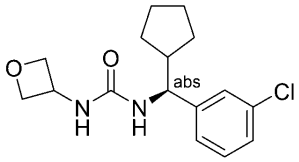
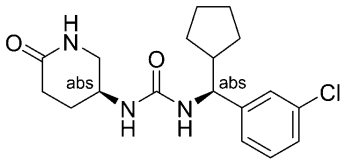
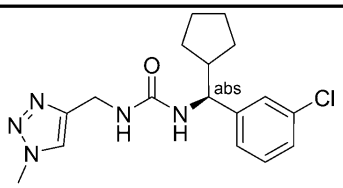
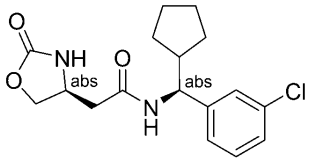
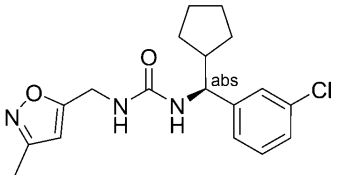
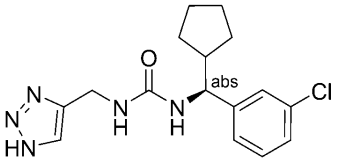
【表１－２１１】

I-872		(400 MHz, dmso) 8.17 (dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 7.40 - 7.36 (m, 1H), 7.36 - 7.20 (m, 3H), 4.72 - 4.65 (m, 1H), 4.32 - 4.22 (m, 1H), 3.79 - 3.68 (m, 1H), 3.25 (埋没した dd, J = 13.4, 6.9 Hz, 2H), 3.03 - 2.90 (m, 1H), 2.85 - 2.66 (m, 2H), 2.48 - 2.42 (埋没した m, 1H), 2.19 - 2.05 (m, 2H), 1.96 (s, 3H), 1.93 - 1.79 (m, 1H), 1.69 - 1.44 (m, 5H), 1.33 - 1.24 (m, 1H), 1.10 - 1.01 (m, 1H), 1.01 - 0.88 (m, 1H).	378.1	E	
I-873				E	
I-874				E	
I-875				E	
I-876				E	
I-877				D	

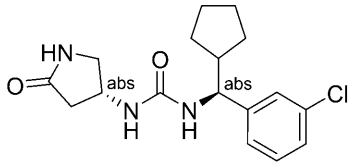
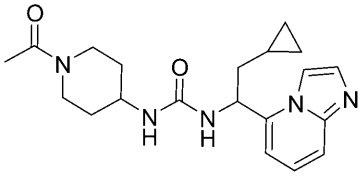
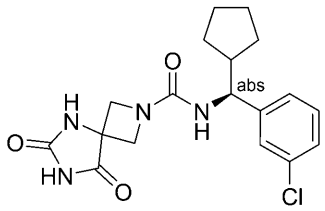
【表１－２１２】

I-878				E	
I-879				E	
I-880				D	
I-881				D	
I-882				E	
I-883				D	
I-884				E	
I-885				D	

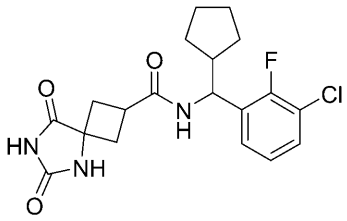
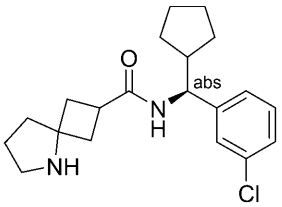
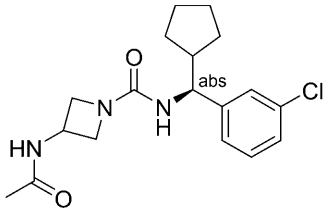
【表１－２１３】

I-886				E	
I-887				E	
I-888				D	
I-889				E	
I-890				D	
I-891				D	
I-892				E	
I-893				D	

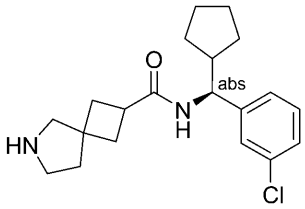
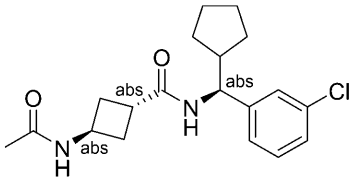
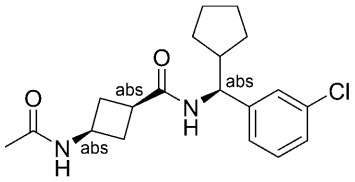
【表１－２１４】

I-894				E	
I-895		(400 MHz, CD3CN) 7.92 (br s, J = 6.9 Hz, 1H), 7.60 (br s, 1H), 7.46 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 9.0, 7.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 5.37 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 5.23 (ddd, J = 8.3, 8.3, 5.5 Hz, 1H), 5.04 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 4.30 - 4.20 (m, 1H), 3.78 - 3.61 (m, 2H), 3.17 - 3.05 (m, 1H), 2.78 - 2.67 (m, 1H), 2.00 (s, 1.5 H), 1.98 (s, 1.5 H), 1.86 - 1.73 (m, 3H), 1.36 - 1.17 (m, 3H), 0.83 - 0.71 (m, 1H), 0.50 - 0.36 (m, 2H), 0.17 - 0.05 (m, 2H).	370.4	E	
I-896		(400 MHz, DMSO-d6)10.64 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.40 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.35-7.29 (m, 1H), 7.26 (dt, J = 6.9, 1.7 Hz, 2H), 6.98 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.41-4.25 (m, 1H), 4.06 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.01 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.88 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.82 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 2.19 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 1.85-1.70 (m, 1H), 1.60-1.52 (m, 2H), 1.5-1.38 (m, 2H), 1.37-1.27 (m, 1H), 1.22 (dt, J = 12.2, 7.3 Hz, 1H), 1.07 (dd, J = 12.4, 8.5 Hz, 1H).	377.1	E	

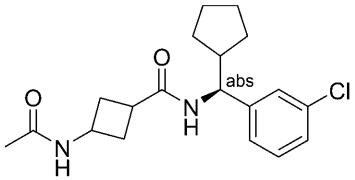
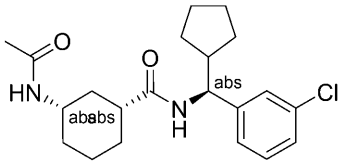
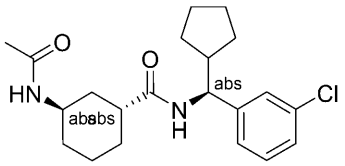
【表１－２１５】

I-897		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.65 - 8.46 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.45 (td, J = 7.6, 7.2, 1.6 Hz, 1H), 7.35 (ddd, J = 8.0, 6.5, 1.7 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 4.88 (td, J = 9.0, 4.8 Hz, 1H), 3.20 - 3.01 (m, 1H), 2.47 - 2.09 (m, 5H), 1.73 (dd, J = 12.3, 7.6 Hz, 1H), 1.64 - 1.40 (m, 4H), 1.35 - 1.22 (m, 2H), 1.07 (q, J = 11.0, 9.5 Hz, 1H).	394.25	D	
I-898		(400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.48 - 7.07 (m, 4H), 4.56 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.30- 2.86 (m, 1H), 2.79- 2.60 (m, 2H), 2.22 - 2.06 (m, 1H), 2.11- 2.02 (m, 2H), 1.96 (qd, J = 8.9, 3.0 Hz, 2H), 1.67 (dtd, J = 13.1, 7.1, 6.6, 2.4 Hz, 4H), 1.60 - 1.37 (m, 5H), 1.26 (dq, J = 12.7,	347.3	D	
I-899		(400 MHz, DMSO-d6) 8.42 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.35 - 7.28 (m, 1H), 7.25 (dt, J = 8.7, 1.7 Hz, 2H), 6.76 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.42 - 4.28 (m, 2H), 3.99 (dt, J = 20.4, 8.0 Hz, 2H), 3.58 (ddd, J = 16.5, 8.4, 5.5 Hz, 2H), 2.27 - 2.12 (m, 1H), 1.80 (s, 4H), 1.84 - 1.72 (m, 1H), 1.66 - 1.55 (m, 1H), 1.59 - 1.47 (m, 1H), 1.50 - 1.37 (m, 1H), 1.44 (s, 1H), 1.26 (dtd, J = 40.5, 7.8, 4.2 Hz, 1H), 1.06 (dq, J = 12.6, 8.1 Hz, 1H).	350.1	E	

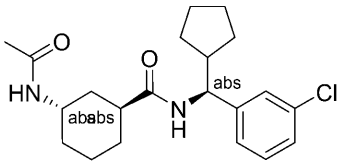
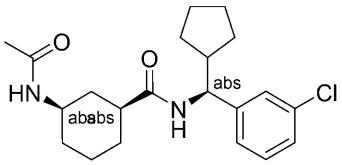
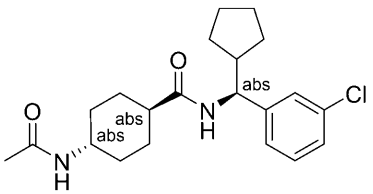
【表１－２１６】

I-900		(400 MHz, DMSO-d6) 8.13 (dd, J = 8.7, 3.9 Hz, 1H), 7.39 - 7.29 (m, 2H), 7.25 (tt, J = 7.3, 1.5 Hz, 2H), 4.56 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.03 - 2.86 (m, 1H), 2.78 - 2.65 (m, 4H), 2.60 (s, 1H), 2.16 (h, J = 8.4 Hz, 1H), 2.11 - 1.96 (m, 3H), 1.99 - 1.84 (m, 1H), 1.71 (dt, J = 11.2, 5.8 Hz, 2H), 1.61 - 1.50 (m, 3H), 1.28 (dd, J = 9.7, 5.1 Hz, 2H), 1.28 - 1.21 (m, 2H), 1.08 (dd, J = 12.9, 7.8 Hz, 1H).	347.15	D	
I-901		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.39-7.30 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 7.1, 5.3, 1.5 Hz, 2H), 4.59 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.25 (h, J = 7.8 Hz, 1H), 2.89 (ddt, J = 12.2, 8.4, 3.7 Hz, 1H), 2.29 (tt, J = 7.8, 3.9 Hz, 1H), 2.24-2.03 (m, 3H), 2.04-1.95 (m, 1H), 1.76 (s, 3H), 1.74-1.65 (m, 1H), 1.63-1.51 (m, 2H), 1.52-1.37 (m, 2H), 1.27 (tdd, J = 10.8, 7.0, 2.6 Hz, 2H), 1.09 (dq, J = 12.2, 8.1 Hz, 1H).	349.1	D	
I-902		(400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.39-7.29 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 7.5, 6.3, 1.5 Hz, 2H), 4.57 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.09 (tq, J = 9.3, 7.7 Hz, 1H), 2.74-2.60 (m, 1H), 2.30 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 2.18 (dd, J = 17.0, 8.2 Hz, 2H), 1.95 (dq, J = 24.1, 9.9 Hz, 2H), 1.74 (s, 3H), 1.69 (td, J = 7.5, 4.2 Hz, 1H), 1.56 (dddd, J = 19.9, 15.9, 8.2, 3.1 Hz, 2H), 1.50-1.38 (m, 2H), 1.26 (dq, J = 12.7, 8.6, 8.0 Hz, 2H), 1.08 (dq, J = 12.4, 8.1 Hz, 1H).	349.1	D	

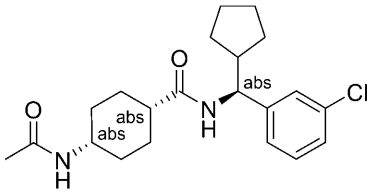
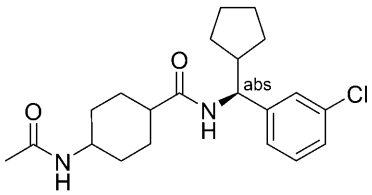
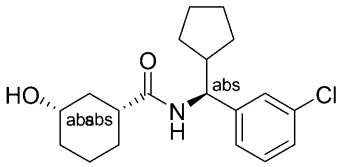
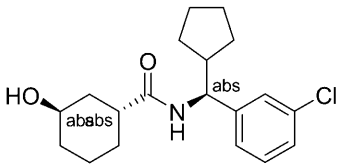
【表１－２１７】

I-903		(400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (dd, J = 8.8, 5.0 Hz, 1H), 8.09 (dd, J = 10.6, 7.8 Hz, 1H), 7.38-7.30 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 7.3, 5.5, 1.5 Hz, 2H), 4.58 (q, J = 9.4 Hz, 1H), 4.30-4.02 (m, 1H), 2.96-2.61 (m, 1H), 2.30 (qd, J = 7.7, 6.4, 3.8 Hz, 1H), 2.25-2.07 (m, 2H), 1.95 (dq, J = 24.2, 9.9 Hz, 2H), 1.75 (d, J = 8.7 Hz, 4H), 1.55 (dddd, J = 19.6, 13.2, 8.1, 2.6 Hz, 2H), 1.49-1.37 (m, 2H), 1.27 (qd, J = 7.8, 3.9 Hz, 2H), 1.09 (qd, J = 8.3, 4.0 Hz, 1H).	349.15	D	
I-904		(400 MHz, DMSO-d6)8.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.36 - 7.29 (m, 1H), 7.26 (dd, J = 6.9, 2.1 Hz, 2H), 4.54 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.92 (s, 1H), 2.44 (p, J = 4.9 Hz, 1H), 2.21 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.78-1.37 (m, 13H), 1.26 (dd, J = 12.8, 7.5 Hz, 2H), 1.07 (dd, J = 12.7, 8.1 Hz, 1H).	377.4	E	
I-905		(400 MHz, DMSO-d6)8.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.35-7.29 (m, 1H), 7.26 (dd, J = 6.9, 2.0 Hz, 2H), 4.53 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.92 (s, 1H), 2.44 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 2.17 (dt, J = 16.7, 8.3 Hz, 1H), 1.83 (s, 3H), 1.80-1.68 (m, 1H), 1.67-1.32 (m, 12H), 1.31-1.18 (m, 2H), 1.13-1.00 (m, 1H).	377.3	D	

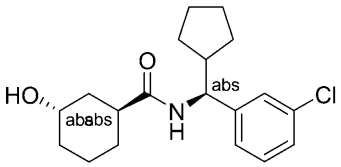
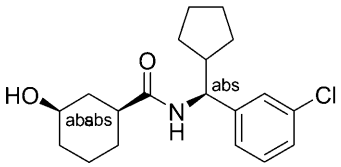
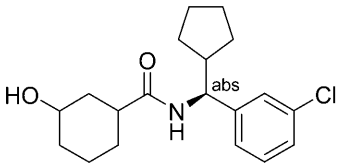
【表１－２１８】

I-906		(400 MHz, DMSO-d6)8.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39-7.30 (m, 2H), 7.27-7.24 (m, 2H), 5.04 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.91-3.89 (m, 1H), 2.42-2.39 (m, 1H), 2.36-2.25 (m, 1H), 2.24-2.09 (m, 2H), 1.97-1.80 (m, 2H), 1.76-1.64 (m, 1H), 1.57-1.55 (m, 2H), 1.49-1.35 (m, 2H), 1.33-1.19 (m, 2H), 1.09 (dt, J = 12.7, 8.0 Hz, 1H).	377.15	E	
I-907		(400 MHz, DMSO-d6)8.17 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39-7.29 (m, 2H), 7.27-7.24 (m, 2H), 4.98 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.21-4.18 (m, 1H), 2.86-2.83 (m, 1H), 2.28-2.26 (m, 1H), 2.17-2.14 (m, 2H), 2.01 (td, J = 10.5, 6.7 Hz, 1H), 1.92 (td, J = 10.4, 6.7 Hz, 1H), 1.69 (dd, J = 12.2, 7.5 Hz, 1H), 1.55-1.53 (m, 2H), 1.49-1.36 (m, 2H), 1.27 (dt, J = 12.5, 3.9 Hz, 2H), 1.09-1.07 (m, 1H).	377.2	E	
I-908		(400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 8.9, 6.4 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 6.8, 1.9 Hz, 2H), 4.57 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.74 (s, 1H), 2.25-2.10 (m, 2H), 1.79 (s, 5H), 1.61-1.53 (m, 6H), 1.53-1.39 (m, 5H), 1.28 (dd, J = 12.5, 7.5 Hz, 2H), 1.09 (dd, J = 12.9, 8.0 Hz, 1H).	377.3	D	

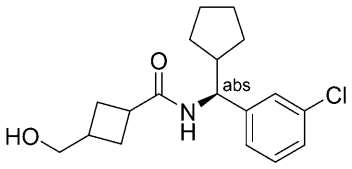
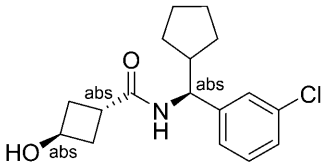
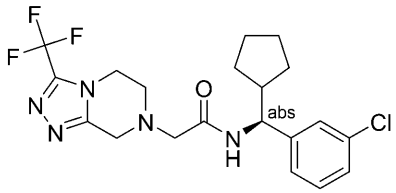
【表１－２１９】

I-909		(400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.39-7.29 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 7.5, 6.1, 1.5 Hz, 2H), 4.55 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.49-3.37 (m, 1H), 2.23-2.05 (m, 2H), 1.87-1.67 (m, 7H), 1.58 (d, J = 14.1 Hz, 3H), 1.51-1.37 (m, 3H), 1.28 (d, J = 8.7 Hz, 3H), 1.21-1.04 (m, 3H).	377.3	E	
I-910		(400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (dd, J = 8.9, 4.7 Hz, 1H), 7.75-7.66 (m, 1H), 7.41-7.29 (m, 2H), 7.29-7.21 (m, 2H), 4.61-4.51 (m, 1H), 3.44 (s, 1H), 2.25-2.05 (m, 2H), 1.78 (d, J = 10.9 Hz, 6H), 1.57 (s, 4H), 1.44 (s, 4H), 1.36-1.23 (m, 2H), 1.20-1.04 (m, 3H).	377.2	D	
I-911		(400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.33 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 6.7 Hz, 2H), 4.55 (q, J = 8.3, 7.1 Hz, 2H), 3.32 (s, 1H), 2.16 (dd, J = 16.3, 8.7 Hz, 2H), 1.72 (s, 4H), 1.57 (s, 3H), 1.44 (s, 2H), 1.25 (s, 4H), 1.10 (ddd, J = 41.9, 26.2, 12.1 Hz, 3H).	336.1	D	
I-912		(400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.29 (m, 2H), 7.26 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 4.62 - 4.51 (m, 2H), 3.37 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 2.17 (dt, J = 16.9, 9.7 Hz, 2H), 1.93 - 1.85 (m, 1H), 1.79 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 1.69 (s, 2H), 1.57 (s, 2H), 1.50 - 1.44 (m, 3H), 1.27 (s, 2H), 1.19 (d, J = 11.4 Hz, 2H), 1.17 - 0.98 (m, 3H).	336.1	E	

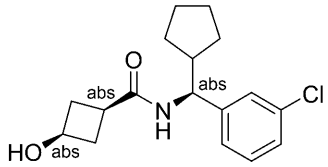
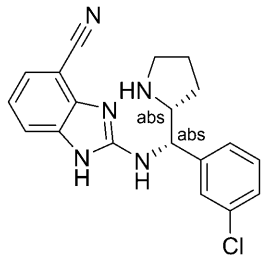
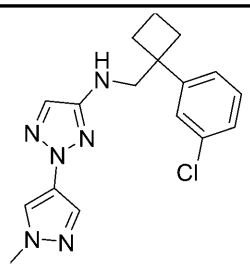
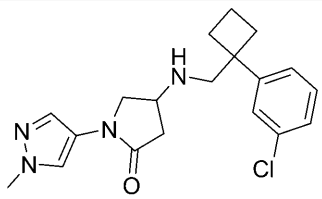
【表１－２２０】

I-913		(400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.36 - 7.29 (m, 1H), 7.26 (ddt, J = 7.6, 4.0, 1.9 Hz, 2H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.34 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 3.90 (s, 1H), 2.58 (s, 1H), 2.16 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 1.69 (dd, J = 23.6, 10.2 Hz, 6H), 1.58 - 1.40 (m, 5H), 1.38 - 1.22 (m, 4H), 1.08 (s, 1H).	336.1	D	
I-914		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 8.9, 6.5 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 6.9, 1.9 Hz, 2H), 4.54 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.38 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 3.91 (s, 1H), 2.60 (s, 1H), 2.16 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 1.62 - 1.44 (m, 1H), 1.43 - 1.31 (m, 9H), 1.25 (t, J = 11.4 Hz, 2H), 1.11 (t, J = 8.0 Hz, 3H), 1.06 (d, J = 7.7 Hz, 1H).	336.1	E	
I-915		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 7.36 - 7.30 (m, 1H), 7.30 - 7.21 (m, 2H), 4.56 (ddd, J = 13.4, 9.5, 4.6 Hz, 1H), 4.37 (dd, J = 19.3, 3.0 Hz, 1H), 3.91 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 2.69 - 2.66 (m, 1H), 2.60 (s, 1H), 2.16 (q, J = 8.6, 8.1 Hz, 3H), 1.90 - 1.64 (m, 3H), 1.63 - 1.41 (m, 1H), 1.35 (d, J = 11.8 Hz, 4H), 1.29 - 1.16 (m, 3H), 1.11 (d, J = 13.3 Hz, 2H).	336.1	E	

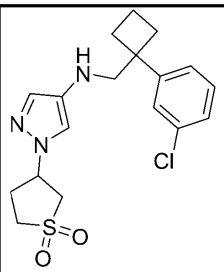
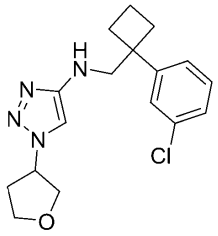
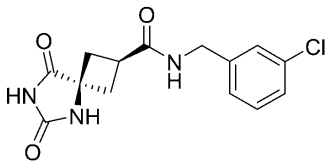
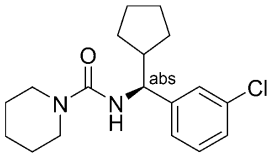
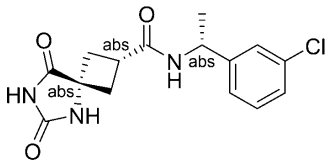
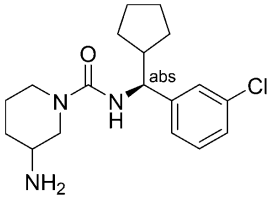
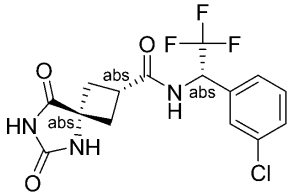
【表１－２２１】

I-916		(400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 4.7, 2.9 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 (ddt, J = 8.7, 7.0, 1.5 Hz, 2H), 4.62- 4.46 (m, 1H), 4.39 (t, J = 5.3 Hz, 1H), 3.40 (dd, J = 6.6, 5.2 Hz, 1H), 3.28 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 3.04 - 2.80 (m, 1H), 2.34 -1.93 (m, 4H), 1.91- 1.66 (m, 3H), 1.56 (dtd, J = 13.8, 7.2, 6.3, 3.8 Hz, 2H), 1.46 (tdd, J = 14.8, 6.2, 3.0 Hz, 2H), 1.26 (pd, J = 8.4, 7.7, 4.1 Hz, 2H), 1.08 (ddt, J = 12.2, 8.4, 4.4 Hz, 1H).	322.25	D	
I-917		(400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.38-7.30 (m, 2H), 7.28 - 7.22 (m, 2H), 4.54 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.57 - 3.45 (m, 1H), 2.29 - 2.21 (m, 1H), 2.15 (m, J = 8.4 Hz, 1H), 1.75 (s, 6H), 1.69 - 1.62 (m, 3H), 1.56 (m, J = 7.4, 3.7 Hz,2H), 1.44 (m, J = 12.0, 7.6 Hz, 2H), 1.33-1.22 (m, 4H), 1.22 - 0.96 (m, 3H).	308.05	D	
I-918		(400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.36 -7.26 (m, 3H), 4.59 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 4.19 (hept, J = 6.8, 6.1 Hz, 2H), 3.95 (s, 2H), 3.28 (d, J = 4.3 Hz, 2H), 3.05 -2.88 (m, 2H), 2.36 - 2.23 (m, 1H), 1.76 (dtd, J = 12.2, 7.5, 4.3 Hz, 1H), 1.66 - 1.38 (m, 4H), 1.27 (ddt, J = 15.3, 7.7, 3.9 Hz, 2H), 1.12 - 1.01 (m, 1H).	442.3	E	

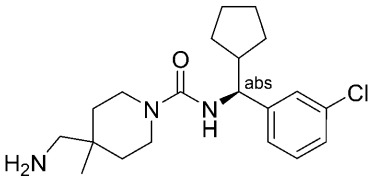
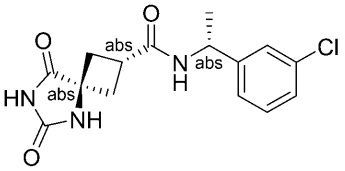
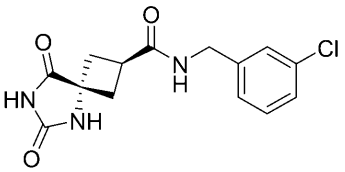
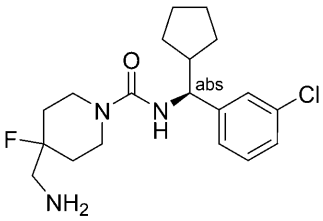
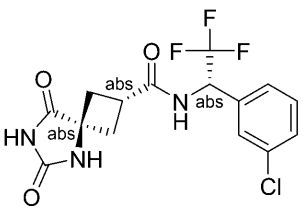
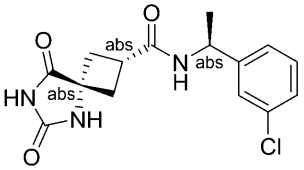
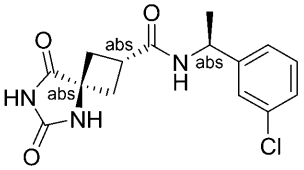
【表１－２２２】

I-919		(400 MHz, DMSO-d6) 8.26 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 7.3, 5.6, 1.5 Hz, 2H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.55 (dt, J = 7.8, 3.8 Hz, 1H), 2.30 - 2.20 (m, 1H), 2.15 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 1.82 (d, J = 12.3 Hz, 1H), 1.78 (s, 3H), 1.75 - 1.66 (m, 3H), 1.62 - 1.50 (m, 3H), 1.45 (dt, J = 12.1, 7.6 Hz, 2H), 1.25 (dt, J = 12.3, 4.8 Hz, 4H), 1.20 - 0.97 (m, 3H).	308.05	D	
I-920		(400 MHz, dmso) δ 7.96 (br. s, 1H), 7.53 (app. t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.42 (br. d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.36 - 7.31 (m, 2H), 7.27 (ddd, J = 7.9, 1.8, 1.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 7.8, 0.9 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.65 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.40 (埋没した dd, J = 14.2, 7.5 Hz, 1H), 2.75 (t, J = 6.5 Hz, 2H), 1.88 - 1.78 (m, 1H), 1.68 - 1.48 (m, 4H), 1.31 - 1.26 (埋没した m, 1H). 1.24 及び 0.82-0.88ppm にグリースのピークが存在。	352.1	E	
I-921			343.39	E	
I-922			359.35	E	

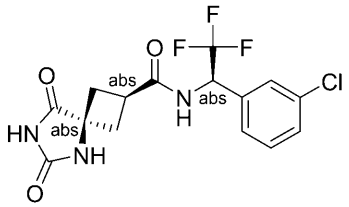
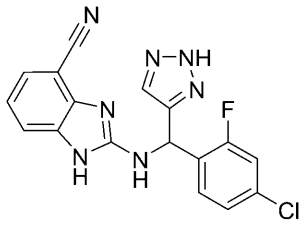
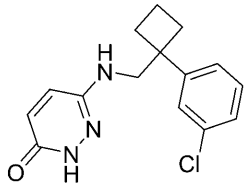
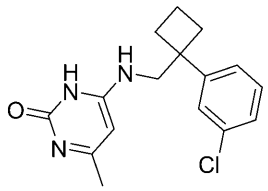
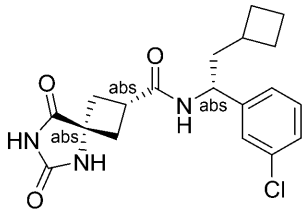
【表１－２２３】

I-923			380.41	E	
I-924			359.35	E	
I-925				E	
I-926				E	
I-927				E	
I-928				E	
I-929				E	

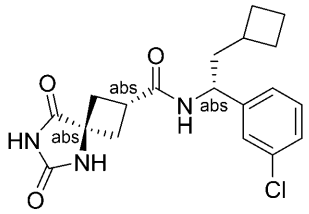
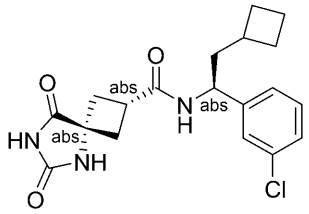
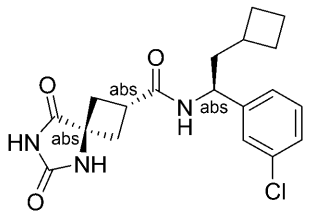
【表１－２２４】

I-930				D	
I-931				E	
I-932				E	
I-933				D	
I-934				E	
I-935				E	
I-936				E	

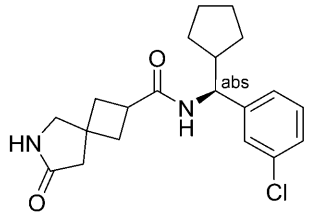
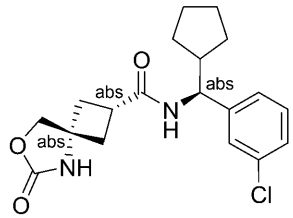
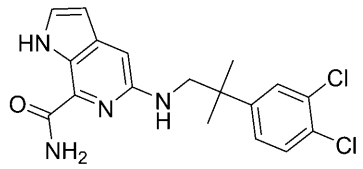
【表１－２２５】

I-937				E	
I-938				E	
I-939				D	
I-940				E	
I-941		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.30- 7.25 (m, 1H), 7.22 (dt, J = 7.7, 1.4 Hz, 1H), 4.69 (td, J = 8.6, 6.1 Hz, 1H), 3.14- 3.00 (m, 1H), 2.48 - 2.28 (m, 4H), 2.19 (h, J = 7.7 Hz, 1H), 1.95 (ddp, J = 11.3, 7.7, 3.9 Hz, 1H), 1.86 (ddt, J = 14.4, 7.4, 4.1 Hz, 1H), 1.82 - 1.52 (m, 6H).	376.25	E	

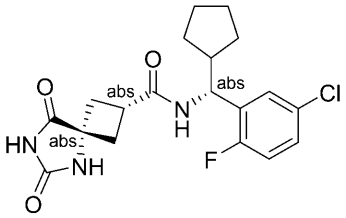
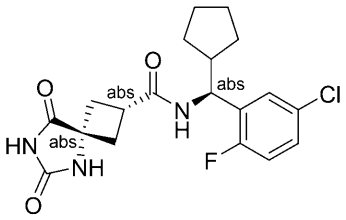
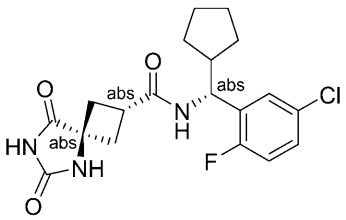
【表１－２２６】

I-942		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.30 - 7.25 (m, 1H), 7.25 - 7.18 (m, 1H), 4.69 (td, J = 8.6, 6.1 Hz, 1H), 3.14 - 3.00 (m, 1H), 2.49- 2.28 (m, 4H), 2.19 (h, J = 7.7 Hz, 1H), 1.95 (ddq, J = 11.4, 7.7, 4.1 Hz, 1H), 1.86 (ddt, J = 14.7, 7.5, 4.1 Hz, 1H), 1.82 - 1.51 (m, 6H).	376.25	E	
I-943		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.27 (dt, J = 8.3, 1.5 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 7.5, 1.6 Hz, 1H), 4.70 (td, J = 8.6, 6.1 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 20.7, 11.8, 9.1 Hz, 2H), 2.20 (tdd, J = 15.9, 10.3, 4.6 Hz, 3H), 1.96 (dtd, J = 11.7, 7.6, 4.1 Hz, 1H), 1.88 (dq, J = 10.8, 3.5 Hz, 1H), 1.83-1.52 (m, 6H).	376.25	E	
I-944		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.27 (dt, J = 8.2, 1.5 Hz, 1H), 7.23 (dt, J = 7.5, 1.5 Hz, 1H), 4.69 (td, J = 8.7, 6.1 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 20.8, 11.8, 9.0 Hz, 2H), 2.20 (tdd, J = 15.9, 10.4, 4.5 Hz, 3H), 2.01 - 1.83 (m, 2H), 1.83 - 1.52 (m, 6H).	376.3	D	

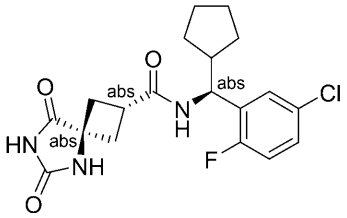
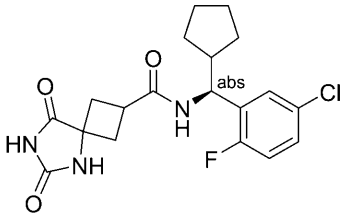
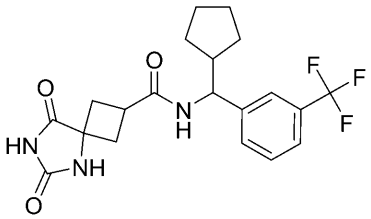
【表１－２２７】

I-945		(400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 21.8 Hz, 1H), 7.40 -7.19 (m, 4H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.28 (s, 1H), 2.97 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.28 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 2.21 - 2.08 (m, 4H), 2.04 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 1.71 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 1.53 (d, J = 25.3 Hz, 2H), 1.49 - 1.37 (m, 2H), 1.25 (s, 3H), 1.09 (d, J = 9.1 Hz, 1H).	361.3	D	
I-946		(400 MHz, DMSO-d6) 8.32 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.38 -7.20 (m, 4H), 4.57 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.30 - 4.18 (m, 2H), 2.86 (tt, J = 9.6, 4.9 Hz, 1H), 2.45 (t, J = 10.8 Hz, 1H), 2.39 - 2.26 (m, 2H), 2.26 - 2.10 (m, 2H), 1.70 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 1.56 (dq, J = 11.6, 7.0, 4.6 Hz, 2H), 1.51 - 1.38 (m, 2H), 1.32 - 1.20 (m, 2H), 1.13 - 1.01 (m, 1H).	363.25	D	
I-947		(400 MHz, DMSO-d6) 10.78 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.67 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.44 (dd, J = 8.5, 2.2 Hz, 1H), 7.35 (t, J = 2.8 Hz, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.18 (dd, J = 3.0, 1.9 Hz, 1H), 5.49 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 3.61 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 1.34 (s, 6H).	377.2	E	

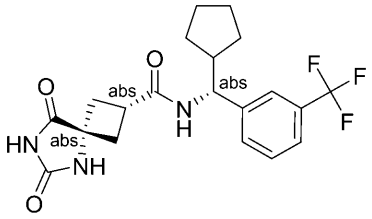
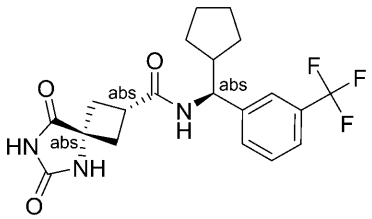
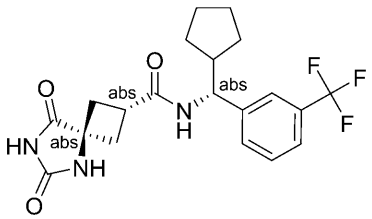
【表１－２２８】

I-948		(400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.47 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 7.33 (ddd, J = 8.7, 4.4, 2.7 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.89 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.16 - 3.02 (m, 1H), 2.49 - 2.26 (m, 4H), 2.16 (h, J = 8.4 Hz, 1H), 1.75 - 1.65 (m, 1H), 1.63 - 1.49 (m, 2H), 1.52 - 1.41 (m, 2H), 1.38 - 1.22 (m, 2H), 1.14 - 1.00 (m, 1H).	394.05	E	
I-949		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.47 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 7.33 (ddd, J = 8.7, 4.4, 2.7 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.89 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.08 (h, J = 8.5, 7.9 Hz, 1H), 2.37 (dp, J = 31.9, 11.3, 10.6 Hz, 4H), 2.16 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 1.70 (s, 1H), 1.61 - 1.41 (m, 4H), 1.38 - 1.22 (m, 2H), 1.07 (s, 1H).	394.05	D	
I-950		(400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.49 (dd, J = 6.2, 2.8 Hz, 1H), 7.33 (ddd, J = 8.8, 4.4, 2.6 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.88 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 15.3, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.30 - 2.10 (m, 3H), 1.77 - 1.69 (m, 1H), 1.64 - 1.56 (m, 2H), 1.46 (s, 2H), 1.29 (td, J = 17.1, 15.4, 7.8 Hz, 2H), 1.08 (s, 1H).	394.05	E	

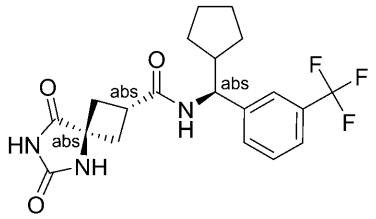
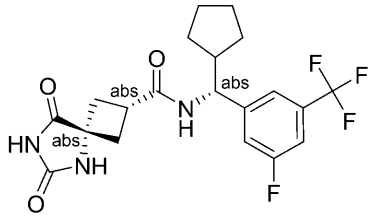
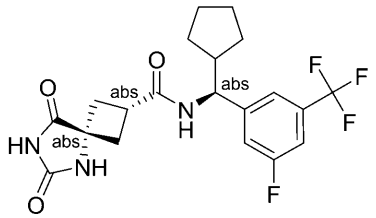
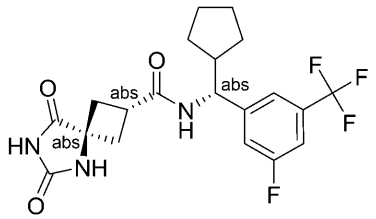
【表１－２２９】

I-951		(400 MHz, DMSO-d6) 10.45 (s, 1H), 8.60 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.49 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 7.33 (ddd, J = 8.5, 4.4, 2.7 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.88 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 15.3, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.25 (td, J = 8.8, 4.7 Hz, 1H), 2.17 (dp, J = 13.2, 4.7 Hz, 2H), 1.73 (ddd, J = 12.0, 8.5, 4.6 Hz, 1H), 1.62 - 1.40 (m, 4H), 1.37 - 1.22 (m, 2H), 1.08 (dd, J = 11.7, 7.4 Hz, 1H).	394.05	B	B
I-952		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.47 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 7.33 (ddd, J = 8.9, 4.4, 2.8 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.89 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.15 - 3.02 (m, 2H), 2.39 (t, J = 10.2 Hz, 2H), 2.30 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 2.16 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 1.72 (s, 1H), 1.60 - 1.53 (m, 2H), 1.49 (dd, J = 15.4, 8.0 Hz, 2H), 1.38 - 1.22 (m, 2H), 1.07 (s, 1H).	394.05	D	
I-953		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.63 - 7.50 (m, 3H), 4.68 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.10 (ddd, J = 17.6, 9.2, 7.6 Hz, 1H), 2.48 - 2.41 (m, 1H), 2.39 (d, J = 11.1 Hz, 1H), 2.30 (t, J = 10.5 Hz, 2H), 2.16 (h, J = 8.2 Hz, 1H), 1.72 (ddt, J = 15.7, 12.1, 5.7 Hz, 1H), 1.60 - 1.52 (m, 2H), 1.55 - 1.39 (m, 2H), 1.33 - 1.21 (m, 2H), 1.11 (dt, J = 12.8, 8.2 Hz, 1H).	410.05	E	

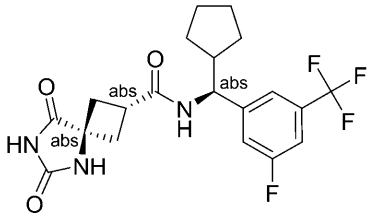
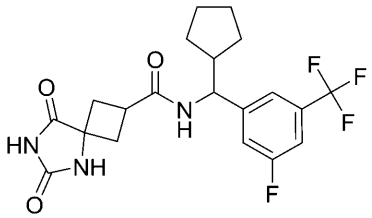
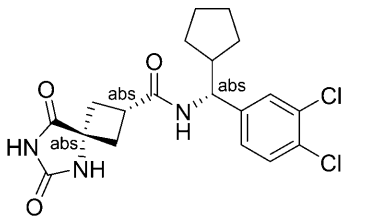
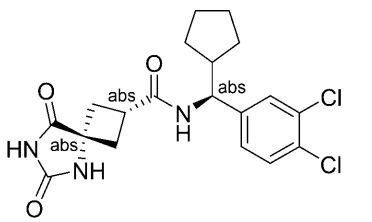
【表１－２３０】

I-954		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.61 - 7.50 (m, 3H), 4.68 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.16 - 3.03 (m, 1H), 2.48 - 2.34 (m, 3H), 2.34 - 2.25 (m, 1H), 2.16 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 1.70 (td, J = 7.7, 4.3 Hz, 1H), 1.63 - 1.55 (m, 2H), 1.59 - 1.39 (m, 2H), 1.35 - 1.20 (m, 2H), 1.17 - 1.01 (m, 1H).	410.05	E	
I-955		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.60 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.58 - 7.50 (m, 2H), 4.68 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.49 - 2.41 (m, 1H), 2.41 - 2.34 (m, 2H), 2.30 (t, J = 10.5 Hz, 1H), 2.16 (h, J = 8.4 Hz, 1H), 1.70 (dt, J = 12.1, 5.8 Hz, 1H), 1.57 (t, J = 4.0 Hz, 2H), 1.58 - 1.40 (m, 2H), 1.33 - 1.21 (m, 2H), 1.10 (dq, J = 12.6, 8.2 Hz, 1H).	410.05	E	
I-956		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.38 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.64 - 7.55 (m, 2H), 7.58 - 7.50 (m, 1H), 4.67 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.63 (dd, J = 11.8, 8.9 Hz, 2H), 2.29 - 2.15 (m, 2H), 2.19 - 2.09 (m, 1H), 1.73 (dd, J = 11.8, 7.1 Hz, 1H), 1.62 - 1.53 (m, 2H), 1.53 - 1.21 (m, 2H), 1.24 (s, 2H), 1.10 (s, 1H).	410.05	E	

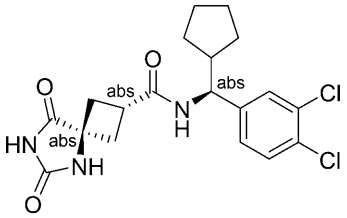
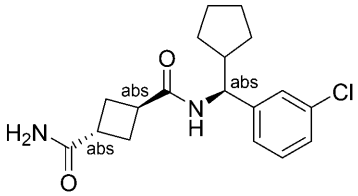
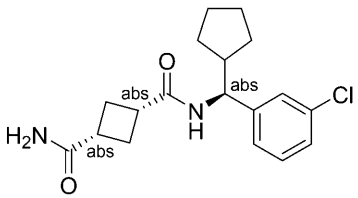
【表１－２３１】

I-957		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.38 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.64 - 7.50 (m, 3H), 4.67 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 - 2.58 (m, 2H), 2.29 - 2.09 (m, 3H), 1.78 - 1.70 (m, 1H), 1.58 (s, 2H), 1.54 - 1.39 (m, 2H), 1.37 - 1.21 (m, 2H), 1.17 - 1.05 (m, 1H).	410.05	D	
I-958		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.50 (dd, J = 8.6, 2.2 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.52 (dd, J = 16.4, 8.5 Hz, 3H), 4.72 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.18 - 3.00 (m, 1H), 2.47 - 2.35 (m, 3H), 2.34 - 2.26 (m, 1H), 2.15 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 1.70 (s, 1H), 1.58 (s, 2H), 1.46 (dq, J = 14.3, 8.4 Hz, 2H), 1.34 - 1.20 (m, 2H), 1.15 (d, J = 9.6 Hz, 1H).	428.1	E	
I-959		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.59 - 7.44 (m, 3H), 4.72 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.16 - 3.04 (m, 1H), 2.44 (dt, J = 11.9, 3.6 Hz, 2H), 2.41 - 2.35 (m, 1H), 2.30 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 2.15 (h, J = 8.4 Hz, 1H), 1.69 (dd, J = 12.1, 7.4 Hz, 1H), 1.63 - 1.52 (m, 2H), 1.46 (td, J = 14.2, 13.1, 7.9 Hz, 2H), 1.27 (dd, J = 12.4, 7.8 Hz, 2H), 1.15 (q, J = 12.1, 10.3 Hz, 1H).	428.1	D	
I-960		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 - 7.41 (m, 3H), 4.70 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 17.5, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.35 - 2.10 (m, 3H), 1.78 - 1.68 (m, 1H), 1.67 - 1.38 (m, 4H), 1.35 - 1.21 (m, 2H), 1.19 - 1.06 (m, 1H).	428.35	E	

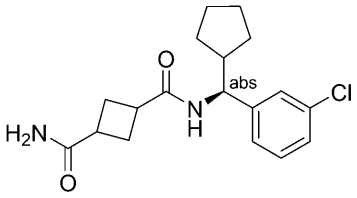
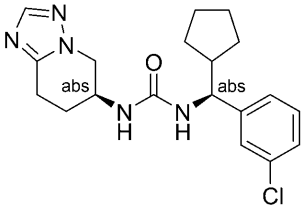
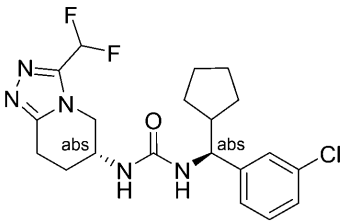
【表１－２３２】

I-961		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.62 - 7.43 (m, 3H), 4.70 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 17.2, 11.8, 9.0 Hz, 2H), 2.20 (tt, J = 16.0, 8.8 Hz, 3H), 1.79 - 1.68 (m, 1H), 1.59 (s, 2H), 1.52 - 1.39 (m, 2H), 1.34 - 1.21 (m, 2H), 1.15 (q, J = 11.4, 9.8 Hz, 1H).	428.05	C	C
I-962		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (d, J = 15.0 Hz, 1H), 8.66 - 8.21 (m, 2H), 7.63 - 7.42 (m, 3H), 4.71 (td, J = 9.2, 6.7 Hz, 1H), 3.19 - 3.03 (m, 1H), 2.68 - 2.59 (m, 1H), 2.46 - 2.35 (m, 2H), 2.34 - 2.08 (m, 2H), 1.96 - 1.65 (m, 1H), 1.64 - 1.51 (m, 2H), 1.52 - 1.38 (m, 2H), 1.27 (dq, J = 11.9, 7.9 Hz, 2H), 1.15 (q, J = 11.6, 10.0 Hz, 1H).	428.1	D	
I-963		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.62 - 7.50 (m, 2H), 7.29 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 4.57 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.45 - 2.26 (m, 4H), 2.11 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 1.74 - 1.34 (m, 5H), 1.32 - 1.19 (m, 2H), 1.15 - 1.02 (m, 1H).	410.25	E	
I-964		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.63 - 7.50 (m, 2H), 7.29 (dd, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 4.57 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.46 - 2.35 (m, 3H), 2.33 - 2.27 (m, 1H), 2.12 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 1.75 - 1.64 (m, 1H), 1.56 (d, J = 4.3 Hz, 2H), 1.51 - 1.38 (m, 2H), 1.32 - 1.19 (m, 2H), 1.15 - 1.02 (m, 1H).	410.25	E	

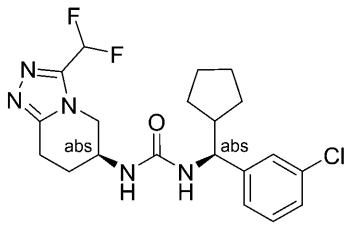
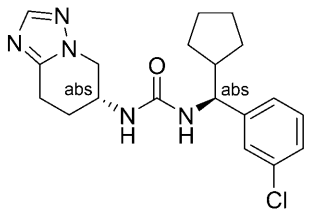
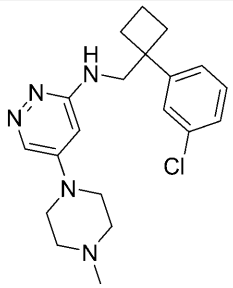
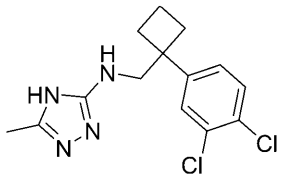
【表１－２３３】

I-965		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.61 - 7.54 (m, 2H), 7.30 (dd, J = 8.3, 2.0 Hz, 1H), 4.56 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 - 2.58 (m, 2H), 2.28 - 2.09 (m, 3H), 1.73 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 1.63 - 1.36 (m, 4H), 1.33 - 1.21 (m, 2H), 1.10 (dt, J = 12.8, 8.2 Hz, 1H).	410.1	D	
I-966		(400 MHz, DMSO-d6) 8.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 - 7.29 (m, 2H), 7.26 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 7.13 (s, 1H), 6.70 (s, 1H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.85 (dp, J = 21.9, 9.0 Hz, 2H), 2.16 (p, J = 10.1 Hz, 4H), 2.07 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 1.70 (ddd, J = 12.0, 9.1, 5.3 Hz, 1H), 1.58 (td, J = 7.9, 7.1, 3.8 Hz, 2H), 1.54 - 1.39 (m, 2H), 1.33 - 1.20 (m, 2H), 1.08 (dq, J = 12.3, 8.0 Hz, 1H).	335.15	D	
I-967		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.30 (m, 2H), 7.30 - 7.21 (m, 2H), 7.16 (s, 1H), 6.70 (s, 1H), 4.58 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.01 (td, J = 8.7, 4.4 Hz, 1H), 2.92 (tt, J = 9.1, 6.3 Hz, 1H), 2.31 - 2.05 (m, 5H), 1.70 (dt, J = 12.1, 5.9 Hz, 1H), 1.57 (qd, J = 9.8, 9.0, 4.5 Hz, 2H), 1.53 - 1.38 (m, 2H), 1.33 - 1.21 (m, 2H), 1.16 - 1.04 (m, 1H).	335.1	D	

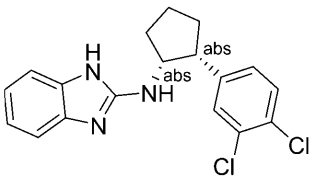
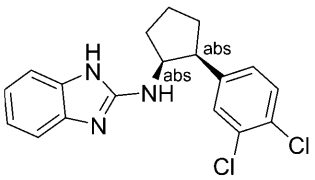
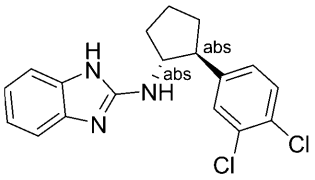
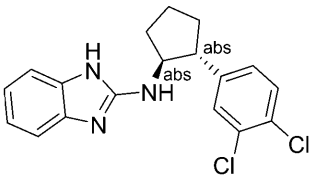
【表１－２３４】

I-968		(400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (dd, J = 18.4, 8.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.30 (m, 2H), 7.30 - 7.21 (m, 2H), 7.14 (d, J = 15.0 Hz, 1H), 6.70 (s, 1H), 4.57 (q, J = 9.7 Hz, 1H), 3.08 - 2.90 (m, 2H), 2.29 - 2.01 (m, 5H), 1.74 - 1.65 (m, 1H), 1.61 - 1.37 (m, 4H), 1.26 (ddt, J = 11.8, 7.9, 4.6 Hz, 2H), 1.15 - 1.02 (m, 1H).	335.1	D	
I-969		(400 MHz, DMSO-d6) 7.87 (s, 1H), 7.33 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.31 7.23 (m, 2H), 7.20 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.45 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.20 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 4.47 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 4.21 (dd, J = 12.4, 4.7 Hz, 1H), 4.13 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.86 (dd, J = 12.5, 5.5 Hz, 1H), 2.96 - 2.77 (m, 2H), 2.12 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 1.97 (dp, J = 20.4, 7.3, 6.8 Hz, 2H), 1.68 - 1.51 (m, 3H), 1.47 (hept, J = 8.2 Hz, 2H), 1.31 (ddt, J = 19.3, 13.0, 7.6 Hz, 2H), 1.13 (dt, J = 12.4, 7.5 Hz, 1H).	374.1	E	
I-970		(400 MHz, DMSO-d6) 7.45 - 7.24 (m, 4H), 7.23 - 7.16 (m, 1H), 6.45 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.23 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 4.47 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 4.20 (dd, J = 12.2, 4.6 Hz, 1H), 4.17 - 4.03 (m, 1H), 3.86 (dd, J = 12.3, 5.9 Hz, 1H), 3.06 - 2.87 (m, 2H), 2.14 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 1.97 (dh, J = 13.7, 6.5 Hz, 2H), 1.71 - 1.60 (m, 1H), 1.60 - 1.52 (m, 2H), 1.52 - 1.39 (m, 2H), 1.31 (ddd, J = 28.6, 12.5, 7.7 Hz, 2H), 1.21 - 1.05 (m, 1H).	424.2	D	

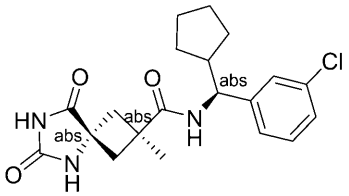
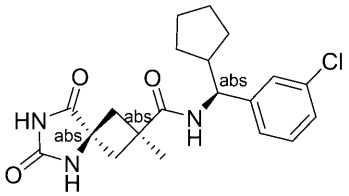
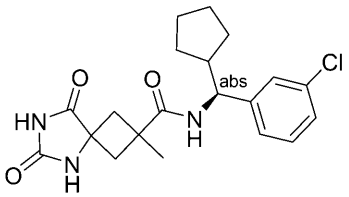
【表１－２３５】

I-971		(400 MHz, DMSO-d6) 7.48 - 7.29 (m, 3H), 7.28 - 7.24 (m, 1H), 7.21 (dt, J = 7.6, 1.5 Hz, 1H), 6.45 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.22 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.45 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 4.27 - 4.21 (m, 1H), 4.07 (h, J = 7.2 Hz, 1H), 3.94 (dd, J = 12.2, 5.9 Hz, 1H), 3.03 - 2.88 (m, 2H), 2.12 (h, J = 8.2 Hz, 1H), 2.02 - 1.80 (m, 2H), 1.71 - 1.38 (m, 5H), 1.38 - 1.19 (m, 2H), 1.11 (dq, J = 12.2, 7.9 Hz, 1H).	424.2	E	
I-972		(400 MHz, DMSO-d6) 7.88 (s, 1H), 7.38 - 7.18 (m, 4H), 6.44 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.21 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 4.46 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 4.24 (dd, J = 12.5, 4.6 Hz, 1H), 4.11 (dt, J = 10.2, 3.6 Hz, 1H), 3.92 (dd, J = 12.5, 5.5 Hz, 1H), 2.94 - 2.75 (m, 2H), 2.12 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 2.03 - 1.83 (m, 2H), 1.67 - 1.39 (m, 5H), 1.39 - 1.18 (m, 2H), 1.18 - 1.07 (m, 1H).	374.05	E	
I-974		(400 MHz, DMSO-d6) 8.34 (s, 2H), 7.31-7.17 (m, 3H), 7.13 (s, 1H), 6.19 (s, 1H), 3.74 (d, J = 6.2 Hz, 6H), 3.53 (s, 2H), 3.34 (s, 2H), 2.82 (s, 3H), 2.29 (d, J = 9.1 Hz, 4H), 2.12 (dd, J = 19.8, 10.4 Hz, 1H), 1.84 (s, 1H).	372.3	E	
I-975		(400 MHz, DMSO-d6) 11.54 (s, 1H), 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.13 (dd, J = 8.3, 2.2 Hz, 1H), 6.06 (s, 1H), 3.42 (d, J = 6.5 Hz, 2H), 2.37 - 2.23 (m, 2H), 2.17 (dd, J = 11.3, 8.6 Hz, 2H), 2.10 - 1.96 (m, 4H), 1.83 - 1.73 (m, 1H).	311.2	E	

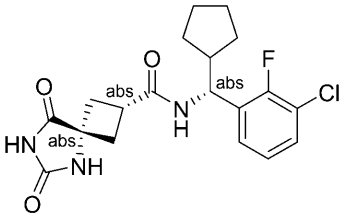
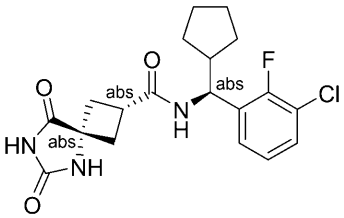
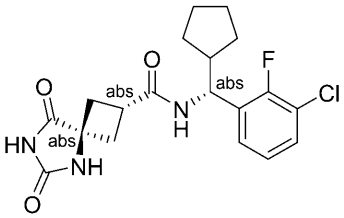
【表１－２３６】

I-976		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 7.60 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 9.8 Hz, 2H), 6.83 (d, J = 13.3 Hz, 2H), 6.69 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.13 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 3.16 - 3.05 (m, 1H), 2.26 (dq, J = 13.5, 6.9 Hz, 1H), 2.12 (dq, J = 15.6, 7.0, 6.2 Hz, 1H), 1.88- 1.66 (m, 3H), 1.56 (dq, J = 12.6, 8.2 Hz, 1H).	346.05	E	
I-977		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 7.60 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 12.9, 7.7 Hz, 2H), 6.87 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.69 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.13 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 3.11 (q, J = 9.5 Hz, 1H), 2.26 (dq, J = 13.8, 6.9 Hz, 1H), 2.18 - 2.06 (m, 1H), 1.87 - 1.65 (m, 3H), 1.56 (dq, J = 12.6, 8.2 Hz, 1H).	346.1	D	
I-978		(400 MHz, DMSO-d6) 10.25 (s, 1H), 7.47 - 7.39 (m, 2H), 7.18 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 16.2, 7.7 Hz, 2H), 6.90 -6.72 (m, 2H), 6.24 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.44 (dq, J = 8.7, 6.2 Hz, 1H), 3.41 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 2.16 - 1.84 (m, 4H), 1.79 -1.63 (m, 2H).	346.05	E	
I-979		(400 MHz, DMSO-d6) 10.25 (s, 1H), 7.47- 7.39 (m, 2H), 7.18 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 7.08 (s, 2H), 6.88 - 6.78 (m, 2H), 6.25 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.44 (dq, J = 8.7, 6.2 Hz, 1H), 3.41 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.17-1.95 (m, 3H), 1.90 (tt, J = 11.2, 6.0 Hz, 1H), 1.79-1.63 (m, 2H).	346.05	D	

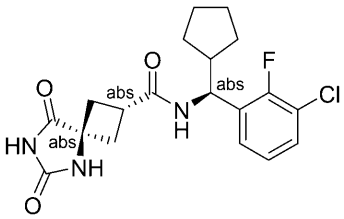
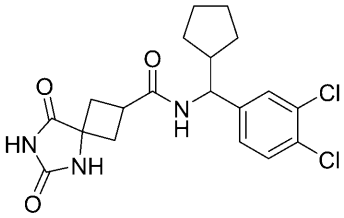
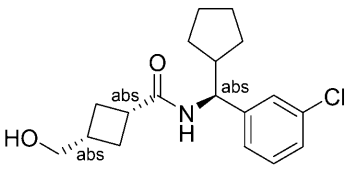
【表１－２３７】

I-980		(400 MHz, DMSO-d6) |AE 10.51 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.37-7.22 (m, 3H), 4.54 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 2.70-2.58 (m, 2H), 2.32 (td, J = 8.8, 7.7, 3.5 Hz, 2H), 2.21 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 1.78 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 1.68-1.55 (m, 3H), 1.50 (s, 3H), 1.48-1.37 (m, 1H), 1.36-1.21 (m, 2H), 1.12 (q, J = 11.0, 9.5 Hz, 1H).	390.25	D	
I-981		(400 MHz, DMSO-d6) 10.31 (s, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.36-7.22 (m, 3H), 4.60-4.51 (m, 1H), 2.88 (dd, J = 12.6, 7.4 Hz, 2H), 2.38-2.15 (m, 1H), 2.10-1.96 (m, 2H), 1.76 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 1.59 (dd, J = 8.4, 4.6 Hz, 2H), 1.53-1.40 (m, 2H), 1.37 (s, 3H), 1.35-1.21 (m, 2H), 1.13 (dd, J = 12.5, 8.2 Hz, 1H).	390.05	E	
I-982		(400 MHz, DMSO-d6) 10.46 (s, 1H), 8.37 (d, J = 118.8 Hz, 1H), 8.08 (dd, J = 15.8, 8.7 Hz, 1H), 7.41 (q, J = 3.1, 2.5 Hz, 1H), 7.37-7.21 (m, 3H), 4.55 (dt, J = 10.4, 7.1 Hz, 1H), 2.88 (dd, J = 12.5, 7.6 Hz, 1H), 2.69-2.60 (m, 1H), 2.35-2.27 (m, 2H), 2.20 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.12-1.95 (m, 1H), 1.85-1.71 (m, 1H), 1.68-1.54 (m, 2H), 1.50 (s, 4H), 1.35-1.18 (m, 2H), 1.12 (p, J = 8.0 Hz, 1H).	390.3	D	

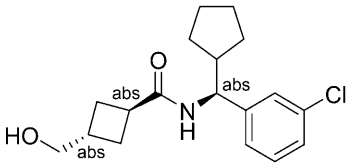
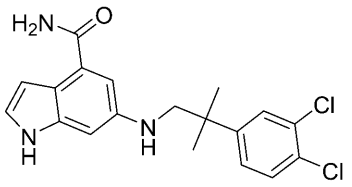
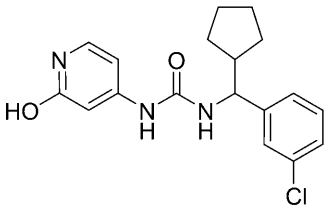
【表１－２３８】

I-983		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.54 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.45 (td, J = 7.6, 1.7 Hz, 1H), 7.40 - 7.31 (m, 1H), 7.21 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 4.88 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.46 - 2.13 (m, 5H), 1.73 (dd, J = 12.2, 7.1 Hz, 1H), 1.66 - 1.39 (m, 4H), 1.29 (dq, J = 18.2, 10.2, 8.7 Hz, 2H), 1.06 (t, J = 10.4 Hz, 1H).	394.15	E	
I-984		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.54 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.49 - 7.42 (m, 1H), 7.36 (ddd, J = 8.0, 6.4, 1.7 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 4.88 (dd, J = 9.9, 8.4 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.46 - 2.41 (m, 1H), 2.41 - 2.34 (m, 2H), 2.28 (t, J = 10.5 Hz, 1H), 2.18 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 1.79 - 1.69 (m, 1H), 1.52 (ddd, J = 30.2, 14.8, 7.2 Hz, 4H), 1.29 (td, J = 18.7, 17.1, 9.0 Hz, 2H), 1.06 (t, J = 10.4 Hz, 1H).	394.1	D	
I-985		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.39 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.50 - 7.33 (m, 2H), 7.21 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 4.93 - 4.80 (m, 1H), 3.12 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.68 - 2.58 (m, 2H), 2.27 - 2.10 (m, 3H), 1.78 (s, 1H), 1.65 - 1.40 (m, 4H), 1.32 (dt, J = 12.6, 7.3 Hz, 2H), 1.08 (d, J = 9.7 Hz, 1H).	394.05	E	

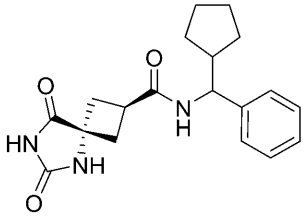
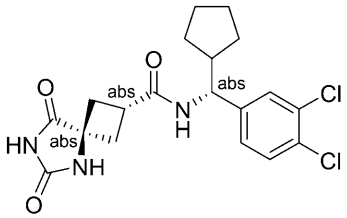
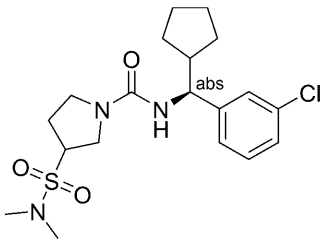
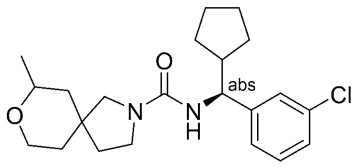
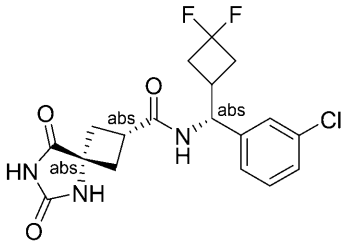
【表１－２３９】

I-986		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.39 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 4.95 - 4.78 (m, 1H), 3.11 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69 - 2.60 (m, 2H), 2.28 - 2.09 (m, 3H), 1.77 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 1.59 (s, 2H), 1.50 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 - 1.26 (m, 2H), 1.07 (d, J = 10.2 Hz, 1H).	394.05	B	B
I-987		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 8.63 - 8.39 (m, 1H), 8.35 - 8.22 (m, 1H), 7.61 - 7.52 (m, 2H), 7.35 - 7.21 (m, 1H), 4.57 (td, J = 9.1, 3.2 Hz, 1H), 3.17 - 2.99 (m, 1H), 2.71 - 2.59 (m, 1H), 2.45 (q, J = 3.4 Hz, 1H), 2.43 - 2.35 (m, 1H), 2.35 - 2.27 (m, 1H), 2.14 (dt, J = 16.9, 8.6 Hz, 1H), 1.71 (ddt, J = 15.1, 12.0, 5.3 Hz, 1H), 1.56 (tq, J = 6.7, 3.4 Hz, 2H), 1.50 - 1.38 (m, 2H), 1.26 (qt, J = 13.1, 6.4 Hz, 2H), 1.09 (dq, J = 12.3, 8.1 Hz, 1H).	410	D	
I-988		(400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39- 7.29 (m, 2H), 7.25 (tt, J = 7.3, 1.5 Hz, 2H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.40 (t, J = 5.3 Hz, 1H), 3.36-3.24 (m, 2H), 2.87 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.33 - 2.21 (m, 1H), 2.16 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.08 (ddt, J = 12.3, 7.9, 4.0 Hz, 1H), 1.98 (dtd, J = 11.8, 8.0, 3.8 Hz, 1H), 1.86 - 1.65 (m, 3H), 1.55 (dtd, J = 15.7, 9.7, 9.0, 3.2 Hz, 2H), 1.50 - 1.38 (m, 2H), 1.32 - 1.19 (m, 2H), 1.14- 1.01 (m, 1H).	322.2	E	

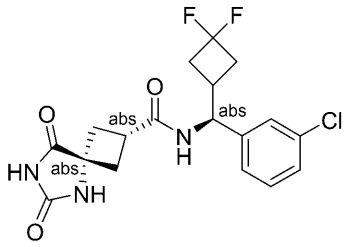
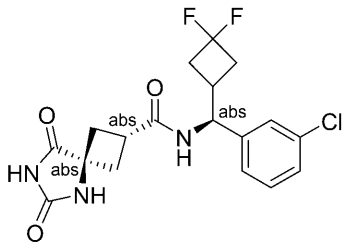
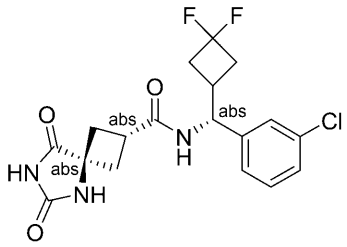
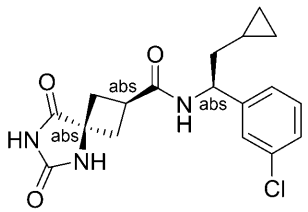
【表１－２４０】

I-989		(400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38- 7.29 (m, 2H), 7.25 (ddd, J = 7.3, 3.7, 1.8 Hz, 2H), 4.57 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.49 (t, J = 5.3 Hz, 1H), 3.40 (dd, J = 6.6, 5.3 Hz, 2H), 2.98 (tt, J = 9.2, 6.6 Hz, 1H), 2.26 (dd, J = 9.8, 4.2 Hz, 1H), 2.26- 1.99 (m, 3H), 1.88 (ddq, J = 8.7, 6.2, 3.4, 2.9 Hz, 1H), 1.78 (ddq, J = 8.6, 6.1, 2.5 Hz, 1H), 1.74 - 1.65 (m, 1H), 1.56 (dtd, J = 13.7, 7.2, 6.3, 3.8 Hz, 2H), 1.46 (dddt, J = 15.7, 12.3, 8.0, 4.4 Hz, 2H), 1.34 - 1.20 (m, 2H), 1.08 (dt, J = 19.9, 7.2 Hz, 1H).	322.2	E	
I-990		(400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s, 1H), 7.65 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.48-7.39 (m, 2H), 7.12 - 7.04 (m, 2H), 6.90 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.69 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.59 (t, J = 2.5 Hz, 1H), 4.92 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 1.38 (s, 6H).	376.05	E	
I-991		(400 MHz, d6-DMSO) 11.65 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.39 - 7.33 (m, 2H), 7.32 - 7.25 (m, 2H), 6.84 (br s, 2H), 5.96 (dd, J = 8.1, 2.4 Hz, 1H), 5.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 4.69 (app t, J = 8.0 Hz, 1H), 2.38 - 2.18 (m, 1H), 1.74 - 1.13 (m, 8H). このバッチは、ヒドロキシピリジン:2-ピリドン互変異性体の＞10:1 混合物である。主要な互変異性体のみが特徴付けられた。	346.2	E	

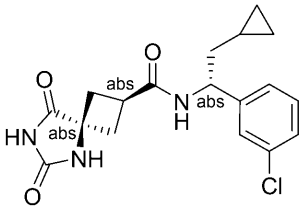
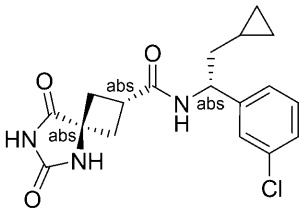
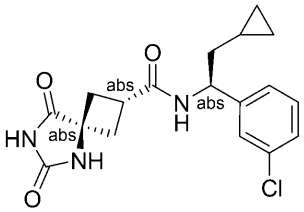
【表１－２４１】

I-992				E	
I-993		(400 MHz, メタノール-d4) 7.55 - 7.42 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 4.60 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.26 - 3.13 (m, 1H), 2.93 - 2.83 (m, 2H), 2.44 (dddd, J = 28.1, 12.7, 9.8, 3.5 Hz, 2H), 2.30 (dt, J = 17.1, 8.6 Hz, 1H), 1.95 - 1.84 (m, 1H), 1.75 - 1.60 (m, 2H), 1.59 - 1.51 (m, 2H), 1.47 - 1.36 (m, 2H), 1.31 (s, 1H), 1.22 - 1.10 (m, 1H), 0.91 (d, J = 7.2 Hz, 1H).	410	D	
I-994			414.42	E	
I-995			391.46	E	
I-996		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.41 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.27 (m, 3H), 4.88 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 3.16 - 3.05 (m, 1H), 2.69 - 2.55 (m, 1H), 2.49 - 2.28 (m, 8H).	398.1	E	

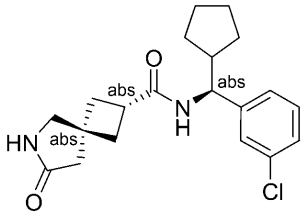
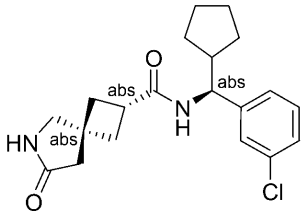
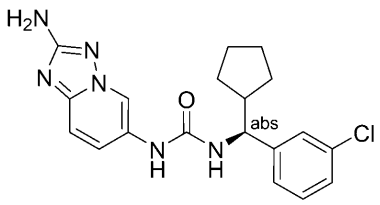
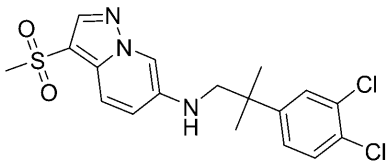
【表１－２４２】

I-997		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.41 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.33 (m, 1H), 7.30 (ddt, J = 7.1, 5.3, 1.6 Hz, 2H), 4.88 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 3.09 (dt, J = 9.6, 8.4 Hz, 1H), 2.68 - 2.54 (m, 1H), 2.48 - 2.37 (m, 6H), 2.33 (t, J = 6.8 Hz, 2H).	398.05	E	
I-998		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.57 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.39 - 7.28 (m, 3H), 4.90 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.75 - 2.69 (m, 1H), 2.69 - 2.57 (m, 2H), 2.48 - 2.31 (m, 3H), 2.23 (dddd, J = 25.3, 12.6, 9.2, 4.0 Hz, 2H).	398.05	D	
I-999		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.29 (m, 3H), 4.90 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.76 - 2.69 (m, 1H), 2.69 - 2.56 (m, 2H), 2.46 - 2.31 (m, 3H), 2.23 (dddd, J = 21.8, 12.8, 9.2, 4.2 Hz, 2H).	398.05	E	
I-1000		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.41 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.38 - 7.32 (m, 2H), 7.31 - 7.26 (m, 1H), 7.24 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 5.80 (ddt, J = 16.9, 10.3, 6.5 Hz, 1H), 5.03 - 4.91 (m, 2H), 4.77 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.48 - 2.26 (m, 4H), 1.98 (dp, J = 21.9, 7.2 Hz, 2H), 1.77 - 1.63 (m, 2H).	362.1	E	

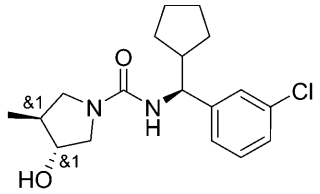
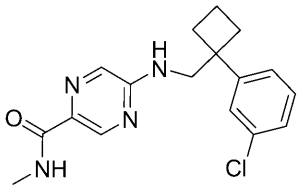
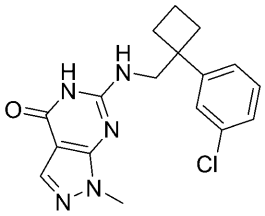
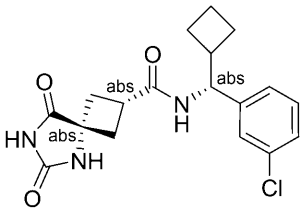
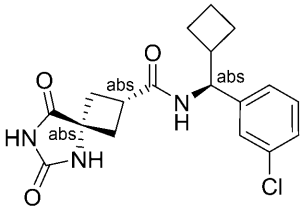
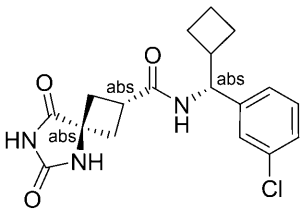
【表１－２４３】

I-1001		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.37 - 7.32 (m, 2H), 7.28 (dt, J = 8.4, 1.5 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 7.6, 1.7 Hz, 1H), 5.80 (ddt, J = 16.8, 10.2, 6.5 Hz, 1H), 5.03 - 4.92 (m, 2H), 4.83 - 4.71 (m, 1H), 3.10 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.47 - 2.28 (m, 4H), 1.99 (ddt, J = 21.6, 14.6, 7.3 Hz, 2H), 1.71 (ddt, J = 10.8, 8.4, 6.0 Hz, 2H).	362.1	E	
I-1002		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38 - 7.32 (m, 2H), 7.31 - 7.22 (m, 2H), 5.81 (ddt, J = 16.8, 10.2, 6.5 Hz, 1H), 5.05 - 4.92 (m, 2H), 4.79 (td, J = 8.5, 6.0 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69 (ddd, J = 18.1, 11.8, 8.9 Hz, 2H), 2.21 (dddd, J = 21.2, 13.0, 9.1, 4.2 Hz, 2H), 2.00 (tp, J = 14.5, 7.4 Hz, 2H), 1.74 (tp, J = 14.7, 7.6, 6.9 Hz, 2H).	362.05	E	
I-1003		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.38 - 7.32 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 13.7, 7.5, 1.6 Hz, 2H), 5.81 (ddt, J = 16.8, 10.2, 6.5 Hz, 1H), 5.05 - 4.93 (m, 2H), 4.79 (td, J = 8.6, 6.0 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (ddd, J = 18.2, 11.9, 9.0 Hz, 2H), 2.21 (dddd, J = 21.0, 12.9, 9.0, 4.3 Hz, 2H), 2.09 - 1.92 (m, 2H), 1.73 (tdd, J = 15.6, 8.4, 4.7 Hz, 2H).	362.25	E	

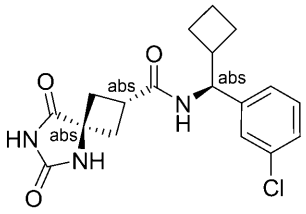
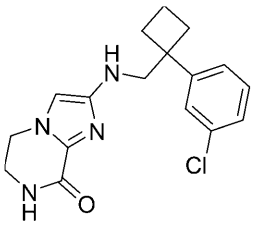
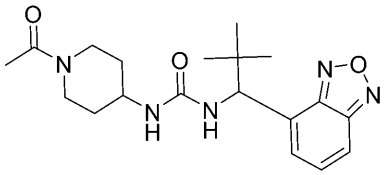
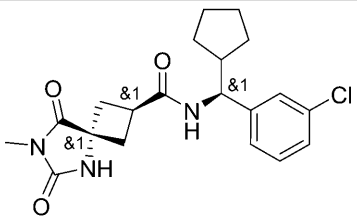
【表１－２４４】

I-1004		(400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.40 - 7.29 (m, 2H), 7.25 (tt, J = 7.3, 1.5 Hz, 2H), 4.56 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.28 (s, 2H), 2.98 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.24 - 1.98 (m, 7H), 1.70 (p, J = 7.3, 6.5 Hz, 1H), 1.61 - 1.49 (m, 2H), 1.48-1.33 (m, 2H), 1.26 (ddd, J = 19.8, 13.8, 9.6 Hz, 2H), 1.08 (dq, J = 12.3, 8.1 Hz, 1H).	361.3	D	
I-1005		(400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.40 - 7.19 (m, 4H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (s, 2H), 2.96 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.28 (s, 2H), 2.21 - 2.08 (m, 3H), 2.03 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 2H), 1.75 - 1.65 (m, 1H), 1.53 (d, J = 24.2 Hz, 2H), 1.49 - 1.38 (m, 2H), 1.34- 1.20 (m, 2H), 1.13 -1.03 (m, 1H).	361.3	D	
I-1006		(400 MHz, DMSO-d6) 8.78 (dd, J = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.41- 7.32 (m, 2H), 7.31-7.21 (m, 3H), 7.18 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.80 (s, 2H), 4.51 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 2.22 (h, J = 8.1 Hz, 1H), 1.73 (dd, J = 12.2, 7.5 Hz, 1H), 1.67 - 1.41 (m, 4H), 1.36 (p, J = 7.7 Hz, 2H), 1.22 - 1.08 (m, 1H).	385.3	D	
I-1007		(400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (s, 1H), 8.02 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.69-7.60 (m, 2H), 7.55 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 9.6, 2.0 Hz, 1H), 5.65 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 3.19 (s, 3H), 1.37 (s, 6H).	412.2	E	

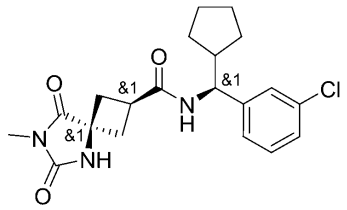
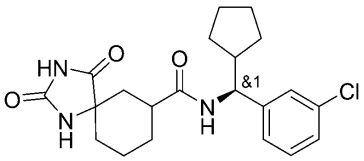
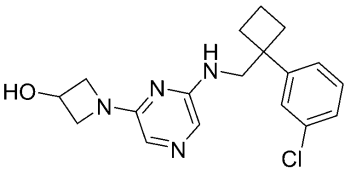
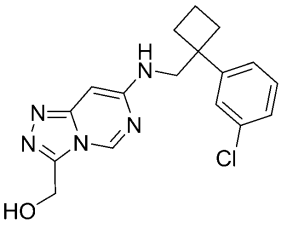
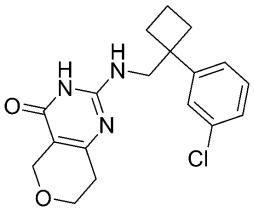
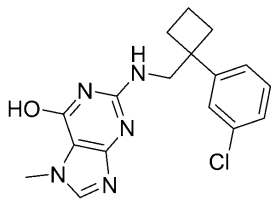
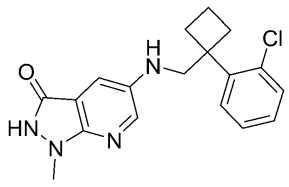
【表１－２４５】

I-1008				E	
I-1009			331.34	E	
I-1010			344.24	E	
I-1011		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.38 - 8.23 (m, 2H), 7.35 - 7.30 (m, 2H), 7.29 - 7.20 (m, 2H), 4.75 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.17 - 3.05 (m, 1H), 2.45 (m, 1H), 2.44 - 2.29 (m, 4H), 1.94 (q, J = 7.0, 5.9 Hz, 1H), 1.72 (dt, J = 19.4, 6.6 Hz, 5H).	362.1	E	
I-1012		(400 MHz, メタノール-d4) 7.34 - 7.26 (m, 2H), 7.22 (ddt, J = 11.9, 7.5, 1.4 Hz, 2H), 4.78 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.26 - 3.15 (m, 1H), 2.72 - 2.53 (m, 4H), 2.51 - 2.43 (m, 1H), 2.17 - 2.07 (m, 1H), 1.94 - 1.72 (m, 5H).	362.1	E	
I-1013		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.18 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 2H), 7.25 (ddt, J = 13.2, 7.6, 1.5 Hz, 2H), 4.76 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.3 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 16.1, 11.9, 9.1 Hz, 2H), 2.60 - 2.54 (m, 1H), 2.27 - 2.13 (m, 2H), 1.96 (s, 1H), 1.81 - 1.66 (m, 4H).	362.1	E	

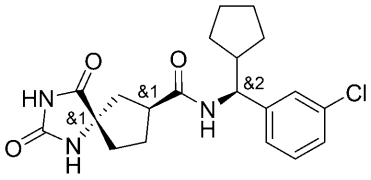
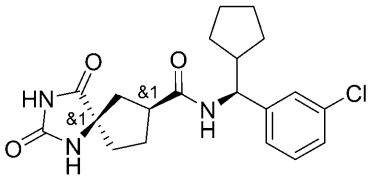
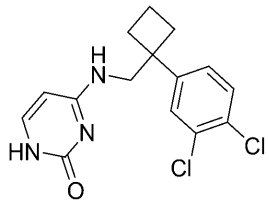
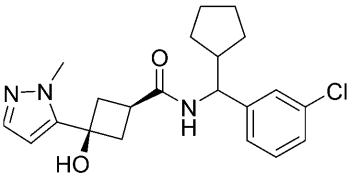
【表１－２４６】

I-1014		(400 MHz, メタノール-d4) 7.34 - 7.21 (m, 4H), 3.37 (s, 3H), 3.28 - 3.14 (m, 1H), 2.90 (ddt, J = 11.9, 8.4, 1.5 Hz, 2H), 2.77 - 2.65 (m, 1H), 2.52 - 2.38 (m, 2H), 2.20 - 2.05 (m, 1H), 1.96 - 1.75 (m, 5H).	362.1	D	
I-1015		(400 MHz, DMSO-d6) 7.76 (s, 1H), 7.33 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 - 7.18 (m, 2H), 7.15 (dt, J = 7.7, 1.4 Hz, 1H), 6.27 (s, 1H), 4.80 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 4.02 - 3.95 (m, 2H), 3.55 - 3.45 (m, 1H), 3.49 - 3.43 (m, 1H), 3.27 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 2.24 (ddd, J = 19.5, 11.9, 8.5 Hz, 4H), 2.13 - 1.98 (m, 1H), 1.79 (s, 1H).	331.05	E	
I-1016		(400 MHz, CDCN) 7.92 (br s, J = 6.9 Hz, 1H), 7.60 (br s, 1H), 7.46 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 9.0, 7.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 5.37 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 5.23 (ddd, J = 8.3, 8.3, 5.5 Hz, 1H), 5.04 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 4.30 - 4.20 (m, 1H), 3.78 - 3.61 (m, 2H), 3.17 - 3.05 (m, 1H), 2.78 - 2.67 (m, 1H), 2.00 (s, 1.5 H), 1.98 (s, 1.5 H), 1.86 - 1.73 (m, 3H), 1.36 - 1.17 (m, 3H), 0.83 - 0.71 (m, 1H), 0.50 - 0.36 (m, 2H), 0.17 - 0.05 (m, 2H). このバッチは、LCによると、約 9%の未知の不純物を含有する。CH3(アセチル)は 2 つのシングレットとして出現。	374.4	E	
I-1017				D	D

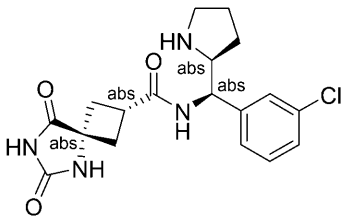
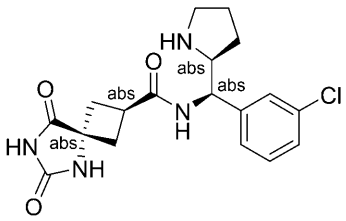
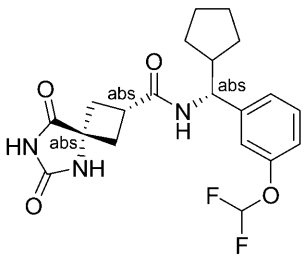
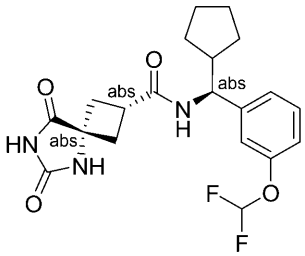
【表１－２４７】

I-1018				D	
I-1019				D	
I-1020			345.34	E	
I-1021			344.34	E	
I-1022			346.34	E	
I-1023			344.34	E	
I-1024			343.34	E	

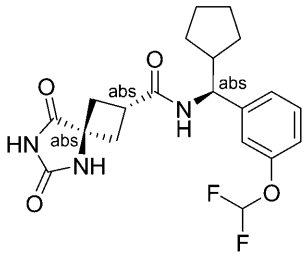
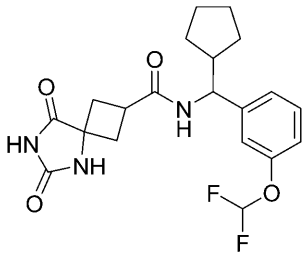
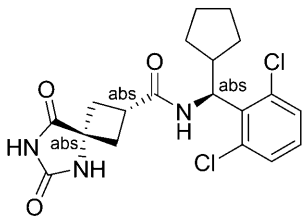
【表１－２４８】

I-1025				B	C
I-1026				E	
I-1027		(400 MHz, DMSO-d6) δ10.19 (br. d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.28 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 7.22 - 7.18 (m, 1H), 7.14 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 5.61 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.66 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 2.30 - 2.16 (m, 4H), 2.11 - 2.00 (m, 1H), 1.83 - 1.72 (m, 1H) ppm. 3.31ppm のピークは未同定の不純物。	324.2	D	
I-1028		(400 MHz, dmso) δ 8.22 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.72 - 7.63 (m, 1H), 7.35 - 7.18 (m, 5H), 6.26 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 4.55 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.16 - 4.07 (m, 1H), 3.76 (s, 3H), 2.59 - 2.51 (埋没した m, 2H), 2.45 - 2.27 (埋没した m, 3H), 2.14 - 2.03 (m, 1H), 1.71 - 1.30 (m, 5H), 1.13 - 1.01 (m, 2H). グリースの存在;約 8.2 にギ酸塩シグナル。	388.1	E	

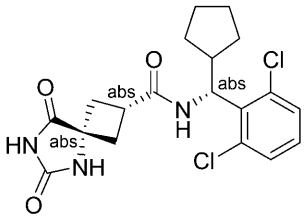
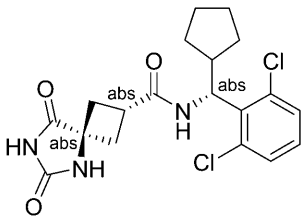
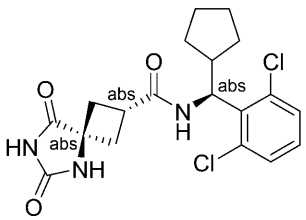
【表１－２４９】

I-1029		(400 MHz, dmso) δ 8.44 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.32 - 8.22 (m, 3H), 7.38 (s, 1H), 7.35 - 7.23 (m, 3H), 4.66 (t, J = 8.5 Hz, 1H), 3.27 (dd, J = 15.1, 7.4 Hz, 1H), 3.14 - 3.04 (m, 1H), 2.84 - 2.69 (m, 2H), 2.46 - 2.27 (m, 4H), 1.82 - 1.71 (m, 1H), 1.68 - 1.53 (m, 2H), 1.48 - 1.36 (m, 1H).	377	E	
I-1030		(400 MHz, dmso) δ 8.60 (s, 1H), 8.35 - 8.24 (m, 3H), 7.39 (s, 1H), 7.35 - 7.24 (m, 3H), 4.65 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.33 - 3.25 (m, 1H), 3.18 - 3.07 (m, 1H), 2.84 - 2.59 (m, 4H), 2.27 - 2.11 (m, 2H), 1.84 - 1.72 (m, 1H), 1.69 - 1.53 (m, 2H), 1.49 - 1.36 (m, 1H).	377	E	
I-1031		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.36 (dd, J = 16.5, 8.6 Hz, 1H), 7.23 - 6.97 (m, 4H), 4.60 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.49 - 2.41 (m, 2H), 2.41 - 2.30 (m, 2H), 2.14 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 1.74 - 1.64 (m, 1H), 1.56 (d, J = 4.7 Hz, 2H), 1.50 - 1.38 (m, 2H), 1.27 (dd, J = 12.3, 7.6 Hz, 2H), 1.11 (q, J = 10.7, 9.4 Hz, 1H).	408.05	E	
I-1032		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.53 - 7.24 (m, 1H), 7.24 - 6.91 (m, 4H), 4.60 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.16 - 2.92 (m, 1H), 2.49 - 2.33 (m, 2H), 2.32 - 2.23 (m, 2H),2.14 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.68 (s, 1H), 1.51 (d, J = 39.9 Hz, 4H), 1.27 (s, 2H), 1.10 (s, 1H).	408.15	E	

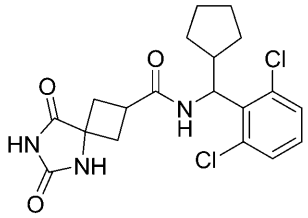
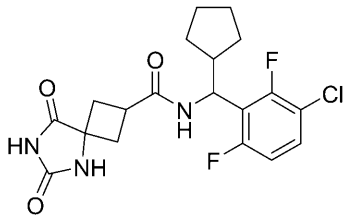
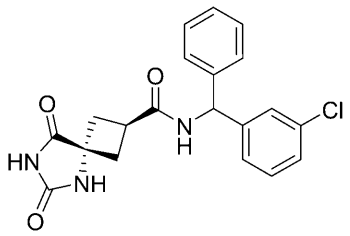
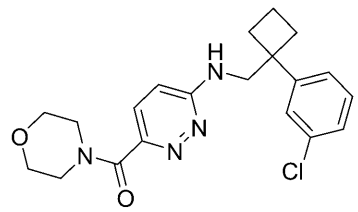
【表１－２５０】

I-1033		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.42 - 7.15 (m, 3H), 7.11 (s, 1H), 7.02 (t, J = 4.4 Hz, 1H), 4.59 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.66 (q, J = 11.6, 10.7 Hz, 2H), 2.20 (dt, J = 25.2, 9.8 Hz, 3H), 1.72 (s, 1H), 1.57 (s, 2H), 1.48 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 1.27 (d, J = 10.1 Hz, 2H), 1.12 (d, J = 8.9 Hz, 1H).	408.15	E	
I-1034		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.67 - 8.36 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.36 (ddd, J = 15.8, 8.6, 1.6 Hz, 1H), 7.23 - 6.95 (m, 4H), 4.60 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.11 (dt, J = 17.5, 8.6 Hz, 1H), 2.39 (dt, J = 30.4, 10.5 Hz, 4H), 2.15 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 1.77 - 1.37 (m, 5H), 1.28 (d, J = 10.2 Hz, 2H), 1.11 (d, J = 10.0 Hz, 1H).	408.2	E	
I-1035		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.41 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.38 (s, 2H), 7.24 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 5.19 (dd, J = 11.3, 6.6 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.77 - 2.65 (m, 2H), 2.43 - 2.31 (m, 3H), 2.21 (t, J = 10.2 Hz, 1H), 2.03 - 1.92 (m, 1H), 1.67 - 1.50 (m, 3H), 1.45 (td, J = 8.4, 7.2, 4.5 Hz, 1H), 1.32 - 1.16 (m, 2H), 1.10 (dq, J = 12.5, 8.0 Hz, 1H).	410	E	

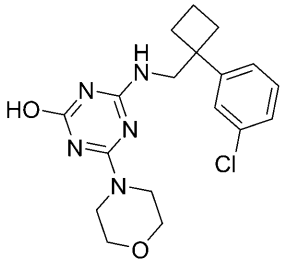
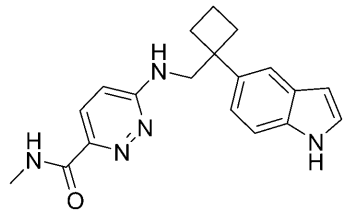
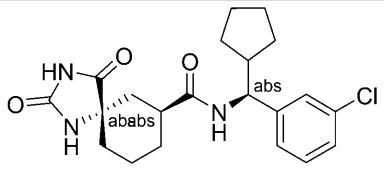
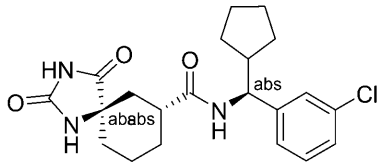
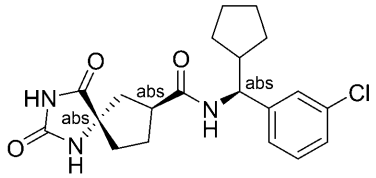
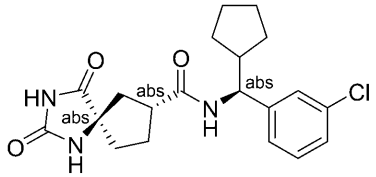
【表１－２５１】

I-1036		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.42 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.38 (s, 2H), 7.24 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 5.19 (dd, J = 11.2, 6.7 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.71 (dp, J = 10.0, 7.8 Hz, 1H), 2.39 (dd, J = 11.2, 8.6 Hz, 3H), 2.21 (td, J = 9.5, 2.4 Hz, 1H), 2.04 - 1.93 (m, 1H), 1.69 - 1.50 (m, 3H), 1.45 (ddt, J = 12.4, 7.8, 4.1 Hz, 1H), 1.33 - 1.16 (m, 2H), 1.10 (dq, J = 12.6, 8.1 Hz, 1H).	410.1	E	
I-1037		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.31 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 19.0 Hz, 2H), 7.25 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 5.21 (dd, J = 11.3, 6.8 Hz, 1H), 3.18 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.79 - 2.64 (m, 1H), 2.58 (dd, J = 11.8, 9.3 Hz, 2H), 2.18 (tdd, J = 15.0, 9.2, 4.1 Hz, 2H), 1.98 (dt, J = 12.3, 6.0 Hz, 1H), 1.69 - 1.38 (m, 4H), 1.35 - 1.16 (m, 2H), 1.16 - 1.07 (m, 1H).	410.25	E	
I-1038		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.31 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 20.1 Hz, 2H), 7.25 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.21 (dd, J = 11.3, 6.7 Hz, 1H), 3.17 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 3.08 (s, 1H), 2.79 - 2.63 (m, 2H), 2.63 - 2.54 (m, 2H), 2.25 - 2.11 (m, 2H), 1.99 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 1.58 (dt, J = 26.6, 7.8 Hz, 2H), 1.49 - 1.38 (m, 1H), 1.36 - 1.21 (m, 1H), 1.21 - 1.05 (m, 3H).	410.25	D	

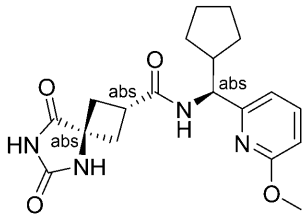
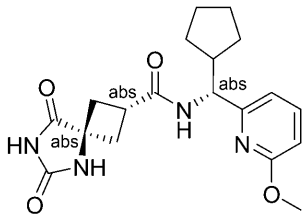
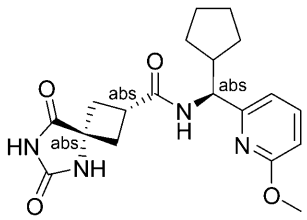
【表１－２５２】

I-1039		(400 MHz, DMSO-d6)10.56 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.61 - 8.19 (m, 2H), 7.38 (s, 2H), 7.24 (td, J = 8.0, 3.4 Hz, 1H), 5.20 (dt, J = 11.2, 7.4 Hz, 1H), 3.23 - 3.09 (m, 1H), 2.78 - 2.64 (m, 1H), 2.59 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 2.39 (dd, J = 11.2, 8.6 Hz, 2H), 2.26 - 2.12 (m, 1H), 1.97 (dd, J = 7.6, 4.7 Hz, 1H), 1.68 - 1.49 (m, 3H), 1.44 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 1.25 (td, J = 16.8, 14.8, 7.3 Hz, 2H), 1.10 (ddd, J = 12.8, 8.5, 4.9 Hz, 1H).	410.25	E	
I-1040		(400 MHz, DMSO-d6) 9.31 - 8.65 (S, 1H),8.61 - 8.53 (m, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.4 Hz, 1H), 3.18 - 3.05 (m, 1H), 2.45 - 2.33 (m, 4H), 2.29 - 2.12 (m, 1H), 1.88 (dt, J = 12.3, 6.2 Hz, 1H), 1.59 (s, 4H), 1.40 - 1.18 (m, 2H), 1.06 - 0.93 (m, 1H).	412.05	C	
I-1041				E	
I-1042			387.41	E	

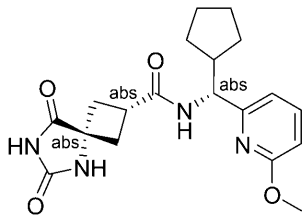
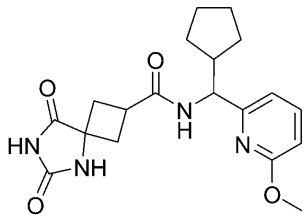
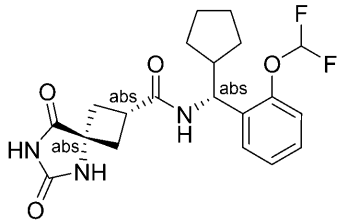
【表１－２５３】

I-1043			376.35	E	
I-1044			336.34	D	
I-1045				D	
I-1046				D	
I-1047				B	C
I-1048				B	C

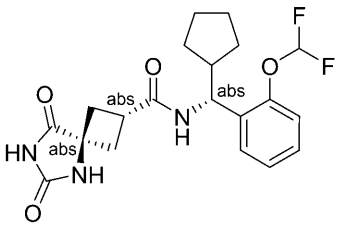
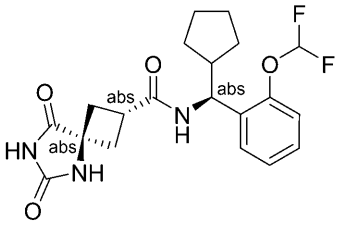
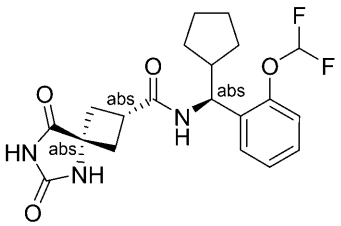
【表１－２５４】

I-1049		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.31 - 8.23 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 8.2, 7.3 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 6.64 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.68 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.24 - 3.11 (m, 1H), 2.49 - 2.25 (m, 5H), 1.68 - 1.50 (m, 3H), 1.45 (qd, J = 7.4, 6.1, 2.2 Hz, 2H), 1.39 - 1.26 (m, 2H), 1.21 (dq, J = 12.5, 7.5 Hz, 1H).	373.1	E	
I-1050		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.31 - 8.23 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 8.2, 7.3 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 6.67 -6.61 (m, 1H), 4.68 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.24 -3.11 (m, 1H), 2.49 - 2.25 (m, 5H), 1.69 - 1.50 (m, 3H), 1.45 (qd, J = 7.3, 6.2, 2.3 Hz, 2H), 1.41 - 1.29 (m, 2H), 1.21 (dd, J = 12.5, 7.5 Hz, 1H).	373.1	E	
I-1051		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.15 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.2, 7.3 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 6.68 - 6.61 (m, 1H), 4.68 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.19 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.76 - 2.61 (m, 2H), 2.39 - 2.24 (m, 1H), 2.27 -2.13 (m, 2H), 1.66 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 1.56 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 1.50- 1.40 (m, 2H), 1.39 - 1.29 (m, 2H), 1.26 - 1.17 (m, 1H).	373.35	E	

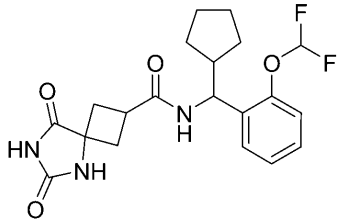
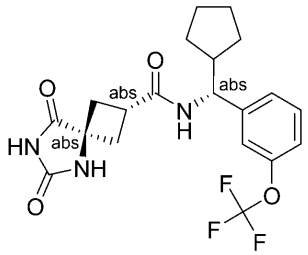
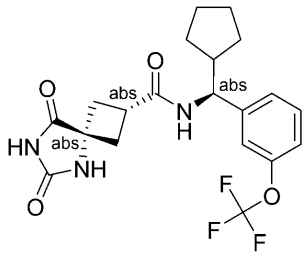
【表１－２５５】

I-1052		(400 MHz, DMSO-d6) 8.60 (s, 1H), 8.16 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.3, 7.3 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 6.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.68 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.19 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (td, J = 11.9, 9.1 Hz, 2H), 2.34 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 2.21 (dddd, J = 22.2, 12.9, 9.1, 4.2 Hz, 2H), 1.71 - 1.64 (m, 1H), 1.56 (td, J = 7.6, 3.8 Hz, 2H), 1.46 (td, J = 7.4, 4.0 Hz, 2H), 1.34 (dt, J = 11.9, 7.6 Hz, 2H), 1.31 - 1.15 (m, 1H).	373.1	E	
I-1053		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.78- 8.03 (m, 2H), 7.62 (ddd, J = 8.6, 7.2, 1.6 Hz, 1H), 6.89 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 6.64 (ddd, J = 8.2, 2.1, 0.7 Hz, 1H), 4.68 (td, J = 8.8, 1.6 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.19 (h, J = 8.8 Hz, 1H), 2.75 - 2.62 (m, 1H), 2.49-2.13 (m, 4H), 1.73 - 1.51 (m, 3H), 1.45 (dd, J = 7.3, 3.3 Hz, 2H), 1.39 -1.28 (m, 2H), 1.27-1.14 (m, 1H).	373.35	E	
I-1054		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.46 - 7.39 (m, 1H), 7.33 - 7.19 (m, 2H), 7.14 - 7.07 (m, 2H), 4.95 (dd, J = 9.6, 8.4 Hz, 1H), 3.09 (tt, J = 9.6, 8.2 Hz, 1H), 2.50 - 2.23 (m, 4H), 2.16 (h, J = 8.1 Hz, 1H), 1.72 (tt, J = 12.2, 6.1 Hz, 1H), 1.63 - 1.38 (m, 4H), 1.38 - 1.22 (m, 2H), 1.14 (s, 1H),	408.05	E	

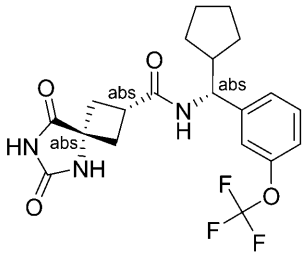
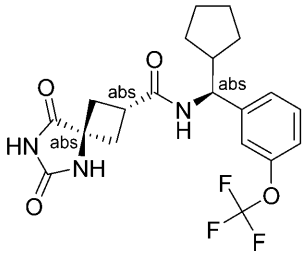
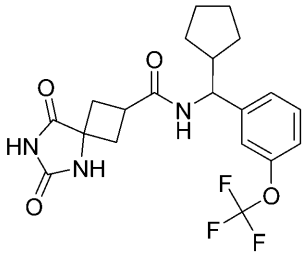
【表１－２５６】

I-1055		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.46 - 7.39 (m, 1H), 7.33 - 7.19 (m, 3H), 7.10 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.95 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.49 - 2.23 (m, 4H), 2.16 (h, J = 8.1 Hz, 1H), 1.80 - 1.65 (m, 1H), 1.62 - 1.40 (m, 4H), 1.38 - 1.22 (m, 2H), 1.14 - 1.05 (m, 1H).	408.05	E	
I-1056		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.48 - 7.38 (m, 1H), 7.38 - 7.19 (m, 3H), 7.11 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 4.99 - 4.90 (m, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.64 (ddd, J = 27.5, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.27 - 2.06 (m, 3H), 1.82 - 1.69 (m, 1H), 1.62 - 1.39 (m, 4H), 1.38 - 1.21 (m, 2H), 1.08 (dq, J = 15.7, 8.0 Hz, 1H).	408.05	D	
I-1057		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.48 - 7.38 (m, 1H), 7.33 - 7.19 (m, 3H), 7.11 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 4.94 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.64 (ddd, J = 27.5, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.18 (ddt, J = 27.2, 11.9, 6.6 Hz, 3H), 1.73 (s, 1H), 1.59 (s, 4H), 1.52 - 1.39 (m, 1H), 1.38 - 1.21 (m, 1H), 1.15 - 1.03 (m, 1H).	408.05	E	

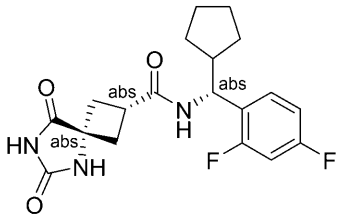
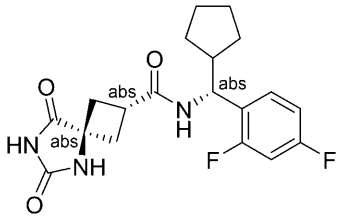
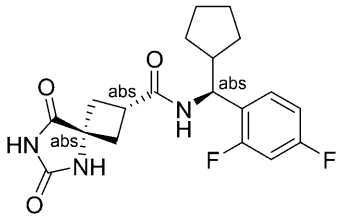
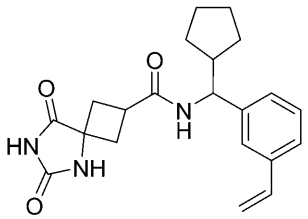
【表１－２５７】

I-1058		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.48 - 7.38 (m, 1H), 7.33 - 7.19 (m, 3H), 7.11 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.95 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.17 - 3.02 (m, 1H), 2.47 - 2.19 (m, 3H), 2.17 - 2.06 (m, 1H), 1.82 - 1.22 (m, 8H), 1.07 (dd, J = 12.7, 7.7 Hz, 1H).	408.15	E	
I-1059		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.47 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.30-8.25 (m, 1H), 7.43 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.35-7.27 (m, 2H), 7.20 (ddt, J = 8.1, 2.4, 1.1 Hz, 1H), 4.64 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.16-3.03 (m, 1H), 2.48-2.26 (m, 4H), 2.12 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 1.68 (dd, J = 12.0, 7.3 Hz, 1H), 1.62-1.50 (m, 2H), 1.49-1.36 (m, 2H), 1.28 (d, J = 14.2 Hz, 2H), 1.17-1.06 (m, 1H).	426.1	E	
I-1060		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.47 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.43 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.35-7.31 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.24-7.17 (m, 1H), 4.64 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.48-2.26 (m, 4H), 2.13 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 1.68 (dd, J = 12.1, 7.3 Hz, 1H), 1.56 (s, 2H), 1.46 (dt, J = 12.7, 6.7 Hz, 2H), 1.28 (d, J = 14.1 Hz, 2H), 1.18-1.02 (m, 1H).	426.05	E	

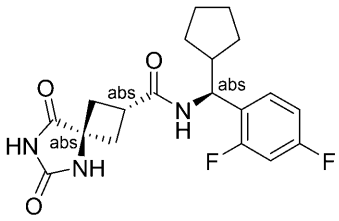
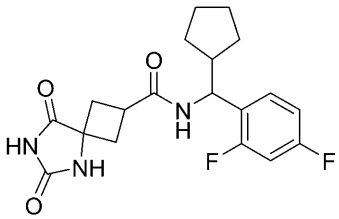
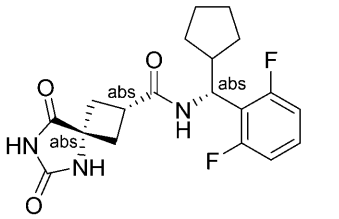
【表１－２５８】

I-1061		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.37-7.27 (m, 2H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 4.63 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 21.9, 12.1, 9.2 Hz, 2H), 2.28-2.09 (m, 3H), 1.72 (dt, J = 12.3, 5.8 Hz, 1H), 1.63-1.39 (m, 4H), 1.30 (dd, J = 17.4, 10.0 Hz, 2H), 1.18-1.04 (m, 1H).	426.1	E	
I-1062		(400 MHz, DMSO-d6)10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.36-7.27 (m, 2H), 7.24-7.17 (m, 1H), 4.63 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 21.9, 12.1, 9.2 Hz, 2H), 2.28-2.09 (m, 3H), 1.72 (s, 1H), 1.64-1.52 (m, 2H), 1.54-1.39 (m, 2H), 1.29 (dt, J = 18.7, 7.1 Hz, 2H), 1.18-1.06 (m, 1H)	426.05	D	
I-1063		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62-8.23 (m, 2H), 7.44 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.37-7.26 (m, 2H), 7.24-7.17 (m, 1H), 4.63 (td, J = 9.2, 4.1 Hz, 1H), 3.10 (dq, J = 17.6, 9.0 Hz, 1H), 2.78-2.58 (m, 1H), 2.48-2.33 (m, 2H), 2.32-2.06 (m, 2H), 1.76-1.65 (m, 1H), 1.64-1.50 (m, 2H), 1.49-1.37 (m, 2H), 1.36-1.22 (m, 2H), 1.12 (dd, J = 18.6, 9.4 Hz, 1H).	426.1	E	

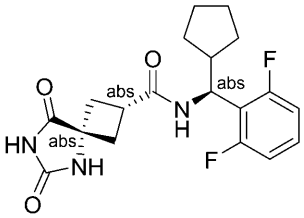
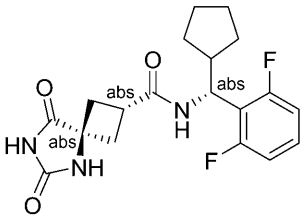
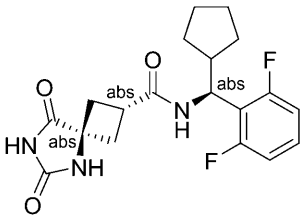
【表１－２５９】

I-1064		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.30 - 8.25 (m, 1H), 7.55 - 7.29 (m, 1H), 7.20 - 6.81 (m, 2H), 4.87 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.09 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.47-2.24 (m, 4H), 2.17 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 1.72 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 1.64 - 1.42 (m, 4H), 1.33 - 1.26 (m, 2H), 1.07 (d, J = 11.0 Hz, 1H).	378.05	E	
I-1065		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.43 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 7.12-7.03 (m, 1H), 4.86 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.47 - 2.24 (m, 4H), 2.18 (dt, J = 16.8, 8.2 Hz, 1H), 1.75 - 1.68 (m, 1H), 1.65 -1.37 (m, 4H), 1.37 -1.21 (m, 2H), 1.05 (p, J = 7.8 Hz, 1H).	378.05	E	
I-1066		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.45 (td, J = 8.6, 6.6 Hz, 1H), 7.15 (ddd, J = 10.5, 9.4, 2.6 Hz, 1H), 7.07 (td, J = 8.6, 2.7 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 10.2, 8.4 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 23.8, 12.1, 9.1 Hz, 2H), 2.28 - 2.09 (m, 3H), 1.80 -1.69 (m, 1H), 1.64 - 1.38 (m, 4H), 1.38 - 1.23 (m, 2H), 1.05 (dq, J = 22.2, 7.4, 6.7 Hz, 1H).	378.05	E	
I-1067			368	E	

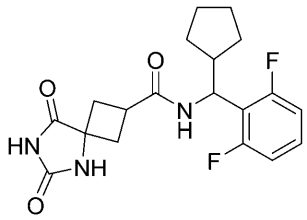
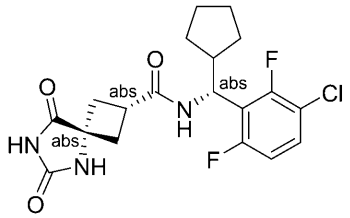
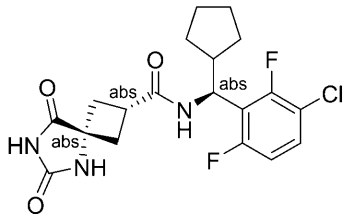
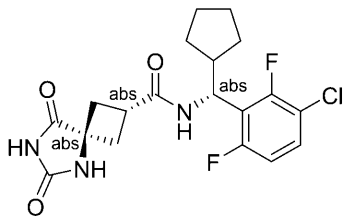
【表１－２６０】

I-1068		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.44 (td, J = 8.5, 6.6 Hz, 1H), 7.15 (ddd, J = 10.5, 9.4, 2.6 Hz, 1H), 7.11 - 7.02 (m, 1H), 4.85 (dd, J = 10.2, 8.5 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.64 (ddd, J = 23.8, 12.1, 9.2 Hz, 2H), 2.28- 2.09 (m, 3H), 1.80 - 1.68 (m, 1H), 1.66 - 1.38 (m, 4H), 1.38- 1.24 (m, 2H), 1.06 (dd, J = 12.7, 7.9 Hz, 1H).	378.05	C	
I-1069		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.63 - 8.04 (m, 2H), 7.50 - 7.37 (m, 1H), 7.18 - 7.11 (m, 1H), 7.08 (td, J = 8.6, 2.6 Hz, 1H), 4.86 (td, J = 9.7, 4.9 Hz, 1H), 3.16 - 3.01 (m, 1H), 2.74- 2.59 (m, 1H), 2.46 - 2.33 (m, 2H), 2.30 - 2.06 (m, 2H), 1.72 (td, J = 11.7, 7.2 Hz, 1H), 1.65 -1.38 (m, 4H), 1.29 (p, J = 7.7, 7.1 Hz, 2H), 1.05 (dd, J = 12.7, 7.6 Hz, 1H).	378.05	D	
I-1070		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.35 - 7.25 (m, 1H), 7.07- 6.97 (m, 2H), 4.87 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 3.11 (q, J = 8.8 Hz, 1H), 2.46 - 2.30 (m, 4H), 2.25 (t, J = 10.3 Hz, 1H), 1.86 (s, 1H), 1.65 - 1.40 (m, 4H), 1.27 (d, J = 22.8 Hz, 2H), 1.03 (d, J = 9.0 Hz, 1H).	378.25	E	

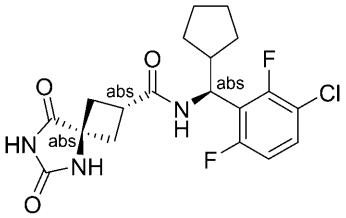
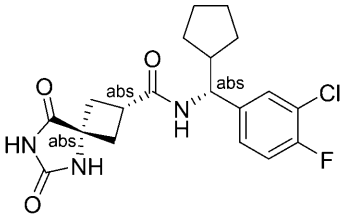
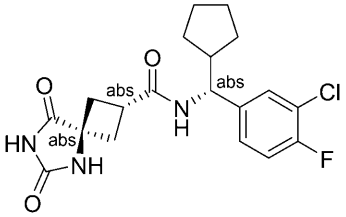
【表１－２６１】

I-1071		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.36 -7.24 (m, 1H), 7.02 (t, J = 8.5 Hz, 2H), 4.87 (dd, J = 10.9, 7.8 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.4 Hz, 1H), 2.40 (dd, J = 11.0, 6.1 Hz, 3H), 2.35 (s, 1H), 2.25 (t, J = 10.3 Hz, 1H), 1.92 - 1.80 (m, 1H), 1.52 (ddt, J = 31.7, 16.2, 6.8 Hz, 4H), 1.37 - 1.26 (m, 2H), 1.01 (t, J = 10.0 Hz, 1H).	378.25	E	
I-1072		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.34 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.32 (ddd, J = 14.8, 8.4, 6.4 Hz, 1H), 7.03 (t, J = 8.5 Hz, 2H), 4.87 (dd, J = 11.1, 7.7 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70 - 2.58 (m, 2H), 2.25-2.16 (m, 1H), 2.17 -2.08 (m, 1H), 1.87 (dt, J = 12.7, 6.1 Hz, 1H), 1.54 (ddd, J = 32.5, 17.5, 8.4 Hz, 4H), 1.30 (dq, J = 18.5, 6.3, 5.7 Hz, 2H), 1.02 (dd, J = 12.7, 7.6 Hz, 1H).	378.3	E	
I-1073		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.34 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.36 - 7.27 (m, 1H), 7.03 (t, J = 8.5 Hz, 2H), 4.89 - 4.83 (m, 1H), 3.15 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.70 - 2.61 (m, 2H), 2.22 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 2.17 - 2.09 (m, 1H), 1.93 - 1.82 (m, 1H), 1.66 - 1.41 (m, 4H), 1.31 (ddd, J = 18.1, 12.3, 6.2 Hz, 2H), 1.03 (s, 1H).	378.15	D	

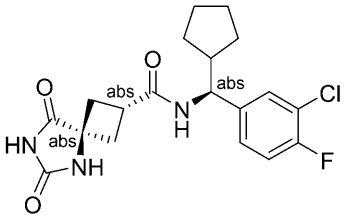
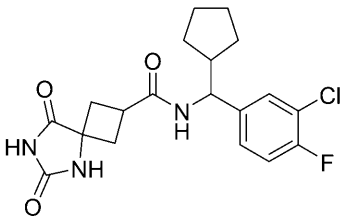
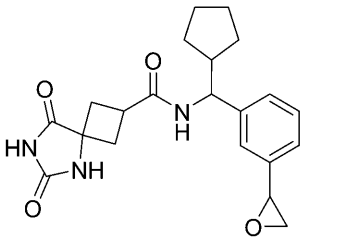
【表１－２６２】

I-1074		(400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.61 - 8.23 (m, 2H), 7.31 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 7.03 (t, J = 8.4 Hz, 2H), 4.87 (dd, J = 11.0, 7.7 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 10.5, 9.9 Hz, 1H), 2.69 - 2.63 (m, 1H), 2.40 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 2.29 - 2.03 (m, 2H), 1.88 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.66 - 1.41 (m, 4H), 1.36 - 1.18 (m, 2H), 1.02 (s, 1H).	378.3	D	
I-1075		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.56 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.5 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.48 - 2.36 (m, 4H), 2.24 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 1.88 (s, 1H), 1.63 - 1.45 (m, 4H), 1.40 - 1.28 (m, 1H), 1.25 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 1.04 - 0.95 (m, 1H).	412	E	
I-1076		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.56 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.5 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.45 - 2.31 (m, 4H), 2.24 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 1.94 - 1.85 (m, 1H), 1.59 (s, 4H), 1.38 - 1.28 (m, 1H), 1.25 (q, J = 7.0, 6.4 Hz, 1H), 1.00 (s, 1H).	412	D	
I-1077		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.46 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.58 - 7.48 (m, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.70 - 2.54 (m, 2H), 2.43 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.21 (s, 1H), 2.14 (s, 1H), 1.90 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 1.63 - 1.45 (m, 4H), 1.37 - 1.22 (m, 2H), 1.01 (s, 1H).	412	D	

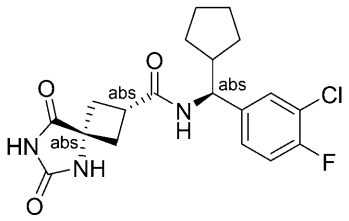
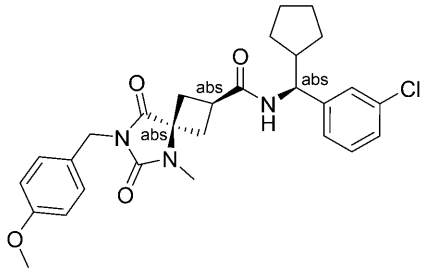
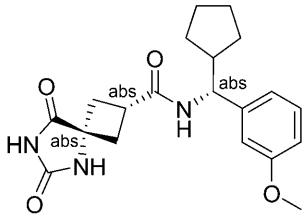
【表１－２６３】

I-1078		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.46 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.53 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.2, 7.5 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.70 - 2.54 (m, 2H), 2.43 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 2.20 (dd, J = 19.2, 7.1 Hz, 1H), 2.14 (s, 1H), 1.90 (s, 1H), 1.60 (s, 3H), 1.58 - 1.49 (m, 1H), 1.37 - 1.22 (m, 2H), 1.01 (s, 1H).	412	A	B
I-1079		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.51 (dd, J = 7.2, 1.9 Hz, 1H), 7.40 - 7.24 (m, 2H), 4.58 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.47 - 2.27 (m, 3H), 2.12 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 1.68 (dd, J = 12.0, 6.8 Hz, 1H), 1.56 (s, 2H), 1.45 (dq, J = 14.4, 8.4, 8.0 Hz, 1H), 1.25 (s, 2H), 1.08 (dd, J = 13.0, 7.9 Hz, 1H).	394	E	
I-1080		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.52 (dd, J = 7.3, 2.0 Hz, 1H), 7.38 - 7.27 (m, 2H), 4.61 - 4.51 (m, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 15.9, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.28 - 2.09 (m, 3H), 1.77 - 1.67 (m, 1H), 1.64 - 1.37 (m, 4H), 1.27 (dd, J = 12.5, 7.6 Hz, 2H), 1.15 - 1.01 (m, 1H).	394	E	

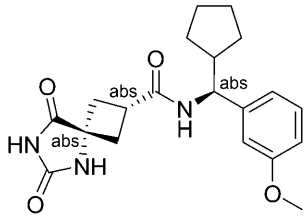
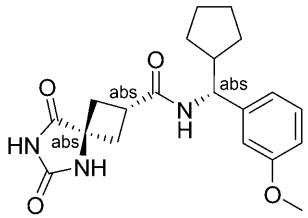
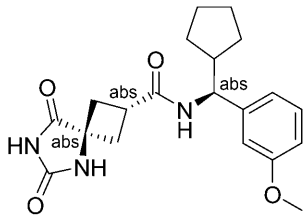
【表１－２６４】

I-1081		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.52 (dd, J = 7.2, 2.1 Hz, 1H), 7.40 - 7.26 (m, 2H), 4.57 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.65 (dt, J = 15.7, 10.8 Hz, 2H), 2.29 - 2.08 (m, 3H), 1.77 - 1.67 (m, 1H), 1.58 (s, 2H), 1.51 - 1.37 (m, 2H), 1.33 - 1.20 (m, 2H), 1.14 - 1.00 (m, 1H).	394	C	C
I-1082		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.64 - 8.22 (m, 2H), 7.51 (ddd, J = 7.3, 3.3, 2.0 Hz, 1H), 7.40 - 7.25 (m, 2H), 4.57 (td, J = 9.2, 3.9 Hz, 1H), 3.09 (dp, J = 17.5, 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 15.9, 12.1, 9.1 Hz, 1H), 2.48 - 2.27 (m, 2H), 2.26 - 2.06 (m, 2H), 1.71 (dd, J = 10.4, 6.1 Hz, 1H), 1.62 - 1.52 (m, 2H), 1.47 (dd, J = 16.2, 8.8 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 11.6 Hz, 2H), 1.08 (dq, J = 16.5, 8.0 Hz, 1H).	394.1	D	
I-1083		δ 10.41 (br s, 1H), 8.62 (s, 0.4H), 8.42 (br d, J = 8.3 Hz, 0.6H), 8.33 - 8.25 (m, 1H), 7.32 - 7.18 (m, 3H), 7.16 - 7.10 (m, 1H), 4.56 (dd, J = 16.5, 8.3 Hz, 1H), 3.89 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.13 - 3.08 (m, 1H), 3.17 - 3.01 (埋没した m, 1H), 2.82 (dd, J = 5.4, 2.5 Hz, 1H), 2.71 - 2.58 (m, 0.6H), 2.47 - 2.26 (m, 3.4H), 2.25 - 2.06 (m, 1H), 1.77 - 1.61 (m, 1H), 1.61 - 1.35 (m, 4H), 1.34 - 1.19 (m, 2H), 1.14 - 0.96 (m, 1H). ジアステレオマーの約 3:2 の混合物。微量の脂肪族不純物	384	E	

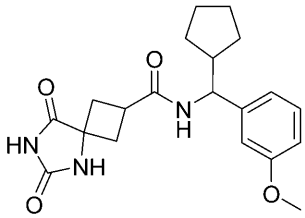
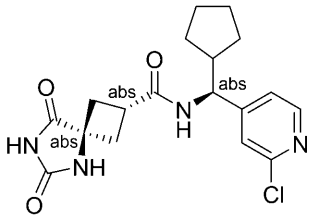
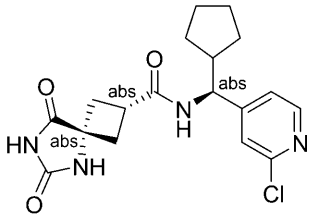
【表１－２６５】

I-1084		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.51 (dd, J = 7.3, 2.0 Hz, 1H), 7.40 - 7.25 (m, 2H), 4.58 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.48 - 2.27 (m, 4H), 2.11 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 1.68 (dd, J = 12.1, 7.3 Hz, 1H), 1.63 - 1.37 (m, 4H), 1.25 (s, 2H), 1.15 - 1.02 (m, 1H).	394.05	E	
I-1085				E	
I-1086		(400 MHz, DMSO-d6)10.59 (s, 1H), 8.36 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.20 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.95-6.82 (m, 2H), 6.77 (ddd, J = 8.2, 2.6, 1.0 Hz, 1H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.74 (s, 3H), 3.16-2.99 (m, 1H), 2.47-2.26 (m, 4H), 2.14 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 1.75-1.60 (m, 2H), 1.53 (d, J = 25.1 Hz, 2H), 1.47 (s, 2H), 1.28 (dt, J = 11.9, 7.5 Hz, 2H), 1.09 (dq, J = 15.7, 7.8 Hz, 1H).	372.1	E	

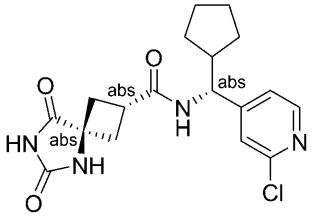
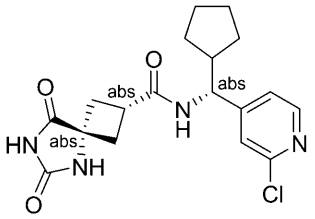
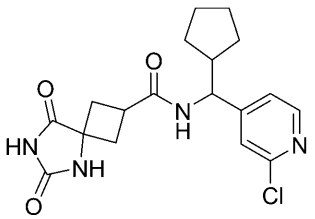
【表１－２６６】

I-1087		(400 MHz, DMSO-d6)10.59 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.20 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.93-6.82 (m, 2H), 6.77 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.56 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.74 (d, J = 2.2 Hz, 3H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.39 (dt, J = 29.4, 10.1 Hz, 4H), 2.14 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 1.67 (s, 1H), 1.56 (s, 2H), 1.46 (dd, J = 15.2, 8.3 Hz, 2H), 1.28 (d, J = 12.8 Hz, 2H), 1.11 (d, J = 10.0 Hz, 1H).	372.1	E	
I-1088		(400 MHz, DMSO-d6)10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.92-6.83 (m, 2H), 6.83-6.69 (m, 1H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 16.8, 12.1, 9.2 Hz, 2H), 2.31-2.06 (m, 3H), 1.70 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 1.64-1.35 (m,4H), 1.36-1.20 (m, 2H), 1.10 (dq, J = 16.1, 7.9 Hz, 1H).	372.1	E	
I-1089		(400 MHz, DMSO-d6)10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.91-6.83 (m, 2H), 6.77 (dd, J = 8.7, 2.5 Hz, 1H), 4.55 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 3.12 (p, J = 9.3 Hz, 1H), 2.66 (dt, J = 16.6, 10.3 Hz, 2H), 2.29-2.05 (m, 3H), 1.78-1.64 (m, 1H), 1.65-1.35 (m, 4H), 1.27 (dd, J = 18.0, 9.1 Hz, 2H), 1.11 (q, J = 10.8, 9.7 Hz, 1H).	372.1	E	

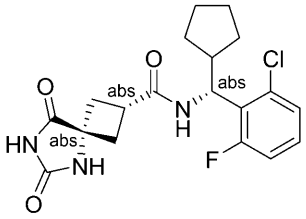
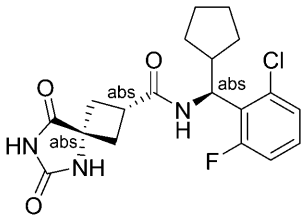
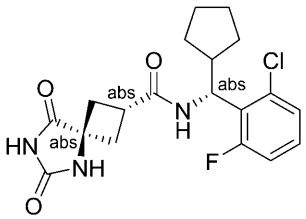
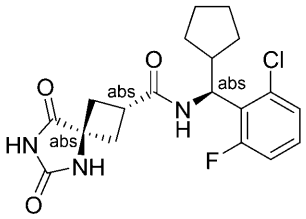
【表１－２６７】

I-1090		(400 MHz, DMSO-d6)10.57 (s, 1H), 8.77-8.07 (m, 2H), 7.20 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.77 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.55 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 3.74 (s, 3H), 3.10 (dt, J = 15.9, 8.8 Hz, 1H), 2.80-2.58 (m, 1H), 2.42 (t, J = 10.5 Hz, 1H), 2.35 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 2.27-2.06 (m, 2H), 1.68 (s, 1H), 1.56 (s,2H), 1.46 (s, 2H), 1.33-1.21 (m, 2H), 1.10 (s, 1H).	372.1	E	
I-1091		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.34 (dd, J = 5.2, 1.4 Hz, 1H), 4.63 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.10 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.46 - 2.26 (m, 3H), 2.13 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 1.69 (s, 1H), 1.57 (s, 2H), 1.47 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 1.26 (d, J = 16.4 Hz, 2H), 1.15 (d, J = 9.4 Hz, 1H).	377.1	E	
I-1092		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.36 - 7.32 (m, 1H), 4.63 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.12 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.44 - 2.26 (m, 3H), 2.13 (q, J = 8.5 Hz, 2H), 1.69 (s, 1H), 1.58 (s, 2H), 1.47 (d, J = 10.3 Hz, 2H), 1.26 (d, J = 16.2 Hz, 2H), 1.15 (d, J = 8.0 Hz, 1H).	377.15	E	

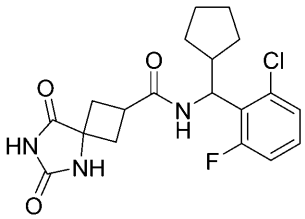
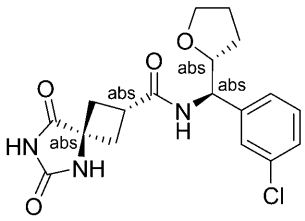
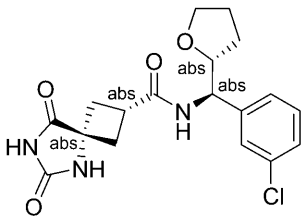
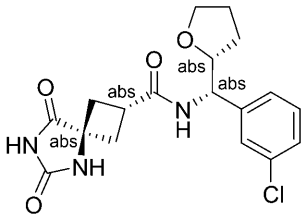
【表１－２６８】

I-1093		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.38 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.35 (dd, J = 5.2, 1.5 Hz, 1H), 4.61 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.66 (dt, J = 13.5, 10.1 Hz, 2H), 2.20 (dq, J = 26.3, 8.7, 8.2 Hz, 3H), 1.84 - 1.64 (m, 1H), 1.56 (d, J = 20.0 Hz, 2H), 1.48 (dd, J = 14.8, 8.0 Hz, 2H), 1.27 (d, J = 11.4 Hz, 2H), 1.15 (q, J = 11.4, 9.9 Hz, 1H).	377.1	E	
I-1094		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.38 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.35 (dd, J = 5.2, 1.5 Hz, 1H), 4.61 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.66 (dd, J = 23.5, 12.2 Hz, 2H), 2.36 - 2.05 (m, 3H), 1.73 (s, 1H), 1.56 (d, J = 19.6 Hz, 2H), 1.52 - 1.39 (m, 2H), 1.28 (s, 2H), 1.15 (d, J = 10.2 Hz, 1H).	377.25	E	
I-1095		(400 MHz, DMSO-d6) 10.30 (s, 1H), 8.76 - 8.16 (m, 3H), 7.45 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 7.34 (td, J = 4.5, 3.9, 1.4 Hz, 1H), 4.62 (td, J = 9.0, 4.6 Hz, 1H), 3.23 - 3.05 (m, 1H), 2.75 - 2.59 (m, 1H), 2.47 - 2.31 (m, 1H), 2.28 - 2.09 (m, 3H), 1.84 - 1.64 (m, 1H), 1.64 - 1.53 (m, 2H), 1.48 (q, J = 7.1, 6.5 Hz, 2H), 1.27 (q, J = 7.1, 5.4 Hz, 2H), 1.14 (t, J = 10.5 Hz, 1H).	377.25	E	

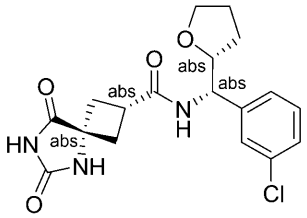
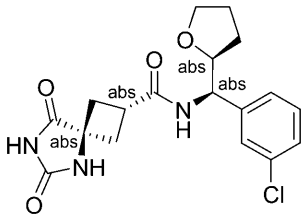
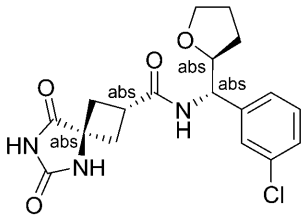
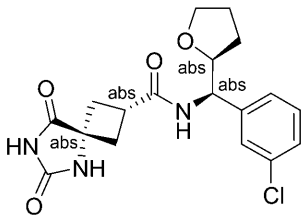
【表１－２６９】

I-1096		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.34 - 7.22 (m, 2H), 7.21 - 7.12 (m, 1H), 5.21 - 4.91 (m, 1H), 3.13 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.37 (dd, J = 21.4, 8.8 Hz, 4H), 2.23 (t, J = 10.3 Hz, 1H), 1.89 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 1.70 - 1.37 (m, 4H), 1.27 (dd, J = 12.8, 6.3 Hz, 2H), 1.08 (dd, J = 12.6, 7.9 Hz, 1H).	394.15	E	
I-1097		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.34 - 7.23 (m, 2H), 7.16 (ddd, J = 9.7, 8.0, 1.6 Hz, 1H), 5.10 - 5.00 (m, 1H), 3.13 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 2.48 - 2.31 (m, 3H), 2.23 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 2.00 - 1.81 (m, 1H), 1.68 - 1.40 (m, 4H), 1.34 - 1.20 (m, 3H), 1.08 (t, J = 10.2 Hz, 1H).	394.25	E	
I-1098		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.31 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.33 - 7.23 (m, 2H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 5.18 - 4.94 (m, 1H), 3.17 (q, J = 9.2 Hz, 1H), 2.76 - 2.55 (m, 2H), 2.39 - 2.08 (m, 2H), 1.99 - 1.81 (m, 1H), 1.72 - 1.40 (m, 5H), 1.28 (dt, J = 14.7, 7.6 Hz, 2H), 1.11 (d, J = 9.3 Hz, 1H).	394.2	E	
I-1099		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.31 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.27 (dt, J = 10.4, 6.5 Hz, 2H), 7.21 - 7.11 (m, 1H), 5.12 - 4.98 (m, 1H), 3.23 - 3.07 (m, 1H), 2.74 - 2.58 (m, 2H), 2.30 - 2.05 (m, 2H), 1.93 (d, J = 25.3 Hz, 1H), 1.71 - 1.43 (m, 5H), 1.35 - 1.23 (m, 2H), 1.09 (s, 1H).	394.15	D	

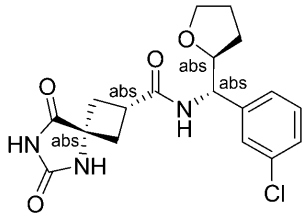
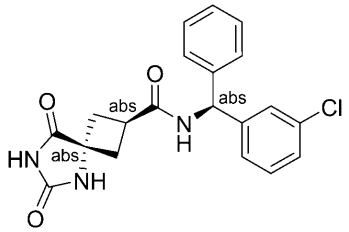
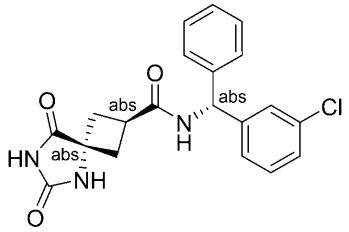
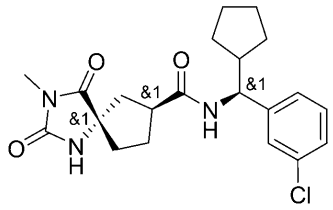
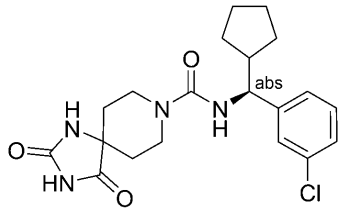
【表１－２７０】

I-1100		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.65 - 8.20 (m, 2H), 7.34 - 7.22 (m, 2H), 7.20 - 7.06 (m, 1H), 5.16 - 4.94 (m, 1H), 3.15 (dt, J = 11.4, 8.8 Hz, 1H), 2.72 - 2.55 (m, 1H), 2.45 - 2.31 (m, 2H), 2.28 - 2.08 (m, 2H), 1.99 - 1.82 (m, 1H), 1.70 - 1.40 (m, 4H), 1.27 (dd, J = 13.6, 6.5 Hz, 2H), 1.13 - 0.98 (m, 1H).	394.25	E	
I-1101		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.45 -7.26 (m, 4H), 4.89 (dd, J = 9.1, 5.3 Hz, 1H), 4.02 - 3.95 (m, 1H), 3.75 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 3.61 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.25- 3.15 (m, 1H), 2.38 (dt, J = 27.8, 10.4 Hz, 4H), 1.73 (dq, J = 12.7, 6.8 Hz, 3H), 1.49 (s, 1H).	378.2	E	
I-1102		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.40 - 7.20 (m, 3H), 4.90 (dd, J = 8.8, 5.4 Hz, 1H), 4.06 - 3.98 (m, 1H), 3.80 - 3.72 (m, 1H), 3.62 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.22 (q, J = 9.2 Hz, 1H), 2.73 - 2.61 (m, 2H), 2.29 -2.15 (m, 2H), 1.75 (tq, J = 13.0, 6.4, 5.8 Hz, 3H), 1.55 -1.44 (m, 1H).	378.2	E	
I-1103		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.50 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.39 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.36 - 7.23 (m, 3H), 4.80 - 4.72 (m, 1H), 3.96 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.70 (dt, J = 8.2, 6.7 Hz, 1H), 3.60 (dt, J = 8.2, 6.7 Hz, 1H), 3.17 -3.07 (m, 1H), 2.47- 2.30 (m, 4H), 1.88 (dq, J = 13.4, 6.8 Hz, 1H), 1.75 (p, J = 6.8 Hz, 2H), 1.59 (dq, J = 14.4, 7.2 Hz, 1H).	378.2	E	

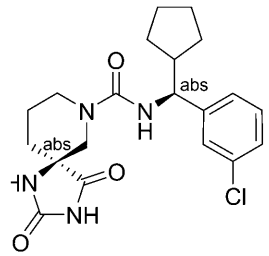
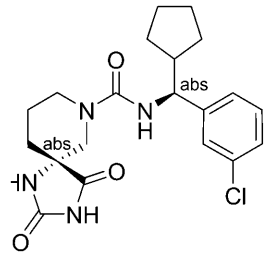
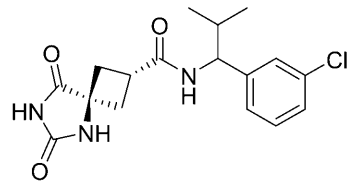
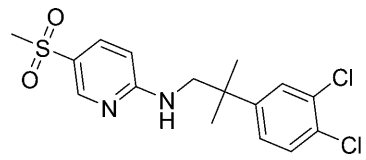
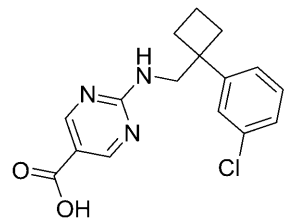
【表１－２７１】

I-1104		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.37 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.36 -7.25 (m, 3H), 4.76 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 4.00 (dt, J = 8.0, 6.7 Hz, 1H), 3.71 (dt, J = 8.1, 6.7 Hz, 1H), 3.61 (dt, J = 8.1, 6.7 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73- 2.62 (m, 2H), 2.28 - 2.12 (m, 2H), 1.91 (dq, J = 11.9, 6.8 Hz, 1H), 1.80- 1.71 (m, 2H), 1.66-1.56 (m, 1H).	378.2	E	
I-1105		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.43 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38- 7.25 (m, 3H), 4.89 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 1H), 3.99 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.76 (dt, J = 8.2, 6.4 Hz, 1H), 3.64- 3.56 (m, 1H), 3.25- 3.14 (m, 1H), 2.48 - 2.30 (m, 4H), 1.79 - 1.67 (m, 3H), 1.54 - 1.42 (m, 1H).	378.2	E	
I-1106		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.50 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.36- 7.25 (m, 3H), 4.77 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 3.96 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.75- 3.66 (m, 1H), 3.60 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.48 - 2.30 (m, 4H), 1.88 (dq, J = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.75 (p, J = 6.8 Hz, 2H), 1.59 (dq, J = 14.3, 7.2 Hz, 1H).	378.2	E	
I-1107		(400 MHz, DMSO-d6) 10.51 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.39 - 7.23 (m, 3H), 4.90 (dd, J = 8.9, 5.4 Hz, 1H), 4.06-3.98 (m, 1H), 3.77 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.62 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.23 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.75 -2.61 (m, 2H), 2.29 - 2.13 (m, 2H), 1.75 (q, J = 9.3, 6.7 Hz, 3H), 1.51 (d, J = 10.2 Hz, 1H).	378.2	E	

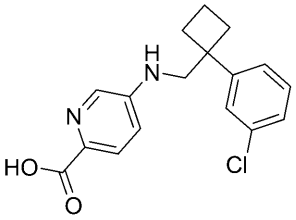
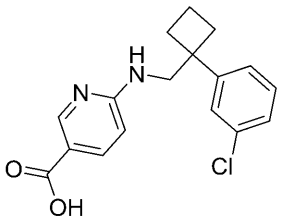
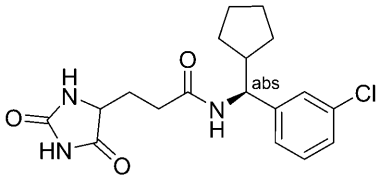
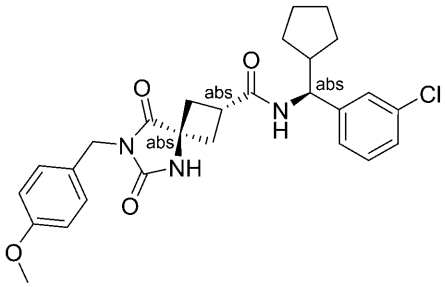
【表１－２７２】

I-1108		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.44-7.20 (m, 4H), 4.76 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.76 - 3.66 (m, 1H), 3.61 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.67 (td, J = 12.5, 8.8 Hz, 2H), 2.29 - 2.11 (m, 2H), 1.91 (dq, J = 13.3, 6.6 Hz, 1H), 1.75 (p, J = 6.9 Hz, 2H), 1.61 (dq, J = 14.4, 7.3 Hz, 1H).	378.2	E	
I-1109				E	
I-1110				E	
I-1111				C	D
I-1112				D	

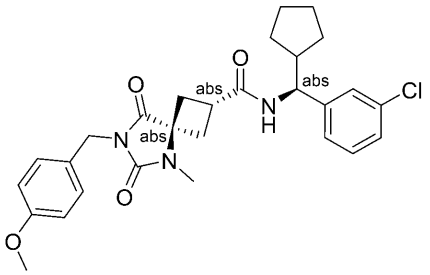
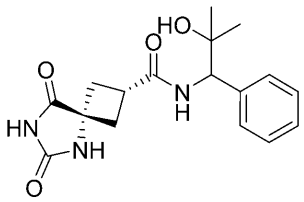
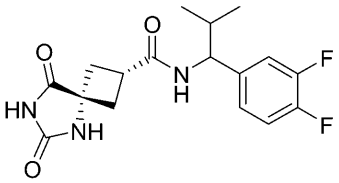
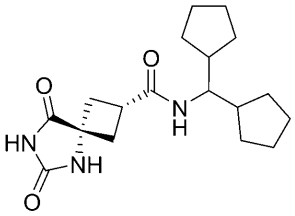
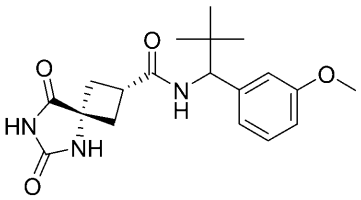
【表１－２７３】

I-1113				E	
I-1114				E	
I-1115			350.35	D	
I-1116		(400 MHz, DMSO-d6) δ 8.33 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.0, 2.5 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.33 (br. t, J = 6.1 Hz, 1H), 6.61 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.62 (br. d, J = 3.8 Hz, 2H), 3.10 (s, 3H), 1.31 (s, 6H).	373.2	E	
I-1117		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.56 (重複する br s, 1H), 8.48 (重複する br s, 1H), 7.80 (br. t, J = 5.9 Hz, 1H), 7.24 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.15 (埋没した d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.14 (重複する s, 1H), 7.08 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 3.72 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.40 - 2.28 (m, 2H), 2.21 (dd, J = 19.9, 9.4 Hz, 2H), 2.13 - 1.95 (m, 1H), 1.87 - 1.70 (m, 1H). 微量の脂肪族不純物。	318	E	

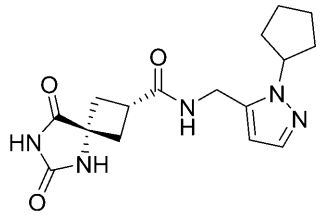
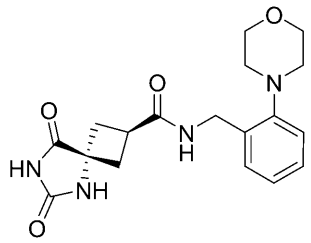
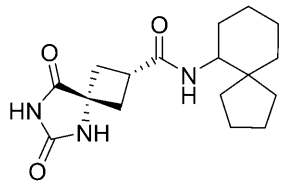
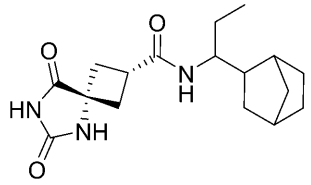
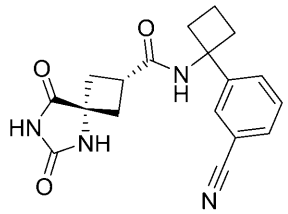
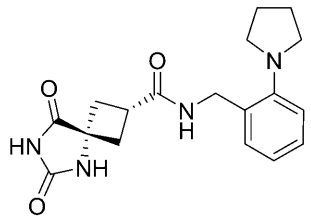
【表１－２７４】

I-1118		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 7.91 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 8.6 Hz, H), 7.28 (dt, J = 8.1, 1.0 Hz, 1H), 7.25 - 7.22 (m, 1H), 7.19 (dd, J = 8.0, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 7.8, 0.9 Hz, 1H), 6.75 (dd, J = 8.9, 2.1 Hz, 1H), 6.58 (br t, J = 5.4 Hz, 1H), 3.48 (埋没した d, J = 5.6 Hz, 2H), 2.34 - 2.21 (m), 4H, 2.11 (dt, J = 18.2, 9.1 Hz, 1H), 1.88 - 1.74 (m, 1H). 8.41ppm に一部ギ酸塩。COOH プロトンは観察されず。	317	D	
I-1119		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.40 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.8, 2.2 Hz, 1H), 7.29 (td, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 7.19 (重複する s, 1H), 7.18 (埋没した d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 6.43 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.72 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 2.37 - 2.14 (m, J = 19.0, 9.8 Hz, 4H), 2.14 - 2.00 (m, 1H), 1.85 - 1.71 (m, 1H). COOH プロトンは観察されず。	317	E	
I-1120				E	
I-1121				B	D

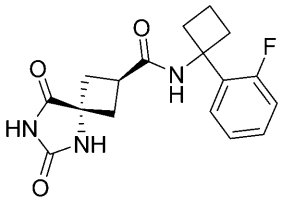
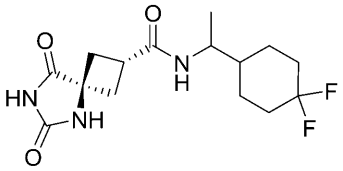
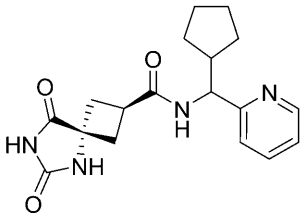
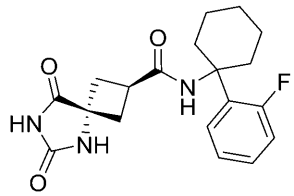
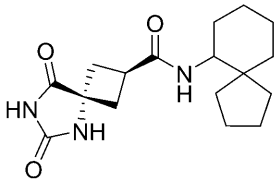
【表１－２７５】

I-1122				D	
I-1123		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.33 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.26 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 7.20 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.75 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 2.58 (s, 2H), 2.39 (d, J = 10.8 Hz, 2H), 1.15 (s, 1H), 1.07 (d, J = 14.5 Hz, 3H), 0.98 (s, 3H).	332.2	E	
I-1124			352	E	
I-1125		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.59 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 3.67 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.40 (d, J = 8.9 Hz, 4H), 1.90 (h, J = 8.1 Hz, 2H), 1.66 - 1.25 (m, 12H), 1.25 - 1.00 (m, 4H).	334.4	E	
I-1126		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.28 (d, J = 12.3 Hz, 2H), 7.19 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.84 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 2.4 Hz, 1H), 4.70 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.73 (s, 3H), 3.25 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 2.41 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 2.35 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 0.83 (s, 9H).	360.2	E	

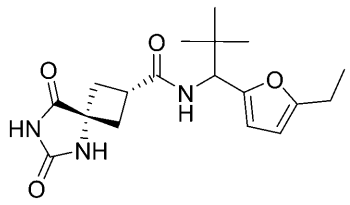
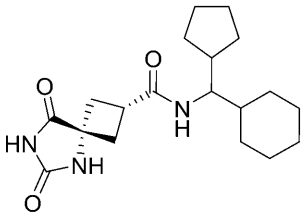
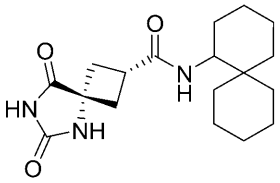
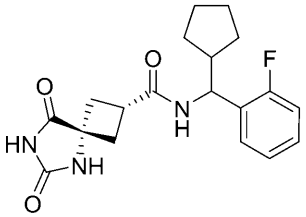
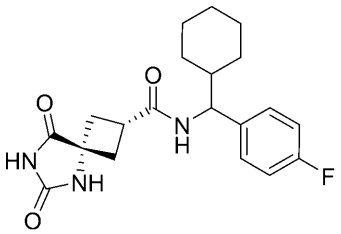
【表１－２７６】

I-1127			332.2	E	
I-1128			359.2	E	
I-1129			320.2	E	
I-1130		(400 MHz, 重水) 3.18 (s, 2H), 2.86 - 2.67 (m, 2H), 2.43 (s, 2H), 2.03 (d, J = 24.7 Hz, 2H), 1.61 (s, 1H), 1.34 (s, 4H), 1.27 - 1.07 (m, 4H), 0.97 (s, 4H), 0.69 (t, J = 7.1 Hz, 3H).	320.2	E	
I-1131		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.58 (d, J = 14.4 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.69 (dd, J = 12.8, 8.0 Hz, 2H), 7.53 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 3.12 (s, 1H), 2.62 (d, J = 11.2 Hz, 2H), 2.43 (d, J = 8.3 Hz, 4H), 2.19 (t, J = 11.0 Hz, 2H).	339.2	E	
I-1132			343.2	E	

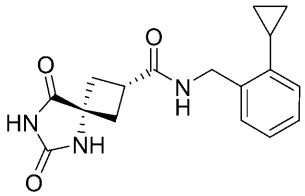
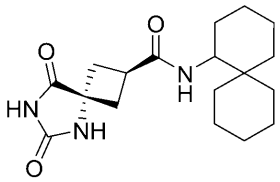
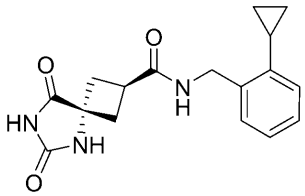
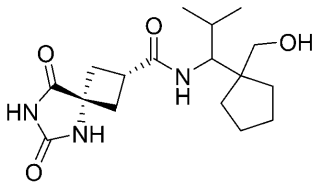
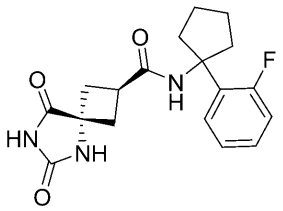
【表１－２７７】

I-1133			332.2	E	
I-1134		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.80 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.69 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.10 - 2.99 (m, 1H), 2.39 (d, J = 8.7 Hz, 4H), 1.99 (s, 2H), 1.70 (s, 4H), 1.38 (s, 1H), 1.16 (d, J = 12.5 Hz, 2H), 0.98 (d, J = 6.8 Hz, 3H).	330.2	E	
I-1135			343.2	E	
I-1136		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.31 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 6.5 Hz, 1H), 7.16 - 7.00 (m, 2H), 3.23 (q, J = 9.2 Hz, 1H), 2.70 - 2.61 (m, 2H), 2.42 (s, 2H), 2.19 (dd, J = 12.6, 9.5 Hz, 2H), 1.70 (d, J = 13.0 Hz, 2H), 1.58 (dd, J = 27.6, 14.6 Hz, 5H), 1.22 (d, J = 12.9 Hz, 1H).	360.4	D	
I-1137		(400 MHz, 重水) 3.55 (s, 1H), 3.17 - 3.03 (m, 1H), 2.58 (s, 2H), 2.52 - 2.39 (m, 2H), 1.44 (s, 6H), 1.33 (s, 6H), 1.21 (s, 6H).	320.2	E	

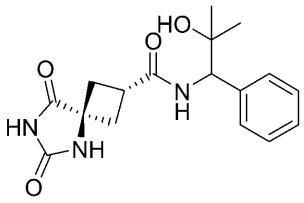
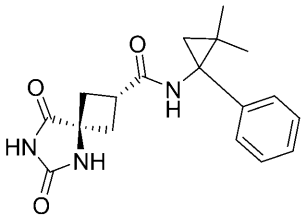
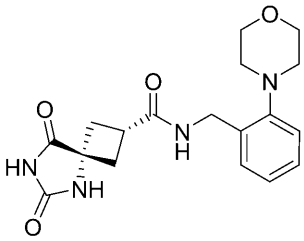
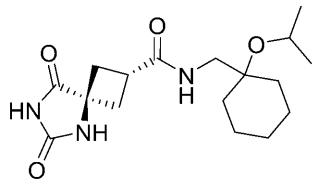
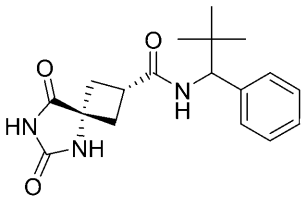
【表１－２７８】

I-1138		(400 MHz, アセトニトリル-d3) 8.45 (s, 1H), 6.83 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.08 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 5.97 (dt, J = 3.2, 1.0 Hz, 1H), 4.84 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 3.20 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.74 - 2.43 (m, 6H), 1.22 (td, J = 7.5, 0.9 Hz, 3H), 0.93 (s, 9H).	346.2	E	
I-1139			348.2	E	
I-1140			334.2	E	
I-1141		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.40 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.26 (q, J = 7.2, 6.7 Hz, 1H), 7.21 - 7.05 (m, 2H), 4.92 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.09 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 2.34 (dt, J = 38.8, 10.6 Hz, 4H), 2.17 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 1.71 (s, 1H), 1.64 - 1.39 (m, 4H), 1.29 (s, 2H), 1.06 (q, J = 8.1, 7.0 Hz, 1H).	360	E	
I-1142		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.26 (dd, J = 8.4, 5.5 Hz, 2H), 7.12 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 4.54 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.44 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 3.10 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 2.43 - 2.22 (m, 3H), 1.69 (d, J = 17.2 Hz, 2H), 1.57 (s, 3H), 1.23 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 1.06 (q, J = 6.9, 6.2 Hz, 2H), 1.00 - 0.74 (m, 2H).	374.2	E	

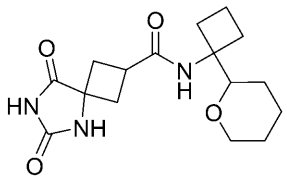
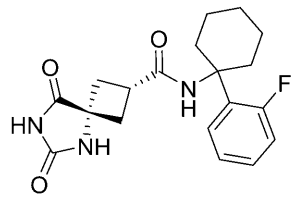
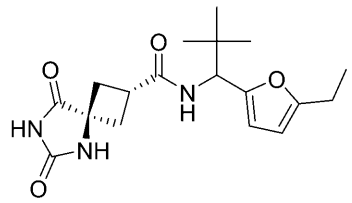
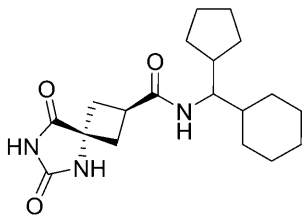
【表１－２７９】

I-1143			314.2	E	
I-1144			334.2	E	
I-1145			314.2	E	
I-1146		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.18 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 3.83 (dd, J = 10.2, 3.3 Hz, 1H), 3.31 - 3.14 (m, 4H), 2.68 (q, J = 9.9 Hz, 2H), 2.21 (td, J = 9.5, 2.9 Hz, 2H), 1.97 (td, J = 6.8, 3.2 Hz, 1H), 1.56 - 1.37 (m, 5H), 1.35 - 1.22 (m, 2H), 0.80 (dd, J = 6.8, 3.4 Hz, 6H).	338.4	E	
I-1147		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.36 (td, J = 8.2, 1.9 Hz, 1H), 7.22 (tt, J = 7.1, 3.5 Hz, 1H), 7.15 - 7.01 (m, 2H), 3.11 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.59 (td, J = 9.5, 2.8 Hz, 2H), 2.42 (d, J = 13.0 Hz, 2H), 2.14 (td, J = 9.5, 2.8 Hz, 2H), 1.91 (q, J = 10.8, 9.4 Hz, 2H), 1.79 - 1.60 (m, 4H).	346.4	E	

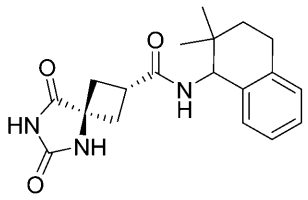
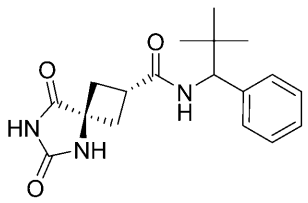
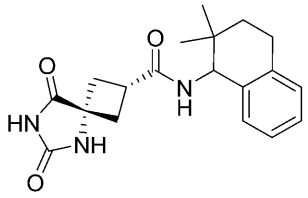
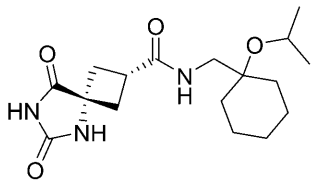
【表１－２８０】

I-1148		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.08 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.25 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.20 (s, 1H), 4.74 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.42 - 3.34 (m, 2H), 3.23 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 2.40 (s, 2H), 1.08 (s, 3H), 0.98 (s, 3H).	332.2	E	
I-1149		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.40 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.26 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.18 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 3.11 - 2.94 (m, 1H), 2.59 (d, J = 14.9 Hz, 2H), 2.12 (t, J = 11.1 Hz, 2H), 1.26 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 1.23 (s, 3H), 0.75 (s, 1H), 0.73 (s, 3H).	328.2	E	
I-1150			359.2	E	
I-1151		(400 MHz, DMSO-d6) 10.27 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.59 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 3.79 (h, J = 6.1 Hz, 1H), 3.24 - 3.06 (m, 3H), 2.40 (d, J = 8.9 Hz, 4H), 1.68 - 1.43 (m, 4H), 1.44 - 1.15 (m, 6H), 1.04 (d, J = 6.1 Hz, 6H).	336.2	E	
I-1152		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.31 (d, J = 10.4 Hz, 2H), 7.28 (d, J = 5.1 Hz, 4H), 7.22 (q, J = 5.3, 4.5 Hz, 1H), 4.72 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 3.25 (q, J = 8.8 Hz, 1H), 2.46 - 2.38 (m, 1H), 2.38 - 2.28 (m, 2H), 2.07 (s, 1H), 0.82 (s, 9H).	330.2	E	

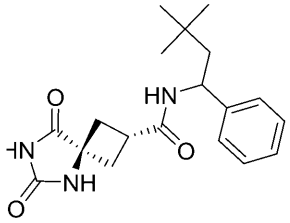
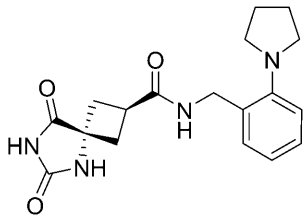
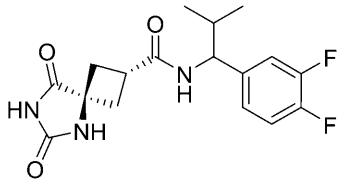
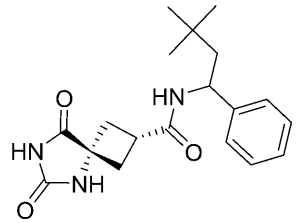
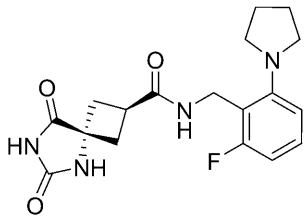
【表１－２８１】

I-1153		(400 MHz, アセトニトリル-d3) 3.98 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 3.66 - 3.52 (m, 1H), 3.41 (s, 1H), 3.03 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 2.66 - 2.54 (m, 1H), 2.54 - 2.44 (m, 1H), 2.32 (s, 4H), 2.06 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 1.90 - 1.79 (m, 1H), 1.72 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 1.60 (d, J = 12.2 Hz, 1H), 1.51 (s, 2H), 1.41 - 1.06 (m, 2H), 1.01 (s, 1H).	322.2	E	
I-1154		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.38 - 7.25 (m, 1H), 7.25 - 7.19 (m, 1H), 7.13 - 6.97 (m, 2H), 3.24 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 2.41 (t, J = 10.2 Hz, 4H), 2.32 (dd, J = 11.7, 9.3 Hz, 2H), 1.71 (t, J = 11.8 Hz, 2H), 1.55 (d, J = 31.3 Hz, 5H), 1.23 (s, 1H).	360.2	E	
I-1155		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.10 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 6.09 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 5.96 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 4.76 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 3.22 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69 (q, J = 9.8 Hz, 2H), 2.57 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.31 - 2.21 (m, 1H), 2.20 - 2.11 (m, 1H), 1.14 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.86 (s, 9H).	348.4	E	
I-1156		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.39 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 3.56 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.13 (q, J = 9.3 Hz, 1H), 2.68 (q, J = 12.7 Hz, 2H), 2.18 (dd, J = 12.6, 8.9 Hz, 2H), 1.99 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 1.72 - 1.38 (m, 11H), 1.35 - 1.22 (m, 2H), 1.20 - 1.04 (m, 4H), 0.92 (d, J = 11.7 Hz, 2H).	348.2	D	

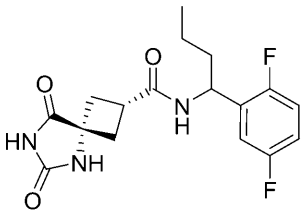
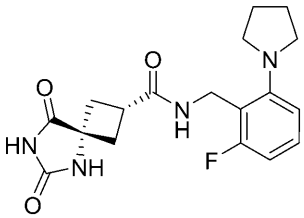
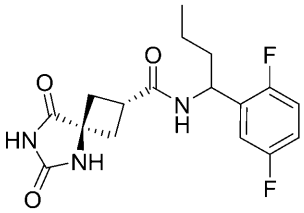
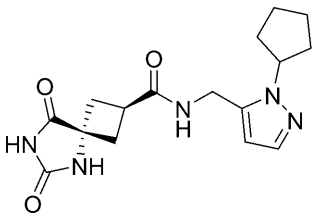
【表１－２８２】

I-1157		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.01 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.12 (qd, J = 8.7, 7.2, 3.5 Hz, 3H), 7.06 - 6.96 (m, 1H), 4.76 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.19 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.74 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 2.49 - 2.40 (m, 4H), 1.72 (dt, J = 13.0, 6.3 Hz, 1H), 1.54 (dt, J = 13.9, 7.1 Hz, 1H), 0.88 (s, 3H), 0.82 (s, 3H).	342.2	E	
I-1158		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.18 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 4.4 Hz, 4H), 7.22 (h, J = 4.1 Hz, 1H), 4.73 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 3.24 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 16.0, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.25 (ddd, J = 12.3, 8.9, 4.2 Hz, 1H), 2.20 - 2.04 (m, 1H), 0.84 (s, 9H).	330.2	E	
I-1159		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.92 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.24 - 6.98 (m, 4H), 4.78 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.28 - 3.19 (m, 1H), 2.86 - 2.69 (m, 4H), 2.30 - 2.17 (m, 2H), 1.80 - 1.66 (m, 1H), 1.61 - 1.46 (m, 1H), 0.89 (s, 3H), 0.82 (s, 3H).	342.2	E	
I-1160		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 3.81 (p, J = 6.1 Hz, 1H), 3.25 - 3.09 (m, 3H), 2.68 (dd, J = 12.4, 9.2 Hz, 2H), 2.19 (t, J = 10.8 Hz, 2H), 1.53 (t, J = 16.3 Hz, 4H), 1.43 - 1.15 (m, 6H), 1.05 (d, J = 6.0 Hz, 6H).	338.2	E	

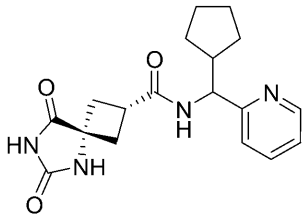
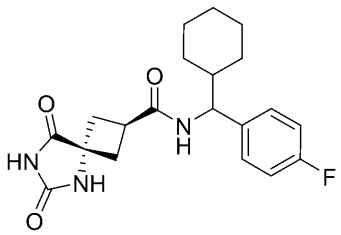
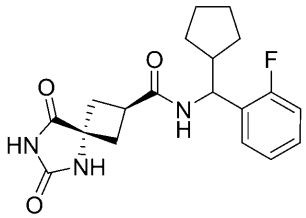
【表１－２８３】

I-1161		(400 MHz, 重水) 7.22 (ddt, J = 21.0, 14.4, 7.5 Hz, 5H), 4.86 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.28 - 3.13 (m, 1H), 2.82 - 2.65 (m, 2H), 2.50 - 2.31 (m, 2H), 1.69 (dd, J = 14.7, 9.8 Hz, 1H), 1.60 - 1.43 (m, 1H), 1.21 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 0.83 (d, J = 1.7 Hz, 9H).	344.2	E	
I-1162			343.2	E	
I-1163		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.19 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.34 (ddd, J = 11.4, 8.1, 2.5 Hz, 2H), 7.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.54 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 20.5, 12.1, 9.1 Hz, 2H), 2.31 - 2.12 (m, 2H), 1.97 - 1.83 (m, 1H), 0.87 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.70 (d, J = 6.6 Hz, 3H).	352.2	E	
I-1164		(400 MHz, 重水) 7.27 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 7.23 - 7.10 (m, 3H), 4.83 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.07 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 - 2.50 (m, 2H), 2.42 (dd, J = 29.4, 10.0 Hz, 2H), 1.66 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 1.59 - 1.41 (m, 1H), 0.81 (s, 9H).	344.2	E	
I-1165		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.10 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 6.81 - 6.57 (m, 2H), 4.28 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 3.25 - 3.14 (m, 4H), 3.07 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.40 (d, J = 8.8 Hz, 4H), 1.92 - 1.77 (m, 4H).	361.2	E	

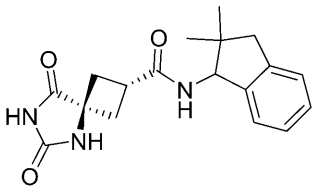
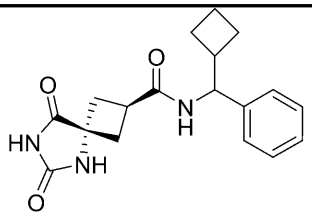
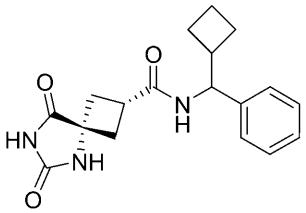
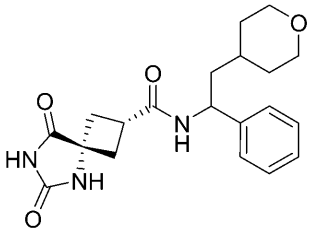
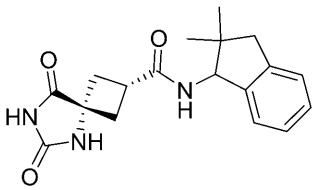
【表１－２８４】

I-1166		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.43 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.16 (dddd, J = 24.0, 14.7, 10.9, 6.6 Hz, 3H), 5.04 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.42 (dd, J = 10.7, 8.1 Hz, 3H), 2.33 (q, J = 10.5 Hz, 1H), 1.75 - 1.46 (m, 2H), 1.25 (ddt, J = 30.1, 15.2, 7.1 Hz, 2H), 0.86 (t, J = 7.3 Hz, 3H).	352.2	E	
I-1167		(400 MHz, DMSO-d6) 10.69 - 10.48 (m, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.01 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 6.76 - 6.58 (m, 2H), 4.27 (q, J = 2.1 Hz, 2H), 3.26 - 3.16 (m, 4H), 3.12 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.76 - 2.64 (m, 2H), 2.25 - 2.09 (m, 2H), 1.99 - 1.69 (m, 4H).	361.2	E	
I-1168		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.34 - 6.91 (m, 3H), 5.05 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 3.14 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.80 - 2.59 (m, 2H), 2.21 (q, J = 10.6 Hz, 2H), 1.80 - 1.61 (m, 1H), 1.60 - 1.47 (m, 1H), 1.41 - 1.29 (m, 1H), 1.29 - 1.12 (m, 1H), 0.87 (t, J = 7.3 Hz, 3H).	352.2	E	
I-1169		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.33 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.07 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 4.75 - 4.61 (m, 1H), 4.34 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 3.05 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 2.42 (d, J = 8.6 Hz, 4H), 2.03 - 1.74 (m, 6H), 1.59 (s, 2H).	332.2	E	

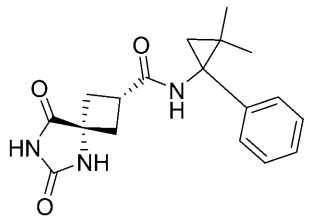
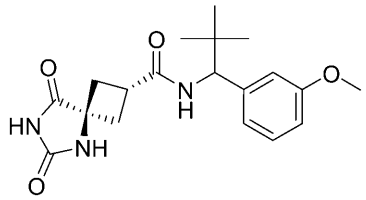
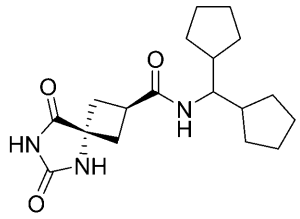
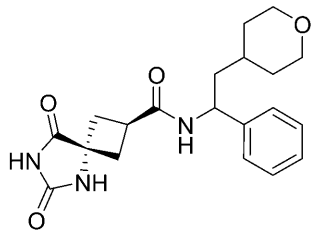
【表１－２８５】

I-1170		(400 MHz, 重水) 8.31 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.71 (td, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.25 - 7.18 (m, 1H), 4.51 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 3.20 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.81 - 2.61 (m, 2H), 2.51 - 2.33 (m, 2H), 2.21 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 1.72 (dd, J = 11.5, 4.4 Hz, 1H), 1.59 - 1.40 (m, 3H), 1.35 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 1.28 - 1.17 (m, 2H), 1.04 (dd, J = 12.8, 7.9 Hz, 1H).	343.2	E	
I-1171		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.20 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.22 (m, 2H), 7.11 (t, J = 8.6 Hz, 2H), 4.53 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72 - 2.59 (m, 2H), 2.30 - 2.08 (m, 2H), 1.78 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 1.69 (d, J = 11.0 Hz, 1H), 1.55 (d, J = 16.0 Hz, 3H), 1.20 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 1.16 - 1.01 (m, 3H), 0.94 (t, J = 11.7 Hz, 1H), 0.81 (d, J = 11.4 Hz, 1H).	374.4	E	
I-1172		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.41 (td, J = 7.5, 1.7 Hz, 1H), 7.26 (q, J = 6.8, 6.3 Hz, 1H), 7.21 - 7.03 (m, 2H), 4.90 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.64 (ddd, J = 24.0, 11.9, 9.1 Hz, 2H), 2.29 - 2.04 (m, 3H), 1.81 - 1.68 (m, 1H), 1.67 - 1.38 (m, 4H), 1.31 (dt, J = 18.6, 6.9 Hz, 2H), 1.08 (dd, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H).	360.4	D	

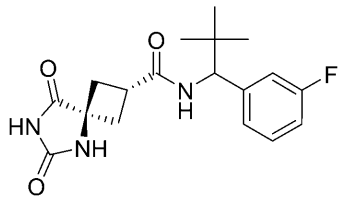
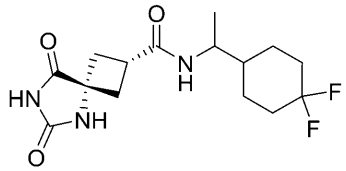
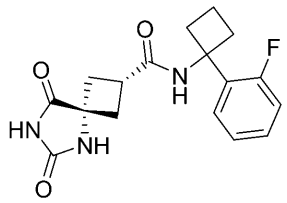
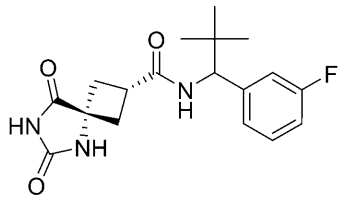
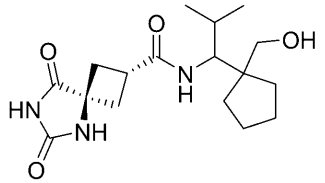
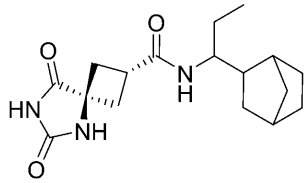
【表１－２８６】

I-1173		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.06 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 7.11 - 7.02 (m, 1H), 5.04 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 3.19 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.69 (s, 2H), 2.49 - 2.44 (m, 4H), 1.12 (s, 3H), 0.83 (s, 3H).	328.2	E	
I-1174		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.30 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.39 - 7.10 (m, 5H), 4.74 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.09 (q, J = 8.8 Hz, 1H), 2.56 (s, 1H), 2.45 - 2.28 (m, 4H), 1.93 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 1.81 - 1.56 (m, 5H).	329.4	E	
I-1175		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.41 - 7.09 (m, 5H), 4.76 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.76 - 2.53 (m, 3H), 2.18 (dddd, J = 22.0, 13.0, 9.1, 4.5 Hz, 2H), 1.95 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 1.73 (dddd, J = 15.7, 12.2, 8.2, 4.6 Hz, 5H).	328.2	E	
I-1176		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.38 - 7.25 (m, 4H), 7.25 - 7.16 (m, 1H), 4.90 (dt, J = 9.4, 5.0 Hz, 1H), 3.81 (dd, J = 11.7, 3.9 Hz, 2H), 3.28 - 3.08 (m, 3H), 2.79 - 2.61 (m, 2H), 2.20 (ddd, J = 20.8, 13.2, 6.9 Hz, 2H), 1.75 - 1.40 (m, 5H), 1.18 (t, J = 12.5 Hz, 2H).	372.2	E	
I-1177		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.18 (q, J = 5.2, 4.4 Hz, 3H), 7.11 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 5.06 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.23 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 2.89 - 2.63 (m, 4H), 2.25 (dd, J = 12.7, 9.2 Hz, 2H), 1.13 (s, 3H), 0.85 (s, 3H).	328.2	E	

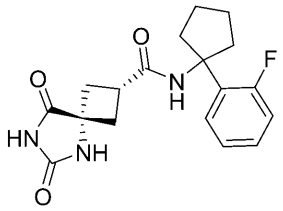
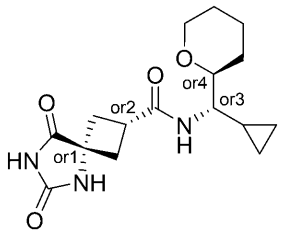
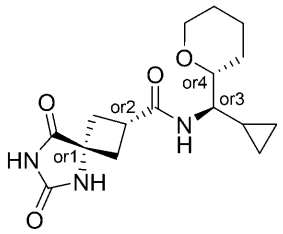
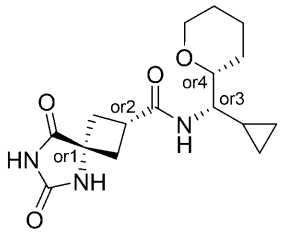
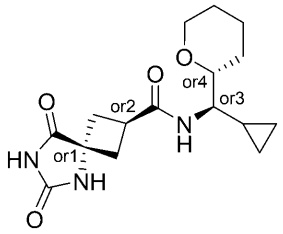
【表１－２８７】

I-1178		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.46 - 7.33 (m, 2H), 7.26 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 7.16 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 2.96 (q, J = 8.9 Hz, 1H), 2.31 (tt, J = 20.3, 11.4 Hz, 4H), 1.27 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 1.22 (s, 3H), 0.72 (d, J = 5.7 Hz, 4H).	328.2	E	
I-1179		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.15 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.19 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.0, 2.5 Hz, 1H), 4.71 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 3.73 (d, J = 1.5 Hz, 3H), 3.22 (q, J = 9.2 Hz, 1H), 2.76 - 2.59 (m, 2H), 2.25 (t, J = 10.7 Hz, 1H), 2.20 - 2.05 (m, 1H), 0.84 (s, 9H).	360.2	E	
I-1180			334.2	E	
I-1181		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.38 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.38 - 7.24 (m, 4H), 7.21 (td, J = 6.7, 2.5 Hz, 1H), 4.89 (s, 1H), 3.80 (d, J = 10.8 Hz, 2H), 3.19 (td, J = 13.1, 10.5 Hz, 2H), 3.07 (q, J = 8.9 Hz, 1H), 2.45 - 2.26 (m, 4H), 1.70 - 1.37 (m, 5H), 1.27 - 1.08 (m, 2H).	372.2	E	

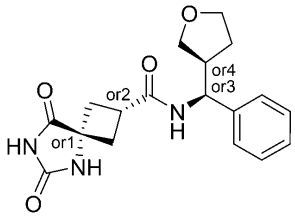
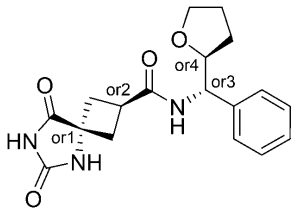
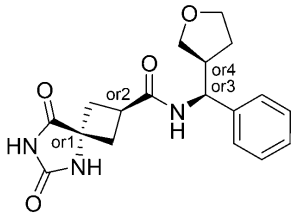
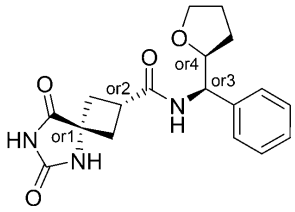
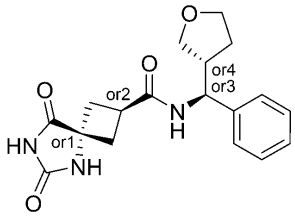
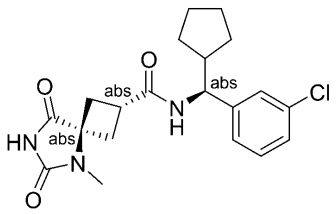
【表１－２８８】

I-1182		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.18 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.40 - 7.28 (m, 1H), 7.15 (dd, J = 19.1, 9.1 Hz, 2H), 7.10 - 6.99 (m, 1H), 4.77 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 3.24 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (dd, J = 13.2, 8.5 Hz, 2H), 2.26 (t, J = 11.3 Hz, 1H), 2.23 - 2.11 (m, 1H), 0.84 (s, 9H).	348.2	E	
I-1183		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.65 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.71 (q, J = 7.3 Hz, 1H), 3.07 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.79 - 2.53 (m, 3H), 2.18 (dd, J = 10.1, 5.6 Hz, 2H), 1.99 (s, 2H), 1.74 (d, J = 31.5 Hz, 3H), 1.41 (s, 1H), 1.28 - 1.10 (m, 2H), 1.00 (d, J = 6.8 Hz, 3H).	330.4	E	
I-1184			332.2	E	
I-1185			348.2	E	
I-1186			338.2	E	
I-1187			320.2	E	

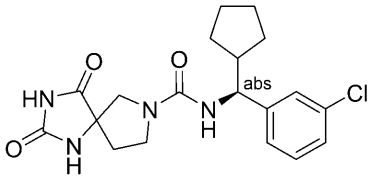
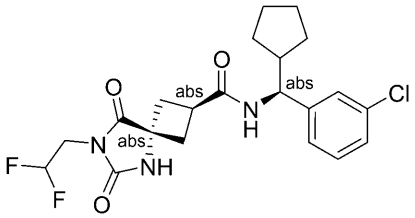
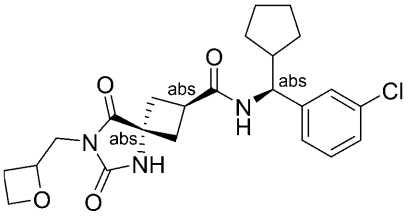
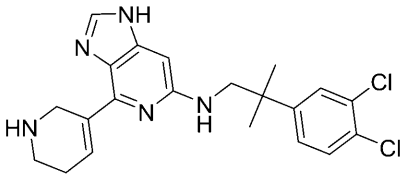
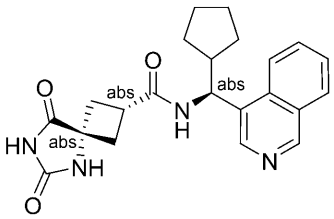
【表１－２８９】

I-1188		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.34 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.13 - 6.99 (m, 2H), 3.13 - 3.03 (m, 1H), 2.38 (t, J = 11.0 Hz, 4H), 2.27 (t, J = 10.4 Hz, 2H), 1.90 (d, J = 10.1 Hz, 2H), 1.69 (s, 4H).	346.2	E	
I-1189			322.2	E	
I-1190			322.2	E	
I-1191			322.2	E	
I-1192			322.2	E	

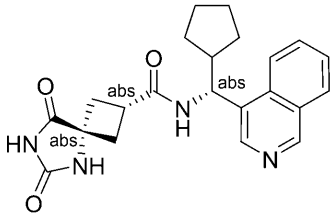
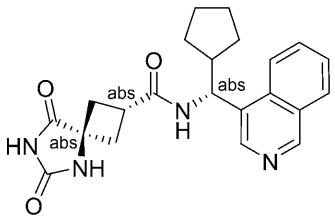
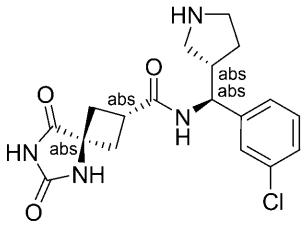
【表１－２９０】

I-1193		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.40 - 7.28 (m, 4H), 7.23 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 4.67 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.73 (dd, J = 9.5, 6.2 Hz, 2H), 3.57 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 3.44 (dd, J = 8.6, 6.6 Hz, 1H), 3.04 (q, J = 8.9 Hz, 1H), 2.44 - 2.27 (m, 5H), 1.65 - 1.51 (m, 1H), 1.41 (dd, J = 12.5, 7.3 Hz, 2H).	344.2	E	
I-1194			344.2	E	
I-1195			344.2	E	
I-1196			344.2	E	
I-1197			344.2	E	
I-1198			390.36	D	

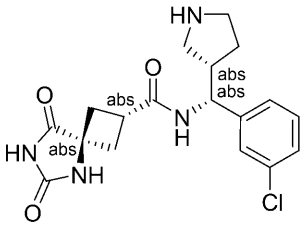
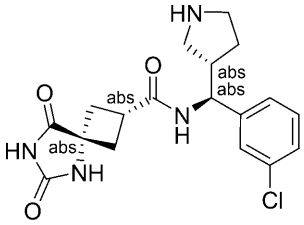
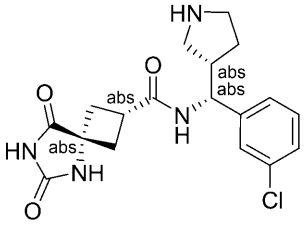
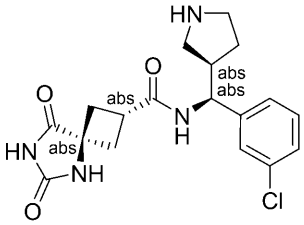
【表１－２９１】

I-1199			391.26	E	
I-1200				C	D
I-1201				D	
I-1202		(400 MHz, DMSO-d6) 12.04 (s, 1H), 7.94 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.63 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.42 (dd, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 6.37 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 5.75 (s, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.57 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.96 (s, 2H), 2.33 (p, J = 1.9 Hz, 2H), 1.31 (s, 6H).	416.1	D	
I-1203		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.59 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.31 - 8.23 (m, 2H), 8.13 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.82 (ddd, J = 8.4, 6.8, 1.4 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 5.37 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 2.47 - 2.38 (m, 2H), 2.36 - 2.20 (m, 2H), 1.83 - 1.73 (m, 1H), 1.69 - 1.60 (m, 1H), 1.59 - 1.52 (m, 2H), 1.50 - 1.40 (m, 2H), 1.36 (dd, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H), 1.05 (dq, J = 12.2, 7.9 Hz, 1H).	393.2	E	

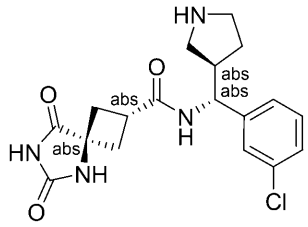
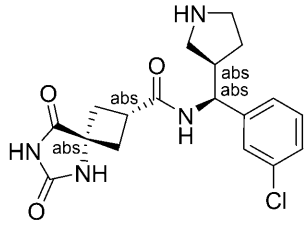
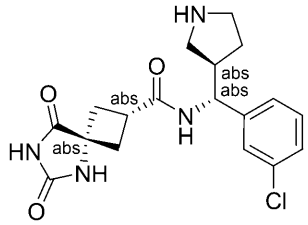
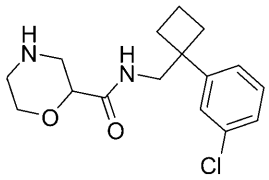
【表１－２９２】

I-1204		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.60 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.36 - 8.19 (m, 2H), 8.14 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.82 (ddd, J = 8.5, 6.8, 1.4 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 5.38 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.59 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 2.48 - 2.38 (m, 2H), 2.35 - 2.21 (m, 2H), 1.77 (dt, J = 14.4, 5.9 Hz, 1H), 1.66 (d, J = 14.4 Hz, 1H), 1.58 - 1.50 (m, 2H), 1.49 - 1.40 (m, 2H), 1.41 - 1.30 (m, 1H), 1.10 - 0.99 (m, 1H).	393.1	E	
I-1205		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.57 (d, J = 13.0 Hz, 2H), 8.46 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.82 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 5.39 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.70 (dd, J = 11.8, 9.0 Hz, 1H), 2.60 (dd, J = 12.3, 9.1 Hz, 2H), 2.23 (ddd, J = 12.4, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.9, 9.1, 4.4 Hz, 1H), 1.86 - 1.74 (m, 1H), 1.65 (s, 1H), 1.51 (td, J = 16.2, 6.7 Hz, 4H), 1.36 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 1.06 (dt, J = 12.9, 7.6 Hz, 1H).	393.2	E	
I-1206		(400 MHz, DMSO-d6) 8.48 (dd, J = 9.1, 3.0 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.50 - 7.20 (m, 4H), 4.63 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.87 (d, J = 53.9 Hz, 1H), 2.75 - 2.67 (m, 1H), 2.46 (m, 1H), 2.43 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 2.41 - 2.32 (m, 2H), 2.29 (d, J = 9.5 Hz, 2H), 1.76 (q, J = 6.6, 6.0 Hz, 1H), 1.41 (s, 1H).	377.15	E	

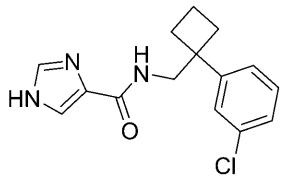
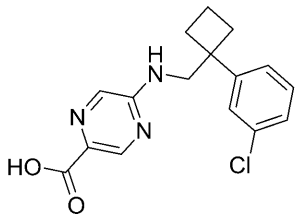
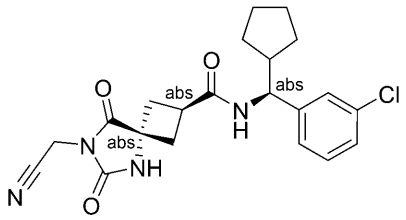
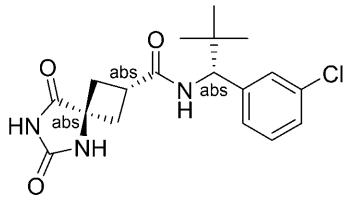
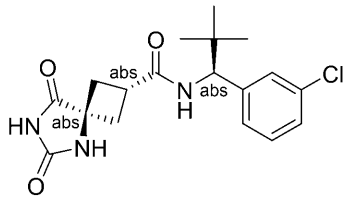
【表１－２９３】

I-1207		(400 MHz, DMSO-d6) 8.68 - 8.39 (m, 1H), 8.29 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.50 - 7.13 (m, 4H), 4.81 - 4.42 (m, 1H), 3.40 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.07 (q, J = 8.9 Hz, 1H), 2.90 (d, J = 45.6 Hz, 1H), 2.77 (s, 1H), 2.72 - 2.59 (m, 2H), 2.48 - 2.26 (m, 4H), 1.41 (t, J = 18.6 Hz, 1H), 1.27 - 1.10 (m, 1H).	377.15	E	
I-1208		(400 MHz, DMSO-d6) 8.61 (s, 1H), 8.45 - 8.24 (m, 1H), 7.46 - 7.10 (m, 4H), 4.67 (d, J = 34.8 Hz, 1H), 3.21 - 3.03 (m, 1H), 2.87 (d, J = 43.8 Hz, 1H), 2.76-2.55 (m, 3H), 2.46 - 2.40 (m, 1H), 2.39 - 2.08 (m, 4H), 1.87 (d, J = 74.2 Hz, 1H), 1.43 (s, 1H).	377.15	E	
I-1209		(400 MHz, DMSO-d6) 8.60 (s, 1H), 8.41 (dd, J = 34.0, 8.2 Hz, 1H), 7.34 (dt, J = 30.3, 9.2 Hz, 4H), 4.90 - 4.42 (m, 1H), 3.43 (s, 1H), 3.26- 3.05 (m, 1H), 2.87 (t, J = 32.5 Hz, 2H), 2.70 (s, 1H), 2.68 - 2.57 (m, 2H), 2.41 - 2.31 (m, 1H), 2.19 (d, J = 31.5 Hz, 2H), 1.42 (s, 1H), 1.31 -1.07 (m, 1H).	377.05	E	
I-1210		(400 MHz, DMSO-d6) 8.48 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.42 - 7.24 (m, 4H), 4.75 - 4.59 (m, 1H), 3.08 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.88 - 2.76 (m, 1H), 2.75 - 2.64 (m, 1H), 2.47 (m, 1H), 2.44 (d, J = 9.9 Hz, 2H), 2.34 (dd, J = 36.2, 10.3 Hz, 4H), 1.76 (s, 1H), 1.39 (t, J = 13.9 Hz, 1H).	377.1	E	

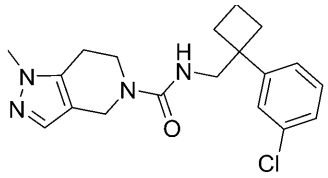
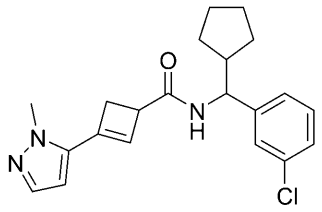
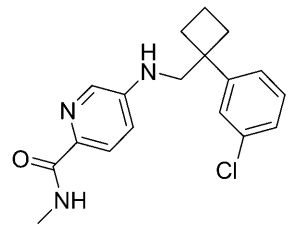
【表１－２９４】

I-1211		(400 MHz, DMSO-d6) 8.68-8.39 (m, 1H), 8.29 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 7.43 -7.24 (m, 4H), 4.66 (dt, J = 38.1, 9.3 Hz, 1H), 3.40 (s, 1H), 3.07 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.98 - 2.74 (m, 2H), 2.66 (d, J = 9.4 Hz, 2H), 2.46 - 2.21 (m, 4H), 1.39 (s, 1H), 1.22 (d, J = 16.4 Hz, 1H).	377.15	E	
I-1212		(400 MHz, DMSO-d6) 8.61 (s, 1H), 8.44 - 8.31 (m, 1H), 7.48-7.13 (m, 4H), 4.62 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.13 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.81 (s, 1H), 2.67 (dq, J = 19.3, 10.1, 8.7 Hz, 3H), 2.48 - 2.42 (m, 1H), 2.39 - 2.07 (m, 4H), 1.78 (s, 1H), 1.43 (s, 1H).	377.15	E	
I-1213		(400 MHz, DMSO-d6) 8.61 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.46 - 7.13 (m, 4H), 4.62 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.42 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.10 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.84 (dd, J = 22.7, 13.9 Hz, 2H), 2.69 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 2.68- 2.59 (m, 2H), 2.37 (s, 1H), 2.23 (t, J = 10.8 Hz, 1H), 2.15 (s, 1H), 1.42 (t, J = 11.0 Hz, 1H), 1.26 - 1.18 (m, 1H).	377.1	E	
I-1214		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.35 (s, 2H), 7.36 - 7.29 (m, 2H), 7.23 (ddd, J = 8.0, 1.8, 0.8 Hz, 1H), 7.08 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 3.80 - 3.72 (m, 2H), 3.50 - 3.42 (m, 2H), 3.35 (dd, J = 13.2, 6.1 Hz, 1H), 2.89 (dd, J = 12.4, 2.1 Hz, 1H), 2.69 (br. d, J = 12.4 Hz, 1H), 2.65 - 2.57 (m, 1H), 2.37 (dd, J = 12.2, 10.4 Hz, 1H), 2.28 - 2.13 (m, 4H), 2.05 - 1.93 (m, 1H), 1.79 - 1.69 (m, 1H). 化合物はギ酸塩である。エナンチオマーのラセミ混合物。	309.2	E	

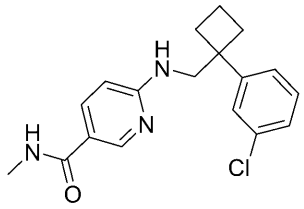
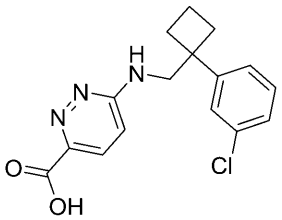
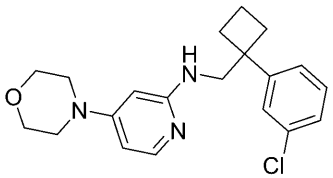
【表１－２９５】

I-1215		(400 MHz, DMSO-d6) δ 12.47 (br. s, 1H), 7.68 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.44 - 7.37 (m, 1H), 7.34 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24 (br. d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.09 (br. d, J = 7.7 Hz, 1H), 3.57 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 2.33 - 2.16 (m, 4H), 2.09 - 1.97 (m, 1H), 1.82 - 1.72 (m, 1H).	290.2	E	
I-1216		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.39 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.89 (br s, 1H), 7.72 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 7.32 - 7.23 (m, 1H), 7.20 - 7.16 (m, 2H), 7.13 - 7.10 (m, 1H), 3.75 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 2.35 - 2.18 (m, 4H), 2.16 - 2.01 (m, 1H), 1.87 - 1.71 (m, 1H). COOH プロトンは観察されず。	317	D	
I-1217				C	D
I-1218				E	
I-1219				B	C

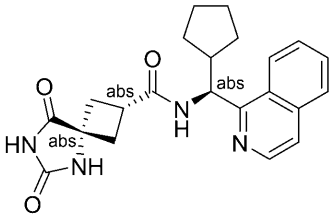
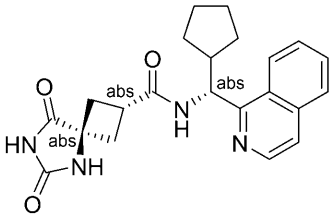
【表１－２９６】

I-1220		(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.27 - 7.18 (m, 3H), 7.06 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 6.99 (dt, J = 7.5, 1.4 Hz, 1H), 6.50 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.65 (s, 3H), 3.52 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.36 (s, 2H), 2.55 (t, J = 5.6 Hz, 2H), 2.30 - 2.23 (m, 2H), 2.17 - 2.08 (m, 2H), 2.01 - 1.89 (m, 1H), 1.76 - 1.66 (m, 1H). 3.36ppm の 2H シングレットは、残留 H2O のピークと部分的に重複している。	359.3	E	
I-1221		(400 MHz, dmso) δ 8.39 (dd, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.37 - 7.31 (m, 2H), 7.31 - 7.24 (m, 2H), 6.29 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 6.28 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 6.21 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 4.59 (td, J = 9.4, 3.7 Hz, 1H), 3.85 (s, 1.64H), 3.83 (s, 1.36H), 3.62 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 2.98 - 2.86 (m, 1H), 2.84 - 2.72 (m, 1H), 2.27 - 2.14 (m, 1H), 1.82 - 1.71 (m, 1H), 1.63 - 1.41 (m, 4H), 1.35 - 1.22 (m, 2H), 1.16 - 1.03 (m, 1H). ジアステレオマーの混合 (約 1.2:1.0)	370.1	D	
I-1222		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 8.22 (q,J= 4.7 Hz, 1H), 7.83 (d,J= 2.7 Hz, 1H), 7.57 (d,J= 8.6 Hz, 1H), 7.28 (t,J= 7.8 Hz, 1H), 7.23 (t,J= 1.8 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 2H), 6.79 (dd,J= 8.7, 2.8 Hz, 1H), 6.37 (t,J= 6.0 Hz, 1H), 3.46 (d,J= 6.1 Hz, 2H), 2.72 (d,J= 4.8 Hz, 3H), 2.35 - 2.19 (m, 4H), 2.17 - 1.98 (m, 1H), 1.90 - 1.72 (m, 1H).	330	E	

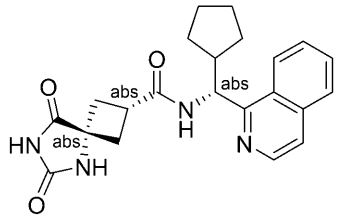
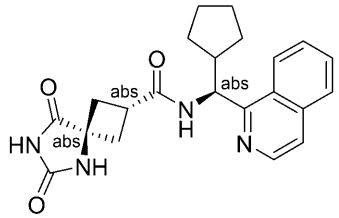
【表１－２９７】

I-1223		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 8.37 (d,J= 2.3 Hz, 1H), 8.05 (q,J= 4.0 Hz, 1H), 7.68 (dd,J= 8.8, 2.4 Hz, 1H), 7.33 - 7.25 (m, 1H), 7.22-7.16 (m, 2H), 7.16 - 7.10 (m, 1H), 6.89 (t,J= 6.3 Hz, 1H), 6.41 (d,J= 8.7 Hz, 1H), 3.69 (d,J= 6.0 Hz, 2H), 2.71 (d,J= 4.5 Hz, 3H), 2.36 - 2.15 (m, 4H), 2.15 - 1.98 (m, 1H), 1.85 - 1.71 (m, 1H). 微量の不純物。	330	E	
I-1224		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 7.87 (br s, 1H), 7.63 (d,J= 9.3 Hz, 1H), 7.44 (br s, 1H), 7.33 - 7.26 (m, 1H), 7.23 - 7.17 (m, 2H), 7.16 - 7.10 (m, 1H), 6.79 (br s, 1H), 3.86 (br s, 2H), 2.39 - 2.19 (m, 4H), 2.16 - 2.01 (m, 1H), 1.88 - 1.73 (m, 1H). 微量の不純物。ギ酸塩が存在。	318	D	
I-1225		NMR (400 MHz, DMSOd6) δ 8.25 (s, 1H, ホルメート), 7.56 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.28 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.20 (埋没した s, 1H), 7.19 (埋没した d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.71 (br s, 1H), 6.15 (dd, J = 6.3, 1.7 Hz, 1H), 5.67 (s, 1H), 3.69 - 3.61 (dd, J = 4.5, 4.5 Hz, 4H), 3.58 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 3.17 - 3.06 (dd, J = 4.2, 4.9 Hz, 4H), 2.33 - 2.14 (m, 4H), 2.14 - 1.99 (m, 1H), 1.79 (m, 1H).	358.3	E	

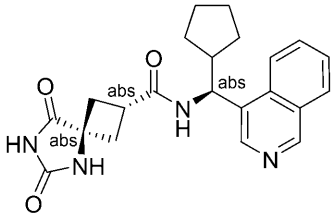
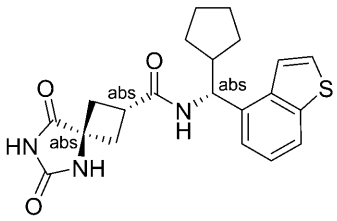
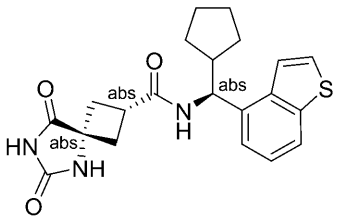
【表１－２９８】

I-1226		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.53 - 8.46 (m, 2H), 8.43 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.81 - 7.72 (m, 2H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 6.8, 1.4 Hz, 1H), 5.68 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.78 - 2.64 (m, 1H), 2.50- 2.37 (m, 2H), 2.28 (dd, J = 8.7, 3.0 Hz, 2H), 1.80 - 1.69 (m, 1H), 1.63 (dd, J = 12.6, 5.9 Hz, 1H), 1.48 (tdt, J = 13.5, 8.8, 6.4 Hz, 4H), 1.34 (dt, J = 12.2, 7.6 Hz, 1H), 0.99 (dq, J = 12.4, 8.0 Hz, 1H).	393.2	E	
I-1227		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.53 - 8.46 (m, 2H), 8.43 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 8.01 - 7.94 (m, 1H), 7.81-7.72 (m, 2H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 6.8, 1.4 Hz, 1H), 5.68 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.73 (dd, J = 16.3, 8.2 Hz, 1H), 2.49 - 2.37 (m, 2H), 2.28 (dd, J = 8.7, 2.9 Hz, 2H), 1.73 (dt, J = 11.3, 6.3 Hz, 1H), 1.62 (s, 1H), 1.58 - 1.39 (m, 4H), 1.35 (dd, J = 12.3, 7.6 Hz, 1H), 1.06 - 0.92 (m, 1H).	393.15	E	

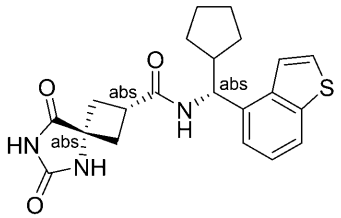
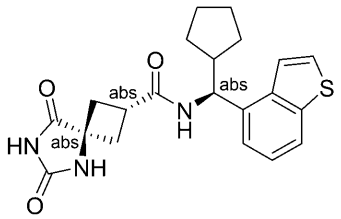
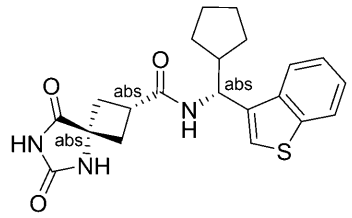
【表１－２９９】

I-1228		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.52 - 8.36 (m, 3H), 7.97 (dd, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.82 - 7.73 (m, 2H), 7.69 (ddd, J = 8.2, 6.8, 1.4 Hz, 1H), 5.70 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.80 - 2.65 (m, 2H), 2.61 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.23 (ddd, J = 12.5, 8.9, 4.4 Hz, 1H), 2.07 (ddt, J = 12.7, 8.8, 4.2 Hz, 1H), 1.73 (td, J = 9.6, 5.3 Hz, 1H), 1.64 (ddd, J = 7.7, 5.7, 2.9 Hz, 1H), 1.58 - 1.40 (m, 4H), 1.35 (qd, J = 7.3, 3.1 Hz, 1H), 1.10 - 0.93 (m, 1H).	393.2	E	
I-1229		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.57 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.52 - 8.37 (m, 3H), 7.98 (dd, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.82 - 7.73 (m, 2H), 7.69 (ddd, J = 8.3, 6.8, 1.4 Hz, 1H), 5.70 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.80- 2.65 (m, 2H), 2.61 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.23 (ddd, J = 12.5, 9.0, 4.5 Hz, 1H), 2.12- 2.01 (m, 1H), 1.73 (td, J = 9.3, 4.8 Hz, 1H), 1.68 - 1.56 (m, 1H), 1.49 (tt, J = 17.1, 6.6 Hz, 4H), 1.39 - 1.28 (m, 1H), 1.10 - 0.93 (m, 1H).	393.2	D	

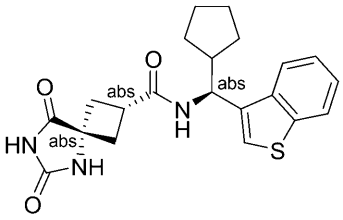
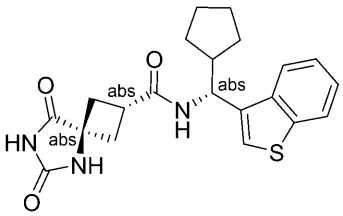
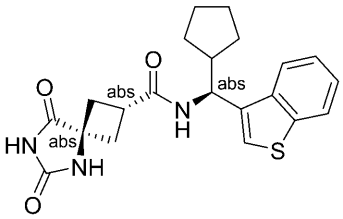
【表１－３００】

I-1230		(400 MHz, メタノール-d4) 9.17 (s, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.39 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.93 - 7.83 (m, 1H), 7.73 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 3.20 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.88 (ddd, J = 28.3, 12.6, 8.4 Hz, 2H), 2.71 (h, J = 7.8, 7.2 Hz, 1H), 2.47 (ddd, J = 12.8, 9.5, 3.7 Hz, 1H), 2.35 (ddd, J = 12.9, 9.5, 3.8 Hz, 1H), 1.98 (q, J = 9.7, 7.9 Hz, 1H), 1.80 (d, J = 14.3 Hz, 1H), 1.71 - 1.55 (m, 4H), 1.54 - 1.42 (m, 1H), 1.16 (dq, J = 14.6, 7.7 Hz, 1H).	393.15	E	
I-1231		(400 MHz, DMSO-d6) 10.35 (s, 1H), 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.87 (dd, J = 6.5, 2.5 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 5.7, 0.8 Hz, 1H), 7.38-7.29 (m, 2H), 5.12 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.15-3.01 (m, 1H), 2.43 (qd, J = 10.8, 8.0 Hz, 3H), 2.36-2.22 (m, 2H), 1.80-1.71 (m, 1H), 1.68-1.34 (m, 5H), 1.27 (ddd, J = 12.4, 7.8, 4.7 Hz, 1H), 1.04 (dq, J = 12.6, 8.0 Hz, 1H).	398.15	E	
I-1232		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.86 (dt, J = 7.4, 3.7 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.34 (q, J = 4.2, 3.7 Hz, 2H), 5.12 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.42 (qd, J = 10.5, 7.9 Hz, 3H), 2.35-2.22 (m, 2H), 1.80-1.70 (m, 1H), 1.60 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 1.52 (tt, J = 12.3, 5.7 Hz, 2H), 1.41 (ddd, J = 19.2, 11.1, 7.7 Hz, 2H), 1.32-1.22 (m, 1H), 1.11-0.97 (m, 1H).	398.15	E	

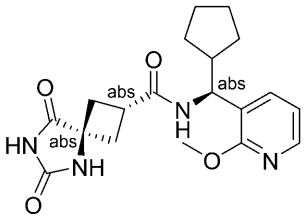
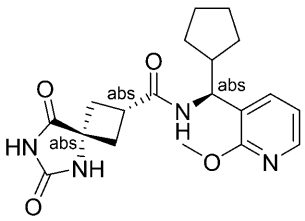
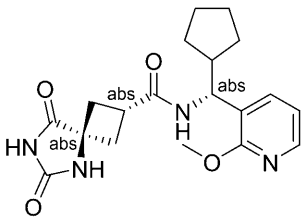
【表１－３０１】

I-1233		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.87 (dt, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 5.6, 0.8 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 7.4, 1.6 Hz, 1H), 7.34 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 5.13 (dd, J = 10.0, 8.6 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.74-2.57 (m, 2H), 2.44 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.5, 9.0, 4.5 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.6, 8.9, 4.4 Hz, 1H), 1.78 (s, 1H), 1.69-1.58 (m, 1H), 1.55-1.34 (m, 4H), 1.35-1.22 (m, 1H), 1.11-0.97 (m, 1H).	398.15	E	
I-1234		(400 MHz, DMSO-d6) 10.48 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.91-7.84 (m, 1H), 7.76 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.73-7.67 (m, 1H), 7.41-7.29 (m, 2H), 5.18-5.09 (m, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 29.7, 12.1, 9.2 Hz, 2H), 2.44 (dt, J = 17.0, 8.2 Hz, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.4, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.7, 9.1, 4.4 Hz, 1H), 1.83-1.74 (m, 1H), 1.65 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 1.59-1.48 (m, 2H), 1.49-1.36 (m, 2H), 1.35-1.22 (m, 1H), 1.04 (dq, J = 15.8, 7.9 Hz, 1H).	398.15	B	
I-1235		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.37 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.00- 7.83 (m, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.42 - 7.30 (m, 2H), 5.12 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.55 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 2.45 (dd, J = 8.8, 2.4 Hz, 2H), 2.39-2.27 (m, 2H), 1.72 (ddd, J = 12.5, 8.0, 5.0 Hz, 1H), 1.66 - 1.45 (m, 5H), 1.39 (dt, J = 15.2, 7.4 Hz, 1H), 1.21 - 1.06 (m, 1H).	398.15	E	

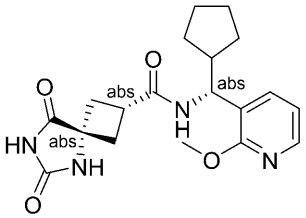
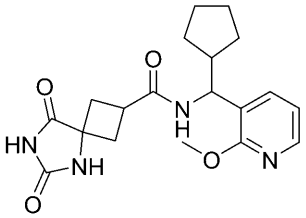
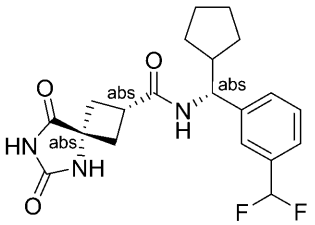
【表１－３０２】

I-1236		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.37 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.00 -7.84 (m, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.46 -7.27 (m, 2H), 5.12 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.54 (s, 1H), 2.45 (dd, J = 8.7, 2.4 Hz, 2H), 2.38- 2.26 (m, 2H), 1.72 (dq, J = 12.5, 6.5, 5.9 Hz, 1H), 1.65 - 1.44 (m, 5H), 1.40 (dq, J = 15.6, 7.6 Hz, 1H), 1.19-1.05 (m, 1H).	398.15	D	
I-1237		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.24 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 8.00 - 7.85 (m, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.37 (tt, J = 7.2, 5.5 Hz, 2H), 5.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.76- 2.71 (m, 1H), 2.70 - 2.61 (m, 2H), 2.22 (ddd, J = 12.6, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.8, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 1.81 - 1.69 (m, 1H), 1.68 -1.32 (m, 6H), 1.19-1.06 (m, 1H).	398.15	E	
I-1238		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.24 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.99- 7.83 (m, 2H), 7.61 (s, 1H), 7.37 (tt, J = 7.2, 5.4 Hz, 2H), 5.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.78 - 2.70 (m, 1H), 2.70- 2.60 (m, 2H), 2.22 (ddd, J = 12.5, 8.9, 4.5 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.8, 8.9, 4.4 Hz, 1H), 1.80 - 1.69 (m, 1H), 1.68- 1.31 (m, 6H), 1.15 (dd, J = 12.9, 7.4 Hz, 1H).	398.15	B	C

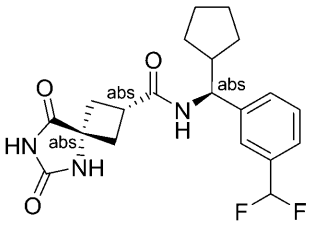
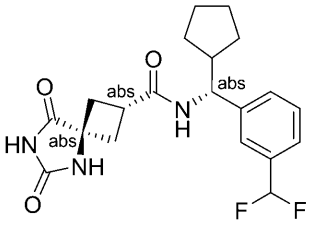
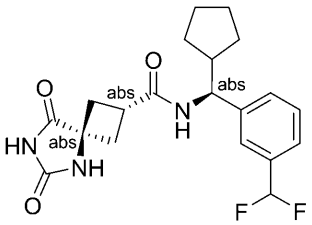
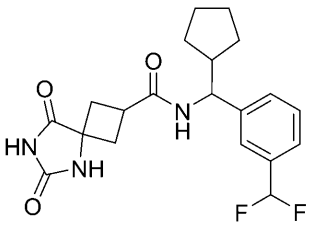
【表１－３０３】

I-1239		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.28 (t, J = 4.5 Hz, 2H), 8.03 (dd, J = 4.9, 1.8 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 7.3, 1.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 7.3, 4.9 Hz, 1H), 5.00 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.12 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.47 - 2.25 (m, 4H), 2.20 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 1.56 (s, 3H), 1.45 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 1.30 (s, 2H), 1.19 - 1.08 (m, 1H).	373.15	E	
I-1240		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.27 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 8.11 - 7.91 (m, 1H), 7.75 - 7.57 (m, 1H), 6.96 (dd, J = 7.3, 4.9 Hz, 1H), 5.00 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.12 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.48 - 2.37 (m, 2H), 2.30 (t, J = 10.5 Hz, 2H), 2.20 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 1.56 (s, 3H), 1.45 (s, 2H), 1.30 (s, 2H), 1.15 (d, J = 9.3 Hz, 1H).	373.15	E	
I-1241		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.70 - 8.55 (m, 1H), 8.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.04 (dd, J = 4.9, 2.5 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 5.6, 3.6 Hz, 1H), 6.96 (ddd, J = 7.1, 4.9, 2.0 Hz, 1H), 4.98 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 1.9 Hz, 3H), 3.19 - 3.07 (m, 1H), 2.65 (dt, J = 23.1, 11.2 Hz, 2H), 2.37 - 2.11 (m, 3H), 1.57 (s, 3H), 1.45 (s, 2H), 1.30 (s, 2H), 1.15 (s, 1H).	373.15	E	

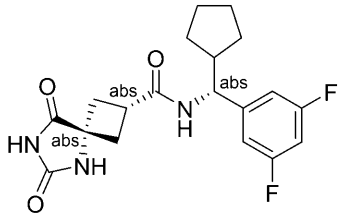
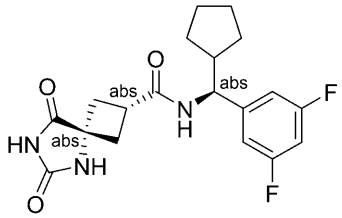
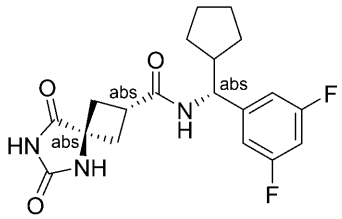
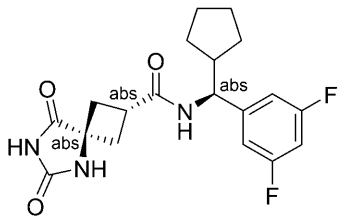
【表１－３０４】

I-1242		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.14 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 5.0, 1.9 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 7.4, 1.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 7.3, 4.9 Hz, 1H), 4.98 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.62 (dd, J = 12.6, 9.6 Hz, 1H), 2.33 (p, J = 1.8 Hz, 1H), 2.27 - 2.11 (m, 3H), 1.70 - 1.53 (m, 3H), 1.45 (d, J = 6.7 Hz, 2H), 1.31 (dd, J = 12.1, 6.9 Hz, 2H), 1.21 - 1.08 (m, 1H).	373.15	E	
I-1243		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.28 (t, J = 4.5 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.03 (ddd, J = 5.0, 1.9, 0.8 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J = 7.2, 5.1, 1.9 Hz, 1H), 6.96 (ddd, J = 7.2, 4.9, 1.1 Hz, 1H), 4.99 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.13 (h, J = 8.9 Hz, 1H), 2.73 - 2.58 (m, 1H), 2.47 - 2.28 (m, 2H), 2.19 (ddd, J = 26.0, 16.7, 10.6 Hz, 2H), 1.67 - 1.51 (m, 3H), 1.45 (s, 2H), 1.37 - 1.26 (m, 2H), 1.16 (d, J = 6.1 Hz, 1H).	373.2	E	
I-1244		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.53- 7.35 (m, 4H), 7.01 (t, J = 56.0 Hz, 1H), 4.63 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.48 -2.27 (m, 4H), 2.16 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 1.76 - 1.65 (m, 1H), 1.63 - 1.36 (m, 4H), 1.34 - 1.19 (m, 2H), 1.08 (dq, J = 16.4, 8.2 Hz, 1H).	390.2	E	

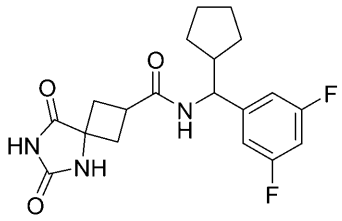
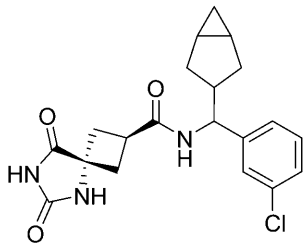
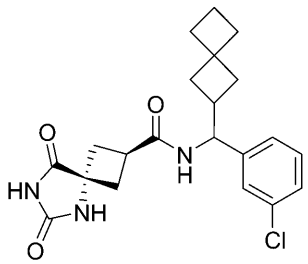
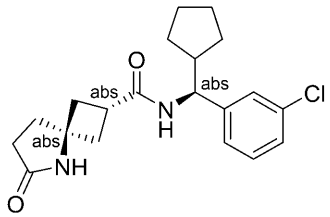
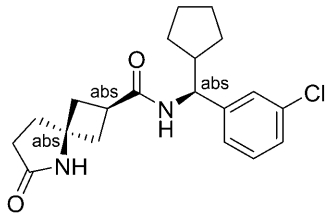
【表１－３０５】

I-1245		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.48 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.53 - 7.36 (m, 3H), 7.01 (t, J = 56.0 Hz, 1H), 4.63 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.47 - 2.27 (m, 4H), 2.17 (h, J = 8.5 Hz, 1H), 1.78 - 1.66 (m, 1H), 1.63 - 1.37 (m, 4H), 1.28 (dd, J = 14.2, 9.1 Hz, 2H), 1.16 - 1.02 (m, 1H).	390.2	E	
I-1246		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.53-7.35 (m, 4H), 7.01 (t, J = 56.0 Hz, 1H), 4.62 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 16.2, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.28 -2.19 (m, 2H), 2.14 (ddt, J = 12.9, 8.9, 4.8 Hz, 1H), 1.74 (tt, J = 12.1, 5.7 Hz, 1H), 1.65 - 1.37 (m, 4H), 1.36 - 1.19 (m, 2H), 1.08 (dq, J = 12.4, 8.2 Hz, 1H).	393.2	E	
I-1247		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.54 - 7.35 (m, 4H), 7.01 (t, J = 56.0 Hz, 1H), 4.62 (dd, J = 9.9, 8.6 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.75 - 2.60 (m, 2H), 2.27- 2.19 (m, 2H), 2.14 (ddt, J = 13.0, 8.9, 4.9 Hz, 1H), 1.79 - 1.69 (m, 1H), 1.65- 1.37 (m, 4H), 1.35 -1.19 (m, 2H), 1.08 (dq, J = 12.5, 8.2 Hz, 1H).	392.3	D	
I-1248		(400 MHz, メタノール-d4) 7.65-7.23 (m, 4H), 6.76 (t, J = 56.3 Hz, 1H), 4.67 (dd, J = 15.9, 10.4 Hz, 1H), 3.25-3.14 (m, 1H), 2.94-2.84 (m, 1H), 2.67-2.52 (m, 1H), 2.51- 2.23 (m, 3H), 1.92 (dt, J = 8.8, 4.7 Hz, 1H), 1.77- 1.49 (m, 4H), 1.47-1.30 (m, 2H), 1.15 (dt, J = 12.8, 8.0 Hz, 1H).	392.15	D	

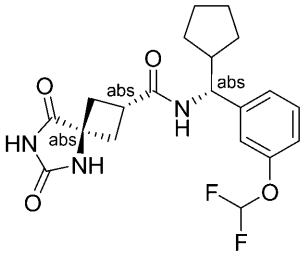
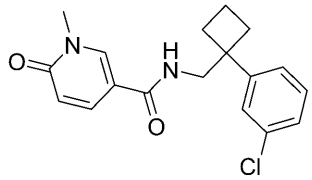
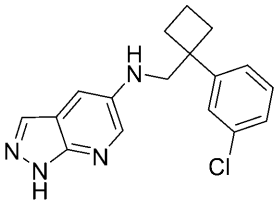
【表１－３０６】

I-1249		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.11 - 7.01 (m, 3H), 4.63 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.48 - 2.36 (m, 4H), 2.12 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 1.67 (dd, J = 12.1, 7.3 Hz, 1H), 1.59 - 1.54 (m, 2H), 1.49 (dd, J = 16.0, 7.8 Hz, 1H), 1.44 (s, 1H), 1.30 - 1.18 (m, 2H), 1.12 (s, 1H).	378.2	E	
I-1250		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.11 - 7.01 (m, 3H), 4.63 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.16 - 3.02 (m, 1H), 2.48 - 2.27 (m, 4H), 2.11 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 1.67 (s, 1H), 1.56 (dd, J = 7.2, 3.8 Hz, 2H), 1.52 - 1.37 (m, 2H), 1.34 - 1.19 (m, 2H), 1.19 - 1.07 (m, 1H).	378.15	E	
I-1251		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.11 - 7.00 (m, 3H), 4.61 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 15.1, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.29 - 2.08 (m, 3H), 1.70 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 1.59 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.54 (s, 2H), 1.52 - 1.39 (m, 1H), 1.27 (t, J = 10.6 Hz, 2H), 1.14 (q, J = 11.7, 10.0 Hz, 1H).	378.2	E	
I-1252		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.11 - 7.00 (m, 3H), 4.61 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73 - 2.59 (m, 2H), 2.29 - 2.08 (m, 3H), 1.74 - 1.67 (m, 1H), 1.58 (s, 2H), 1.55 - 1.36 (m, 1H), 1.27 (t, J = 10.3 Hz, 3H), 1.14 (dt, J = 12.5, 8.2 Hz, 1H).	378.15	D	

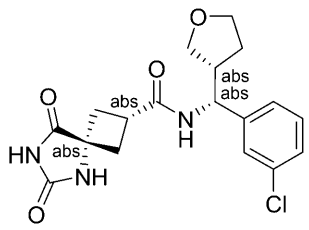
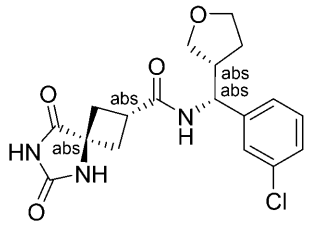
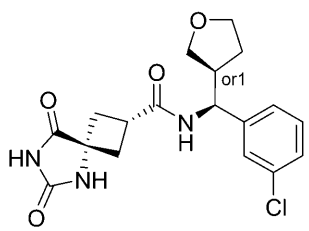
【表１－３０７】

I-1253		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.12 - 7.01 (m, 3H), 4.62 (td, J = 9.2, 5.4 Hz, 1H), 3.20 - 3.02 (m, 1H), 2.67 - 2.59 (m, 1H), 2.44 - 2.35 (m, 2H), 2.25 - 2.04 (m, 2H), 1.74 - 1.64 (m, 1H), 1.57 (s, 2H), 1.46 (s, 2H), 1.24 (s, 2H), 1.14 (q, J = 11.7, 9.8 Hz, 1H).	378.15	D	
I-1254			388.2	B	D
I-1255			402.2	E	
I-1256			361.33	C	C
I-1257			361.23	D	

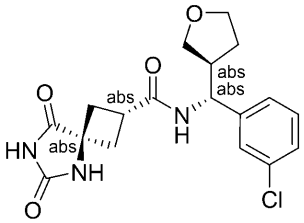
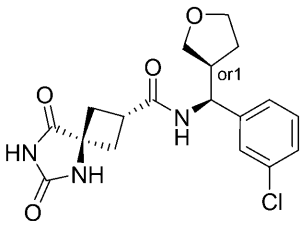
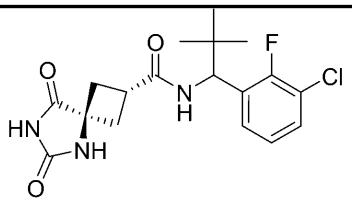
【表１－３０８】

I-1258		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.41 - 7.15 (m, 3H), 7.11 (s, 1H), 7.02 (dd, J = 7.2, 3.0 Hz, 1H), 4.59 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 2.81 - 2.61 (m, 2H), 2.27 - 2.09 (m, 3H), 1.72 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 1.58 (s, 2H), 1.52 - 1.37 (m, 2H), 1.37 - 1.21 (m, 2H), 1.15 - 1.02 (m, 1H).	408.05	E	
I-1259		(400 MHz, DMSO-d6) δ 8.24 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 8.07 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 9.5, 2.6 Hz, 1H), 7.31 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.21 (ddd, J = 7.9, 1.9, 0.8 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.09 - 7.06 (m, 1H), 6.38 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.55 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 3.45 (s, 3H), 2.37 - 2.30 (m, 2H), 2.25 - 2.16 (m, 2H), 2.08 - 1.96 (m, 1H), 1.81 - 1.71 (m, 1H) ppm.	331.2	E	
I-1260		NMR (400 MHz, DMSOd6) δ 13.09 (s, 1H), 8.06 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.3 (埋没した t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.28 (埋没した s, 1H), 7.21 (埋没した d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.19 (埋没した dd, J = 7.3, 1.0 Hz, 1H), 6.97 (br s, 1H), 5.45 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 3.37 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.37-2.23 (m, 4H), 2.17 - 2.05 (m, 1H), 1.88 - 1.76 (m, 1H).	313.2	E	

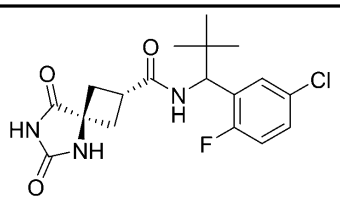
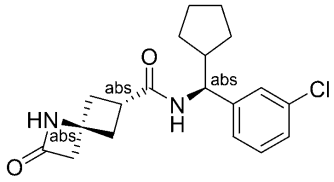
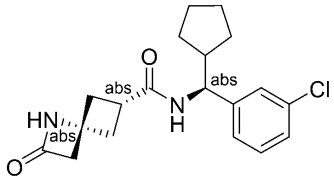
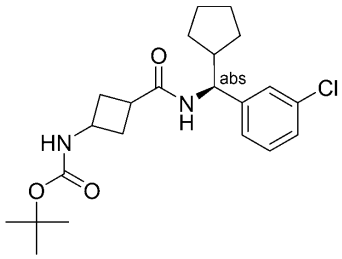
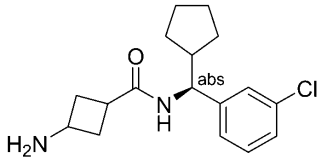
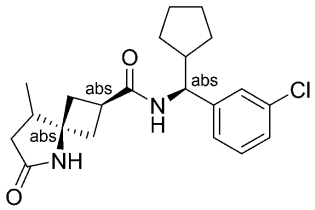
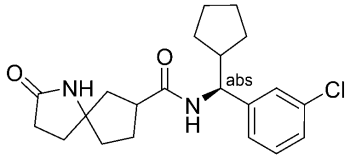
【表１－３０９】

I-1261		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.43 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.40 - 7.26 (m, 3H), 4.68 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 3.79 - 3.70 (m, 2H), 3.58 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 3.46 (dd, J = 8.7, 6.4 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.72 - 2.54 (m, 3H), 2.30 - 2.09 (m, 2H), 1.65 - 1.52 (m, 1H), 1.43 (dq, J = 14.8, 7.5 Hz, 1H).	378.1	E	
I-1262		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.53 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.42 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.39 - 7.27 (m, 4H), 4.71 - 4.62 (m, 1H), 3.73 (td, J = 8.2, 5.0 Hz, 2H), 3.57 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 3.43 (dd, J = 8.6, 6.5 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.56 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 2.46 - 2.33 (m, 2H), 2.29 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 1.57 (dt, J = 12.8, 6.2 Hz, 1H), 1.42 (dq, J = 14.9, 7.7 Hz, 1H).	378.1	E	
I-1263		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.62 - 8.36 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.44 - 7.22 (m, 4H), 4.72 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.74 (td, J = 8.2, 4.7 Hz, 1H), 3.62 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 3.41 (s, 1H), 3.22 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 3.09 (h, J = 8.5 Hz, 1H), 2.69 - 2.53 (m, 1H), 2.48 - 2.28 (m, 4H), 1.93 (dtd, J = 12.6, 7.7, 4.8 Hz, 1H), 1.64 (dq, J = 12.4, 7.5 Hz, 1H).	378.1	E	

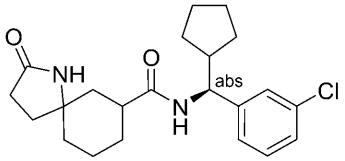
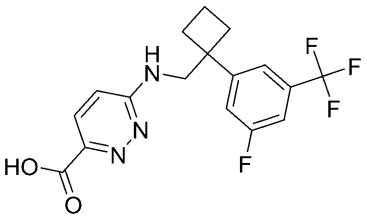
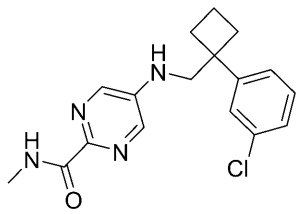
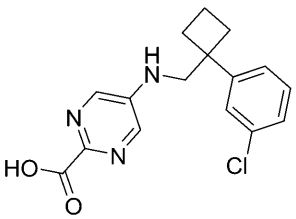
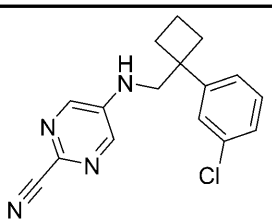
【表１－３１０】

I-1264		(400 MHz, DMSO-d6) 10.41 (s, 1H), 8.55 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.44 - 7.21 (m, 4H), 4.72 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.74 (td, J = 8.2, 4.8 Hz, 1H), 3.62 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 3.39 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 3.22 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69 - 2.54 (m, 1H), 2.48 - 2.27 (m, 4H), 1.98 - 1.85 (m, 1H), 1.64 (dq, J = 12.2, 7.5 Hz, 1H).	378.1	E	
I-1265		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.40 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.44 - 7.24 (m, 4H), 4.72 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.75 (td, J = 8.2, 5.0 Hz, 1H), 3.63 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 3.39 (dd, J = 8.6, 7.4 Hz, 1H), 3.23 (dd, J = 8.6, 6.9 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (tdd, J = 15.1, 10.9, 8.1 Hz, 3H), 2.24 (ddd, J = 12.4, 9.0, 4.2 Hz, 1H), 2.16 (ddd, J = 12.9, 9.0, 4.2 Hz, 1H), 1.95 (dtd, J = 12.6, 7.7, 5.0 Hz, 1H), 1.67 (dq, J = 12.3, 7.5 Hz, 1H).	378.05	E	
I-1266				B	

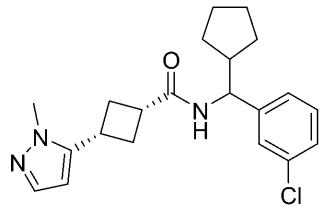
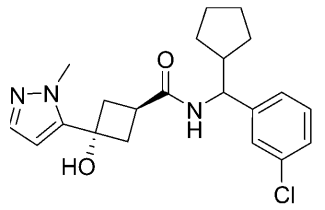
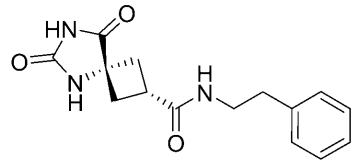
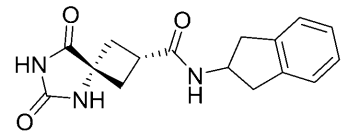
【表１－３１１】

I-1267				B	
I-1268				C	
I-1269				C	
I-1270			307.17	E	
I-1271			307.22	D	
I-1272			375.28	C	
I-1273			375.28	C	

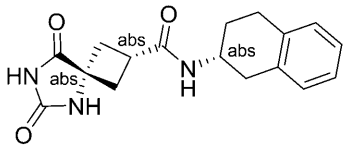
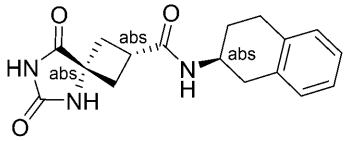
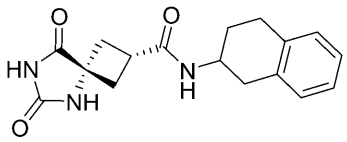
【表１－３１２】

I-1274			389.28	D	
I-1275		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 8.36 (d,J= 5.3 Hz, 0.5H), 7.60 (dd,J= 9.0, 5.5 Hz, 1H), 7.42 (d,J= 6.4 Hz, 1H), 7.39 - 7.27 (m, 2H), 7.09 (d,J= 5.0 Hz, 1H), 6.73 (dd,J= 8.8, 5.4 Hz, 1H), 3.86 (重複する s, 2H), 2.41 - 2.20 (m, 4H), 2.19 - 2.03 (m, 1H), 1.92 - 1.66 (m, 1H). 微量の不純物。COOH ピークは完全に観察されなかった。	370.3	D	
I-1276		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 8.36 (q,J= 4.6 Hz, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.27 (t,J= 7.8 Hz, 1H), 7.23 (t,J= 1.8 Hz, 1H), 7.20 - 7.13 (m, 2H), 6.57 (t,J= 6.2 Hz, 1H), 3.54 (d,J= 6.2 Hz, 2H), 2.72 (d,J= 4.8 Hz, 3H), 2.34 - 2.21 (m, 4H), 2.20 - 2.04 (m, 1H), 1.91 - 1.72 (m, 1H).	331.2	D	
I-1277		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 8.52 (s, 5H, ギ酸塩), 7.92 (s, 2H), 7.30 (t,J= 7.8 Hz, 1H), 7.26 - 7.23 (m, 1H), 7.22 - 7.14 (m, 2H), 6.22 (br s, 1H), 3.45 (d,J= 6.3 Hz, 2H), 2.38 - 2.20 (m, 4H), 2.17 - 1.99 (m, 1H), 1.94 - 1.73 (m, 1H). 微量の脂肪族不純物。20%w/w のギ酸塩。	318.2	E	
I-1278		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 7.97 (s, 2H), 7.25 (t,J= 7.7 Hz,1H), 7.20 (s, 1H), 7.17 (d,J= 7.7 Hz, 2H), 7.11 (d,J= 7.6 Hz, 1H), 3.58 (s, 2H), 2.26 (t,J= 7.5 Hz, 4H), 2.20 - 2.01 (m, 1H), 1.89 - 1.73 (m, 1H). 濃縮試料	299.2	E	

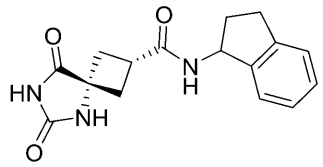
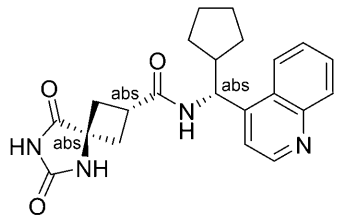
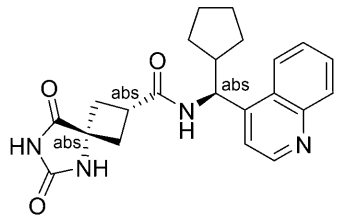
【表１－３１３】

I-1279		(400 MHz, dmso) δ 8.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38 - 7.29 (m, 2H), 7.29 - 7.21 (m, 3H), 6.02 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.65 (s, 3H), 3.50 - 3.39 (m, 1H), 3.09 - 2.99 (埋没した m, 1H), 2.55 - 2.46 (m, 1H), 2.46 - 2.36 (埋没した m, 1H), 2.22 - 2.04 (m, 3H), 1.78 - 1.66 (m, 1H), 1.63 - 1.37 (m, 4H), 1.34 - 1.19 (m, 2H), 1.14 - 1.00 (m, 1H).	372.1	D	
I-1280		(400 MHz, dmso) δ 8.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36 - 7.29 (m, 2H), 7.28 - 7.21 (m, 2H), 7.21 - 7.18 (m, 1H), 6.02 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 5.73 (br. s, 1H), 4.53 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.74 (s, 3H), 3.26 (埋没した m, 1H), 2.53 (埋没した m, 2H), 2.47 - 2.38 (m, 1H), 2.37 - 2.27 (m, 1H), 2.21 - 2.10 (m, 1H), 1.75 - 1.64 (m, 1H), 1.64 - 1.37 (m, 4H), 1.32 - 1.18 (m, 2H), 1.13 - 1.00 (m, 1H). 一部ギ酸塩	388.1	D	
I-1281		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 - 10.49 (m, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.91 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 7.29 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 7.23 - 7.15 (m, 3H), 3.31 - 3.22 (m, 2H), 3.07 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 2.72 - 2.63 (m, 2H), 2.15 (td, J = 9.5, 2.8 Hz, 2H).	288.1	E	
I-1282		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.13 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 5.4, 3.3 Hz, 2H), 7.17 - 7.09 (m, 2H), 4.53 - 4.37 (m, 1H), 3.21 - 2.99 (m, 3H), 2.73 (ddd, J = 19.7, 14.4, 7.7 Hz, 4H), 2.16 (ddd, J = 13.0, 8.3, 2.8 Hz, 2H).	300.1	E	

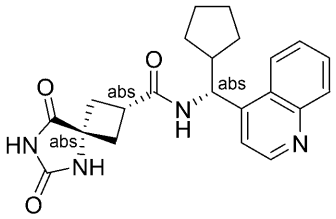
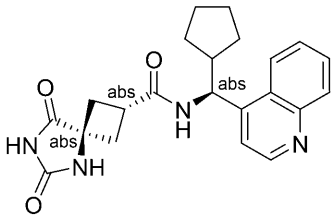
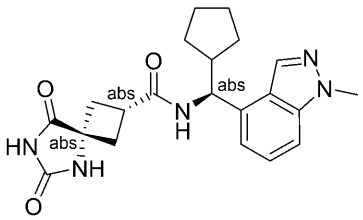
【表１－３１４】

I-1283		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.62 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.13 - 7.02 (m, 4H), 3.94 (s, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.94 (dd, J = 16.2, 5.2 Hz, 1H), 2.81 (q, J = 6.1 Hz, 2H), 2.73 (ddd, J = 13.6, 9.0, 3.0 Hz, 2H), 2.60 (dd, J = 16.3, 9.7 Hz, 1H), 2.23 - 2.13 (m, 2H), 1.98 - 1.88 (m, 1H), 1.70 - 1.55 (m, 1H).	314.1	E	
I-1284		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.90 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.15 - 6.99 (m, 4H), 3.99 - 3.90 (m, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.94 (dd, J = 16.4, 5.3 Hz, 1H), 2.81 (dt, J = 10.6, 5.0 Hz, 2H), 2.73 (ddd, J = 13.8, 9.2, 3.0 Hz, 2H), 2.60 (dd, J = 16.4, 9.7 Hz, 1H), 2.23 - 2.13 (m, 2H), 1.92 (dd, J = 12.3, 4.3 Hz, 1H), 1.63 (dtd, J = 12.4, 10.0, 6.5 Hz, 1H).	314.15	E	
I-1285		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.90 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.15 - 6.99 (m, 4H), 3.95 (s, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.94 (dd, J = 16.2, 5.1 Hz, 1H), 2.81 (q, J = 6.0 Hz, 2H), 2.72 (ddd, J = 12.0, 10.4, 3.0 Hz, 2H), 2.60 (dd, J = 16.4, 9.7 Hz, 1H), 2.23 - 2.13 (m, 2H), 1.95 - 1.88 (m, 1H), 1.63 (dtd, J = 12.5, 10.1, 6.5 Hz, 1H).	314.15	E	

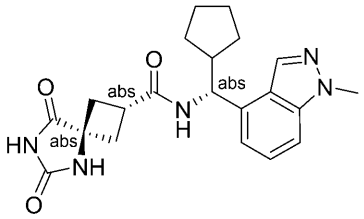
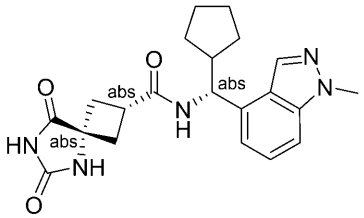
【表１－３１５】

I-1286		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 5.30 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.92 (ddd, J = 15.8, 8.8, 3.2 Hz, 1H), 2.78 (ddd, J = 15.8, 8.9, 4.7 Hz, 3H), 2.37 (dtd, J = 11.4, 7.8, 3.2 Hz, 1H), 2.25 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 2.20 (td, J = 9.2, 8.4, 4.5 Hz, 1H), 1.78 (dq, J = 12.5, 8.7 Hz, 1H).	300.1	E	
I-1287		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.88 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.76 (ddd, J = 8.3, 6.8, 1.3 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J = 8.3, 6.8, 1.4 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 5.49 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.18 - 3.05 (m, 1H), 2.51 - 2.46 (m, 3H), 2.42 - 2.26 (t, J = 10.4 Hz, 2H), 1.74 - 1.60 (m, 1H), 1.57 - 1.41 (m, 4H), 1.33 (s, 1H), 1.14 - 1.00 (m, 1H), 1.07 (s, 1H).	393.1	E	
I-1288		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.88 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.80 - 7.72 (m, 1H), 7.68 - 7.60 (m, 1H), 7.51 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 5.49 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.49 - 2.35 (m, 2H), 2.34 (td, J = 8.1, 7.5, 3.9 Hz, 1H), 2.26 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 1.70 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 1.47 (s, 6H), 1.35 (dd, J = 12.2, 7.7 Hz, 1H), 1.07 (s, 1H).	393.15	E	

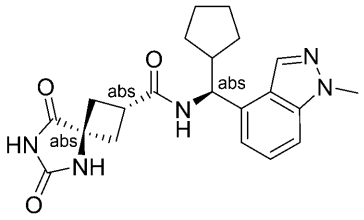
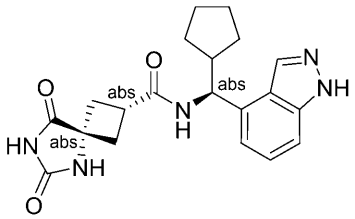
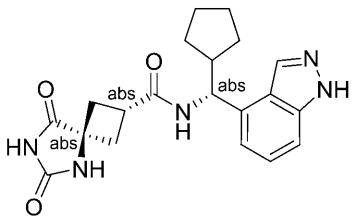
【表１－３１６】

I-1289		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.88 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.76 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.64 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 5.49 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.75 - 2.65 (m, 1H), 2.47 (s, 1H), 2.25 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 2.11 (s, 1H), 1.49 (s, 8H), 1.06 (s, 1H).	393.15	E	
I-1290		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.88 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 8.60 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.76 (ddd, J = 8.3, 6.8, 1.3 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J = 8.3, 6.8, 1.4 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 5.49 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.70 (dd, J = 12.1, 9.1 Hz, 1H), 2.61 (dd, J = 12.1, 9.1 Hz, 1H), 2.29 - 2.18 (m, 1H), 2.11 (ddd, J = 12.8, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 1.80 - 1.62 (m, 3H), 1.54 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 1.48 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.38 - 1.30 (m, 2H), 1.24 (s, 1H), 1.13 - 0.99 (m, 1H).	393.15	D	
I-1291		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 1.1 Hz, 2H), 7.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.31 (dd, J = 8.4, 7.0 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.88 (dd, J = 10.0, 8.3 Hz, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.17 - 3.04 (m, 1H), 2.47-2.37 (m, 3H), 2.35-2.27 (m, 1H), 2.25-2.17 (m, 1H), 1.79 (td, J = 12.1, 7.4 Hz, 1H), 1.66-1.46 (m, 3H), 1.44-1.30 (m, 2H), 1.21 (td, J = 11.9, 11.0, 6.3 Hz, 1H), 1.14 - 1.01 (m, 1H).	396.15	E	

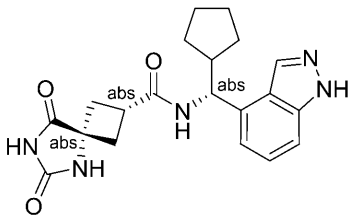
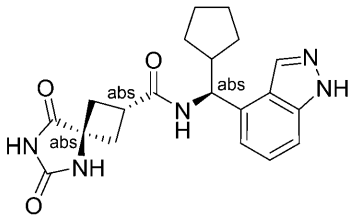
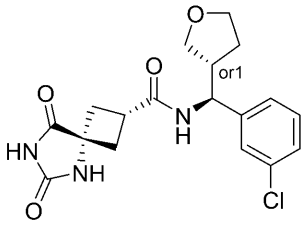
【表１－３１７】

I-1292		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 1.0 Hz, 2H), 7.47 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.31 (dd, J = 8.4, 7.0 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.92- 4.85 (m, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.10 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.47 - 2.36 (m, 3H), 2.30 (dd, J = 7.9, 4.0 Hz, 1H), 2.24 - 2.17 (m, 1H), 1.84 - 1.72 (m, 1H), 1.66 - 1.45 (m, 3H), 1.43 - 1.29 (m, 2H), 1.26 -1.15 (m, 1H), 1.09 (td, J = 12.7, 6.3 Hz, 1H).	396.15	E	
I-1293		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 8.4, 7.0 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.90 (dd, J = 10.1, 8.3 Hz, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.74-2.64 (m, 1H), 2.62 - 2.54 (m, 1H), 2.43 (dt, J = 16.8, 8.1 Hz, 1H), 2.21 (ddd, J = 12.5, 8.9, 4.5 Hz, 1H), 2.09 (ddt, J = 13.9, 9.6, 4.9 Hz, 1H), 1.81 (td, J = 12.2, 7.3 Hz, 1H), 1.68 - 1.45 (m, 3H), 1.45 -1.31 (m, 2H), 1.27 - 1.16 (m, 1H), 1.14-1.00 (m, 1H)	396.15	E	

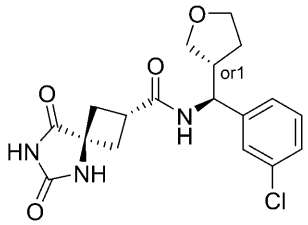
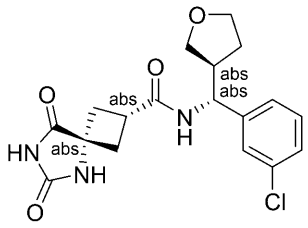
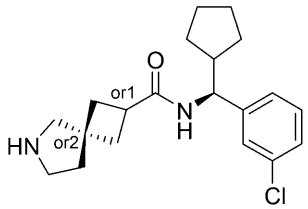
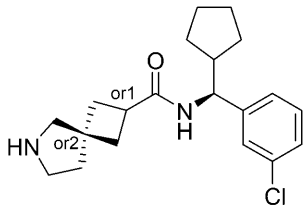
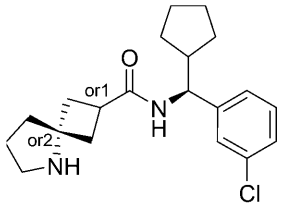
【表１－３１８】

I-1294		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 8.4, 7.0 Hz, 1H), 7.06 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 4.90 (dd, J = 10.1, 8.3 Hz, 1H), 4.02 (s, 3H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (d, J = 21.3 Hz, 1H), 2.60 - 2.54 (m, 1H), 2.44 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.21 (ddd, J = 12.6, 9.0, 4.6 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.8, 8.9, 4.5 Hz, 1H), 1.81 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 1.68 - 1.45 (m, 3H), 1.45- 1.31 (m, 2H), 1.22 (dd, J = 13.3, 5.6 Hz, 1H), 1.13 -1.02 (m, 1H).	396.2	E	
I-1295		(400 MHz, DMSO-d6) 13.02 (s, 1H), 10.57 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.30 - 7.22 (m, 1H), 7.01 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.91 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.43 (t, J = 8.7 Hz, 3H), 2.32 (s, 1H), 2.24 (q, J = 12.1, 10.6 Hz, 1H), 1.84 - 1.74 (m, 1H), 1.57 (d, J = 32.3 Hz, 3H), 1.53 - 1.31 (m, 1H), 1.23 (d, J = 12.9 Hz, 2H), 1.09 (dt, J = 12.6, 7.5 Hz, 1H).	382.15	E	
I-1296		(400 MHz, DMSO-d6) 13.02 (s, 1H), 10.58 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 8.3, 7.0 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.90 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.47 - 2.36 (m, 3H), 2.36 - 2.27 (m, 1H), 2.27 - 2.18 (m, 1H), 1.84 - 1.73 (m, 1H), 1.52 (s, 3H), 1.47 - 1.31 (m, 1H), 1.24 (s, 2H), 1.15 - 1.02 (m, 1H).	382.15	E	

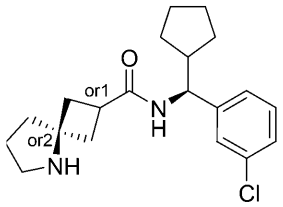
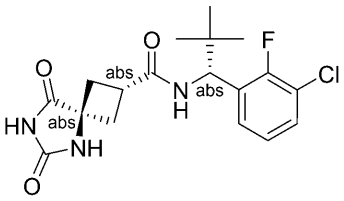
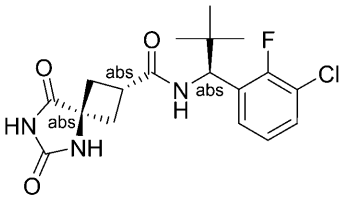
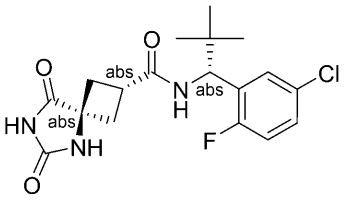
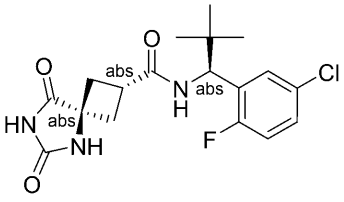
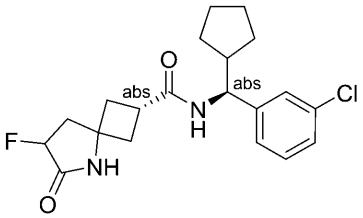
【表１－３１９】

I-1297		(400 MHz, DMSO-d6) 13.02 (s, 1H), 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.92 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.69 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.58 (dd, J = 12.0, 9.3 Hz, 1H), 2.50 - 2.44 (s, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.4, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 2.15 - 2.07 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 1.86 - 1.77 (m, 1H), 1.60 (dd, J = 12.4, 8.5 Hz, 1H), 1.53 (tt, J = 10.9, 5.9 Hz, 1H), 1.48 - 1.34 (m, 3H), 1.26 - 1.19 (m, 1H), 1.09 (qd, J = 13.9, 12.3, 7.7 Hz, 1H).	382.15	E	
I-1298		(400 MHz, DMSO-d6) 13.02 (s, 1H), 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.38 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 8.3, 7.0 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 4.97 - 4.87 (m, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.58 (dd, J = 12.0, 9.3 Hz, 1H), 2.45 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.4, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.8, 7.7, 4.4 Hz, 1H), 1.88 - 1.77 (m, 1H), 1.59 - 1.31 (m, 5H), 1.24 (s, 1H), 1.16 - 1.02 (m, 1H).	382.15	D	
I-1299		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.52 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.45 - 7.25 (m, 4H), 4.67 (dd, J = 10.2, 8.7 Hz, 1H), 3.79 - 3.68 (m, 2H), 3.57 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 3.43 (dd, J = 8.6, 6.5 Hz, 1H), 3.05 (tt, J = 9.6, 8.1 Hz, 1H), 2.69 - 2.54 (m, 1H), 2.47 - 2.24 (m, 4H), 1.58 (dtd, J = 12.5, 7.8, 4.8 Hz, 1H), 1.48 - 1.38 (m, 1H).	378.1	E	

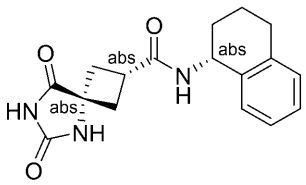
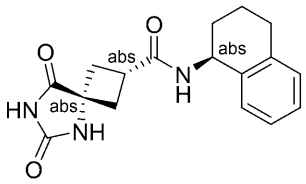
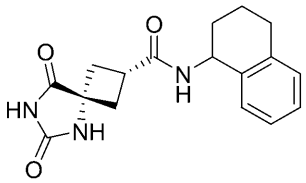
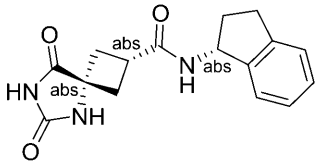
【表１－３２０】

I-1300		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.46 - 7.25 (m, 4H), 4.75 - 4.62 (m, 1H), 3.80 - 3.70 (m, 2H), 3.58 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 3.46 (dd, J = 8.6, 6.5 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73 - 2.54 (m, 3H), 2.29 - 2.05 (m, 2H), 1.58 (dt, J = 12.6, 6.3 Hz, 1H), 1.48 - 1.36 (m, 1H).	378.1	D	
I-1301		(400 MHz, メタノール-d4) | 7.44 - 7.23 (m, 4H), 4.81 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 3.94 (td, J = 8.3, 5.0 Hz, 1H), 3.79 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 3.54 (dd, J = 8.8, 7.3 Hz, 1H), 3.40 - 3.35 (m, 1H), 3.22 (tt, J = 9.6, 8.2 Hz, 1H), 2.90 (dddd, J = 12.4, 6.7, 3.4, 1.3 Hz, 2H), 2.83 - 2.69 (m, 1H), 2.55 - 2.38 (m, 2H), 2.14 (dtd, J = 12.8, 7.8, 5.0 Hz, 1H), 1.86 (dq, J = 12.6, 7.5 Hz, 1H).	378.1	E	
I-1302				D	
I-1303				D	
I-1304				D	

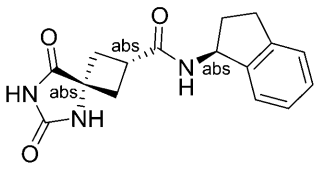
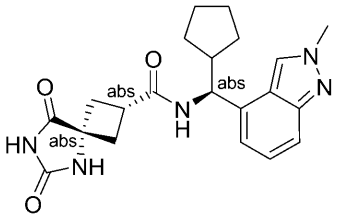
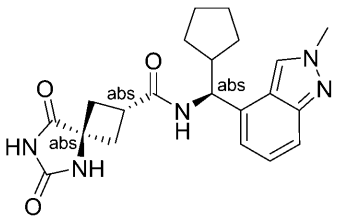
【表１－３２１】

I-1305				D	
I-1306				E	
I-1307				B	
I-1308				E	
I-1309				B	B
I-1310			379.23	D	

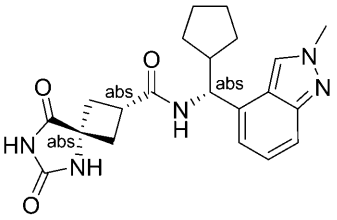
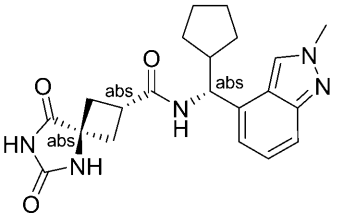
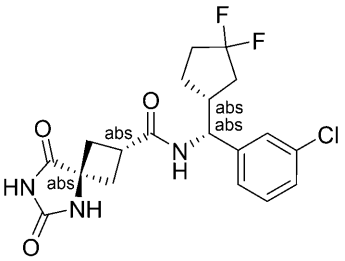
【表１－３２２】

I-1311		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.20 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 3.1 Hz, 3H), 7.09 (p, J = 3.1 Hz, 1H), 5.00 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73 (td, J = 19.1, 16.6, 10.6 Hz, 4H), 2.21 (q, J = 9.3 Hz, 2H), 1.87 (d, J = 10.8 Hz, 2H), 1.69 (tt, J = 17.2, 9.4 Hz, 2H).	314.15	E	
I-1312		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.20 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 3.2 Hz, 3H), 7.11 - 7.06 (m, 1H), 4.98 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.82 - 2.64 (m, 4H), 2.22 (qd, J = 9.8, 9.4, 5.1 Hz, 2H), 1.92 - 1.81 (m, 2H), 1.69 (tt, J = 16.8, 9.6 Hz, 2H).	314.15	E	
I-1313		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.20 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 3.1 Hz, 3H), 7.08 (dd, J = 7.2, 2.8 Hz, 1H), 5.03 - 4.93 (m, 1H), 3.15 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.73 (dtd, J = 23.9, 11.7, 11.2, 4.5 Hz, 4H), 2.22 (qd, J = 10.0, 9.5, 5.2 Hz, 2H), 1.87 (dt, J = 11.1, 3.9 Hz, 2H), 1.68 (ddd, J = 18.9, 14.9, 8.1 Hz, 2H).	314.2	E	
I-1314		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.28 - 7.14 (m, 4H), 5.30 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.92 (ddd, J = 15.8, 8.8, 3.2 Hz, 1H), 2.78 (ddd, J = 15.2, 8.4, 4.0 Hz, 3H), 2.37 (dtd, J = 12.5, 7.8, 3.2 Hz, 1H), 2.29 - 2.15 (m, 2H), 1.78 (dq, J = 12.5, 8.7 Hz, 1H).	300.05	E	

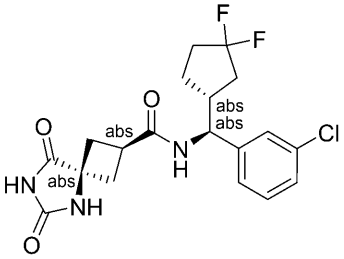
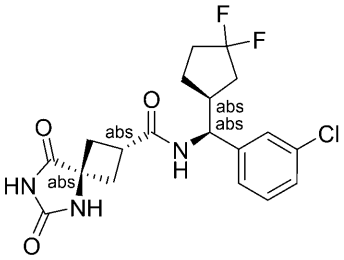
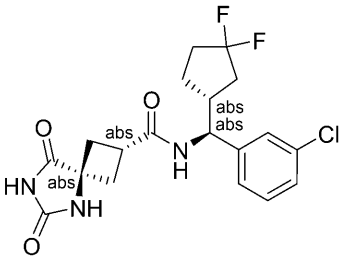
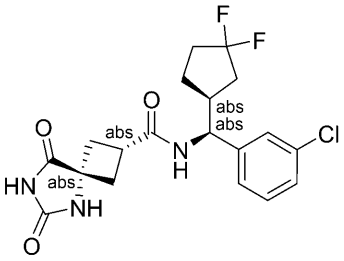
【表１－３２３】

I-1315		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.27 - 7.15 (m, 4H), 5.30 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.97 - 2.86 (m, 1H), 2.79 (td, J = 13.5, 10.8, 7.5 Hz, 3H), 2.36 (dt, J = 12.8, 4.0 Hz, 1H), 2.23 (s, 1H), 2.22 (q, J = 11.0, 10.6 Hz, 1H), 1.78 (dq, J = 12.0, 8.7 Hz, 1H).	300.1	E	
I-1316		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.49 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.43 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 8.6, 6.8 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 4.84 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.16 (s, 3H), 3.17 - 3.03 (m, 1H), 2.50 - 2.37 (m, 3H), 2.37 - 2.22 (m, 2H), 1.73 (ddd, J = 12.1, 8.3, 4.6 Hz, 1H), 1.66-1.31 (m, 5H), 1.30 - 1.20 (m, 1H), 1.09 (dq, J = 12.8, 8.2 Hz, 1H).	396.1	E	
I-1317		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.49 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.43 (dt, J = 8.7, 0.9 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 8.6, 6.8 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 4.84 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 4.16 (s, 3H), 3.10 (tt, J = 9.7, 8.2 Hz, 1H), 2.50 - 2.34 (m, 3H), 2.34 - 2.16 (m, 2H), 1.74 (td, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H), 1.66 - 1.27 (m, 6H), 1.24 (s, 1H), 1.21 - 1.02 (m, 1H),	396.3	E	

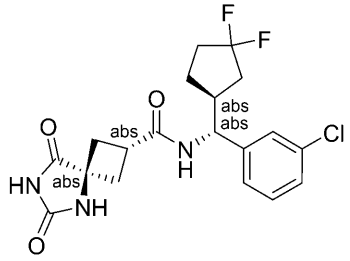
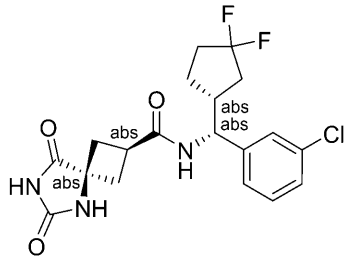
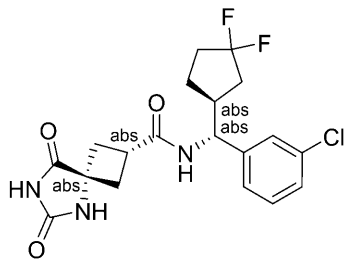
【表１－３２４】

I-1318		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.47 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.43 (dt, J = 8.7, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 8.6, 6.8 Hz, 1H), 6.95 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 4.87 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.16 (s, 3H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70 (dd, J = 12.1, 9.1 Hz, 1H), 2.60 (dd, J = 12.1, 9.1 Hz, 1H), 2.50- 2.39 (m, 1H), 2.23 (ddd, J = 12.4, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 2.16-2.05 (m, 1H), 1.75 (dt, J = 14.5, 6.1 Hz, 1H), 1.68 - 1.22 (m, 6H), 1.19 - 1.03 (m, 1H).	396.35	E	
I-1319		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 8.6, 6.8 Hz, 1H), 6.95 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 4.87 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.16 (s, 3H), 3.12 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.70 (dd, J = 12.0, 9.1 Hz, 1H), 2.60 (dd, J = 12.1, 9.1 Hz, 1H), 2.45 (dd, J = 9.5, 7.6 Hz, 1H), 2.23 (ddd, J = 12.6, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 2.11 (ddd, J = 12.9, 9.0, 4.5 Hz, 1H), 1.82 - 1.70 (m, 1H), 1.66 - 1.22 (m, 6H), 1.20- 1.03 (m, 1H).	396.35	E	
I-1320		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.48 - 7.19 (m, 4H), 4.78 (s, 1H), 3.11 (s, 1H), 2.48 - 2.22 (m, 5H), 2.15 (s, 1H), 2.01 (s, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.55 (s, 1H).	412	D	

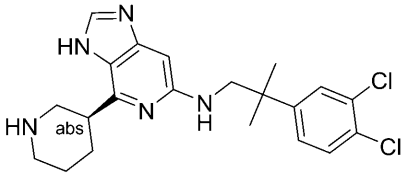
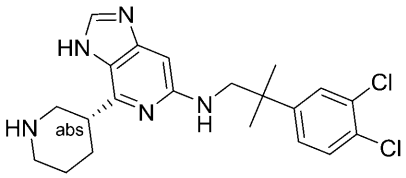
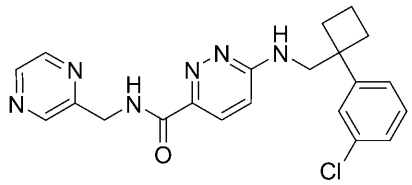
【表１－３２５】

I-1321		(400 MHz, DMSO-d6) 10.72 - 10.41 (m, 1H), 8.51 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.49 -7.21 (m, 4H), 4.73 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.14 - 3.02 (m, 1H), 2.48- 2.35 (m, 3H), 2.35 - 2.27 (m, 1H), 2.25 -2.05 (m, 2H), 2.03 - 1.79 (m, 2H), 1.42 (q, J = 8.7 Hz, 2H).	412	E	
I-1322		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.60 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.49 - 7.23 (m, 3H), 4.78 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 15.8, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.25 (ddd, J = 12.3, 9.1, 4.1 Hz, 1H), 2.16 (ddt, J = 14.4, 10.0, 4.8 Hz, 2H), 2.09 - 1.93 (m, 1H), 1.92- 1.71 (m, 3H), 1.57 (dq, J = 13.0, 9.1 Hz, 1H).	412.05	C	
I-1323		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38- 7.33 (m, 1H), 7.30 (tt, J = 6.5, 1.5 Hz, 2H), 4.72 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 21.8, 12.1, 8.8 Hz, 2H), 2.46 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 2.30 - 2.05 (m, 4H), 2.04 - 1.81 (m, 2H), 1.50- 1.34 (m, 2H).	412.15	C	
I-1324		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.44 - 7.23 (m, 4H), 4.78 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.15 - 3.06 (m, 1H), 2.42 (d, J = 10.3 Hz, 4H), 2.34 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 2.14 (s, 1H), 2.02 (s, 1H), 1.82 (d, J = 14.4 Hz, 3H), 1.56 (d, J = 11.7 Hz, 1H).	412.05	D	

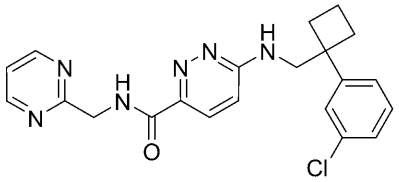
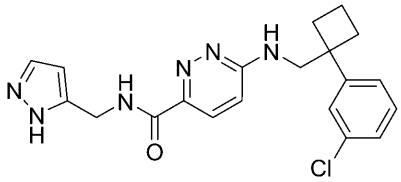
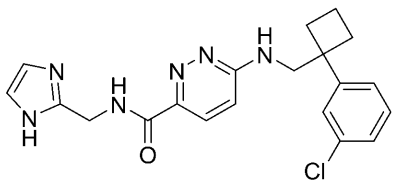
【表１－３２６】

I-1325		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.44 - 7.22 (m, 4H), 4.73 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.08 (dd, J = 9.7, 8.0 Hz, 1H), 2.49 - 2.35 (m, 4H), 2.29 (d, J = 10.6 Hz, 1H), 2.15 (ddt, J = 36.6, 13.8, 7.7 Hz, 2H), 2.04 - 1.78 (m, 2H), 1.42 (q, J = 8.6 Hz, 2H).	412.05	E	
I-1326		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.60 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.34 (m, 1H), 7.30 (ddt, J = 7.4, 5.9, 1.5 Hz, 2H), 4.78 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 15.8, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.48- 2.40 (m, 1H), 2.25 (ddd, J = 12.4, 9.1, 4.2 Hz, 1H), 2.16 (ddt, J = 14.5, 10.0, 4.6 Hz, 2H), 2.01 (dtd, J = 17.3, 13.7, 8.9 Hz, 1H), 1.92 -1.72 (m, 3H), 1.57 (dq, J = 12.9, 9.1 Hz, 1H).	412.05	E	
I-1327		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 - 10.50 (m, 1H), 8.59 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.38 -7.27 (m, 3H), 4.73 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 21.6, 12.2, 8.8 Hz, 2H), 2.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.31 - 2.06 (m, 4H), 2.01 - 1.80 (m, 2H), 1.42 (q, J = 9.0 Hz, 2H).	412.15	E	

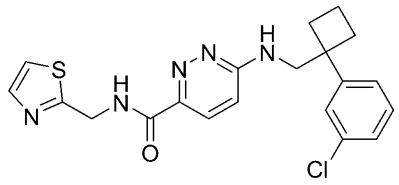
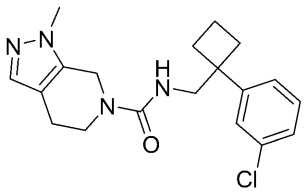
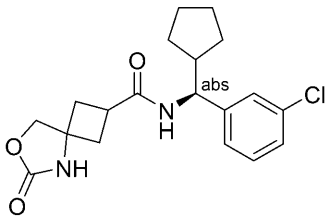
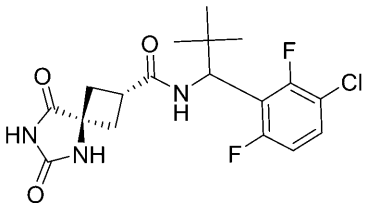
【表１－３２７】

I-1328		(400 MHz, DMSO-d6) 7.88 (s, 1H), 7.63 (q, J = 2.9, 2.3 Hz, 1H), 7.57- 7.49 (m, 1H), 7.46 - 7.40 (m, 1H), 6.30 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 3.55 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 2.99 (s, 3H), 2.68 - 2.57 (m, 1H), 2.33 (s, 1H), 1.88 (s, 2H), 1.66 (s, 1H), 1.50 (s, 1H), 1.32 (s, 6H).	418.1	E	
I-1329		(400 MHz, DMSO-d6) 11.95 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.63 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.4, 2.2 Hz, 1H), 6.31 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 3.55 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 3.14 - 2.80 (m, 3H), 2.68-2.52 (m, 2H), 1.91 - 1.85 (m, 2H), 1.66 (s, 1H), 1.51 (s, 1H), 1.32 (s, 6H).	418.1	E	
I-1330		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.40 (t,J= 6.1 Hz, 1H), 8.60 (d,J= 1.4 Hz, 1H), 8.58 (dd,J= 2.4, 1.6 Hz, 1H), 8.52 (d,J= 2.5 Hz, 1H), 7.66 (d,J= 9.3 Hz, 1H), 7.36 - 7.27 (重複する m, 1H), 7.31 (重複する dd,J= 8.4, 7.7 Hz, 1H), 7.25 - 7.18 (m, 2H), 7.14 (td,J= 7.7, 1.3 Hz, 1H), 6.85 (br d,J= 8.7 Hz, 1H), 4.63 (d,J= 6.1 Hz, 2H), 3.87 (d,J= 5.4 Hz, 2H), 2.42 - 2.19 (m, 4H), 2.18 - 2.02 (m, 1H), 1.91 - 1.69 (m, 1H). 小さなギ酸塩シグナル	409.2	D	

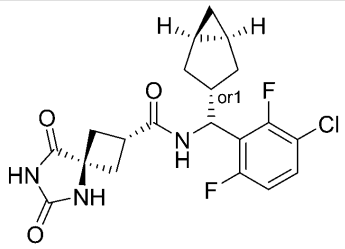
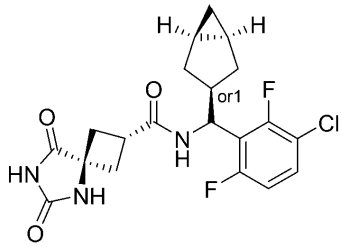
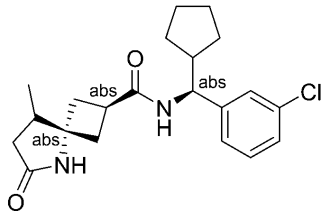
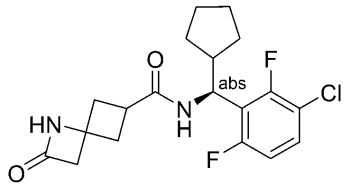
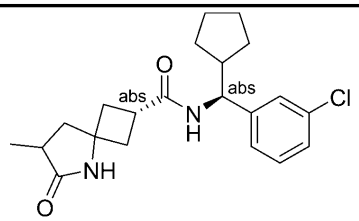
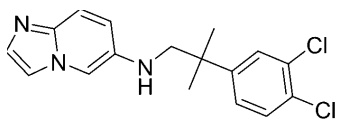
【表１－３２８】

I-1331		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.15 (t,J= 5.7 Hz, 1H), 8.78 (d,J= 4.9 Hz, 2H), 7.66 (d,J= 9.3 Hz, 1H), 7.41 (t,J= 4.9 Hz, 1H), 7.37 - 7.24 (2つの重複する m, 2H), 7.24 - 7.18 (m, 2H), 7.18 - 7.12 (m, 1H), 6.86 (br d,J= 8.8 Hz, 1H), 4.68 (d,J= 5.7 Hz, 2H), 3.88 (d,J= 5.4 Hz, 2H), 2.40 - 2.20 (m, 4H), 2.19 - 2.03 (m, 1H), 1.89 - 1.74 (m, 1H). 小さなギ酸塩シグナル	409.2	D	
I-1332		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 12.59 (br s, 1H), 8.97 (br s, 1H), 7.66 (d,J= 9.3 Hz, 1H), 7.54 (br s, 1H), 7.32 - 7.24 (重複する m, 1H), 7.31 (dd,J= 8.4, 7.7, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 2H), 7.14 (dt,J= 7.7, 1.2 Hz, 1H), 6.84 (br d,J= 9.0 Hz, 1H), 6.14 (d,J= 1.5 Hz, 1H), 4.45 (d,J= 6.0 Hz, 2H), 3.85 (d,J= 5.5 Hz, 2H), 2.39 - 2.15 (m, 4H), 2.16 - 1.89 (m, 2H), 1.87 - 1.62 (m, 2H). 小さなギ酸塩シグナル	397.2	D	
I-1333		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 9.02 (t,J= 5.9 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.66 (d,J= 9.3 Hz, 1H), 7.32 (2つの重複する m, 2H), 7.25 - 7.18 (m, 2H), 7.14 (dt,J= 7.7, 1.2 Hz, 1H), 6.90 (s, 2H), 6.84 (br d,J= 8.2 Hz, 1H), 4.48 (d,J= 5.9 Hz, 2H), 3.86 (d,J= 5.6 Hz, 2H), 2.39 - 2.16 (m, 4H), 2.16 - 1.96 (m, 1H), 1.87 - 1.66 (m, 1H). 約 15～20%の不純物(既知/アッセイした化合物)	397.2	D	

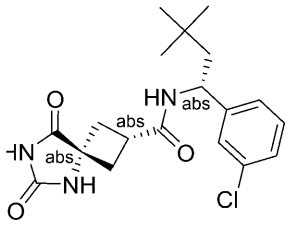
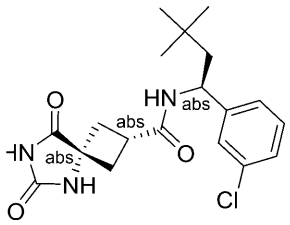
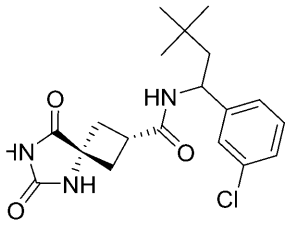
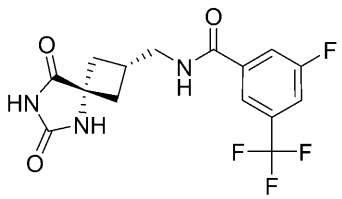
【表１－３２９】

I-1334		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 9.61 (t,J= 6.2 Hz, 1H), 7.71 (d,J= 3.3 Hz, 1H), 7.67 (d,J= 9.3 Hz, 1H), 7.59 (d,J= 3.3 Hz, 1H), 7.36 (埋没した m, 1H), 7.31 (dd,J= 8.4, 7.7 Hz, 1H), 7.25 - 7.18 (m, 2H), 7.14 (td,J= 7.7, 1.3 Hz, 1H), 6.85 (d,J= 8.8 Hz, 1H), 4.72 (d,J= 6.3 Hz, 2H), 3.88 (d,J= 5.3 Hz, 2H), 2.42 - 2.19 (m, 4H), 2.18 - 1.97 (m, 1H), 1.89 - 1.66 (m, 1H). 小さなギ酸塩シグナル。約 5～10%の混合不純物。	414.3	D	
I-1335		(400 MHz, DMSO-d6) δ 7.42 (s, 1H), 7.32 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.0, 2.1, 1.0 Hz, 1H), 7.10 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.06 (ddd, J = 7.6, 1.5, 1.1 Hz, 1H), 6.32 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 3.63 (s, 3H), 3.42 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 3.33 - 3.31 (m, 2H), 2.62 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 2.34 - 2.25 (m, 2H), 2.21 - 2.12 (m, 2H), 2.05 - 1.93 (m, 1H), 1.79 - 1.70 (m, 1H). 3.33-3.31ppm の 2H マルチプレットは、残留 H2O のピークによって部分的に不明瞭である。THF と思われる不純物を含有。	359.3	E	
I-1336				C	
I-1337				A	B

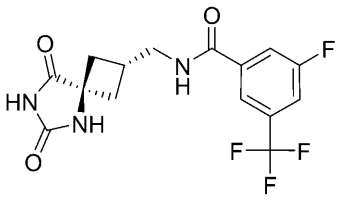
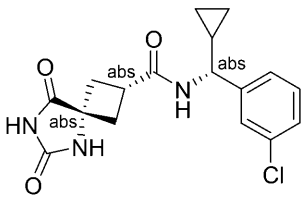
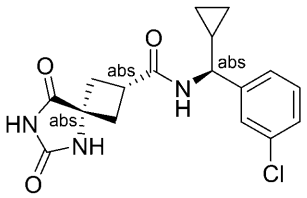
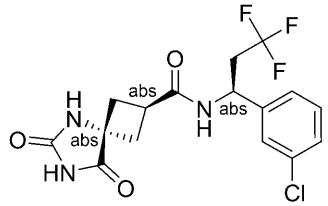
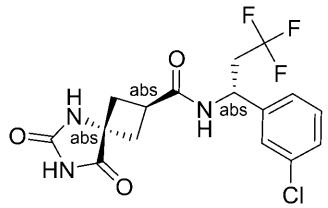
【表１－３３０】

I-1338				A	B
I-1339				B	
I-1340				C	
I-1341			383.33	A	B
I-1342			375.23	D	
I-1343		(400 MHz, dmso) δ 8.19 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 7.66 - 7.62 (m, 3H), 7.56 (dd, J = 8.5, 0.7 Hz, 1H), 7.42 (ddd, J = 8.5, 2.2, 0.7 Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.26 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 9.7, 2.1 Hz, 1H), 5.11 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 3.13 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 1.37 (s, 6H). 8.19 の余分なプロトンはギ酸塩に対応する。	334.1	D	

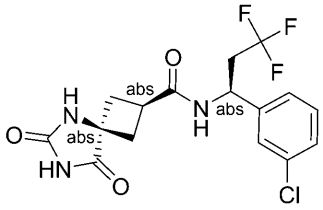
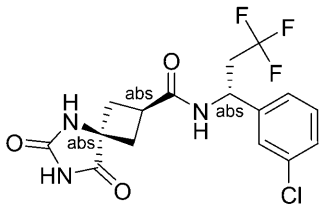
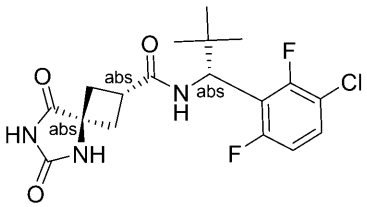
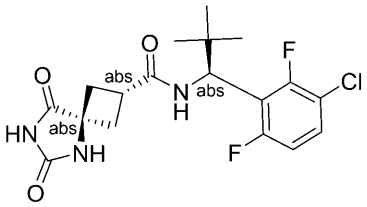
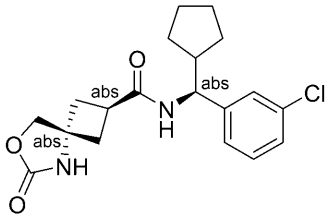
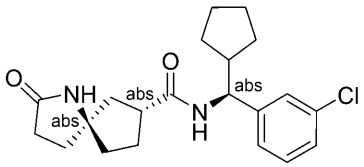
【表１－３３１】

I-1344		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.29 - 7.20 (m, 2H), 4.92 (td, J = 9.1, 3.0 Hz, 1H), 3.10 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (t, J = 10.6 Hz, 2H), 2.17 (dddd, J = 16.2, 12.9, 8.9, 4.5 Hz, 2H), 1.74 (dd, J = 14.3, 9.7 Hz, 1H), 1.46 (dd, J = 14.3, 3.1 Hz, 1H), 0.91 (s, 9H).	378.1	D	
I-1345		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.25 (ddt, J = 13.9, 7.4, 1.4 Hz, 2H), 4.92 (td, J = 9.2, 3.0 Hz, 1H), 3.12 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 11.9, 9.4 Hz, 2H), 2.25 - 2.01 (m, 2H), 1.72 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 1.46 (dd, J = 14.3, 3.2 Hz, 1H), 0.91 (s, 9H).	378.05	D	
I-1346		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.25 (ddt, J = 13.8, 7.4, 1.4 Hz, 2H), 4.92 (td, J = 9.1, 3.1 Hz, 1H), 3.19 - 3.05 (m, 1H), 2.67 (dd, J = 12.1, 9.3 Hz, 2H), 2.17 (dd, J = 11.8, 7.5 Hz, 2H), 1.74 (dd, J = 14.3, 9.7 Hz, 1H), 1.46 (dd, J = 14.3, 3.2 Hz, 1H), 0.91 (s, 9H).	378.25	D	
I-1347		(400 MHz, DMSO-d6)10.55 (s, 1H), 8.84 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.06 (s, 1H), 8.03-7.96 (m, 1H), 7.94-7.88 (m, 1H), 3.31 (s, 2H), 2.56 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 2.43 (ddd, J = 10.8, 7.7, 2.8 Hz, 2H), 2.04 (dt, J = 12.4, 9.7 Hz, 2H).	360	D	

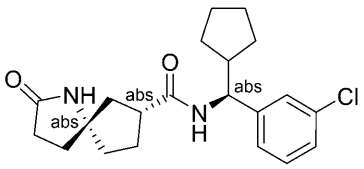
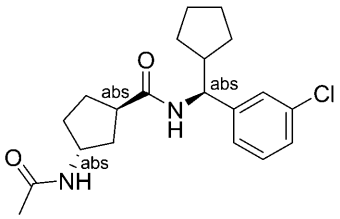
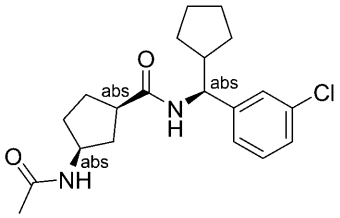
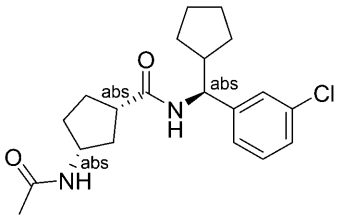
【表１－３３２】

I-1348		(400 MHz, DMSO-d6)10.64-10.49 £m, 1H £(c)8.91 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.99 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.52-3.43 (m, 2H), 2.60 (dd, J = 15.9, 7.9 Hz, 1H), 2.38-2.20 (m, 4H).	360	D	
I-1349		(400 MHz, DMSO-d6) 10.45 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.41 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.38 - 7.27 (m, 3H), 4.21 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (dtd, J = 20.3, 9.1, 2.0 Hz, 2H), 2.27 - 2.13 (m, 2H), 1.18 - 1.03 (m, 1H), 0.49 (dd, J = 8.2, 4.2 Hz, 2H), 0.42 - 0.28 (m, 2H).	348.1	D	
I-1350		(400 MHz, DMSO-d6) 10.45 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.41 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.38 - 7.27 (m, 3H), 4.21 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.76 - 2.61 (m, 2H), 2.29 - 2.13 (m, 2H), 1.12 (ddt, J = 12.4, 8.2, 3.5 Hz, 1H), 0.49 (dd, J = 8.2, 4.2 Hz, 2H), 0.42 - 0.25 (m, 2H).	348	D	
I-1351		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.66 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.46 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.43- 7.28 (m, 3H), 5.20 (td, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 3.11-3.00 (m, 1H), 2.83 - 2.64 (m, 2H), 2.41 (dqd, J = 20.4, 10.8, 6.7 Hz, 4H).	390.1	D	
I-1352		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.66 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.46 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.43 - 7.28 (m, 3H), 5.20 (td, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 3.11 - 2.98 (m, 1H), 2.82 - 2.62 (m, 2H), 2.48 - 2.29 (m, 4H).	390.1	D	

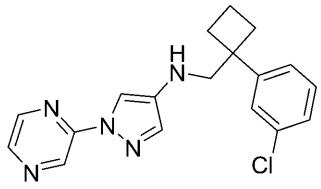
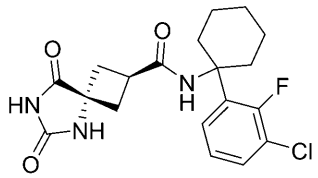
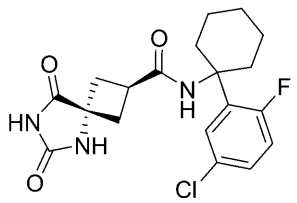
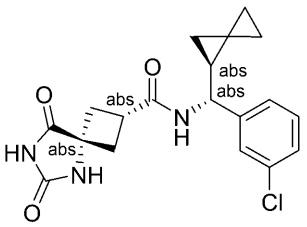
【表１－３３３】

I-1353		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.61 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.47 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.43 - 7.27 (m, 3H), 5.20 (td, J = 8.6, 5.8 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.83 - 2.72 (m, 2H), 2.72- 2.62 (m, 2H), 2.26 - 2.12 (m, 2H).	390.25	D	
I-1354		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.61 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.46 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.42 - 7.30 (m, 3H), 5.20 (td, J = 8.6, 5.7 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.83 - 2.72 (m, 2H), 2.72-2.62 (m, 2H), 2.20 (dddd, J = 15.3, 12.8, 9.1, 4.2 Hz, 2H).	390.2	D	
I-1355				E	
I-1356			400.23	A	B
I-1357				B	
I-1358				B	

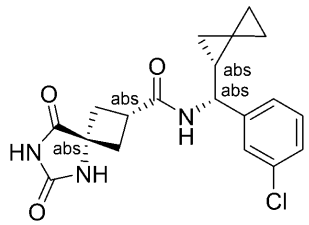
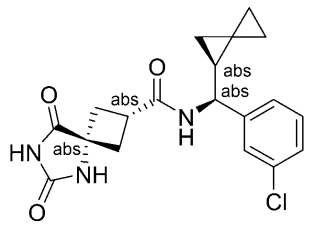
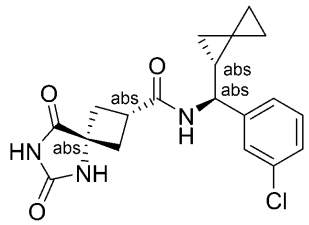
【表１－３３４】

I-1359				C	
I-1360		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.36 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 1H), 7.28 - 7.23 (m, 2H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.07 - 3.97 (m, 1H), 2.75 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.21 - 2.10 (m, 1H), 1.89 - 1.78 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.75 - 1.32 (m, 9H), 1.31 - 1.21 (m, 2H), 1.07 (dq, J = 12.7, 8.6 Hz, 1H).	363.3	B	
I-1361		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.29 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.36 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 1H), 7.28 - 7.23 (m, 2H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.02 - 3.92 (m, 1H), 2.70 - 2.60 (m, 1H), 2.20 - 2.09 (m, 1H), 2.10 - 2.02 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.78 - 1.68 (m, 2H), 1.63 (m, 2H), 1.59 - 1.34 (m, 6H), 1.30 - 1.20 (m, 2H), 1.08 (dq, J = 13.0, 8.6 Hz, 1H).	363.3	D	
I-1362		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.33 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 1H), 7.28 - 7.23 (m, 2H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.02 - 3.91 (m, 1H), 2.67 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.21 - 2.10 (m, 1H), 1.94 (dt, J = 12.5, 7.4 Hz, 1H), 1.81 - 1.67 (m, 4H), 1.73 (s, 3H), 1.62 - 1.34 (m, 5H), 1.32 - 1.21 (m, 3H), 1.08 (dq, J = 12.5, 8.4 Hz, 1H).	363.3	D	

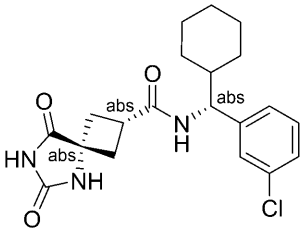
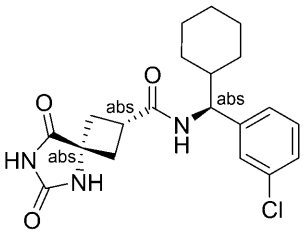
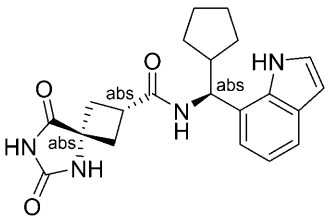
【表１－３３５】

I-1363		(400 MHz, dmso) δ 9.04 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 8.44 - 8.39 (m, 2H), 7.67 (br. s, 1H), 7.41 (br. s, 1H), 7.32 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24 - 7.22 (m, 1H), 7.22 - 7.18 (m, 1H), 7.18 - 7.14 (m, 1H), 4.88 (t, J = 6.4 Hz, 1H), 3.28 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 2.30 - 2.22 (m, 4H), 2.16 - 2.05 (m, 1H), 1.86 - 1.76 (m, 1H).	340.1	E	
I-1364		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.42 (ddd, J = 8.2, 6.7, 1.6 Hz, 1H), 7.32 (td, J = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 3.23 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69 - 2.58 (m, 2H), 2.44 (d, J = 12.6 Hz, 2H), 2.20 (td, J = 9.6, 2.8 Hz, 2H), 1.77 - 1.65 (m, 2H), 1.65 - 1.46 (m, 5H), 1.23 (d, J = 11.9 Hz, 1H).	394.15	E	
I-1365		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.35 - 7.25 (m, 2H), 7.15 (dd, J = 12.2, 8.5 Hz, 1H), 3.23 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (dd, J = 12.8, 9.4 Hz, 2H), 2.41 (d, J = 12.8 Hz, 2H), 2.25 - 2.14 (m, 2H), 1.75 - 1.65 (m, 2H), 1.53 (s, 5H), 1.24 (s, 1H).	394.1	B	C
I-1366		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.36 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38 - 7.27 (m, 3H), 4.29 (dd, J = 9.9, 7.9 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (dt, J = 12.0, 8.7 Hz, 2H), 2.28 - 2.13 (m, 2H), 1.46 (ddd, J = 9.9, 7.8, 4.3 Hz, 1H), 0.99 (dd, J = 7.8, 4.3 Hz, 1H), 0.87 (t, J = 4.4 Hz, 1H), 0.82 - 0.74 (m, 3H), 0.70 (dd, J = 8.2, 4.0 Hz, 1H).	374.15	E	

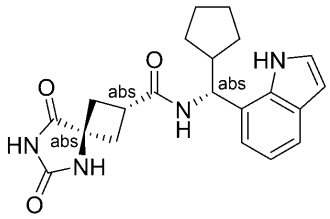
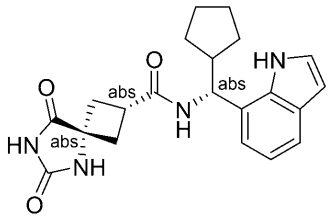
【表１－３３６】

I-1367		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 - 7.24 (m, 3H), 7.17 (dt, J = 7.6, 1.6 Hz, 1H), 4.48 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.80 - 2.65 (m, 2H), 2.21 (ddt, J = 19.5, 12.8, 4.3 Hz, 2H), 1.62 - 1.51 (m, 1H), 1.00 (dd, J = 7.8, 4.2 Hz, 1H), 0.80 (t, J = 4.3 Hz, 1H), 0.77 - 0.67 (m, 3H), 0.64 - 0.56 (m, 1H).	374.15	E	
I-1368		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.47 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38 - 7.24 (m, 3H), 7.16 (dt, J = 7.6, 1.6 Hz, 1H), 4.48 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 (ddd, J = 15.8, 11.7, 8.8 Hz, 2H), 2.29 - 2.13 (m, 2H), 1.62 - 1.49 (m, 1H), 1.00 (dd, J = 7.8, 4.2 Hz, 1H), 0.80 (t, J = 4.3 Hz, 1H), 0.77 - 0.67 (m, 3H), 0.63 - 0.57 (m, 1H).	374.15	D	
I-1369		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.36 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.44 - 7.26 (m, 4H), 4.29 (dd, J = 10.0, 7.9 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (dt, J = 11.9, 8.7 Hz, 2H), 2.29 - 2.12 (m, 2H), 1.46 (ddd, J = 9.9, 7.8, 4.3 Hz, 1H), 0.99 (dd, J = 7.8, 4.3 Hz, 1H), 0.87 (t, J = 4.3 Hz, 1H), 0.83 - 0.74 (m, 3H), 0.73 - 0.66 (m, 1H).	374.2	E	

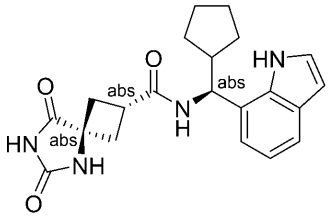
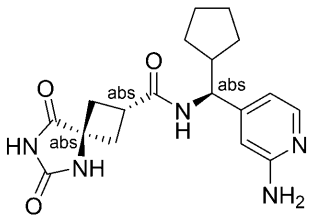
【表１－３３７】

I-1370		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.36 - 7.30 (m, 2H), 7.27 (dt, J = 8.1, 1.3 Hz, 1H), 7.21 (dt, J = 7.6, 1.4 Hz, 1H), 4.55 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.74 - 2.58 (m, 2H), 2.18 (dddd, J = 34.1, 12.9, 9.0, 4.4 Hz, 2H), 1.73 (dd, J = 28.7, 11.7 Hz, 2H), 1.58 (s, 3H), 1.42 - 1.00 (m, 4H), 0.91 (dt, J = 35.4, 11.5 Hz, 2H).	390.2	E	
I-1371		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.36 - 7.30 (m, 2H), 7.30 -7.25 (m, 1H), 7.21 (dt, J = 7.6, 1.4 Hz, 1H), 4.55 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 21.5, 12.1, 9.2 Hz, 2H), 2.18 (dddd, J = 34.3, 13.0, 9.0, 4.4 Hz, 2H), 1.73 (dd, J = 29.2, 11.9 Hz, 2H), 1.56 (d, J = 12.0 Hz, 3H), 1.22 (d, J = 14.6 Hz, 1H), 1.11 (dd, J = 16.4, 6.5 Hz, 3H), 0.89 (dq, J = 33.6, 11.4 Hz, 2H).	390.2	D	
I-1372		(400 MHz, DMSO-d6) 10.98 (s, 1H), 10.59 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.39 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.32 (t, J = 2.8 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.42 (dd, J = 3.1, 1.8 Hz, 1H), 5.11 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.18 - 3.04 (m, 1H), 2.48 - 2.37 (m, 1H), 2.37 - 2.20 (m, 4H), 1.69 (dt, J = 12.1, 5.9 Hz, 1H), 1.65 - 1.51 (m, 2H), 1.50 - 1.33 (m, 3H), 1.31 - 1.23 (m, 1H), 1.15 (dq, J = 12.5, 8.2 Hz, 1H).	381.3	E	

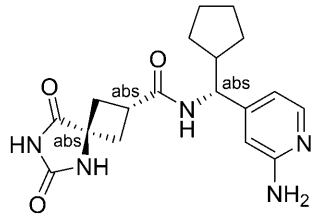
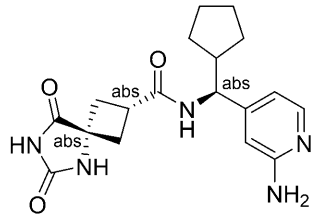
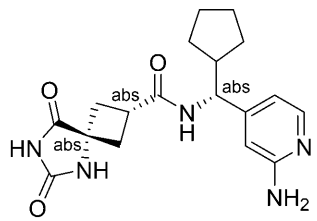
【表１－３３８】

I-1373		(400 MHz, DMSO-d6) 10.98 (s, 1H), 10.59 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.39 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.32 (t, J = 2.8 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.42 (dd, J = 3.1, 1.8 Hz, 1H), 5.11 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.17 - 3.04 (m, 1H), 2.48 - 2.41 (m, 1H), 2.40 - 2.25 (m, 4H), 1.65 - 1.52 (m, 1H), 1.51 - 1.33 (m, 2H), 1.29 (dd, J = 12.2, 7.3 Hz, 3H), 1.24 (s, 1H), 1.21 - 1.07 (m, 1H).	381.3	E	
I-1374		(400 MHz, DMSO-d6) 10.95 (s, 1H), 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.33 (t, J = 2.8 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.42 (dd, J = 3.1, 1.8 Hz, 1H), 5.09 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.74 - 2.59 (m, 2H), 2.43 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.25 (ddd, J = 12.4, 8.9, 4.4 Hz, 1H), 2.17 - 2.04 (m, 1H), 1.79 - 1.68 (m, 1H), 1.67 - 1.53 (m, 2H), 1.53 - 1.43 (m, 1H), 1.43 - 1.34 (m, 2H), 1.28 (td, J = 13.3, 12.7, 8.0 Hz, 1H), 1.19 - 1.09 (m, 1H).	381.15	E	

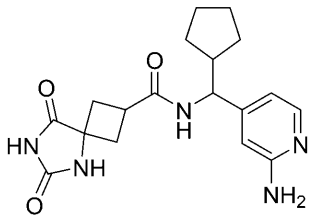
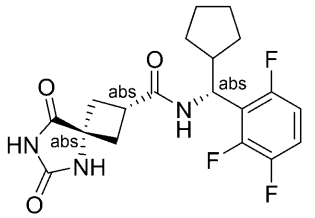
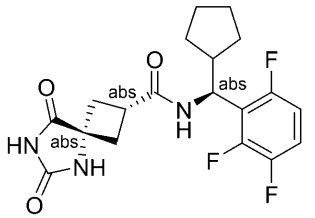
【表１－３３９】

I-1375		(400 MHz, DMSO-d6) 10.95 (s, 1H), 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.42 (dd, J = 3.2, 1.7 Hz, 1H), 5.09 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 25.0, 12.0, 9.2 Hz, 2H), 2.47 - 2.38 (m, 1H), 2.25 (ddd, J = 12.4, 9.0, 4.3 Hz, 1H), 2.11 (ddd, J = 15.7, 8.3, 3.6 Hz, 1H), 1.75 (h, J = 6.8, 6.0 Hz, 1H), 1.68 - 1.59 (m, 1H), 1.58 - 1.44 (m, 2H), 1.43 - 1.33 (m, 2H), 1.33- 1.22 (m, 1H), 1.20 - 1.05 (m, 1H).	379.2	D	
I-1376		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.80 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 6.42 (dd, J = 5.3, 1.5 Hz, 1H), 6.30 (s, 1H), 5.80 (s, 2H), 4.37 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.47 - 2.29 (m, 4H), 2.11 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 1.67 (t, J = 6.4 Hz, 1H), 1.59 - 1.49 (m, 2H), 1.47 (q, J = 5.4, 3.1 Hz, 2H), 1.46 - 1.31 (m, 1H), 1.25 (td, J = 11.7, 7.3 Hz, 1H), 1.09 (dd, J = 12.5, 7.8 Hz, 1H).	358.15	E	

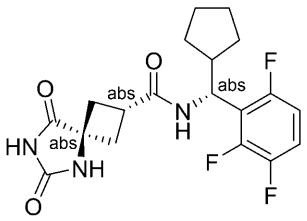
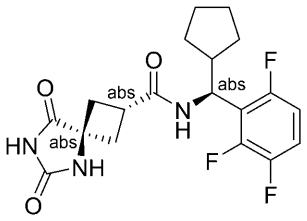
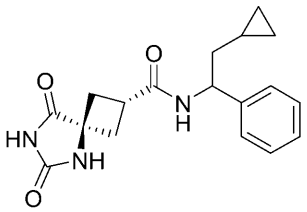
【表１－３４０】

I-1377		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.80 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 6.42 (dd, J = 5.3, 1.5 Hz, 1H), 6.31 (s, 1H), 5.83 (s, 2H), 4.37 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.44 (d, J = 3.6 Hz, 2H), 2.33 (d, J = 11.1 Hz, 2H), 2.13 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 1.67 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 1.59 - 1.53 (m, 2H), 1.46 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 1.38 - 1.32 (m, 1H), 1.23 (d, J = 11.8 Hz, 1H), 1.10 (dt, J = 13.0, 7.8 Hz, 1H).	358.15	E	
I-1378		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.22 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 6.43 (dd, J = 5.4, 1.5 Hz, 1H), 6.31 (s, 1H), 5.79 (s, 2H), 4.37 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 12.0, 9.1, 6.1 Hz, 2H), 2.27 - 2.06 (m, 3H), 1.70 (s, 1H), 1.56 (tq, J = 10.2, 6.6, 5.0 Hz, 2H), 1.51 - 1.41 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 12.1, 7.1 Hz, 1H), 1.25 (tt, J = 12.0, 6.2 Hz, 1H), 1.09 (dt, J = 12.8, 7.4 Hz, 1H).	358.15	E	
I-1379		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 6.43 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 6.31 (s, 1H), 5.81 (s, 2H), 4.37 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 11.9, 9.2, 6.1 Hz, 2H), 2.27 - 2.06 (m, 3H), 1.69 (dd, J = 12.0, 6.6 Hz, 1H), 1.56 (tt, J = 10.3, 5.0 Hz, 2H), 1.47 (hept, J = 6.8 Hz, 2H), 1.40 - 1.32 (m, 1H), 1.30 - 1.21 (m, 1H), 1.10 (dt, J = 12.8, 7.7 Hz, 1H).	358.15	E	

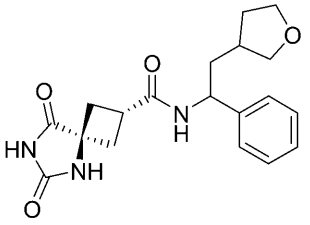
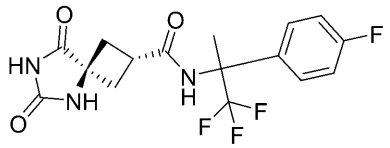
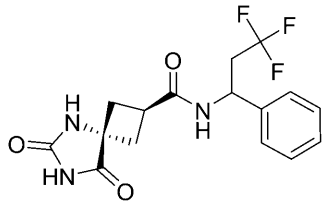
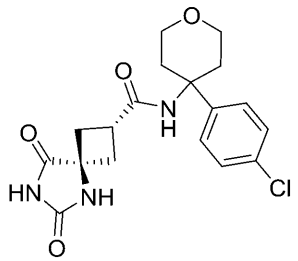
【表１－３４１】

I-1380		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 6.43 (dd, J = 5.3, 1.5 Hz, 1H), 6.31 (s, 1H), 5.80 (s, 2H), 4.37 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.67 (ddd, J = 11.9, 9.1, 6.2 Hz, 2H), 2.18 (dddd, J = 30.9, 13.3, 9.2, 4.5 Hz, 3H), 1.74 - 1.66 (m, 1H), 1.59 (dd, J = 7.8, 3.7 Hz, 2H), 1.58 - 1.41 (m, 2H), 1.45 - 1.31 (m, 1H), 1.31 - 1.19 (m, 1H), 1.09 (dt, J = 12.9, 7.9 Hz, 1H).	358.15	E	
I-1381		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.55 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.38 (qd, J = 9.4, 4.8 Hz, 1H), 7.08 (tdt, J = 9.1, 5.6, 2.7 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.5 Hz, 1H), 3.19- 3.05 (m, 1H), 2.47- 2.31 (m, 4H), 2.25 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 1.94 - 1.86 (m, 1H), 1.67 - 1.40 (m, 4H), 1.36 (dd, J = 7.7, 4.7 Hz, 1H), 1.31 - 1.21 (m, 1H), 1.02 (dt, J = 12.7, 7.7 Hz, 1H).	396.2	E	
I-1382		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.54 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.38 (qd, J = 9.4, 4.8 Hz, 1H), 7.13-7.02 (m, 1H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.4 Hz, 1H), 3.19- 3.05 (m, 1H), 2.47-2.33 (m, 4H), 2.25 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 1.88 (s, 1H), 1.64 - 1.43 (m, 4H), 1.37 (dd, J = 12.2, 7.3 Hz, 1H), 1.25 (dq, J = 15.5, 8.0, 7.6 Hz, 1H), 1.01 (s, 1H).	396.2	E	

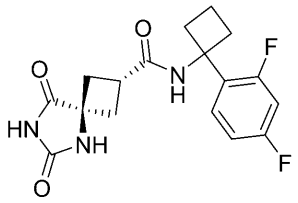
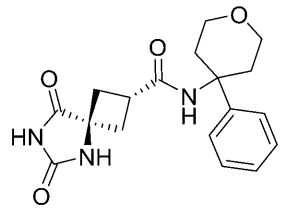
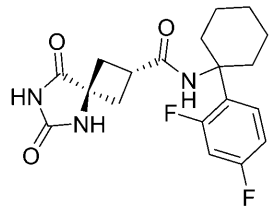
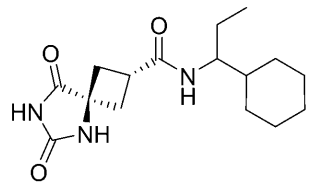
【表１－３４２】

I-1383		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.45 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.38 (qd, J = 9.4, 4.8 Hz, 1H), 7.08 (tdd, J = 9.4, 3.9, 2.0 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 28.8, 12.1, 8.9 Hz, 2H), 2.42 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.18 (dddd, J = 28.1, 12.8, 9.0, 4.2 Hz, 2H), 1.98 - 1.84 (m, 1H), 1.68 - 1.42 (m, 4H), 1.41- 1.20 (m, 2H), 1.09-0.95 (m, 1H).	396.15	E	
I-1384		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.46 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.38 (qd, J = 9.3, 4.8 Hz, 1H), 7.08 (tdd, J = 9.5, 3.9, 2.0 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 28.9, 12.0, 8.9 Hz, 2H), 2.43 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 2.18 (dddd, J = 28.0, 12.8, 9.0, 4.2 Hz, 2H), 1.91 (ddd, J = 15.8, 13.7, 9.6 Hz, 1H), 1.68 - 1.41 (m, 4H), 1.31 (ddt, J = 35.9, 12.8, 7.8 Hz, 2H), 1.09 - 0.95 (m, 1H).	396.15	D	
I-1385		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.41 - 7.24 (m, 4H), 7.19 (ddd, J = 8.6, 5.6, 2.3 Hz, 1H), 4.84 (td, J = 8.5, 5.9 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.46 - 2.18 (m, 4H), 1.66 - 1.39 (m, 2H), 0.59 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 0.34 (ddt, J = 21.0, 8.5, 4.3 Hz, 2H), 0.10 (dq, J = 8.8, 4.6 Hz, 1H).	328	E	

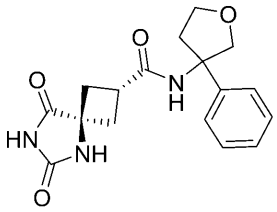
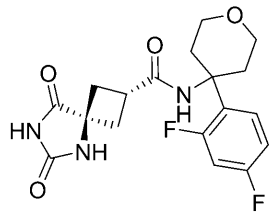
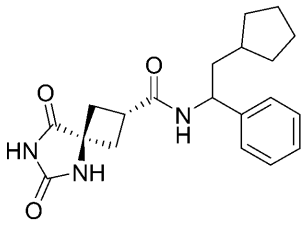
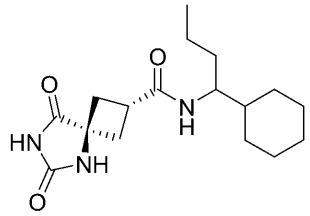
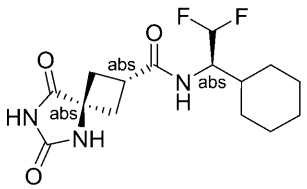
【表１－３４３】

I-1386		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.42 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.30 (d, J = 6.6 Hz, 4H), 7.22 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 4.78 (dt, J = 16.6, 8.7 Hz, 1H), 3.83 - 3.61 (m, 2H), 3.57 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 3.20 (dt, J = 15.3, 7.7 Hz, 1H), 3.08 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.48 - 2.26 (m, 4H), 2.10 - 1.84 (m, 2H), 1.70 (ddd, J = 29.1, 13.4, 7.0 Hz, 2H), 1.52 - 1.39 (m, 1H).	358	E	
I-1387		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.42 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 7.20 (t, J = 8.6 Hz, 2H), 3.41 - 3.33 (m, 1H), 2.47 - 2.21 (m, 4H), 1.91 (s, 3H).	374.2	E	
I-1388		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.47 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.41 - 7.31 (m, 4H), 7.27 (td, J = 6.4, 5.9, 2.8 Hz, 1H), 5.20 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.84 - 2.59 (m, 4H), 2.28 - 2.07 (m, 2H).	356.2	E	
I-1389		(400 MHz, DMSO-d6) 10.66 (s, 1H), 8.22 (d, J = 21.9 Hz, 2H), 7.44 - 7.25 (m, 4H), 3.71 (d, J = 11.2 Hz, 2H), 3.58 (t, J = 11.6 Hz, 2H), 3.20 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 2.42 (t, J = 9.3 Hz, 2H), 2.31 (t, J = 10.5 Hz, 2H), 2.23 (d, J = 13.5 Hz, 2H), 1.85 (t, J = 11.2 Hz, 2H).	378	E	

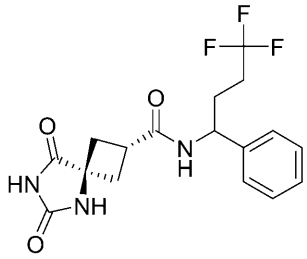
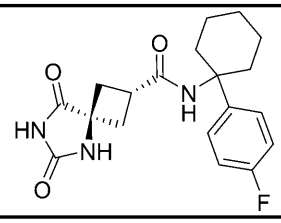
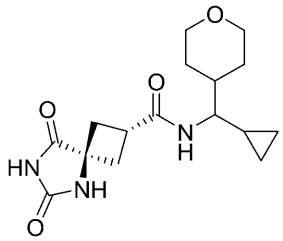
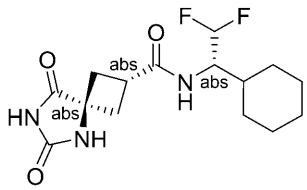
【表１－３４４】

I-1390		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.54 - 7.38 (m, 1H), 7.10 (ddd, J = 11.7, 9.2, 2.6 Hz, 1H), 7.04 - 6.91 (m, 1H), 3.03 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.45 (d, J = 8.1 Hz, 3H), 2.35 (td, J = 8.7, 2.6 Hz, 2H), 2.25 (td, J = 9.6, 2.7 Hz, 2H), 2.07 (s, 2H), 2.05 - 1.93 (m, 1H), 1.74 (d, J = 4.9 Hz, 1H).	350.2	E	
I-1391		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.38 - 7.12 (m, 5H), 3.72 (d, J = 11.3 Hz, 2H), 3.59 (t, J = 11.6 Hz, 2H), 3.28 - 3.16 (m, 1H), 2.44 (td, J = 8.5, 2.6 Hz, 2H), 2.39 - 2.22 (m, 4H), 1.87 (td, J = 13.0, 4.5 Hz, 2H).	344	E	
I-1392		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.33 (td, J = 9.3, 6.7 Hz, 1H), 7.08 (ddd, J = 12.4, 9.1, 2.8 Hz, 1H), 6.98 (td, J = 8.6, 2.7 Hz, 1H), 3.22 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.46 - 2.35 (m, 4H), 2.30 (dd, J = 11.9, 9.3 Hz, 2H), 1.74 - 1.45 (m, 7H), 1.21 (d, J = 13.1 Hz, 1H).	378	E	
I-1393		(400 MHz, DMSO-d6) 10.49 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.52 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.46 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.40 (d, J = 8.6 Hz, 4H), 1.62 (d, J = 24.4 Hz, 5H), 1.46 (s, 1H), 1.33 - 1.01 (m, 5H), 0.90 (t, J = 11.8 Hz, 2H), 0.75 (t, J = 7.3 Hz, 3H).	308.2	E	

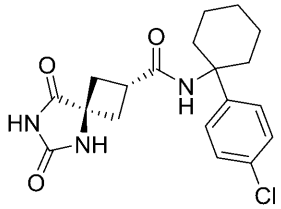
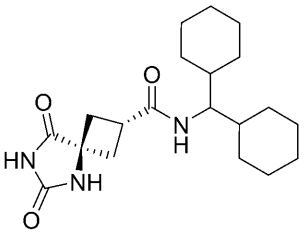
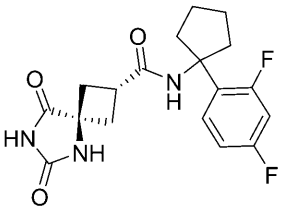
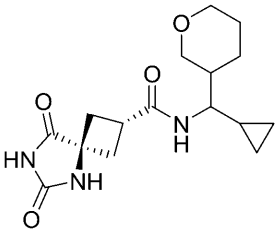
【表１－３４５】

I-1394		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.40 - 7.13 (m, 5H), 4.10 - 3.93 (m, 2H), 3.93 - 3.77 (m, 2H), 3.19 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.72 - 2.57 (m, 3H), 2.20 (p, J = 8.3 Hz, 3H).	330	E	
I-1395		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.36 (td, J = 9.1, 6.5 Hz, 1H), 7.12 (ddd, J = 12.4, 9.2, 2.7 Hz, 1H), 7.01 (td, J = 8.5, 2.7 Hz, 1H), 3.75 - 3.54 (m, 4H), 3.20 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.46 - 2.22 (m, 6H), 1.95 (td, J = 13.1, 12.6, 4.7 Hz, 2H).	380.2	E	
I-1396		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.28 (ddd, J = 10.5, 8.2, 6.3 Hz, 4H), 7.24 - 7.16 (m, 1H), 4.85 - 4.72 (m, 1H), 3.07 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.46 - 2.27 (m, 4H), 1.67 (dq, J = 10.7, 7.2, 5.4 Hz, 4H), 1.55 (qd, J = 10.0, 9.6, 5.6 Hz, 3H), 1.43 (dq, J = 12.6, 7.1, 6.2 Hz, 2H), 1.09 (d, J = 9.6 Hz, 2H).	356	E	
I-1397		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.52 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.54 (s, 1H), 3.03 (q, J = 8.9 Hz, 1H), 2.40 (d, J = 8.8 Hz, 4H), 1.75 - 1.51 (m, 5H), 1.36 (s, 1H), 1.33 - 0.96 (m, 7H), 0.89 (d, J = 12.5 Hz, 2H), 0.82 (t, J = 7.1 Hz, 3H).	322.2	E	
I-1398		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.31 (s, 1H), 8.04 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 6.06 (td, J = 55.1, 3.0 Hz, 1H), 3.97 (dd, J = 20.2, 10.1 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.47 - 2.33 (m, 4H), 1.80 - 1.43 (m, 6H), 1.07 (ddt, J = 53.3, 30.3, 13.3 Hz, 5H).	330.2	E	

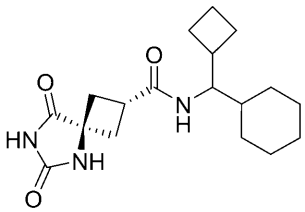
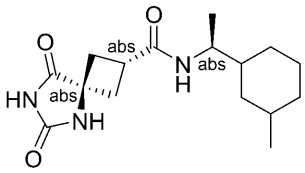
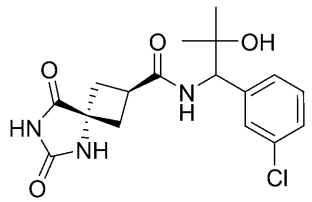
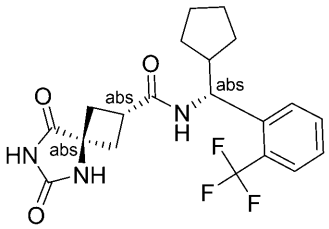
【表１－３４６】

I-1399		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.42 - 7.15 (m, 5H), 4.87 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.47 - 2.38 (m, 3H), 2.32 (t, J = 10.2 Hz, 1H), 2.19 (dq, J = 10.3, 5.0, 4.5 Hz, 2H), 1.93 - 1.76 (m, 2H).	370.2	E	
I-1400		(400 MHz, DMSO-d6) 10.49 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.43 - 7.26 (m, 2H), 7.15 - 6.94 (m, 2H), 3.22 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.42 (td, J = 8.6, 2.6 Hz, 2H), 2.38 - 2.20 (m, 4H), 1.55 (d, J = 33.8 Hz, 7H), 1.23 (s, 1H).	360.2	E	
I-1401		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.75 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.92 - 3.78 (m, 2H), 3.30 - 3.15 (m, 2H), 3.04 (p, J = 9.1 Hz, 2H), 2.40 (dd, J = 9.7, 5.2 Hz, 4H), 1.73 - 1.56 (m, 2H), 1.51 (d, J = 13.3 Hz, 1H), 1.22 (t, J = 13.5 Hz, 2H), 0.79 (dq, J = 8.1, 4.1, 3.4 Hz, 1H), 0.44 (dd, J = 8.7, 4.5 Hz, 1H), 0.27 (tt, J = 9.0, 4.0 Hz, 1H), 0.14 (ddq, J = 18.3, 8.8, 4.5 Hz, 2H).	322.2	E	
I-1402		(400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.03 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 6.05 (td, J = 55.0, 3.0 Hz, 1H), 3.96 (dt, J = 16.8, 8.7 Hz, 1H), 3.24 - 3.07 (m, 1H), 2.47 - 2.34 (m, 4H), 1.79 - 1.44 (m, 6H), 1.29 - 0.83 (m, 5H).	330.2	E	

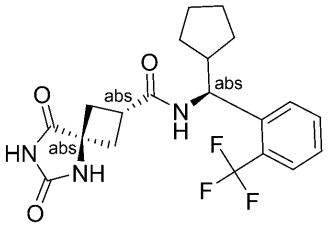
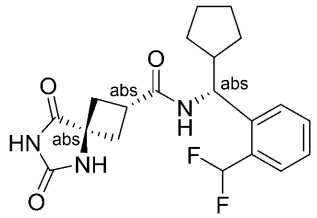
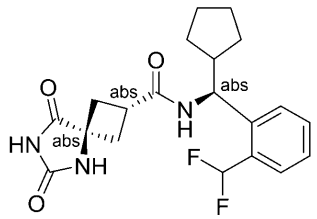
【表１－３４７】

I-1403		(400 MHz, DMSO-d6) 10.47 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.31 (d, J = 1.6 Hz, 4H), 3.22 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.41 (td, J = 8.6, 2.6 Hz, 2H), 2.37 - 2.19 (m, 4H), 1.68 - 1.39 (m, 7H), 1.22 (s, 1H).	376.2	E	
I-1404		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.38 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.53 - 3.39 (m, 1H), 3.10 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.41 (d, J = 8.9 Hz, 4H), 1.65 (s, 4H), 1.61 - 1.47 (m, 6H), 1.39 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 1.24 - 0.97 (m, 6H), 0.87 (p, J = 12.1 Hz, 4H).	362.2	E	
I-1405		(400 MHz, DMSO-d6) 10.52 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.37 (td, J = 9.1, 6.7 Hz, 1H), 7.08 (ddd, J = 12.0, 9.2, 2.7 Hz, 1H), 6.95 (td, J = 8.4, 2.6 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.37 (td, J = 12.8, 11.0, 5.7 Hz, 4H), 2.26 (td, J = 9.5, 2.7 Hz, 2H), 1.94 - 1.79 (m, 2H), 1.78 - 1.58 (m, 4H).	364.2	E	
I-1406		(400 MHz, DMSO-d6) 10.09 (s, 1H), 8.44 (d, J = 119.0 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 56.4, 9.2 Hz, 1H), 3.98 - 3.63 (m, 2H), 3.28 - 3.11 (m, 2H), 3.05 (ddd, J = 18.0, 10.8, 6.8 Hz, 2H), 2.47 - 2.31 (m, 3H), 2.26 - 1.89 (m, 1H), 1.85 - 1.49 (m, 3H), 1.39 (q, J = 11.5 Hz, 1H), 1.21 (dq, J = 21.0, 10.0 Hz, 1H), 0.88 - 0.69 (m, 1H), 0.45 (dq, J = 9.1, 4.9 Hz, 1H), 0.27 (td, J = 8.7, 4.1 Hz, 1H), 0.21 - 0.02 (m, 2H).	332.2	E	

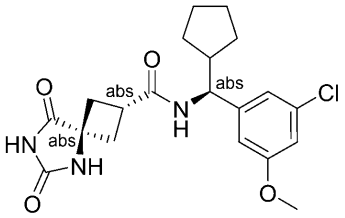
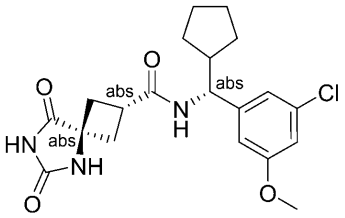
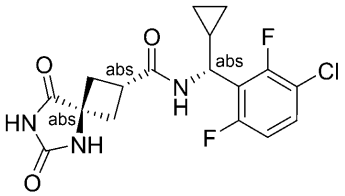
【表１－３４８】

I-1407		(400 MHz, DMSO-d6) 10.41 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.50 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.56 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 3.09 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 2.41 (d, J = 8.7 Hz, 5H), 1.92 - 1.70 (m, 3H), 1.64 (s, 5H), 1.54 (d, J = 12.9 Hz, 3H), 1.22 (s, 1H), 1.06 (d, J = 10.8 Hz, 3H), 0.88 (d, J = 11.4 Hz, 2H).	334.2	E	
I-1408		(400 MHz, DMSO-d6) 10.30 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.69 (dd, J = 8.6, 3.0 Hz, 1H), 3.58 (p, J = 7.1 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.39 (dd, J = 9.1, 2.5 Hz, 4H), 1.78 - 1.52 (m, 4H), 1.26 (d, J = 3.5 Hz, 2H), 1.16 (s, 1H), 0.95 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.85 (dd, J = 6.5, 3.4 Hz, 3H), 0.81 - 0.69 (m, 2H), 0.55 (tt, J = 12.9, 6.4 Hz, 1H).	308.2	E	
I-1409			348.13	E	
I-1410		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.18 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.72-7.62 (m, 2H), 7.45 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 5.16 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 15.7, 12.1, 9.2 Hz, 2H), 2.34-2.17 (m, 2H), 2.10 (ddd, J = 12.9, 8.8, 4.5 Hz, 1H), 1.77-1.35 (m, 6H), 1.20 (ddd, J = 11.7, 7.6, 4.3 Hz, 1H), 1.01 (dq, J = 12.4, 8.0 Hz, 1H).	410.3	E	

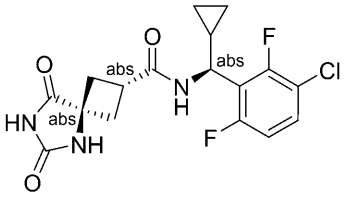
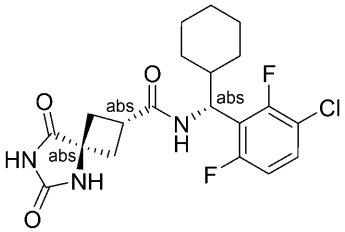
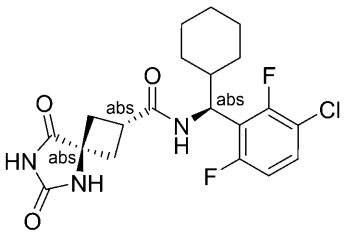
【表１－３４９】

I-1411		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.18 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.72-7.62 (m, 2H), 7.49-7.41 (m, 1H), 5.15 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 15.7, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.34-2.17 (m, 2H), 2.10 (ddd, J = 12.8, 8.8, 4.5 Hz, 1H), 1.72-1.37 (m, 6H), 1.21 (dtd, J = 11.6, 7.4, 4.2 Hz, 1H), 1.01 (dq, J = 12.5, 8.1 Hz, 1H).	410.2	D	
I-1412		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.44 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.69-7.46 (m, 4H), 7.42-7.32 (m, 1H), 4.70 (dd, J = 10.4, 8.2 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (ddd, J = 25.2, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.41 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.5, 9.0, 4.3 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.8, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 1.87-1.77 (m, 1H), 1.66-1.55 (m, 1H), 1.56-1.46 (m, 2H), 1.46-1.28 (m, 2H), 1.25-1.13 (m, 1H), 0.99-0.88 (m, 1H).	392.3	E	
I-1413		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.44 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.68-7.45 (m, 4H), 7.42-7.34 (m, 1H), 4.70 (dd, J = 10.4, 8.1 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (ddd, J = 25.2, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.46- 2.35 (m, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.6, 9.0, 4.3 Hz, 1H), 2.09 (ddd, J = 12.9, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 1.83 (td, J = 12.3, 7.2 Hz, 1H), 1.68-1.46 (m, 3H), 1.45-1.27 (m, 2H), 1.19 (tt, J = 11.2, 7.7 Hz, 1H), 1.00-0.86 (m, 1H).	392.3	D	

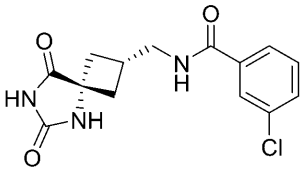
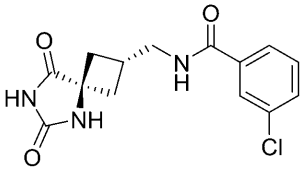
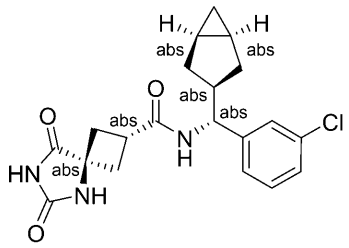
【表１－３５０】

I-1414		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.95 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 6.86 (dt, J = 5.5, 2.2 Hz, 2H), 4.53 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72-2.59 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 3H), 1.69 (s, 1H), 1.57 (s, 2H), 1.46 (qd, J = 10.3, 4.4 Hz, 2H), 1.28 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 1.18-1.06 (m, 1H).	406.15	E	
I-1415		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.95 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 6.86 (dt, J = 5.4, 2.2 Hz, 2H), 4.53 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72-2.59 (m, 2H), 2.28-2.08 (m, 3H), 1.70 (s, 1H), 1.57 (s, 2H), 1.53-1.37 (m, 2H), 1.32-1.20 (m, 2H), 1.18-1.06 (m, 1H).	406.1	E	
I-1416		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.72 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.29 (dd, J = 10.0, 6.7 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 11.9, 9.1 Hz, 1H), 2.58 (dd, J = 12.0, 9.1 Hz, 1H), 2.25- 2.09 (m, 2H), 1.39 (s, 1H), 0.61 (ddt, J = 13.3, 8.4, 4.2 Hz, 1H), 0.45 (dtt, J = 32.3, 9.8, 4.6 Hz, 2H), 0.18 (dt, J = 9.6, 5.1 Hz, 1H).	384.1	E	

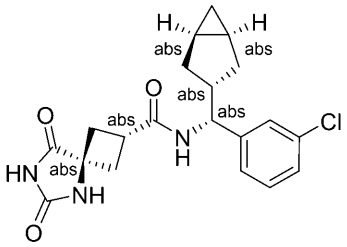
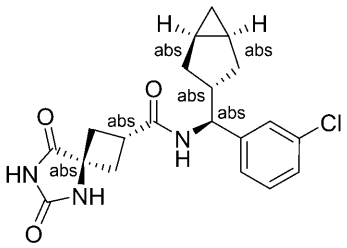
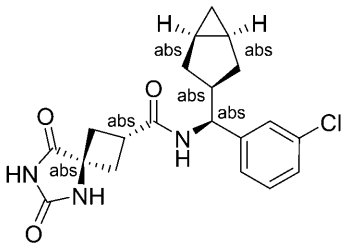
【表１－３５１】

I-1417		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.72 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.29 (dd, J = 10.0, 6.7 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 11.9, 9.2 Hz, 1H), 2.58 (dd, J = 11.9, 9.1 Hz, 1H), 2.17 (dddd, J = 20.6, 15.7, 11.0, 4.5 Hz, 2H), 1.39 (s, 1H), 0.60 (td, J = 8.6, 4.1 Hz, 1H), 0.45 (dtt, J = 32.6, 9.9, 4.7 Hz, 2H), 0.18 (dt, J = 9.8, 4.9 Hz, 1H).	384.1	C	
I-1418		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.37 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 10.4, 7.8 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 26.9, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.27-2.17 (m, 1H), 2.14 (td, J = 13.7, 12.8, 4.9 Hz, 1H), 2.03-1.94 (m, 1H), 1.83 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 1.72 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 1.60 (s, 2H), 1.21 (d, J = 13.4 Hz, 2H), 1.20-1.07 (m, 2H), 0.99-0.90 (m, 1H), 0.87 (d, J = 12.1 Hz, 1H).	426.15	E	
I-1419		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.37 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 10.4, 7.7 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 26.9, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.18 (dddd, J = 30.9, 12.9, 9.1, 4.3 Hz, 2H), 2.03-1.94 (m, 1H), 1.83 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 1.72 (d, J = 10.9 Hz, 1H), 1.60 (s, 2H), 1.25-1.07 (m, 4H), 0.99-0.90 (m, 1H), 0.87 (d, J = 12.0 Hz, 1H).	426.15	B	

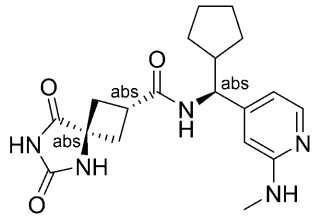
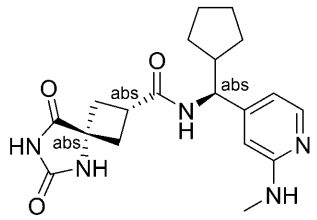
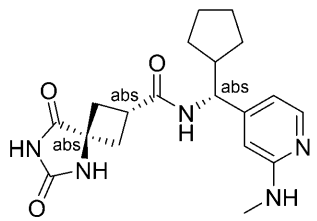
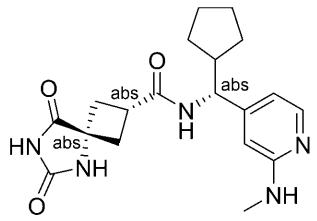
【表１－３５２】

I-1420		(400 MHz, DMSO-d6)10.51 (s, 1H), 8.63 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.89 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.81 (dd, J = 7.8, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (dt, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 3.29 (t, J = 6.2 Hz, 2H), 2.59-2.53 (m, 1H), 2.42 (td, J = 8.9, 8.4, 2.8 Hz, 2H), 2.08-1.94 (m, 2H).	307.95	E	
I-1421		(400 MHz, DMSO-d6)10.56(s, 1H),8.68 (s, 1H), 8.39 (d, J = 45.4 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.83-7.78 (m, 1H), 7.63-7.57 (m, 1H), 7.50 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 3.43 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 2.68 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 2.39-2.14 (m, 4H).	307.95	E	
I-1422		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.38-7.17 (m, 4H), 4.57 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.64 (ddd, J = 20.8, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.18 (dddd, J = 32.2, 13.0, 9.0, 4.4 Hz, 2H), 1.97-1.77 (m, 2H), 1.53-1.35 (m, 2H), 1.21 (tt, J = 10.5, 6.8 Hz, 3H), 0.25 (td, J = 7.9, 4.7 Hz, 1H), 0.13 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	388.25	E	

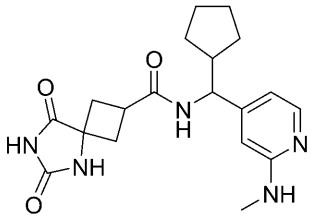
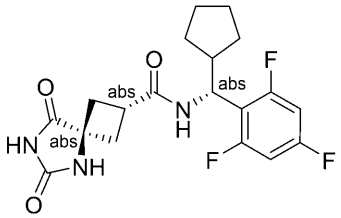
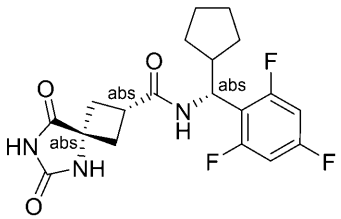
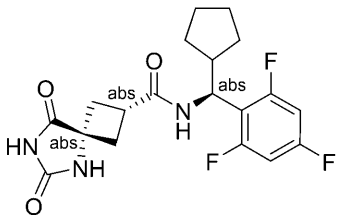
【表１－３５３】

I-1423		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.21 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36 - 7.30 (m, 2H), 7.27 (dt, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.21 (dt, J = 7.5, 1.5 Hz, 1H), 4.45 (dd, J = 10.9, 8.7 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71-2.61 (m, 3H), 2.23 (ddd, J = 12.5, 9.0, 4.3 Hz, 1H), 2.10 (dddd, J = 19.7, 14.5, 9.1, 5.0 Hz, 2H), 1.69 (ddd, J = 14.4, 9.6, 5.9 Hz, 1H), 1.39-1.31 (m, 1H), 1.30-1.15 (m, 2H), 1.10-0.99 (m, 1H), 0.65 (td, J = 8.2, 4.4 Hz, 1H), 0.10 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	388.25	E	
I-1424		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.37 - 7.18 (m, 4H), 4.57 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.64 (ddd, J = 20.7, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.27-2.06 (m, 2H), 1.86 (ddd, J = 28.6, 10.7, 6.8 Hz, 2H), 1.56-1.41 (m, 2H), 1.22 (ddd, J = 12.4, 10.3, 5.6 Hz, 3H), 0.25 (td, J = 7.9, 4.7 Hz, 1H), 0.13 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	388.25	B	D
I-1425		(400 MHz, DMSO-d6) 10.34 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.21 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 - 6.83 (m, 4H), 4.45 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 3.18-2.97 (m, 1H), 2.65 (dd, J = 18.0, 7.8 Hz, 3H), 2.23 (s, 1H), 2.09 (d, J = 14.6 Hz, 2H), 1.67 (d, J = 14.8 Hz, 1H), 1.40-1.13 (m, 3H), 1.05 (dd, J = 14.1, 6.4 Hz, 1H), 0.66 (s, 1H), 0.10 (d, J = 5.3 Hz, 1H).	388.25	C	D

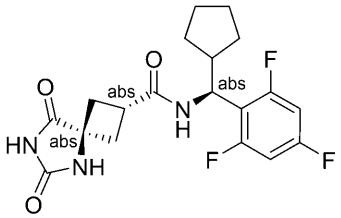
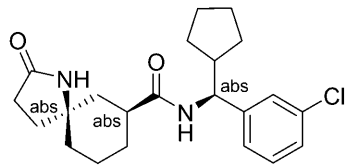
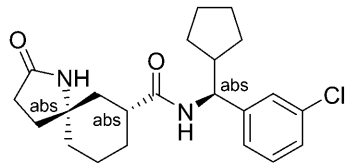
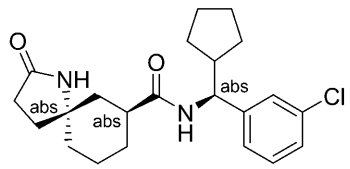
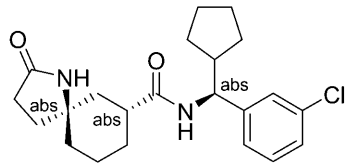
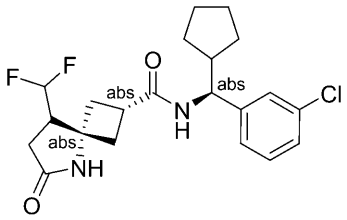
【表１－３５４】

I-1426		(400 MHz, MeOD) 1.12-1.26 (1H, m), 1.27-1.41 (2H, m), 1.41-1.52 (1H, m), 1.52-1.74 (4H, m), 1.85 (1H, dt), 2.26 (1H, dt), 2.48 (1H, dd), 2.52-2.71 (3H, m), 2.87 (3H, s), 3.13-3.28 (1H, m), 4.47 (1H, d), 6.44 (1H, s), 6.52 (1H, dd), 7.87 (1H, d).	372.25	E	
I-1427		(400 MHz, MeOD) 0.12 (1H, s), 1.18 (1H, dd), 1.31 (2H, s), 1.41 (2H, d), 1.46 (2H, d), 1.55 (1H, s), 1.64 (2H, s), 1.68 (3H, s), 1.79-1.93 (1H, m), 2.16-2.34 (1H, m), 2.49 (1H, d), 2.55-2.69 (3H, m), 2.87 (3H, s), 3.13-3.25 (1H, m), 4.47 (1H, d), 4.62 (1H, s), 6.45 (1H, s), 6.53 (1H, dd), 7.86 (1H, d).	372.25	E	
I-1428		(400 MHz, MeOD) 1.11-1.27 (1H, m), 1.27-1.44 (2H, m), 1.43-1.55 (1H, m), 1.55-1.77 (4H, m), 1.83-1.97 (1H, m), 2.21-2.35 (1H, m), 2.38-2.57 (2H, m), 2.87 (3H, s), 2.9-2.97 (2H, m), 3.13-3.28 (1H, m), 4.51 (1H, d), 6.47 (1H, s), 6.54-6.6 (1H, m), 7.87 (1H, d).	372.25	E	
I-1429		(400 MHz, MeOD) 1.20 (1H, tt), 1.31 (1H, s), 1.35-1.44 (1H, m), 1.49 (H, dt), 1.55-1.78 (4H, m), 1.88 (1H, dt), 2.19-2.37 (1H, m), 2.45 (2H, dddd), 2.89 (3H, s), 2.9-2.96 (2H, m), 3.17-3.25 (1H, m), 4.51 (1H, d), 6.47 (1H, s), 6.55 (1H, dd), 7.83-7.92 (1H, m).	372.2	E	

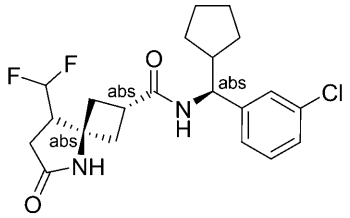
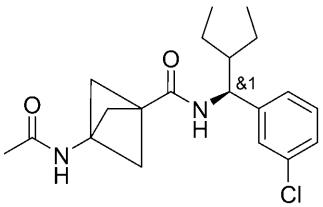
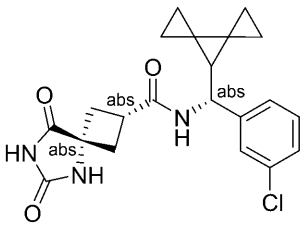
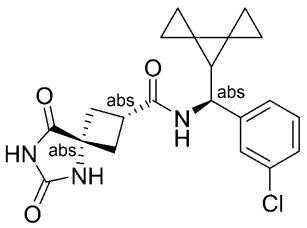
【表１－３５５】

I-1430		(400 MHz, MeOD)1.11-1.26 (1H, m), 1.31 (1H, s), 1.40 (1H, t), 1.44-1.63 (3H, m), 1.67 (2H, d), 1.88 (1H, d), 2.29 (1H, dt), 2.45 (2H, ddd), 2.54-2.66 (1H, m), 2.87 (3H, s), 2.92 (1H, dd), 3.20 (1H, dt), 4.4-4.63 (1H, m), 6.46 (1H, d), 6.51-6.62 (1H, m), 7.87 (1H, d).	372.2	E	
I-1431		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.12 (t, J = 9.0 Hz, 2H), 4.79 (dd, J = 11.0, 7.6 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.45-2.33 (m, 4H), 2.25 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 1.90 (s, 1H),1.62-1.42 (m, 4H), 1.33 (s, 1H), 1.24 (s, 1H), 1.06-0.94 (m, 1H).	396.1	E	
I-1432		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.12 (t, J = 9.0 Hz, 2H), 4.79 (dd, J = 11.1, 7.6 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.45-2.32 (m, 4H), 2.25 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 1.86 (dt, J = 12.3, 6.2 Hz, 1H), 1.62-1.42 (m, 4H), 1.35 (dd, J = 12.1, 7.5 Hz, 1H), 1.24 (s, 1H), 0.99 (p, J = 8.0 Hz, 1H).	396.1	E	
I-1433		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 4.79 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70-2.52 (m, 2H), 2.40 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.17 (dddd, J = 28.3, 12.8, 9.0, 4.2 Hz, 2H), 1.92-1.85 (m, 1H), 1.65 (s, 4H), 1.60-1.42 (m, 1H), 1.40-1.18 (m, 1H), 1.00 (dd, J = 12.7, 7.6 Hz, 1H).	396.15	E	

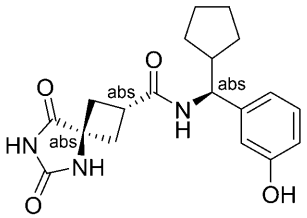
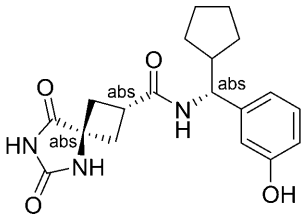
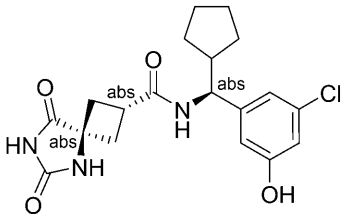
【表１－３５６】

I-1434		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.38 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 4.79 (dd, J = 11.1, 7.6 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 27.5, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.40 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 2.26 - 2.08 (m, 2H), 1.87 (dt, J = 12.3, 6.1 Hz, 1H), 1.65-1.43 (m, 4H), 1.40-1.31 (m, 1H), 1.24 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.07-0.95 (m, 1H).	396.1	C	
I-1435				D	
I-1436				D	
I-1437				E	
I-1438				E	
I-1439			411.34	C	

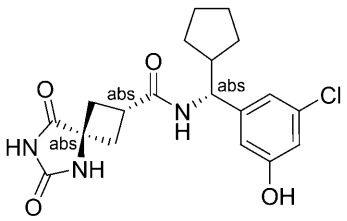
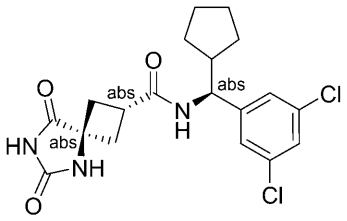
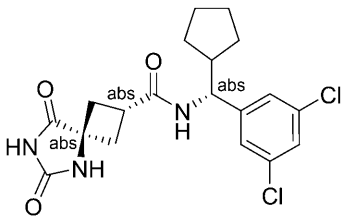
【表１－３５７】

I-1440			411.34	C	
I-1441		(400 MHz, DMSO-d6) δ 8.42 (s, 1H), 8.11 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.41 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 1H), 7.28 - 7.25 (m, 2H), 4.50 (dd, J = 10.4, 9.0 Hz, 1H), 2.30 - 2.18 (m, 1H), 2.11 (s, 6H), 1.79 - 1.70 (重複する m, 1H), 1.74 (重複する s, 3H), 1.62 - 1.38 (m, 4H), 1.27 - 1.17 (m, 2H), 1.10 - 0.99 (m, 1H).	361.3	E	
I-1442		(400 MHz, DMSO) 0.52-0.72 (m, 5H), 0.74 (tq, J = 6.8, 3.9 Hz, 1H), 0.81-0.91 (m, 2H), 1.87 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 2.20 (dddd, J = 25.4, 13.0, 9.1, 4.3 Hz, 2H), 2.66 (td, J = 11.4, 9.0 Hz, 2H), 3.09 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 4.57 (dd, J = 10.0, 8.3 Hz, 1H), 7.15 (dt, J = 7.6, 1.5 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.25-7.31 (m, 1H), 7.34 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 10.58 (s, 1H).	400.15	D	
I-1443		(400 MHz, DMSO) 0.52-0.71 (m, 5H), 0.75 (ddd, J = 7.9, 5.4, 3.3 Hz, 1H), 0.81-0.91 (m, 2H), 1.87 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 2.12-2.28 (m, 2H), 2.66 (td, J = 11.4, 9.0 Hz, 2H), 3.09 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 4.57 (dd, J = 10.0, 8.3 Hz, 1H), 7.15 (dt, J = 7.7, 1.5 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.28 (ddd, J = 8.0, 2.2, 1.3 Hz, 1H), 7.34 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.56-8.6 (m, 1H), 10.58 (s, 1H).	400.15	D	

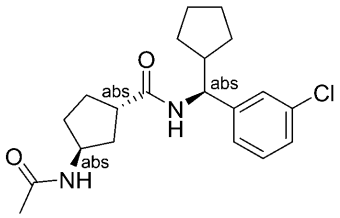
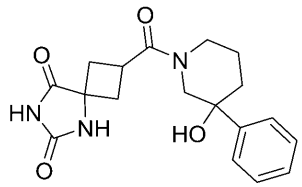
【表１－３５８】

I-1444		(400 MHz, DMSO) 1.07 (dd, J = 12.6, 7.8 Hz, 1H), 1.27 (ddd, J = 16.3, 12.5, 7.8 Hz, 2H), 1.53 (s, 4H), 1.64-1.74 (m, 1H), 2.16 (dddd, J = 30.2, 16.5, 8.6, 4.1 Hz, 3H), 2.6-2.73 (m, 2H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 4.46 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.60 (ddd, J = 8.0, 2.5, 1.0 Hz, 1H), 6.66-6.74 (m, 2H), 7.07 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 10.55 (s, 1H).	358.15	E	
I-1445		(400 MHz, DMSO) 1.02-1.14 (m, 1H), 1.2-1.35 (m, 2H), 1.41-1.6 (m, 4H), 1.68-1.76 (m, 1H), 2.06-2.27 (m, 3H), 2.64 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 2.69 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 4.46 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.56-6.63 (m, 1H), 6.66-6.74 (m, 2H), 7.07 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 9.26 (s, 1H), 10.55 (s, 1H).	358.15	E	
I-1446		(400 MHz, DMSO) 1.07 (dd, J = 12.7, 7.9 Hz, 1H), 1.22-1.38 (m, 2H), 1.42-1.52 (m, 2H), 1.56 (s, 2H), 1.70 (s, 1H), 2.06-2.27 (m, 3H), 2.65 (dt, J = 11.9, 9.3 Hz, 2H), 3.11 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 4.44 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.64 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 6.78 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 9.84 (s, 1H), 10.57 (s, 1H).	392.1	A	B

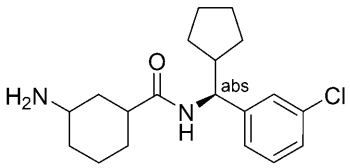
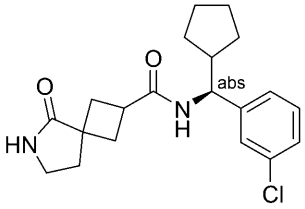
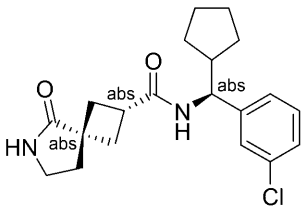
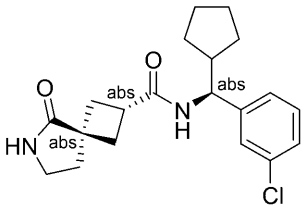
【表１－３５９】

I-1447		(400 MHz, DMSO) 1.07 (s, 1H), 1.28 (s, 2H), 1.4-1.53 (m, 2H), 1.57 (s, 2H), 1.66-1.74 (m, 1H), 2.12 (dd, J = 10.5, 5.3 Hz, 2H), 2.16-2.28 (m, 1H), 2.6-2.72 (m, 2H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 4.44 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.64 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 6.78 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 9.83 (s, 1H), 10.57 (s, 1H).	392.1	E	
I-1448		(400 MHz, DMSO) 1.05-1.18 (m, 1H), 1.27 (dd, J = 12.9, 7.0 Hz, 2H), 1.38-1.53 (m, 2H), 1.58 (s, 2H), 1.71 (dd, J = 12.5, 7.8 Hz, 1H), 2.15 (dq, J = 8.7, 4.6 Hz, 2H), 2.24 (ddd, J = 12.7, 9.2, 4.4 Hz, 1H), 2.65 (td, J = 11.9, 9.0 Hz, 2H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 4.58 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.45 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 10.56 (s, 1H).	410	B	
I-1449		(400 MHz, DMSO) 1.04-1.18 (m, 1H), 1.27 (dd, J = 13.1, 6.8 Hz, 2H), 1.39-1.52 (m, 2H), 1.55 (d, J = 19.2 Hz, 2H), 1.70 (dd, J = 11.9, 7.1 Hz, 1H), 2.16 (dd, J = 10.2, 6.4 Hz, 2H), 2.21-2.28 (m, 1H), 2.65 (td, J = 11.9, 9.0 Hz, 2H), 3.11 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 4.58 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.41 (dd, J = 27.7, 1.9 Hz, 3H), 8.30 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 10.56 (s, 1H).	410	E	

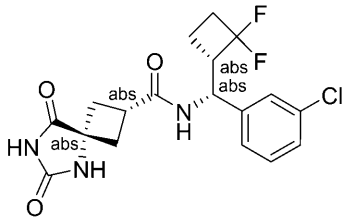
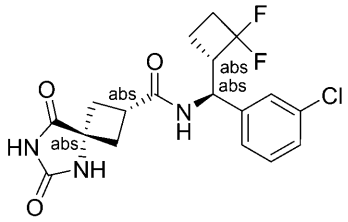
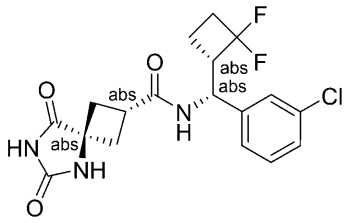
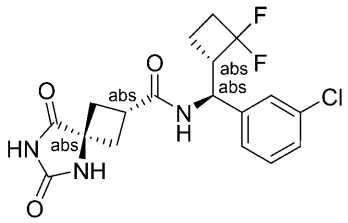
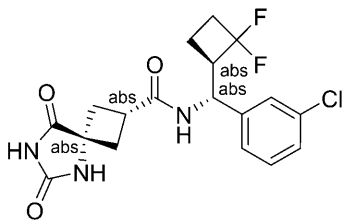
【表１－３６０】

I-1450		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.24 (d,J= 8.7 Hz, 1H), 7.76 (d,J= 6.9 Hz, 1H), 7.36 (t,J= 1.7 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 1H), 7.28 - 7.23 (m, 2H), 4.55 (t,J= 9.3 Hz, 1H), 4.05 - 3.95 (m, 1H), 2.82 - 2.71 (m, 1H), 2.22 - 2.09 (m, 1H), 1.95 - 1.81 (m, 2H), 1.75 (重複する s, 3H), 1.74 (重複する m, 2H), 1.65 - 1.33 (m, 7H), 1.31 - 1.20 (m, 2H), 1.14 - 1.02 (m, 1H).	363.3	C	
I-1451		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.49 (br s, 0.05H), 8.41 (br s, 0.1H), 8.30 (br s, 0.25H), 8.25 (br s, 0.6H), 7.59 - 7.48 (m, 2H), 7.40 - 7.30 (m, 2H), 7.30 - 7.20 (m, 1H), 5.14 (br s, 0.6H), 5.10 (br s, 0.1H), 4.98 (br s, 0.05H), 4.94 (br s, 0.25H), 4.41 (d, J = 12.9 Hz, 0.6H), 4.04 (重複する d, J = 12.7, 0.1H), 4.01 (埋没した d, J = 12.7, 0.05H), 3.62 (d, J = 13.2 Hz, 0.25H), 3.56 - 3.42 (m, 0.4H), 3.31 - 3.17 (埋没した m, 1.6H), 3.16 - 3.07 (m, 0.4H), 3.05 (d, J = 13.0 Hz, 0.4H), 2.95 - 2.79 (m, 0.15H), 2.69 - 2.58 (m, 1.2H), 2.58 - 2.52 (重複する m, 2H), 2.48 - 2.36 (m, 1.5H), 2.34 - 2.26 (m, 0.6H), 2.25 - 2.08 (m, 0.4H), 2.09 - 1.94 (m, 1H), 1.91 - 1.75 (m, 1H), 1.72 (br d, J = 14.1 Hz, 1H), 1.47 (br d, J = 12.6 Hz, 1H). 4 つの化合物の約 12:5:2:1 の混合物(報告されたピークの平均)--LC による(3:1 の比)	344.2	E	

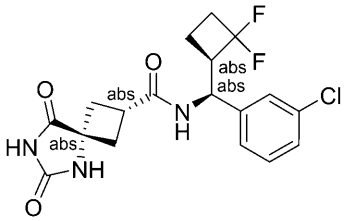
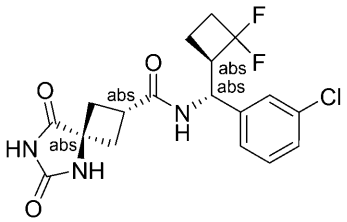
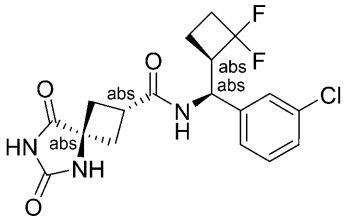
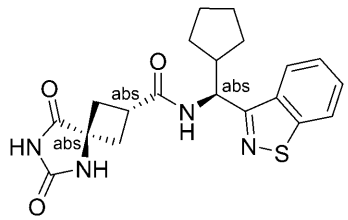
【表１－３６１】

I-1452			335.22	D	
I-1453		(400 MHz, DMSO) 1.09 (ddd, J = 12.8, 8.6, 4.7 Hz, 1H), 1.26 (pd, J = 8.1, 7.5, 4.0 Hz, 2H), 1.36-1.68 (m, 5H), 1.76-1.85 (m, 1H), 1.93-2.1 (m, 2H), 2.12-2.37 (m, 2H), 2.50 (s, 1H), 2.52 (s, 1H), 2.74 (dt, J = 14.5, 3.6 Hz, 1H), 3.02-3.17 (m, 2H), 4.56 (ddd, J = 12.1, 10.7, 8.6 Hz, 1H), 5.35 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 5.60 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.2-7.4 (m, 3H), 7.42-7.48 (m, 1H), 7.60 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H).	361.2	E	
I-1454		(400 MHz, DMSO) 1.08 (dq, J = 17.0, 8.1 Hz, 1H), 1.27 (d, J = 24.3 Hz, 3H), 1.37-1.67 (m, 5H), 1.80 (s, 1H), 1.95-2.07 (m, 2H), 2.31 (p, J = 8.8 Hz, 2H), 2.50 (s, 1H), 2.52 (s, 1H), 2.74 (dd, J = 14.4, 3.8 Hz, 1H), 3.04-3.17 (m, 2H), 4.58 (dd, J = 10.5, 8.6 Hz, 1H), 5.36 (s, 1H), 5.59 (s, 1H), 7.24-7.38 (m, 3H), 7.45 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.61 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.7 Hz, 1H).	361.2	E	
I-1455		(400 MHz, DMSO) 1.10 (dd, J = 12.5, 8.3 Hz, 1H), 1.27 (dt, J = 20.7, 6.5 Hz, 2H), 1.37-1.76 (m, 5H), 1.83 (s, 1H), 2.01 (td, J = 15.5, 14.9, 10.7 Hz, 2H), 2.13-2.4 (m, 2H), 2.50 (s, 1H), 2.52 (s, 1H), 2.73 (dd, J = 14.4, 3.8 Hz, 1H), 3.01-3.17 (m, 2H), 4.55 (dd, J = 10.5, 8.6 Hz, 1H), 5.35 (s, 1H), 5.61 (s, 1H), 7.23-7.38 (m, 3H), 7.44 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.60 (s, 1H), 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H).	361.2	E	

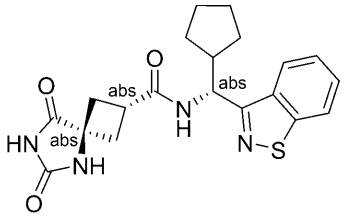
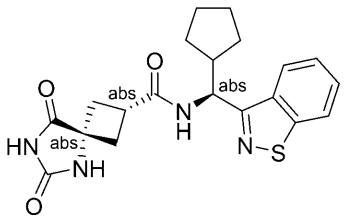
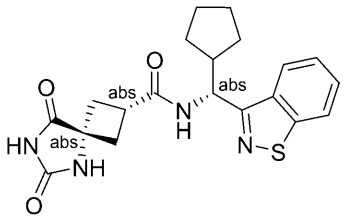
【表１－３６２】

I-1456		(400 MHz, DMSO-d6) 10.51 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.45 - 7.20 (m, 4H), 5.04 (dd, J = 11.2, 8.8 Hz, 1H), 3.14 (dq, J = 27.2, 10.2, 9.0 Hz, 2H), 2.66 (q, J = 10.5 Hz, 2H), 2.42 (dd, J = 12.1, 8.5 Hz, 2H), 2.28 - 2.11 (m, 2H), 1.94 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 1.53 (q, J = 9.2, 8.4 Hz, 1H).	398.25	E	
I-1457		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42 -7.25 (m, 4H), 5.03 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 3.10 (q, J = 9.1 Hz, 2H), 2.71- 2.60 (m, 2H), 2.43-2.29 (m, 2H), 2.26 - 2.11 (m, 2H), 1.92 (s, 1H), 1.58 -1.49 (m, 1H).	398.25	E	
I-1458		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.42 - 7.23 (m, 4H), 5.02 (dd, J = 11.0, 8.8 Hz, 1H), 3.05 (tt, J = 9.6, 8.1 Hz, 2H), 2.47 - 2.28 (m, 6H), 1.91 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 1.51 (q, J = 9.6 Hz, 1H).	398.25	E	
I-1459		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.39 - 7.25 (m, 4H), 5.05- 4.99 (m, 1H), 3.12-2.99 (m, 2H), 2.48- 2.29 (m, 6H), 1.92 (s, 1H), 1.52 (t, J = 9.6 Hz, 1H).	398.25	E	
I-1460		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.63 - 8.56 (m, 1H), 8.49 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.39 - 7.27 (m, 3H), 5.00 (dd, J = 11.5, 8.6 Hz, 1H), 3.18 -3.06 (m, 2H), 2.69-2.57 (m, 2H), 2.44 -2.34 (m, 2H), 2.17 (dq, J = 20.5, 9.0, 6.7 Hz, 2H), 1.56 (s, 1H), 1.45 (t, J = 9.6 Hz, 1H).	398.25	E	

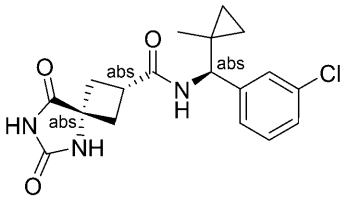
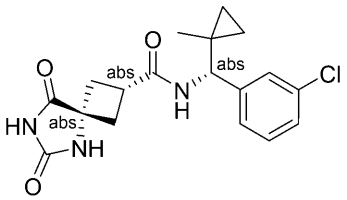
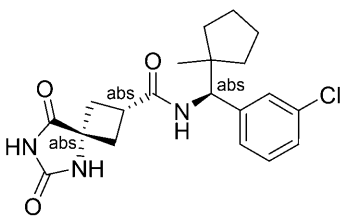
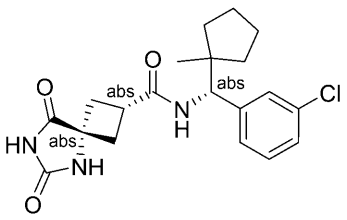
【表１－３６３】

I-1461		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.61 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.39 - 7.27 (m, 3H), 5.03 - 4.97 (m, 1H), 3.11 (t, J = 9.3 Hz, 2H), 2.62 (dd, J = 20.0, 9.7 Hz, 2H), 2.46 - 2.32 (m, 2H), 2.16 (dt, J = 16.4, 10.7 Hz, 2H), 1.56 (s, 1H), 1.49 - 1.39 (m, 1H).	398.25	D	
I-1462		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.61 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.43 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38 - 7.29 (m, 3H), 5.02 - 4.96 (m, 1H), 3.03 (p, J = 8.4 Hz, 2H), 2.44 - 2.30 (m, 6H), 1.54 (s, 1H), 1.44 (t, J = 9.4 Hz, 1H).	398.25	E	
I-1463		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.43 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38 - 7.29 (m, 3H), 4.99 (dd, J = 11.4, 8.7 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 8.4 Hz, 2H), 2.44 - 2.30 (m, 6H), 1.52 (d, J = 18.7 Hz, 1H), 1.44 (t, J = 9.6 Hz, 1H).	398.25	E	
I-1464		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.2, 6.9, 1.1 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.2, 6.6 Hz, 1H), 5.33 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.78 - 2.66 (m, 2H), 2.66 - 2.58 (m, 1H), 2.29 - 2.16 (m, 1H), 2.15 - 2.05 (m, 1H), 1.81 (s, 1H), 1.68 - 1.33 (m, 6H), 1.24 (s, 1H), 1.11 (s, 1H).	399.15	B	B

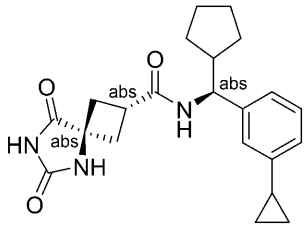
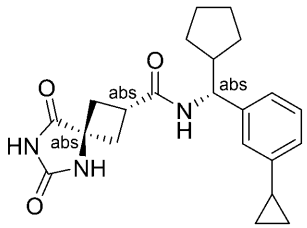
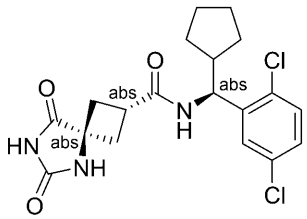
【表１－３６４】

I-1465		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.32 - 8.20 (m, 2H), 8.20 - 8.14 (m, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.2, 7.0, 1.1 Hz, 1H), 7.49 (ddd, J = 8.1, 6.9, 1.1 Hz, 1H), 5.34 - 5.19 (m, 1H), 3.09 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.44 (dd, J = 8.8, 5.4 Hz, 2H), 2.37 - 2.24 (m, 2H), 1.81 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 1.68 - 1.31 (m, 7H), 1.24 (s, 1H), 1.13 (d, J = 21.2 Hz, 1H).	399.15	E	
I-1466		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.32 - 8.22 (m, 2H), 8.22 - 8.15 (m, 1H), 7.60 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.49 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 5.29 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.24 - 2.91 (m, 1H), 2.44 (d, J = 9.5 Hz, 2H), 2.38 - 2.25 (m, 2H), 1.81 (s, 1H), 1.52 (d, J = 41.0 Hz, 7H), 1.29 - 1.21 (m, 1H), 1.11 (s, 1H).	399.15	D	
I-1467		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.21 - 8.15 (m, 1H), 7.60 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.50 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 5.33 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.21 - 3.08 (m, 1H), 2.79 - 2.67 (m, 2H), 2.62 (t, J = 11.0 Hz, 1H), 2.23 (s, 1H), 2.11 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 1.81 (s, 1H), 1.57 (s, 3H), 1.43 (d, J = 57.7 Hz, 4H), 1.24 (s, 1H), 1.13 (d, J = 15.9 Hz, 1H).	399.2	E	

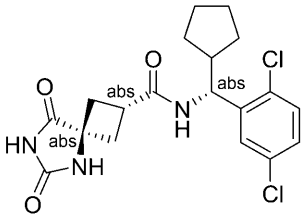
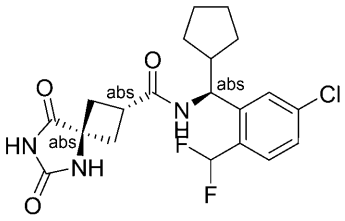
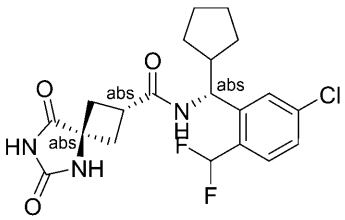
【表１－３６５】

I-1468		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.41-7.25 (m, 4H), 4.55 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.24 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72 (t, J = 10.3 Hz, 1H), 2.67 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 2.24 (s, 1H), 2.21 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 0.89 (s, 3H), 0.69 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 0.51-0.44 (m, 1H), 0.29 (q, J = 1.9 Hz, 2H).	362	D	
I-1469		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.41-7.25 (m, 4H), 4.55 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.25 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70 (ddd, J = 15.3, 11.4, 8.8 Hz, 2H), 2.30-2.16 (m, 2H), 0.89 (s, 3H), 0.73-0.65 (m, 1H), 0.52-0.42 (m, 1H), 0.29 (q, J = 1.9 Hz, 2H).	362	E	
I-1470		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.23 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.37 - 7.24 (m, 3H), 4.85 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.23 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73 - 2.62 (m, 2H), 2.27 (ddd, J = 12.5, 9.1, 4.3 Hz, 1H), 2.16 (ddd, J = 12.8, 9.1, 4.4 Hz, 1H), 1.58 (s, 6H), 1.24 (s, 1H), 1.16 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 1.05 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 0.82 (s, 3H).	390.2	B	B
I-1471		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.24 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38 - 7.20 (m, 3H), 4.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.23 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 12.2, 9.1, 5.3 Hz, 2H), 2.37 - 2.22 (m, 1H), 2.17 (ddd, J = 12.8, 9.0, 4.3 Hz, 1H), 1.57 (s, 6H), 1.24 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 1.04 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 0.82 (s, 3H).	390.2	E	

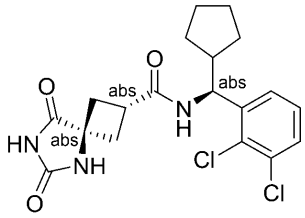
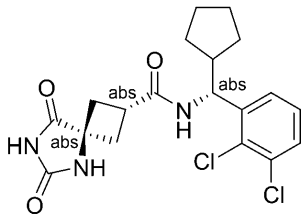
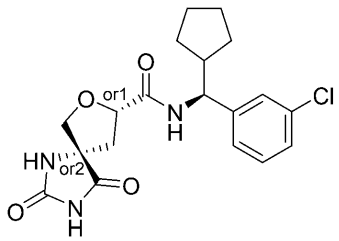
【表１－３６６】

I-1472		(400 MHz, DMSO-d6) 10.52 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.08 -6.98 (m, 2H), 6.88 (dt, J = 7.7, 1.5 Hz, 1H), 4.52 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.72- 2.59 (m, 2H), 2.27-2.07 (m, 3H), 1.95-1.81 (m, 1H), 1.73-1.65 (m, 1H), 1.56 (dd, J = 7.6, 3.9 Hz, 1H), 1.52 (s, 2H), 1.44 (dt, J = 13.6, 7.8 Hz, 1H), 1.34-1.23 (m, 1H), 1.24 (s, 1H), 1.20-1.02 (m, 1H), 0.98-0.89 (m, 2H), 0.69-0.60 (m, 2H).	382.1	E	
I-1473		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.08-6.98 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 4.52 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.3 Hz, 1H), 2.72 -2.59 (m, 2H), 2.21 (s, 1H), 2.22-2.07 (m, 2H), 1.93-1.81 (m, 1H), 1.56 (s, 2H), 1.49 (dd, J = 17.6, 8.1 Hz, 3H), 1.44 (s, 1H), 1.25 (s, 1H), 1.07 (s, 1H), 0.94 (dt, J = 8.4, 3.1 Hz, 2H), 0.68-0.60 (m, 2H).	382.15	E	
I-1474		(400 MHz, DMSO) 1.15 (dd, J = 12.7, 7.5 Hz, 1H), 1.34 (td, J = 11.9, 7.4 Hz, 2H), 1.49 (q, J = 8.6, 7.0 Hz, 2H), 1.57 (dd, J = 11.3, 6.3 Hz, 2H), 1.69 (s, 1H), 2.15-2.25 (m, 3H), 2.65 (ddd, J = 14.7, 12.1, 8.9 Hz, 2H), 3.13 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 5.09 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 10.56 (s, 1H).	410.05	D	

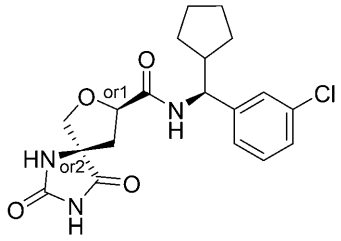
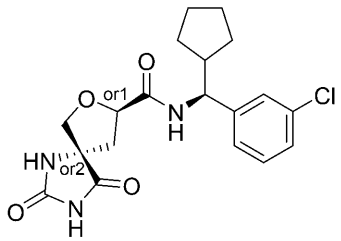
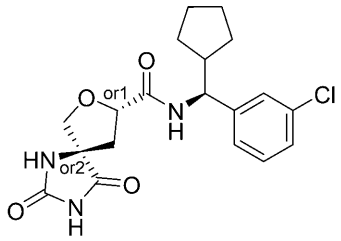
【表１－３６７】

I-1475		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.31 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 8.6, 2.6 Hz, 1H), 5.09 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.72 - 2.59 (m, 2H), 2.30 - 2.10 (m, 3H), 1.73 - 1.63 (m, 1H), 1.62 - 1.56 (m, 2H),1.52 - 1.43 (m, 2H), 1.41 - 1.27 (m, 2H), 1.22 - 1.10 (m, 1H).	410.1	E	
I-1476		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.44 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.82 - 7.17 (m, 4H), 4.71 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (ddd, J = 17.7, 12.1, 8.9 Hz, 2H), 2.38 (dd, J = 17.2, 8.7 Hz, 1H), 2.24 (ddd, J = 12.6, 9.1, 4.3 Hz, 1H), 2.11 (ddd, J = 12.8, 8.9, 4.1 Hz, 1H), 1.86 - 1.76 (m, 1H), 1.69 - 1.39 (m, 4H), 1.39 - 1.27 (m, 1H), 1.27 - 1.16 (m, 1H), 1.01 -0.87 (m, 1H).	426.25	D	
I-1477		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.44 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.72 - 7.26 (m, 4H), 4.76 -4.67 (m, 1H), 3.07 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.68 - 2.56 (m, 2H), 2.42 -2.33 (m, 1H), 2.24 (ddd, J = 12.5, 9.1, 4.2 Hz, 1H), 2.11 (ddd, J = 12.7, 9.0, 4.2 Hz, 1H), 1.82 (h, J = 7.2 Hz, 1H), 1.69 - 1.39 (m, 4H), 1.39-1.28 (m, 1H), 1.27 - 1.19 (m, 1H), 1.02 - 0.89 (m, 1H).	426.3	E	

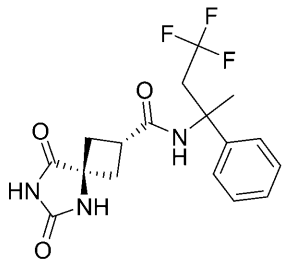
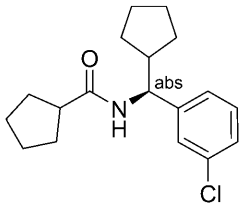
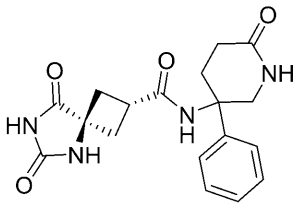
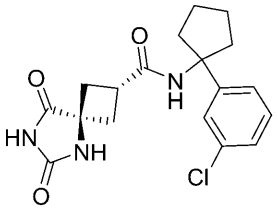
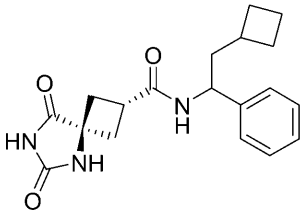
【表１－３６８】

I-1478		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.36 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.14 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.21 - 3.03 (m, 1H), 2.75 - 2.57 (m, 2H), 2.37 - 2.12 (m, 3H), 1.70 (s, 1H), 1.60 (s, 2H), 1.53 - 1.42 (m, 3H), 1.40 (s, 1H), 1.16 (d, J = 7.4 Hz, 1H).	410	A	B
I-1479		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.36 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.14 (s, 1H), 3.19 - 3.07 (m, 1H), 2.71 - 2.56 (m, 2H), 2.24 (d, J = 8.7 Hz, 3H), 1.76 - 1.67 (m, 1H), 1.60 (s, 2H), 1.54 - 1.42 (m, 2H), 1.34 (d, J = 27.7 Hz, 2H), 1.14 (dd, J = 12.9, 7.7 Hz, 1H).	410	D	
I-1480		(400 MHz, DMSO-d6) 10.83 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.45 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.37 - 7.23 (m, 3H), 4.58 - 4.42 (m, 2H), 3.99 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.86 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 2.40- 2.22 (m, 2H), 2.13 (dd, J = 13.1, 9.3 Hz, 1H), 1.74 (dd, J = 12.2, 7.5 Hz, 1H), 1.63- 1.36 (m, 4H), 1.25 (td, J = 8.1, 4.1 Hz, 2H), 1.13 - 0.99 (m, 1H).	392.25	D	

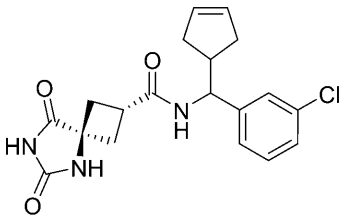
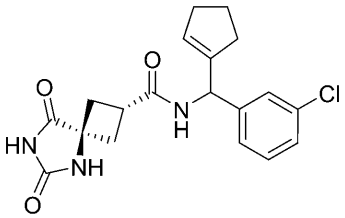
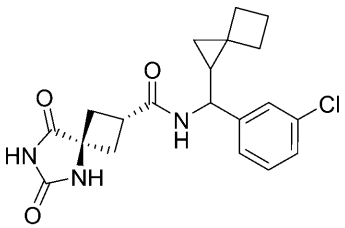
【表１－３６９】

I-1481		(400 MHz, DMSO-d6) 10.85 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.43 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.50 - 7.46 (m, 1H), 7.37- 7.25 (m, 3H), 4.56 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 4.46 - 4.40 (m, 1H), 4.02 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.91 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 2.41 - 2.31 (m, 2H), 2.28-2.22 (m, 1H), 1.78 (dt, J = 12.3, 5.8 Hz, 1H), 1.64 -1.38 (m, 4H), 1.27 (dq, J = 21.1, 7.3, 6.8 Hz, 2H), 1.12- 0.99 (m, 1H).	392.25	E	
I-1482		(400 MHz, DMSO-d6) 10.80 (s, 1H), 8.52 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.45 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38 - 7.26 (m, 3H), 4.59-4.51 (m, 1H), 4.46 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.88 (s, 2H), 2.55 (s, 1H), 2.26 (dt, J = 16.8, 8.3 Hz, 1H), 1.99 (dd, J = 13.1, 8.0 Hz, 1H), 1.73 (dd, J = 12.3, 7.6 Hz, 1H), 1.63 - 1.40 (m, 4H), 1.26 (dq, J = 8.2, 4.2, 3.6 Hz, 2H), 1.14- 0.99 (m, 1H).	392.25	D	
I-1483		(400 MHz, DMSO-d6) 10.80 (s, 1H), 8.49 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.44 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38 - 7.25 (m, 3H), 4.58 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 4.42 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 3.91 (q, J = 9.2 Hz, 2H), 2.55 (s, 1H), 2.29 (dd, J = 17.0, 8.6 Hz, 1H), 2.04 (dd, J = 13.1, 7.7 Hz, 1H), 1.84 - 1.72 (m, 1H), 1.52 (ddd, J = 30.5, 16.3, 5.0 Hz, 4H), 1.29 (dt, J = 12.4, 8.1 Hz, 2H), 1.14 - 1.02 (m, 1H).	392.25	D	

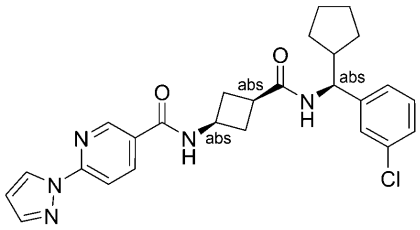
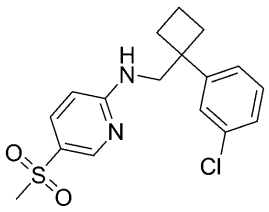
【表１－３７０】

I-1484			369.3	E	
I-1485		(400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.37 - 7.29 (m, 1H), 7.29 - 7.22 (m, 2H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.60 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.16 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 1.84 - 1.73 (m, 2H), 1.63 - 1.53 (m, 6H), 1.53 - 1.37 (m, 5H), 1.28 (dq, J = 11.6, 7.5 Hz, 2H), 1.09 (dt, J = 12.6, 8.1 Hz, 1H).	306.1	E	
I-1486			356.3	E	
I-1487			361.9	E	
I-1488			341.4	E	

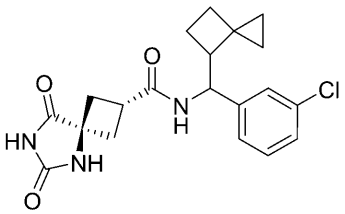
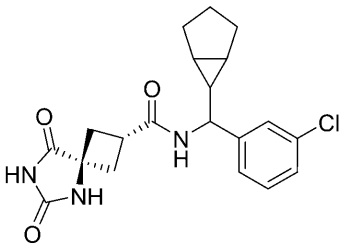
【表１－３７１】

I-1489		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.51 (br. s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.30 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.9, 6.3 Hz, 1H), 7.30 - 7.26 (m, 2H), 5.64 (app. dddd, J = 9.7, 5.8, 4.1, 2.0 Hz, 2H), 4.69 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 - 2.59 (m, 3H), 2.38 (app. dd, J = 16.8, 8.6 Hz, 1H), 2.27 - 2.19 (m, 1H), 2.18 - 2.08 (m, 2H), 2.08 - 1.96 (m, 1H), 1.96 - 1.86 (m, 1H).	374.2	D	
I-1490		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.43 (br. s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.48 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38 - 7.29 (m, 3H), 7.23 (dt, J = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 5.54 (br. d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.40 (br. app. q, J = 1.6 Hz, 1H), 3.20 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.75 - 2.62 (m, 2H), 2.31 - 2.14 (m, 5H), 2.14 - 2.03 (m, 1H), 1.80 (app. p, J = 7.6 Hz, 2H).	374.2	D	
I-1491		NMR (400 MHz, DMSO D6) δ 10.42 (br s, 1H), 8.65 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 7.44 - 7.24 (m, 4H), 3.94 (dd, J = 10.5, 8.0 Hz, 1H), 3.26-3.16 (m, 1H), 2.76 - 2.62 (m, 2H), 2.33 - 2.24 (m, 1H), 2.18 (m, 2H), 2.13 - 1.93 (m, 6H), 1.02 (ddd, J = 10.5, 8.7, 5.4 Hz, 1H), 0.57 (dd, J = 8.6, 5.0 Hz, 1H), 0.45 (t, J = 5.2 Hz, 1H). ジアステレオマーの 5:4 混合物が観察された。主要なもののみを記載。	388.2	E	

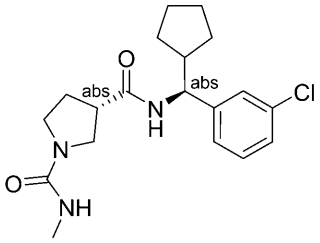
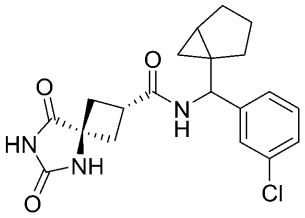
【表１－３７２】

I-1492		NMR (400 MHz, DMSOD6) δ 8.90 (埋没した d, J = 5.7Hz, 1H), 8.89 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 2.6, 0.6 Hz, 1H), 8.40 (dd, J = 8.6, 2.3 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 8.6, 0.5 Hz, 1H), 7.87 (dd, J = 1.6, 0.6 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 8.9, 6.5 Hz, 1H), 7.28 - 7.24 (m, 2H), 6.61 (dd, J = 2.6, 1.7 Hz, 1H), 4.58 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.44 - 4.32 (m, 1H), 2.82 - 2.71 (m, 1H), 2.47 - 2.37 (m, 1H), 2.37-2.28 (m, 1H), 2.23 (埋没した q, J = 9.9 Hz, 1H), 2.21 - 2.11 (m, 2H), 1.76 - 1.67 (m, 1H), 1.62 - 1.50 (m, 2H), 1.50 - 1.37 (m, 2H), 1.32 - 1.20 (m, 2H), 1.13 - 1.01 (m, 1H). 2.68ppm に未知のピーク。	478.4	D	
I-1493		(400 MHz, DMSO-d6) δ 8.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.0, 2.4 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 5.9 Hz), 7.32 - 7.26 (m, 1H), 7.21 - 7.17 (m, 2H), 7.14 - 7.10 (m, 1H), 6.55 (br. s, 1H), 3.75 (br. s, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.33 - 2.19 (m, 4H), 2.13 - 2.01 (m, 1H), 1.84 - 1.74 (m, 1H).	351.2	E	

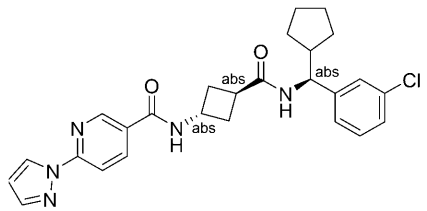
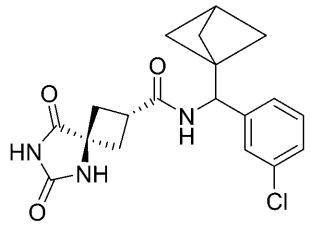
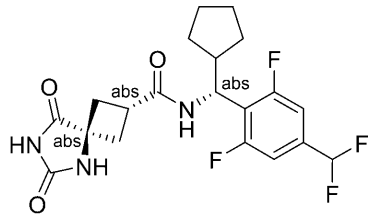
【表１－３７３】

I-1494		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 9.82 (br s, 1H), 8.62 (s, 0.5H), 8.58 (s, 0.5H), 8.17 (d,J= 9.1 Hz, 0.5H), 8.06 (d,J= 8.7 Hz, 0.5H), 7.46 - 7.09 (m, 4H), 4.82 (t,J= 9.0 Hz, 0.5H), 4.69 (dd,J= 11.0, 8.7 Hz, 0.5H), 3.12 (p,J= 9.0 Hz, 0.5H), 3.01 (p,J= 9.2 Hz, 0.5H), 2.91 - 2.81 (m, 0.5H), 2.80 - 2.71 (m, 0.5H), 2.71 - 2.52 (m, 2H), 2.28 - 1.82 (m, 4.5H), 1.77 - 1.57 (m, 1.5H), 0.74 - 0.65 (m, 0.5H), 0.44 - 0.30 (m, 1.5H), 0.27 - 0.15 (m, 1H), 0.14 - 0.06 (m, 0.5H), -0.03 - -0.12 (m, 0.5H). 一部ギ酸塩。微量の脂肪族不純物。ジアステレオマーの1:1 混合物。	388.3	D	
I-1495		NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ 10.07 (br s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.39 (d,J= 8.2 Hz, 1H), 7.37-7.31 (m, 2H), 7.29-7.25 (m, 2H), 4.22 (t,J= 6.9 Hz, 1H), 3.15 (p,J= 9.0 Hz, 1H), 2.70 (dd, J = 12.2, 9.4 Hz, 1H), 2.64 (dd, J = 12.3, 9.6 Hz, 1H), 2.29 - 2.13 (m, 2H), 1.74 - 1.43 (m, 5H), 1.35 - 1.30 (m, 1H), 1.29 - 1.24 (m ,1H), 1.17 - 0.99 (m, 1H), 0.88 (dt,J= 9.3, 3.0 Hz, 1H). 一部ギ酸塩。微量の脂肪族不純物。LC 及び HNMR に基づくと、約 4%のマイナーなジアステレオマー。	388.3	D	

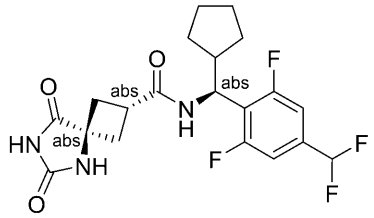
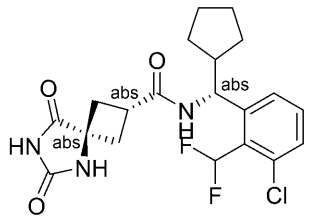
【表１－３７４】

I-1496		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.44 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.37 (br. t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.36 - 7.31 (m, 1H), 7.29 - 7.23 (m, 2H), 5.99 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 4.57 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.32 (埋没した m, 2H), 3.20 - 3.11 (m, 2H), 2.93 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.52 (d, J = 4.4 Hz, 3H), 2.24 - 2.11 (m, 1H), 2.08 - 1.98 (m, 1H), 1.94 - 1.85 (m, 1H), 1.78 - 1.68 (m, 1H), 1.62 - 1.38 (m, 4H), 1.32 - 1.21 (m, 2H), 1.14 - 1.01 (m, 1H).	364.3	D	
I-1497		NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.50 (br. s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.34 (d,J= 8.6 Hz, 0.6H), 8.22 (d,J= 8.8 Hz, 0.4H), 7.37 - 7.31 (m, 2H), 7.30 - 7.24 (m, 2H), 4.91 (d,J= 8.8 Hz, 0.4H), 4.83 (d,J= 8.5 Hz, 0.6H), 3.21 (p,J= 9.0 Hz, 0.4H), 3.20 (p,J= 9.1 Hz, 0.6H) 2.73 - 2.63 (m, 2H), 2.29 - 2.16 (m, 2H), 1.74 - 1.63 (m, 1H), 1.62 - 1.27 (m, 4.4H), 1.20 - 1.11 (埋没した m, 0.6H), 1.09 (重複する dt,J= 8.1, 3.9 Hz, 1H), 0.50 (td,J= 8.4, 5.2 Hz, 1H), 0.43 - 0.36 (m, 1H). ジアステレオマーの 3:2 混合物	388.2	D	

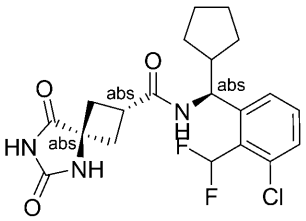
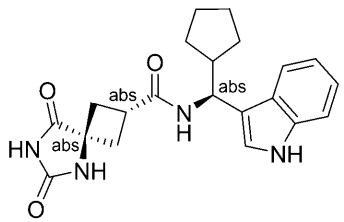
【表１－３７５】

I-1498		NMR (400 MHz, DMSOd6) δ 8.89 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.68 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 8.38 (dd, J = 8.6, 2.2 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.38 (br s, 1H), 7.33 (dd, J = 9.6, 8.9 Hz, 1H), 7.29 - 7.25 (m, 2H), 6.62 (dd, J = 2.8, 1.8 Hz, 1H), 4.62 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.54 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.02 - 2.94 (m, 1H), 2.45 - 2.23 (m, 3H), 2.23 - 2.12 (m, 1H), 1.77-1.67 (m, 1H), 1.65 - 1.37 (m, 4H), 1.37 - 1.19 (m, 4H), 1.10 (tt, J = 16.4, 8.3 Hz, 1H).	478.4	D	
I-1499		NMR (400 MHz, DMSOd6) δ 10.39 (br s, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.5, 7.5 Hz, 1H), 7.30-7.26 (m, 2H), 7.16 (dt, J = 7.6, 1.5 Hz, 1H), 4.89 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.24 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.74 - 2.62 (m, 2H), 2.46 (s, 1H), 2.30 - 2.14 (m, 2H), 1.56 (s, 6H).	374.3	C	
I-1500		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.45 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.01 (t, J = 55.5 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 31.6, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.43 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 2.17 (dddd, J = 29.3, 12.8, 9.1, 4.2 Hz, 2H), 1.91 (dtd, J = 15.6, 8.6, 7.3, 4.7 Hz, 1H), 1.68- 1.41 (m, 4H), 1.30 (dddd, J = 20.9, 15.9, 12.3, 7.8 Hz, 2H), 1.01 (dq, J = 12.4, 8.0 Hz, 1H).	428.35	E	

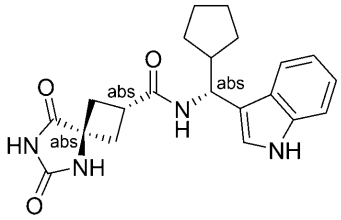
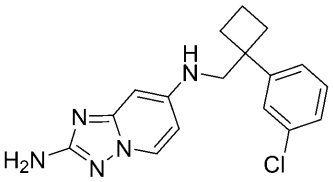
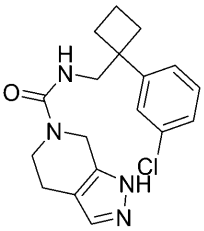
【表１－３７６】

I-1501		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.45 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.01 (t, J = 55.5 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.3 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 31.6, 12.0, 8.9 Hz, 2H), 2.43 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 2.17 (dddd, J = 29.3, 12.9, 9.1, 4.2 Hz, 2H), 1.91 (dtd, J = 15.9, 8.4, 7.5, 4.7 Hz, 1H), 1.68- 1.41 (m, 4H), 1.30 (dddd, J = 20.9, 15.8, 12.2, 7.7 Hz, 2H), 1.01 (dq, J = 15.1, 8.1 Hz, 1H).	428.35	D	
I-1502		(400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.60 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.80-7.26 (m, 4H), 4.99 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 9.3 Hz, 1H), 2.64 (dt, J = 21.8, 10.4 Hz, 2H), 2.34 - 2.18 (m, 2H), 2.16 - 2.06 (m, 1H), 1.78 (q, J = 8.4, 5.8 Hz, 1H), 1.74 - 1.24 (m, 5H), 1.23 - 1.12 (m, 1H), 0.99 (q, J = 11.2, 9.7 Hz, 1H).	426.3	D	

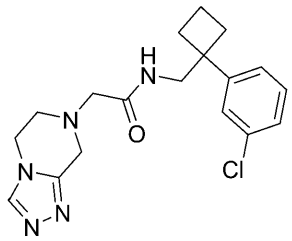
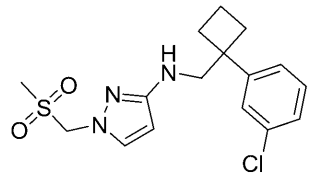
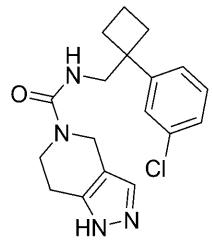
【表１－３７７】

I-1503		(400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.60 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.80- 7.26 (m, 4H), 4.99 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 9.3 Hz, 1H), 2.64 (dt, J = 21.8, 10.4 Hz, 2H), 2.34-2.18 (m, 2H), 2.16- 2.06 (m, 1H), 1.78 (q, J = 8.4, 5.8 Hz, 1H), 1.74-1.24 (m, 5H), 1.23- 1.12 (m, 1H), 0.99 (q, J = 11.2, 9.7 Hz, 1H).	426.3	C	
I-1504		(400 MHz, メタノール-d4) 7.65 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.09 (ddd, J = 8.2, 7.0, 1.2 Hz, 1H), 7.00 (td, J = 7.5, 7.0, 1.1 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 3.21 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.95 - 2.83 (m, 2H), 2.66 (dt, J = 16.0, 7.8 Hz, 1H), 2.39 (dddd, J = 28.9, 13.1, 9.6, 3.9 Hz, 2H), 1.90 (dt, J = 12.6, 6.3 Hz, 1H), 1.75 - 1.45 (m, 5H), 1.30 (q, J = 7.0, 6.4 Hz, 2H).	381.3	E	

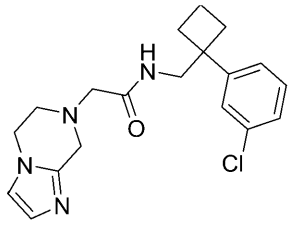
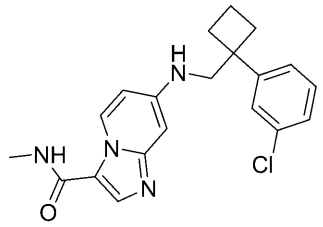
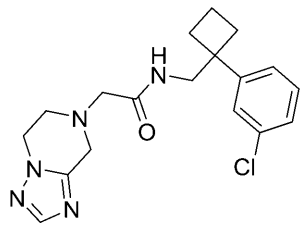
【表１－３７８】

I-1505		(400 MHz, メタノール-d4) 7.67- 7.62 (m, 1H), 7.34 (dd, J = 8.1, 1.0 Hz, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.09 (ddd, J = 8.2, 7.0, 1.2 Hz, 1H), 7.00 (ddd, J = 8.0, 7.0, 1.1 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 3.19 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.92 (ddd, J = 13.5, 8.7, 5.6 Hz, 2H), 2.66 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.46- 2.29 (m, 2H), 1.94- 1.84 (m, 1H), 1.76- 1.46 (m, 5H), 1.30 (q, J = 7.5 Hz, 2H).	381.3	D	
I-1506		7.94 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.33 - 7.23 (m, 2H), 7.21 - 7.14 (m, 2H), 6.28 - 6.23 (m, 1H), 6.22 - 6.14 (m, 1H), 6.00 - 5.93 (m, 1H), 5.56 - 5.39 (m, 2H), 3.41 (br s, 2H), 2.35 - 2.19 (m, 4H), 2.15 - 2.02 (m, 1H), 1.87 - 1.74 (m, 1H), 0.48 - 0.45 (m, 1H)	328	D	
I-1507		- 12.44 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.28 (t, J = 8.0, 1H), 7.20 (d, J = 8.4, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.01 (d, J = 7.6, 1H), 6.48 (s, 1H), 4.37 (s, 2H), 3.48 (t, J = 5.6, 2H), 3.36 (d, J = 6.0, 2H), 2.46 (s, 2H), 2.30 - 2.25 (m, 2H), 2.16 - 2.09 (m, 2H), 2.00 - 1.89 (m, 1H), 1.75 - 1.67 (m, 1H).	345.1	E	

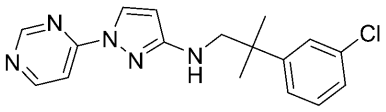
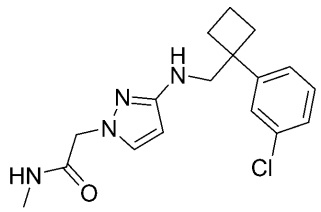
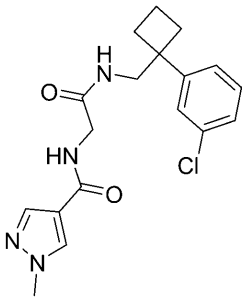
【表１－３７９】

I-1508		- 8.43 (s, 3H), 7.63 (br t, J = 6.0, 1H), 7.29 - 7.25 (m, 1H), 7.22 - 7.20 (m, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.04 (d, J = 7.2, 1H), 3.97 (t, J = 5.2, 2H), 3.75 (s, 2H), 3.46 (d, J = 6.0, 2H), 3.16 (s, 2H), 2.81 (t, J = 5.2, 2H), 2.22 - 2.15 (m, 4H), 2.03 - 2.01 (m, 1H), 1.80 - 1.75 (m, 1H).	360.1	E	
I-1509		- 7.43 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.35 - 7.28 (m, 1H), 7.24 - 7.18 (m, 2H), 7.13 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 5.34 (s, 2H), 5.28 (t, J = 6.4 Hz, 1H), 3.37 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 2.94 (s, 3H), 2.33 - 2.15 (m, 4H), 2.11 - 1.98 (m, 1H), 1.84 - 1.71 (m, 1H)	354	E	
I-1510		- 12.42 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.28 (t, J = 8.0, 1H), 7.20 - 7.18 (m, 1H), 7.07 (t, J = 2.0, 1H), 7.01 (d, J = 7.6, 1H), 6.46 (t, J = 5.6, 1H), 4.29 (s, 2H), 3.53 (t, J = 6.0, 2H), 3.35 (d, J = 6.0, 2H), 2.57 (t, J = 5.6, 2H), 2.30 - 2.24 (m, 2H), 2.16 - 2.08 (m, 2H), 2.00 - 1.89 (m, 1H), 1.76 - 1.66 (m, 1H).	345.1	E	

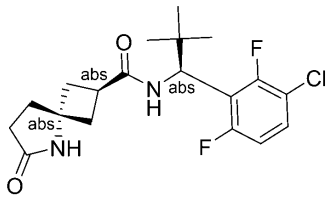
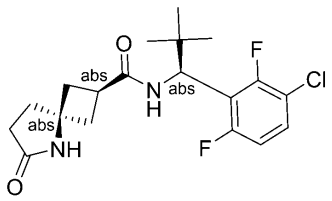
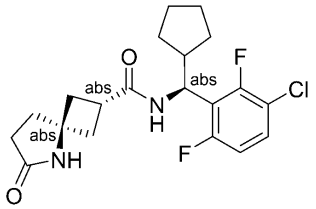
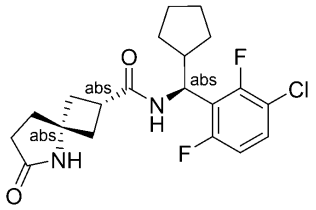
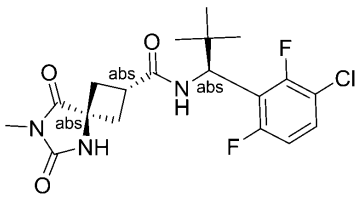
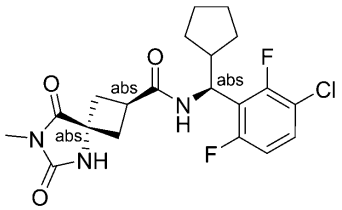
【表１－３８０】

I-1511		7.59 (br t, J = 6.4, 1H), 7.25 - 7.22 (m, 2H), 7.11 (t, J = 1.6, 1H), 7.04 - 7.03 (m, 2H), 6.83 (d, J = 1.2, 1H), 3.89 (t, J = 5.2, 2H), 3.60 (s, 2H), 3.46 (d, J = 6.4, 2H), 3.11 (s, 2H), 2.78 (t, J = 5.2, 2H), 2.27 - 2.15 (m, 4H), 2.03 - 1.96 (m, 1H), 1.81 - 1.73 (m, 1H).	359.1	E	
I-1512		13.69 - 13.31 (m, 1H), 9.06 (br d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.83 (br d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.69 (br s, 1H), 7.34 - 7.14 (m, 4H), 7.03 - 6.84 (m, 1H), 6.59 - 6.25 (m, 1H), 3.56 (br d, J = 5.2 Hz, 2H), 2.78 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.38 - 2.25 (m, 4H), 2.19 - 2.05 (m, 1H), 1.91 - 1.73 (m, 1H)	369	D	
I-1513		7.90 (s, 1H), 7.66 (br t, J = 6.2 Hz, 1H), 7.32 - 7.18 (m, 2H), 7.11 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 1.2, 7.6 Hz, 1H), 4.05 (t, J = 5.2 Hz, 2H), 3.74 (s, 2H), 3.46 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 3.18 (s, 2H), 2.92 (t, J = 5.2 Hz, 2H), 2.27 - 2.15 (m, 4H), 2.09 - 1.94 (m, 1H), 1.83 - 1.68 (m, 1H)	360.1	E	

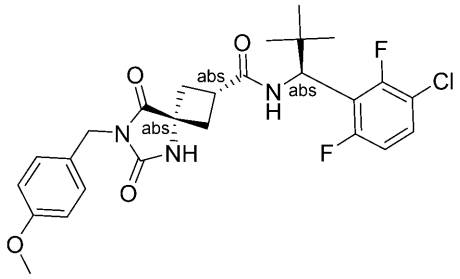
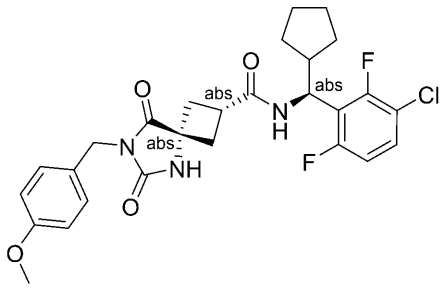
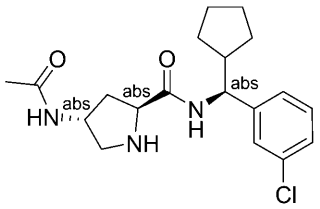
【表１－３８１】

I-1514		8.91 (s, 1H), 8.69 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.49 - 7.38 (m, 2H), 7.33 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.28 - 7.21 (m, 1H), 6.03 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.43 (s, 2H), 1.33 (s, 6H)	328.1	E	
I-1515		7.66 (br d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.36 - 7.28 (m, 2H), 7.24 - 7.17 (m, 2H), 7.17 - 7.12 (m, 1H), 5.37 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 4.86 (t, J = 6.4 Hz, 1H), 4.42 (s, 2H), 3.31 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 2.58 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.31 - 2.14 (m, 4H), 2.10 - 1.97 (m, 1H), 1.84 - 1.71 (m, 1H)	333.1	E	
I-1516		8.27 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.83 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.64 (br t, J = 6.0 Hz, 1H), 7.29 - 7.17 (m, 2H), 7.11 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.04 (td, J = 1.2, 8.4 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.73 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 3.41 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.27 - 2.10 (m, 4H), 2.08 - 1.96 (m, 1H), 1.80 - 1.66 (m, 1H)	361.1	E	

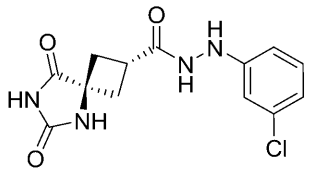
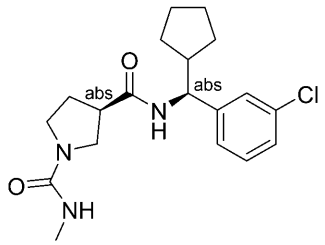
【表１－３８２】

I-1517			385.28	B	C
I-1518			385.38	D	
I-1519			397.34	A	B
I-1520			397.34	C	
I-1521			414.24	A	B
I-1522			426.49	B	B

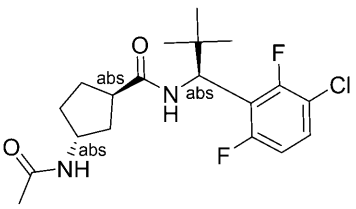
【表１－３８３】

I-1523			520.32	A	B
I-1524			532.3	A	B
I-1525		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.38 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 1H), 7.30 - 7.25 (m, 2H), 4.52 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 4.07 - 3.98 (m, 1H), 3.63 (dd, J = 8.4, 6.7 Hz, 1H), 3.18 (埋没した br. s, 1H), 2.95 (dd, J = 10.8, 5.7 Hz, 1H), 2.69 (dd, J = 10.8, 4.6 Hz, 1H), 2.38 - 2.25 (m, 1H), 1.83 (重複する m, 2H), 1.77 (重複する s, 3H), 1.75 - 1.65 (m, 1H), 1.62 - 1.38 (m, 4H), 1.32 - 1.16 (m, 2H), 1.11 - 1.01 (m, 1H).	364.3	E	

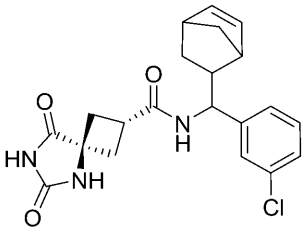
【表１－３８４】

I-1526		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.29 (br s, 1H), 9.72 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.14 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 6.71 (ddd, J = 7.8, 2.0, 0.8 Hz, 1H), 6.67 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 6.66 - 6.61 (m, 1H), 3.23 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.80 - 2.69 (m, 2H), 2.33 - 2.23 (m, 2H). 化合物は 15% の回転異性体として出現。サンプルは 0.45 当量の DIPEA を含む。20 重量%のギ酸塩。微量の脂肪族不純物。	309.2	E	
I-1527		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.44 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.36 - 7.31 (m, 1H), 7.29 - 7.24 (m, 2H), 5.99 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 4.57 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.32 (埋没した m, 2H), 3.20 - 3.11 (m, 2H), 2.93 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.52 (重複する d, J = 4.4 Hz, 3H), 2.24 - 2.11 (m, 1H), 2.08 - 1.99 (m, 1H), 1.97 - 1.85 (m, 1H), 1.78 - 1.66 (m, 1H), 1.64 - 1.37 (m, 4H), 1.31 - 1.21 (m, 2H), 1.14 - 1.02 (m, 1H).	364.3	D	

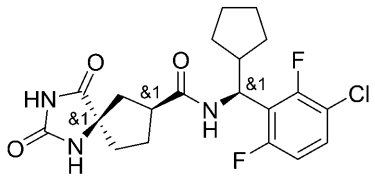
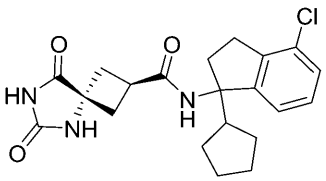
【表１－３８５】

I-1528		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.08 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 4.04 - 3.94 (m, 1H), 2.97 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.89 - 1.78 (m, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.66 - 1.57 (m, 1H), 1.49 - 1.30 (m, 2H), 0.93 (s, 9H). 未知の脂肪族不純物を含有。	387.3	B	B

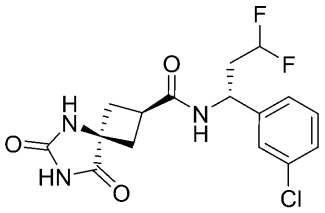
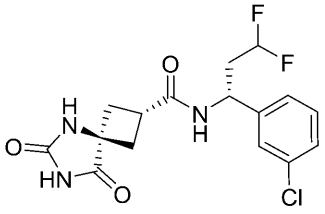
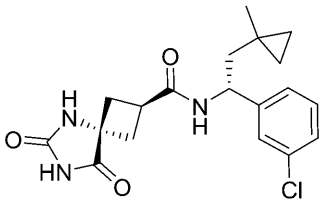
【表１－３８６】

I-1529		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 10.29 (br. s, 1H), 8.59 (s, 0.1H), 8.56 (3 つの重複する s, 3x0.3H), 8.38 - 8.26 (m, 1H), 7.37 - 7.19 (m, 3.7H), 7.15 (dt, J = 7.4, 1.4 Hz, 0.3H), 6.22 (dd, J = 5.7, 3.0 Hz, 0.3H), 6.17 (dd, J = 5.6, 2.9 Hz, 0.3H), 6.10 (dd, J = 5.6, 3.0 Hz, 0.1H), 6.05 (dd, J = 5.6, 2.9 Hz, 03H), 6.03 (埋没した dd, J = 5.6, 2.9 Hz, 0.1H), 6.01 (dd, J = 5.5, 2.7 Hz, 0.3H), 5.93 (dd, J = 5.6, 3.1 Hz, 0.3H), 5.89 (dd, J = 5.6, 2.8 Hz, 0.3H), 4.55 - 4.46 (m, 0.4H), 4.08 - 3.98 (m, 0.6H), 3.02 (4 つの重複する p, 9.1 Hz, 1H), 2.89 (br. s, 0.3H), 2.79 (br. s, 0.3H), 2.74 (br. s, 0.3H), 2.71 (br. s, 0.1H), 2.70 - 2.50 (m, 2.4H), 2.44 - 2.30 (m, 0.6H), 2.28 - 2.01 (m, 2.7H), 1.84 - 1.76 (m, 0.3H), 1.74 - 1.67 (m, 0.1H), 1.66 - 1.58 (m, 0.3H), 1.49 - 1.38 (m, 0.7H), 1.33 - 1.13 (m, 2.2H), 1.05 - 0.95 (m, 0.1H), 0.74 (dd, J = 10.5, 8.0 Hz, 0.1H), 0.69 - 0.60 (m, 0.3H), 0.38 (ddd, J = 11.6, 4.1, 2.3 Hz, 0.3H). 4 つの異性体の 1:1:1:0.3 混合物。	400.3	C	

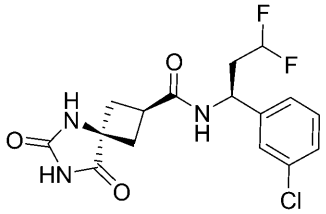
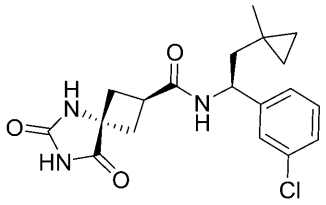
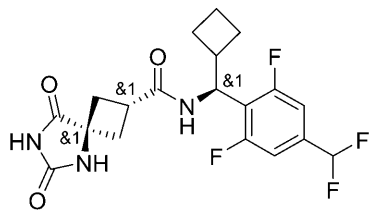
【表１－３８７】

I-1530		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.51 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.52 (dd, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.47 - 2.33 (m, 1H), 2.17 - 2.04 (m, 1H), 2.01 - 1.82 (m, 4H), 1.72 - 1.41 (m, 6H), 1.39 - 1.30 (m, 1H), 1.27 - 1.16 (m, 1H), 1.01 (q, J = 10.9, 9.4 Hz, 1H).	426.05	A	B
I-1531		(400 MHz, DMSO-d6) - 10.55 (br. s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.24 - 7.19 (m, 1H), 7.19 - 7.15 (m, 2H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.99 (ddd, J = 16.1, 9.6, 4.8 Hz, 1H), 2.79 (ddd, J = 16.5, 9.3, 5.7 Hz, 1H), 2.71 - 2.43 (重複する m, 3H), 2.36 (ddd, J = 11.6, 8.8, 4.6 Hz, 1H), 2.17 - 2.06 (m, 3H), 1.80 - 1.71 (m, 1H), 1.57 - 1.37 (m, 4H), 1.32 - 1.13 (m, 2H), 1.08 - 0.98 (m, 1H). 一部ギ酸塩。未知の脂肪族不純物を含有。3.57ppm の不純物は 1,4-ジオキサンであり得る。	402.3	D	

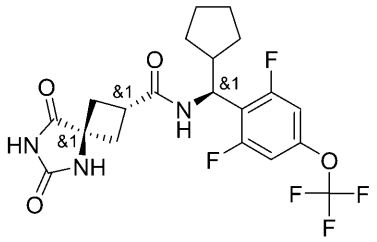
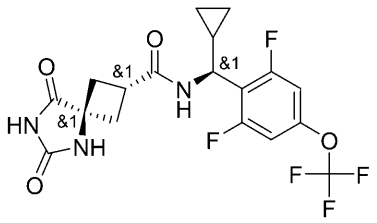
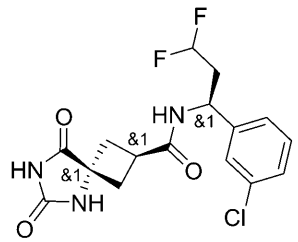
【表１－３８８】

I-1532		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.44 - 7.22 (m, 4H), 6.24 - 5.90 (m, 1H), 5.06 (td, J = 9.2, 4.7 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.76 - 2.61 (m, 2H), 2.43 - 2.15 (m, 4H).	372.05	E	
I-1533		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.58 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.47 - 7.23 (m, 4H), 6.03 (tt, J = 56.1, 4.7 Hz, 1H), 5.03 (td, J = 9.1, 5.2 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.43 (ddt, J = 9.7, 7.6, 3.4 Hz, 3H), 2.37 - 2.12 (m, 3H).	372.1	E	
I-1534		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.17 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.41-7.31 (m, 2H), 7.27 (ddt, J = 7.0, 5.2, 1.5 Hz, 2H), 5.03 (td, J = 9.4, 5.0 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.70 (ddd, J = 11.8, 9.2, 7.1 Hz, 2H), 2.20 (dddd, J = 26.1, 12.9, 8.9, 4.4 Hz, 2H), 1.71 (dd, J = 14.0, 5.0 Hz, 1H), 1.47 (dd, J = 14.0, 10.0 Hz, 1H), 1.03 (s, 3H), 0.47 (dt, J = 9.2, 4.8 Hz, 1H), 0.23-0.04 (m, 3H).	376	E	

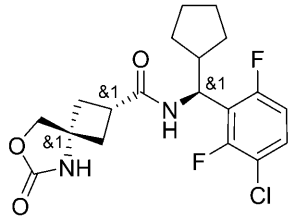
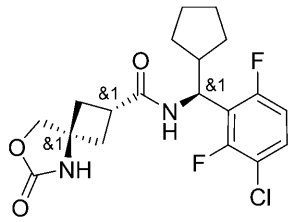
【表１－３８９】

I-1535		(400 MHz, DMSO-d6) 10.65 - 10.48 (m, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.47 - 7.24 (m, 4H), 6.24 - 5.90 (m, 1H), 5.06 (td, J = 9.4, 4.8 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.78 - 2.60 (m, 2H), 2.43 - 2.15 (m, 4H).	372.05	E	
I-1536		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.16 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.39-7.31 (m, 2H), 7.27 (ddt, J = 6.8, 5.2, 1.5 Hz, 2H), 5.03 (td, J = 9.4, 5.0 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.70 (ddd, J = 11.9, 9.2, 7.1 Hz, 2H), 2.20 (dddd, J = 26.0, 12.9, 8.9, 4.4 Hz, 2H), 1.71 (dd, J = 14.0, 5.0 Hz, 1H), 1.47 (dd, J = 14.0, 10.0 Hz, 1H), 1.03 (s, 3H), 0.47 (dt, J = 9.2, 4.4 Hz, 1H), 0.23-0.04 (m, 3H).	376.05	D	
I-1537		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.32 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.00 (t, J = 55.5 Hz, 1H), 5.06 (dd, J = 10.8, 7.1 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.80 (q, J = 8.3, 7.2 Hz, 1H), 2.66 (dd, J = 11.9, 9.0 Hz, 1H), 2.57 (dd, J = 11.9, 9.0 Hz, 1H), 2.25 - 2.03 (m, 3H), 1.92 - 1.67 (m, 4H), 1.59 - 1.50 (m, 1H).	414.3	D	

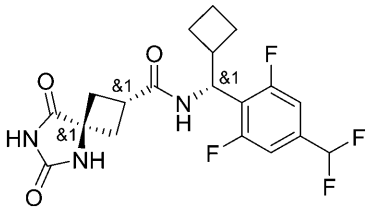
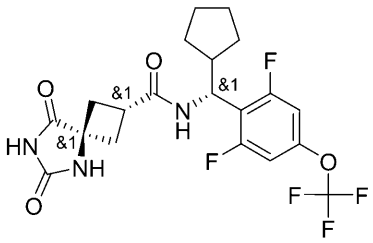
【表１－３９０】

I-1538		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.23 - 3.07 (m, 1H), 2.63 (ddd, J = 23.3, 12.1, 8.9 Hz, 2H), 2.47 - 2.32 (m, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.5, 9.1, 4.2 Hz, 1H), 2.14 (ddd, J = 12.8, 9.0, 4.2 Hz, 1H), 1.99 - 1.81 (m, 1H), 1.69 - 1.41 (m, 4H), 1.39 - 1.21 (m, 2H), 1.00 (dq, J = 16.1, 7.9 Hz, 1H).	462.1	E	
I-1539		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.70 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.29 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 4.33 - 4.05 (m, 1H), 3.25 - 3.07 (m, 1H), 2.73 - 2.64 (m, 1H), 2.58 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.26 - 2.07 (m, 2H), 1.31 (d, J = 54.3 Hz, 1H), 0.60 (tt, J = 8.6, 4.6 Hz, 1H), 0.43 (ddq, J = 31.6, 9.6, 4.7 Hz, 2H), 0.17 (dq, J = 9.6, 4.7 Hz, 1H).	434.1	E	
I-1540		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.58 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.44 - 7.26 (m, 4H), 6.22 - 5.86 (m, 1H), 5.03 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.43 (dd, J = 9.7, 5.2 Hz, 3H), 2.37 - 2.15 (m, 3H).	372.05	E	

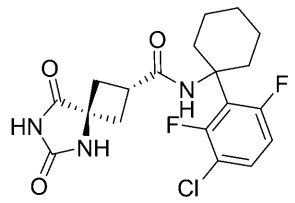
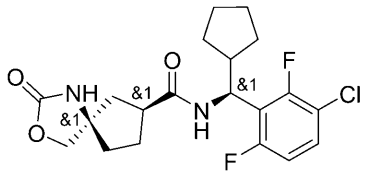
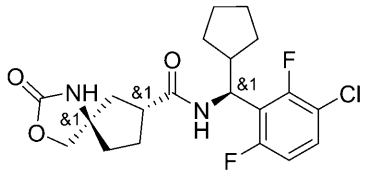
【表１－３９１】

I-1541		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.53 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.5 Hz, 1H), 4.32 (d, J = 1.5 Hz, 2H), 2.76 - 2.66 (m, 1H), 2.43- 2.28 (m, 2H), 2.23 (dd, J = 20.8, 8.6 Hz, 3H), 1.88 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 1.66- 1.41 (m, 4H), 1.34 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.27 - 1.15 (m, 1H), 1.01 (d, J = 9.3 Hz, 1H).	399.25	B	
I-1542		(400 MHz, DMSO-d6) 8.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.54 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.84 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 4.22 (q, J = 9.3 Hz, 2H), 2.97- 2.83 (m, 1H), 2.41 (d, J = 10.3 Hz, 2H), 2.30 (t, J = 13.0 Hz, 2H), 2.18 (d, J = 12.2 Hz, 1H), 1.94- 1.83 (m, 1H), 1.68- 1.41 (m, 4H), 1.34 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 1.24 (s, 1H), 1.00 (s, 1H).	397.15	B	B

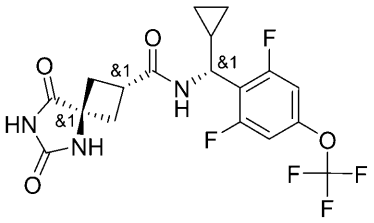
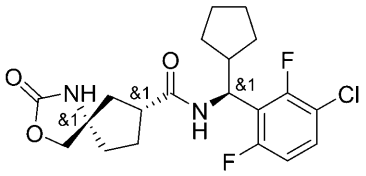
【表１－３９２】

I-1543		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.32 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.00 (t, J = 55.5 Hz, 1H), 5.06 (dd, J = 10.8, 7.1 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.80 (q, J = 7.8, 7.3 Hz, 1H), 2.66 (dd, J = 12.1, 9.0 Hz, 1H), 2.57 (dd, J = 11.9, 9.0 Hz, 1H), 2.16 (dtd, J = 23.9, 9.0, 4.7 Hz, 3H), 1.86 - 1.68 (m, 4H), 1.59 - 1.48 (m, 1H).	414.25	E	
I-1544		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (ddd, J = 23.3, 12.1, 8.9 Hz, 2H), 2.46 - 2.32 (m, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.5, 9.2, 4.1 Hz, 1H), 2.14 (ddd, J = 12.8, 9.0, 4.2 Hz, 1H), 1.96 - 1.83 (m, 1H), 1.65 - 1.54 (m, 2H), 1.54 - 1.41 (m, 2H), 1.35 (dt, J = 12.7, 7.7 Hz, 1H), 1.30 - 1.19 (m, 1H), 1.00 (dq, J = 16.2, 8.2 Hz, 1H).	462.15	E	

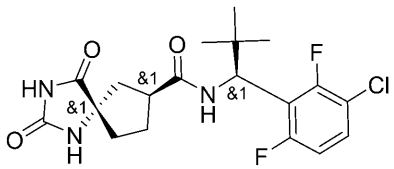
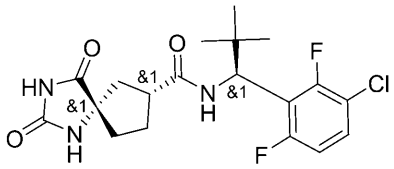
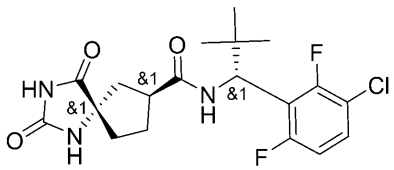
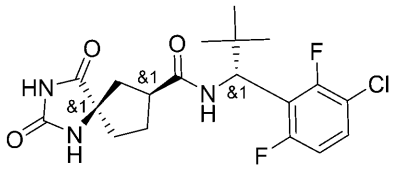
【表１－３９３】

I-1545		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.49 (dt, J = 8.5, 4.3 Hz, 1H), 7.04 (ddd, J = 12.4, 9.0, 1.8 Hz, 1H), 3.20 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69- 2.55 (m, 4H), 2.16 (td, J = 9.5, 2.8 Hz, 2H), 1.86 (t, J = 12.6 Hz, 2H), 1.61 (dt, J = 22.3, 12.0 Hz, 4H), 1.48 (d, J = 13.3 Hz, 2H), 1.26 (d, J = 12.6 Hz, 1H).		C	
I-1546		(400 MHz, DMSO-d6) 8.41 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.09 (s, 2H), 2.73 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 2.42 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 1.95 - 1.40 (dt, 11H), 1.39 - 1.19 (m, 2H), 1.02 (q, J = 10.9, 9.1 Hz, 1H).	413.1	C	
I-1547		(400 MHz, DMSO-d6) 8.41 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.16 - 4.06 (m, 2H), 2.74 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.42 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 1.94 (tt, J = 12.3, 6.6 Hz, 2H), 1.82 (dd, J = 12.7, 9.8 Hz, 1H), 1.77 - 1.43 (m, 8H), 1.41 - 1.22 (m, 2H), 1.01 (dd, J = 12.3, 7.4 Hz, 1H).	413.1	B	

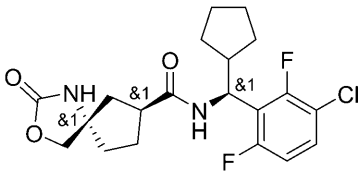
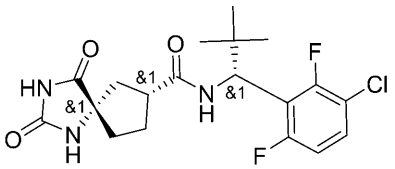
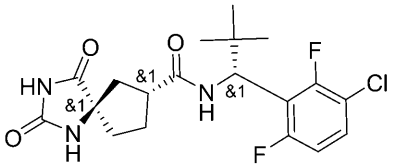
【表１－３９４】

I-1548		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.75 - 8.48 (m, 2H), 7.29 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 4.39 - 4.09 (m, 1H), 3.23 - 3.05 (m, 1H), 2.72 - 2.64 (m, 1H), 2.58 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.16 (dddd, J = 24.7, 20.8, 12.5, 8.0 Hz, 2H), 1.31 (d, J = 53.4 Hz, 1H), 0.59 (td, J = 8.4, 4.1 Hz, 1H), 0.48 (tq, J = 8.5, 4.8, 4.2 Hz, 1H), 0.39 (dt, J = 9.7, 4.7 Hz, 1H), 0.17 (dd, J = 9.7, 5.0 Hz, 1H).	434.05	E	
I-1549		(400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 4.15 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.97 - 2.82 (m, 1H), 2.47 - 2.36 (m, 1H), 1.99 - 1.71 (m, 5H), 1.68 - 1.41 (m, 6H), 1.40 - 1.19 (m, 2H), 1.07 - 0.95 (m, 1H).	413.1	B	B

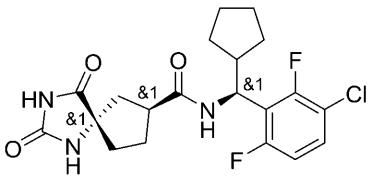
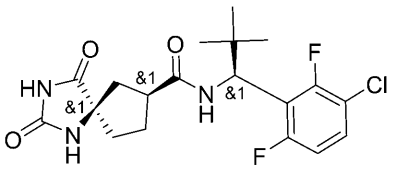
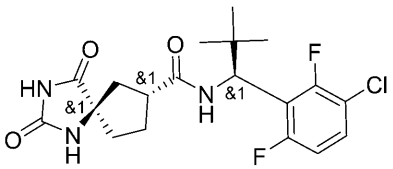
【表１－３９５】

I-1550		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.11 - 2.95 (m, 1H), 2.09 - 1.95 (m, 3H), 1.87 - 1.73 (m, 2H), 1.68 (dt, J = 12.0, 5.9 Hz, 1H), 0.95 (s, 9H).	414.1	B	
I-1551		(400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s, 1H), 8.44 - 8.08 (m, 2H), 7.72 - 7.48 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.13 - 3.01 (m, 1H), 2.19 - 2.05 (m, 1H), 1.95 (ddd, J = 17.7, 12.0, 7.0 Hz, 3H), 1.66 (t, J = 10.8 Hz, 2H), 0.94 (s, 9H).	414.1	E	
I-1552		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.30 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.07 (s, 1H), 3.21 - 3.03 (m, 1H), 2.21 - 2.05 (m, 1H), 1.97 - 1.84 (m, 3H), 1.75 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 1.66 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 0.94 (s, 9H).	414.1	E	
I-1553		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.31 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.15 (dd, J = 16.9, 6.9 Hz, 1H), 2.17 - 1.87 (m, 3H), 1.87 - 1.68 (m, 3H), 0.94 (s, 9H).	414.1	E	

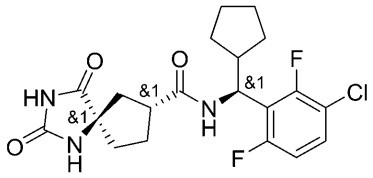
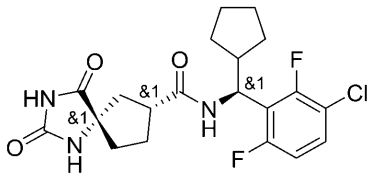
【表１－３９６】

I-1554		(400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 11.2, 7.4 Hz, 1H), 4.08 (s, 2H), 2.97 - 2.82 (m, 1H), 2.48 - 2.37 (m, 1H), 2.03 - 1.89 (m, 2H), 1.87 - 1.43 (m, 9H), 1.40 - 1.15 (m, 2H), 1.06 - 0.95 (m, 1H).	413.1	B	B
I-1555		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.15 (dd, J = 17.0, 6.9 Hz, 1H), 2.19 - 1.87 (m, 3H), 1.85 - 1.68 (m, 3H), 0.94 (s, 9H).	414.1	D	
I-1556		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.30 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.32 - 7.02 (m, 1H), 5.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.23 - 3.03 (m, 1H), 2.19 - 2.03 (m, 1H), 2.03 - 1.85 (m, 3H), 1.76 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.73 - 1.55 (m, 1H), 0.94 (s, 9H).	414.1	C	

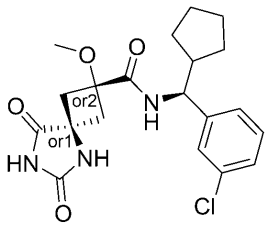
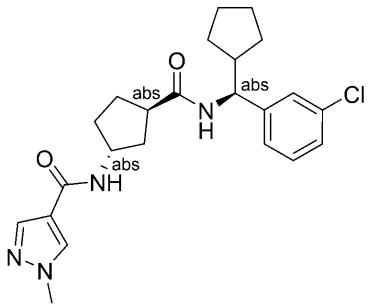
【表１－３９７】

I-1557		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.50 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.29 - 7.05 (m, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.01 - 2.79 (m, 1H), 2.43 - 2.32 (m, 1H), 2.11 - 1.87 (m, 4H), 1.85 - 1.71 (m, 2H), 1.69 - 1.44 (m, 5H), 1.39 - 1.20 (m, 2H), 1.01 (s, 1H).	426.2	B	B
I-1558		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.43 - 8.14 (m, 2H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.13 - 3.01 (m, 1H), 2.18 - 2.07 (m, 1H), 1.94 (ddd, J = 26.0, 12.9, 8.0 Hz, 3H), 1.76 - 1.57 (m, 2H), 0.94 (s, 9H).	414.1	B	B
I-1559		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.43 - 8.06 (m, 2H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.07 (dd, J = 9.7, 7.3 Hz, 1H), 2.13 - 1.95 (m, 3H), 1.82 (dt, J = 14.5, 7.2 Hz, 2H), 1.71 - 1.60 (m, 1H), 0.95 (s, 9H).	414.1	D	

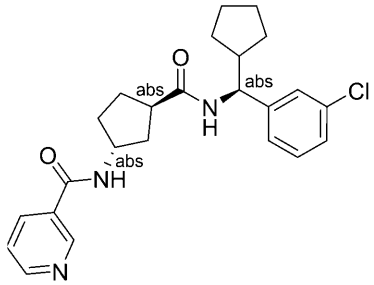
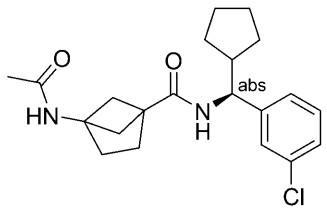
【表１－３９８】

I-1560		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.55 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.82 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 2.97 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.45 - 2.29 (m, 1H), 2.16 - 2.01 (m, 1H), 1.90 (tt, J = 12.2, 4.0 Hz, 4H), 1.81 - 1.42 (m, 6H), 1.38 - 1.18 (m, 2H), 1.00 (dd, J = 12.9, 7.6 Hz, 1H).	426.05	B	
I-1561		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.55 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.05 - 2.79 (m, 1H), 2.43 - 2.27 (m, 1H), 2.11 - 1.87 (m, 4H), 1.87 - 1.69 (m, 3H), 1.63 - 1.44 (m, 4H), 1.42 - 1.21 (m, 2H), 1.00 (dd, J = 12.9, 7.5 Hz, 1H).	426.05	D	

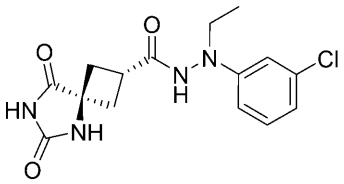
【表１－３９９】

I-1562		(400 MHz, DMSO-d6) - 9.09 (br. s, 1H), 8.59 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.49 - 7.47 (m, 1H), 7.34 - 7.31 (m, 2H), 7.29 - 7.25 (m, 1H), 4.54 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 3.05 (s, 3H), 2.66 (dd, J = 13.1, 2.3 Hz, 1H), 2.60 - 2.57 (m, 1H), 2.57 - 2.53 (m, 1H), 2.42 - 2.30 (m, 2H), 1.84 - 1.75 (m, 1H), 1.64 - 1.38 (m, 4H), 1.33 - 1.17 (m, 2H), 1.13 - 1.02 (m, 1H). 一部ギ酸塩。シクロブタン置換のシス/トランス幾何学は不明。	406.3	E	
I-1563		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.27 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.83 (重複する s, 1H), 7.82 (埋没した d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.35 - 7.29 (m, 1H), 7.26 (m, J = 7.3, 3.4, 1.9 Hz, 2H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.26 - 4.14 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.81 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.22 - 2.09 (m, 1H), 1.97 - 1.68 (m, 5H), 1.62 - 1.37 (m, 6H), 1.32 - 1.21 (m, 2H), 1.13 - 1.03 (m, 1H).	429.2	C	

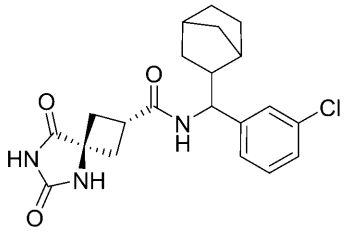
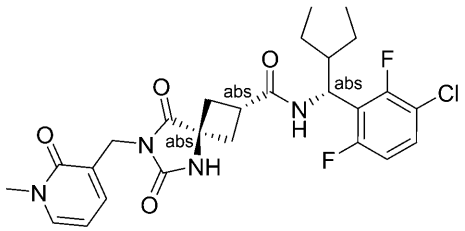
【表１－４００】

I-1564		NMR (400 MHz, DMSOd6) - 8.99 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.17 (dt, J = 7.9, 1.9 Hz, 1H), 7.49 (dd, J = 7.9, 4.8 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 9.3, 6.0 Hz, 1H), 7.29 - 7.23 (m, 2H), 4.57 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.35 - 4.23 (m, 1H), 2.85 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.26 - 2.09 (m, 1H), 2.03 - 1.91 (m, 2H), 1.91 - 1.79 (m, 2H), 1.78-1.67 (dt, 1H), 1.67 - 1.50 (m, 5H), 1.50 - 1.36 (m, 1H), 1.34 - 1.20 (m, 2H), 1.15-1.02 (m, 1H).	426.4	C	
I-1565		(400 MHz, DMSO-d6) - 回転異性体の 19:1 混合物として- 8.24 (s, 1H), 7.94 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.34 - 7.29 (m, 1H), 7.29 - 7.24 (m, 2H), 4.53 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 2.31 - 2.19 (m, 1H), 1.99 - 1.94 (m, 2H), 1.76 (重複する s, 3H), 1.79 - 1.69 (重複する m, 5H), 1.61 - 1.37 (m, 6H), 1.28 - 1.17 (m, 2H), 1.11 - 1.01 (m, 1H).	375.3	E	

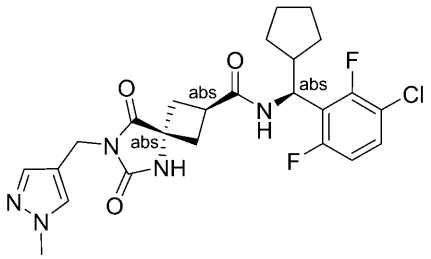
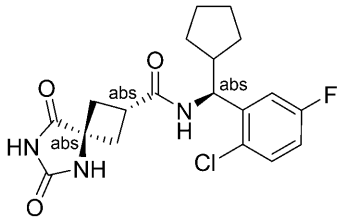
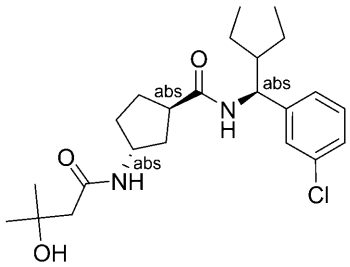
【表１－４０１】

I-1566		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 10.32 (br s, 1H), 9.90 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.23 - 7.14 (m, 1H), 6.77 - 6.68 (m, 3H), 3.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 3.29 - 3.19 (m, 1H), 2.81 - 2.72 (m, 2H), 2.35 - 2.26 (m, 2H), 1.08 (t, J = 7.1 Hz, 3H). 微量の不純物。約 20% のマイナーな回転異性体が存在。主要なもののみ記載。	337.2	E	

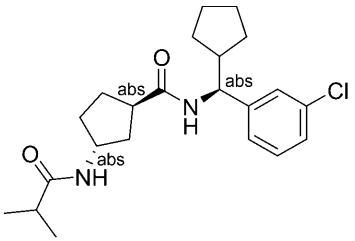
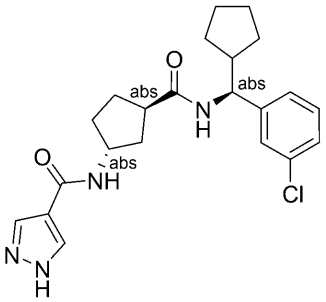
【表１－４０２】

I-1567		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 10.47 (br. s, 1H), 8.61 (埋没した s, 0.25H), 8.60 (重複する s, 0.75H), 8.34 - 8.29 (m, 0.5H), 8.26 (dd, J = 8.7, 1.7 Hz, 0.25H), 8.19 (dd, J = 8.7, 2.1 Hz, 0.25H), 7.39 (br. s, 0.25H), 7.37 - 7.31 (m, 1.5H), 7.30 - 7.21 (m, 2.25H), 4.64 - 4.56 (m, 0.25H), 4.56 - 4.48 (m, 0.25H), 4.37 (ddd, J = 11.4, 8.3, 3.3 Hz, 0.5H), 3.13 - 2.99 (m, 1H), 2.62 (dd, J = 21.3, 9.7 Hz, 2H), 2.29 (br. s, 0.25H), 2.25 - 2.04 (m, 3.75H), 1.84 - 1.66 (m, 0.50H), 1.66 - 1.14 (m, 6.50H), 1.13 - 0.86 (m, 1.5H), 0.78 (d, J = 12.3 Hz, 0.25H), 0.60 (d, J = 8.9 Hz, 0.25H). ジアステレオマーの2:1:1 混合物のように見えたが、2 つのジアステレオマーのピークが重複している 1:1:1:1 混合物かもしれない。	402.2	D	
I-1568			533.37	B	B

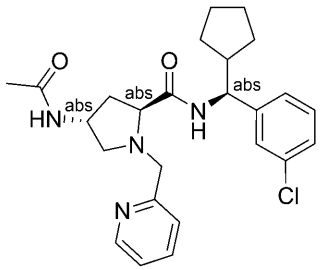
【表１－４０３】

I-1569			506.47	A	A
I-1570				D	
I-1571		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.36 (t, J = 1.5 Hz, 1H), 7.35 - 7.29 (m, 1H), 7.28 - 7.23 (m, 2H), 4.84 (s, 1H), 4.54 (app. t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.10 - 4.01 (m, 1H), 2.82 - 2.72 (m, 1H), 2.21 - 2.10 (重複する m, 1H), 2.16 (重複する s, 2H), 1.94 - 1.34 (m, 11H), 1.31 - 1.19 (m, 2H), 1.13 (重複する s, 6H), 1.16 - 1.02 (重複する m, 1H). 微量の脂肪族不純物が存在。	421.4	D	

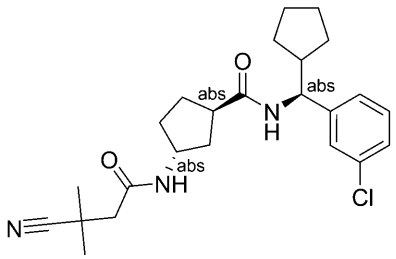
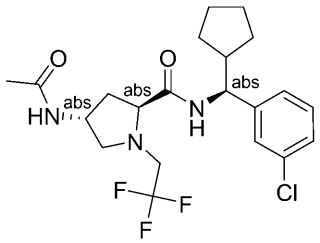
【表１－４０４】

I-1572		NMR (400 MHz, DMSOd6) - 8.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.35 - 7.29 (m, 1H), 7.28-7.23 (m, 2H), 4.54 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.07 - 3.96 (m, 1H), 2.76 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.36 - 2.25 (m, 1H), 2.21 - 2.09 (m, 1H), 1.92 - 1.67 (m, 4H), 1.67 - 1.32 (m, 7H), 1.31-1.20 (m, 2H), 1.14 - 1.02 (m, 1H), 0.98 (d, J = 2.3 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 2.3 Hz, 3H).	391.4	D	
I-1573		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 13.08 (br. s, 1H), 8.27 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.14 (br. s, 1H), 7.90 (br. s, 1H), 7.82 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 1.5 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 1H), 7.28 - 7.23 (m, 2H), 4.56 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.26 - 4.17 (m, 1H), 2.82 (app. p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.21 - 2.10 (m, 1H), 1.98 - 1.66 (m, 5H), 1.62 - 1.36 (m, 6H), 1.33 - 1.20 (m, 2H), 1.13 - 1.02 (m, 1H). 8.14ppm 及び 7.90ppm のシングレットは、ピラゾールの N-H が互変異性体化した結果、ブロード化している。	415.3	B	D

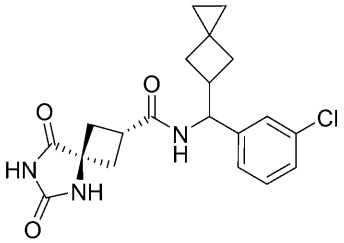
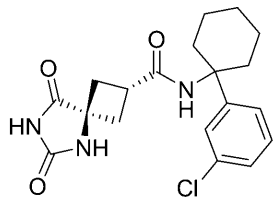
【表１－４０５】

I-1574		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.77 (d, J = 9.1 Hz, 0.8H), 8.69 (d, J = 5.6 Hz, 0.2H), 8.54 - 8.51 (m, 0.8H), 8.36 - 8.30 (m, 0.4H), 8.26 (d, J = 7.7 Hz, 0.2H), 8.07 (d, J = 7.2 Hz, 0.2H, 8.00 (d, J = 7.0 Hz, 0.8H), 7.74 (td, J = 7.6, 1.6 Hz, 0.8H), 7.70 (重複する m, 0.2H), 7.45 (s, 0.8H), 7.37 (d, J = 7.7 Hz, 0.8H), 7.31 - 7.18 (m, 3.8H), 7.16 - 7.12 (m, 0.2H), 4.61 (t, J = 9.3 Hz, 0.8H), 4.51 (t, J = 9.5 Hz, 0.2H), 4.40 - 4.30 (m, 0.2H), 4.22 - 4.07 (m, 1H), 3.97 (d, J = 17.4 Hz, 0.2H), 3.77 (d, J = 13.7 Hz, 0.8H), 3.62 (d, J = 13.6 Hz, 0.8H), 3.54 (dd, J = 8.2, 6.5 Hz, 0.2H), 3.39 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 3.10 (dd, J = 8.7, 6.5 Hz, 1H), 2.39 - 2.16 (m, 2H), 2.05 - 1.90 (m, 2H), 1.79 (s, 0.6H), 1.76 (重複する s, 2.4H), 1.74 - 1.66 (m, 0.8H), 1.64 - 1.39 (m, 4H), 1.37 - 1.19 (m, 1.8H), 1.18 - 0.95 (m, 1.2H). おそらく 2 つの回転異性体の 4:1 混合物。	455.1	E	

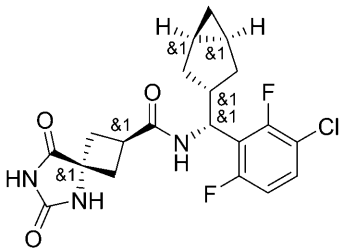
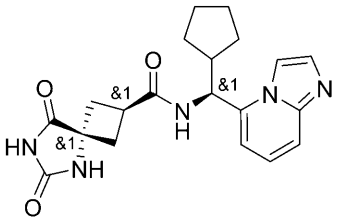
【表１－４０６】

I-1575		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.35 - 7.29 (m, 1H), 7.28 - 7.22 (m, 2H), 4.55 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.10 - 4.00 (m, 1H), 2.78 (app. p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.35 (d, AB の A, JAB = 14.5 Hz, 1H), 2.31 (d, AB の B, JAB = 14.5 Hz, 1H), 2.22 - 2.10 (m, 1H), 1.95 - 1.36 (m, 11H), 1.34 (s, 6H), 1.31 - 1.20 (m, 2H), 1.13 - 1.02 (m, 1H). 未知の脂肪族不純物を含有。	430.4	D	
I-1576		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.18 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.37 (br. t, J = 1.4 Hz 1H), 7.35 - 7.29 (m, 1H), 7.27 - 7.22 (m, 2H), 4.58 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.20 (app. h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.51 (dd, J = 7.7, 5.5 Hz, 1H), 3.37 (重複する m, 2H), 3.29 (重複する m, 1H), 2.54 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 2.32 - 2.20 (m, 1H), 1.97 - 1.86 (m, 2H), 1.78 (s, 3H), 1.76 - 1.67 (m, 1H), 1.63 - 1.38 (m, 4H), 1.32 - 1.18 (m, 2H), 1.14 - 1.03 (m, 1H).	446.2	E	

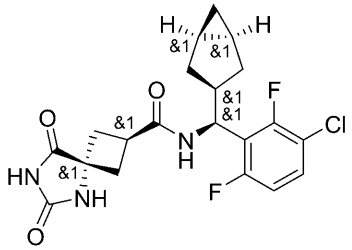
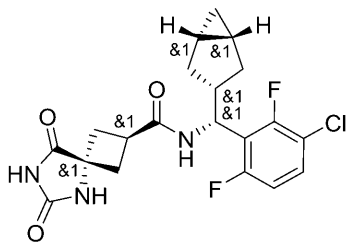
【表１－４０７】

I-1577		NMR (400 MHz, DMSo-d6)- 10.06 (br s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.25 (d,J= 8.6 Hz, 1H), 7.36 (t,J= 1.6 Hz, 1H), 7.35 - 7.29 (m, 1H), 7.29 - 7.24 (m, 2H), 4.89 - 4.82 (appt dd, 1H), 3.14 (p,J= 9.1 Hz, 1H), 2.77 - 2.59 (m, 3H), 2.27 - 2.10 (m, 2H), 2.08 - 2.00 (m, 1H), 1.99 - 1.91 (m, 1H), 1.89 - 1.77 (m, 2H), 0.40 - 0.32 (m, 4H). 得られたジアステレオマーは１つのみ。微量の脂肪族不純物。	388.3	D	
I-1578		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.33- 7.28 (m, 3H), 7.23 (dt, J = 7.0, 1.8 Hz, 1H), 3.25 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70 - 2.63 (m, 2H), 2.31 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.22 (td, J = 9.6, 2.8 Hz, 2H), 1.57 (d, J = 28.1 Hz, 6H), 1.25 (s, 1H).	376.2	D	

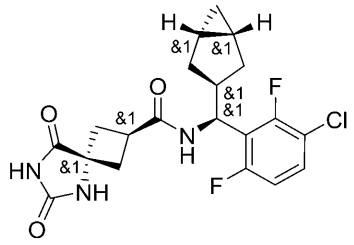
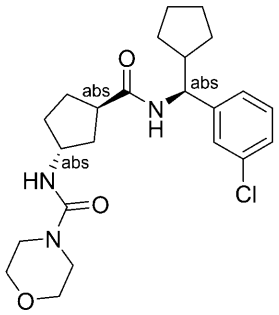
【表１－４０８】

I-1579		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.37 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.75 (dd, J = 12.0, 7.5 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.84 (s, 1H), 2.61 (dt, J = 27.8, 10.5 Hz, 2H), 2.18 (ddt, J = 32.3, 12.5, 7.3 Hz, 3H), 1.89 - 1.70 (m, 1H), 1.46 - 1.26 (m, 3H), 1.24 (s, 1H), 0.96 (dd, J = 14.0, 5.3 Hz, 1H), 0.65 (s, 1H), 0.07 (q, J = 4.2 Hz, 1H).	424.1	B	C
I-1580		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.38 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.62 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 9.0, 7.0 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 5.08 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.76 - 2.57 (m, 3H), 2.24 (ddd, J = 12.8, 9.1, 4.3 Hz, 1H), 2.12 (ddt, J = 15.6, 10.5, 5.3 Hz, 1H), 1.77 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 1.69 - 1.43 (m, 6H), 1.21 - 1.10 (m, 1H).	382.15	E	

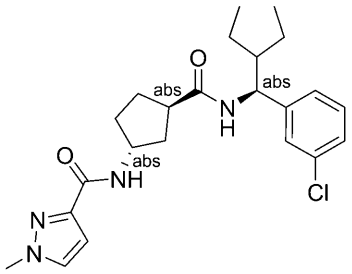
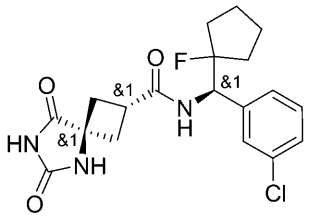
【表１－４０９】

I-1581		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.40 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 10.4, 7.3 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.60 (ddd, J = 31.8, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.27 - 2.03 (m, 4H), 1.49 - 1.38 (m, 1H), 1.34 (dd, J = 8.8, 2.3 Hz, 2H), 1.24 (ddt, J = 17.4, 8.3, 3.8 Hz, 2H), 0.28 (td, J = 7.9, 4.8 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	424.15	A	B
I-1582		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.40 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.16 - 7.07 (m, 1H), 4.83 (dd, J = 10.4, 7.4 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.60 (ddd, J = 31.7, 12.0, 9.0 Hz, 2H), 2.32 - 2.02 (m, 4H), 1.44 (s, 1H), 1.37 - 1.30 (m, 2H), 1.29 - 1.17 (m, 2H), 0.28 (td, J = 7.9, 4.8 Hz, 1H), 0.15 (t, J = 4.2 Hz, 1H).	424.15	E	

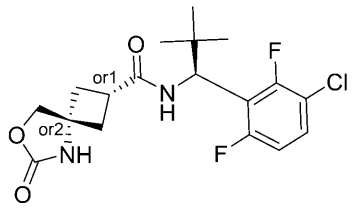
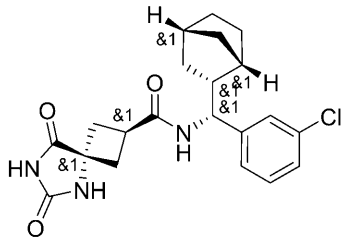
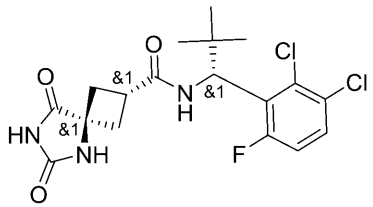
【表１－４１０】

I-1583		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 4.75 (dd, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.96 - 2.76 (m, 1H), 2.69- 2.53 (m, 2H), 2.32-2.05 (m, 3H), 1.92 - 1.70 (m, 1H), 1.46 - 1.27 (m, 3H), 1.24 (s, 1H), 0.96 (dd, J = 13.5, 5.4 Hz, 1H), 0.66 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 0.07 (q, J = 4.2 Hz, 1H).	424.15	A	B
I-1584		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.23 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38 - 7.35 (m, 1H), 7.35 - 7.29 (m, 1H), 7.29 - 7.23 (m, 2H), 6.25 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 4.55 (app. t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.97 (app. sext, J = 6.7 Hz, 1H), 3.55 - 3.49 (m, 4H), 3.25 - 3.21 (m, 4H), 2.76 (app. p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.22 - 2.09 (m, 1H), 1.89 - 1.66 (m, 5H), 1.61 - 1.37 (m, 6H), 1.32 - 1.20 (m, 2H), 1.13 - 1.03 (m, 1H).	434.5	D	

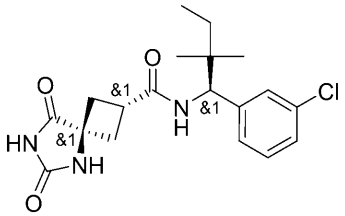
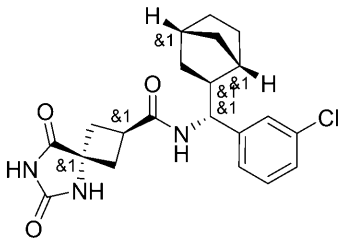
【表１－４１１】

I-1585		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.26 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.37 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 1H), 7.28 - 7.23 (m, 2H), 6.59 - 6.58 (m, 1H), 4.56 (app. t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.26 (app. sext, J = 7.0 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.83 (app. p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.21 - 2.10 (m, 1H), 1.96 - 1.77 (m, 4H), 1.77 - 1.67 (m, 1H), 1.62 - 1.37 (m, 6H), 1.33 - 1.21 (m, 2H), 1.13 - 1.03 (m, 1H). 未知の脂肪族不純物を含有。	429.4	D	
I-1586		NMR (400 MHz, DMSOd6) - 10.46 (br s, 1H), 8.67 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.39-7.29 (m,, 3H), 5.09 (dd, J = 27.1, 9.2 Hz, 1H), 3.24 (p, J = 9.4 Hz, 1H), 2.72-2.62 (m, 2H), 2.26 (td, J = 15.1, 6.2 Hz, 1H), 2.17 (td, J = 15.2, 5.8 Hz, 1H), 1.92 - 1.77 (m, 2H), 1.77-1.56 (m, 5H), 1.39-1.20 (m, 1H).	394.3	D	

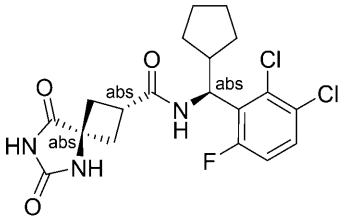
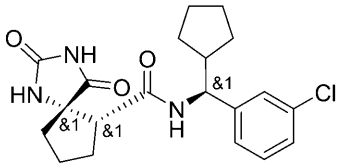
【表１－４１２】

I-1587		(400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 5.08 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 4.34 (s, 2H), 2.90 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.35 (t, J = 10.4 Hz, 1H), 2.24 (dd, J = 20.8, 8.4 Hz, 3H), 0.92 (s, 9H).	387.25	B	B
I-1588		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.59 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 - 7.32 (m, 2H), 7.27 (ddt, J = 15.8, 7.5, 1.5 Hz, 2H), 4.38 (dd, J = 11.2, 8.7 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.64 (dt, J = 11.9, 9.1 Hz, 2H), 2.26 - 2.17 (m, 2H), 2.12 (ddd, J = 12.7, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 1.72 (s, 1H), 1.60 (s, 1H), 1.47 - 1.32 (m, 4H), 1.18 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 1.04 (ddt, J = 29.2, 20.0, 10.3 Hz, 3H).	402.1	E	
I-1589		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.40 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.77 - 2.59 (m, 2H), 2.37 - 2.10 (m, 2H), 0.97 (d, J = 1.9 Hz, 9H).	416	A	B

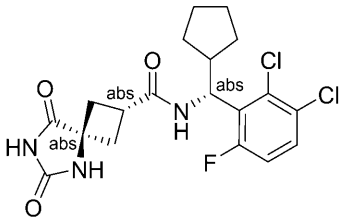
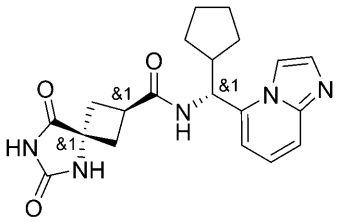
【表１－４１３】

I-1590		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.19 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.27 (m, 2H), 7.23 (dt, J = 7.2, 1.7 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.23 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70 - 2.62 (m, 2H), 2.30 - 2.10 (m, 2H), 1.29 (dq, J = 15.0, 7.6 Hz, 1H), 1.16 (dq, J = 14.6, 7.4 Hz, 1H), 0.87 - 0.69 (m, 9H).	378.2	B	C
I-1591		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.36 - 7.22 (m, 3H), 4.53 (dd, J = 11.8, 8.6 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.63 (td, J = 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.30 (s, 1H), 2.27 - 2.07 (m, 4H), 1.49 (dd, J = 21.6, 11.2 Hz, 2H), 1.35 - 1.26 (m, 3H), 1.25 (s, 1H), 1.22 (s, 1H), 0.61 (dd, J = 12.3, 5.1 Hz, 1H).	402.1	E	

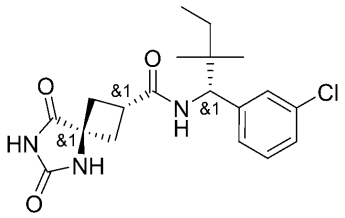
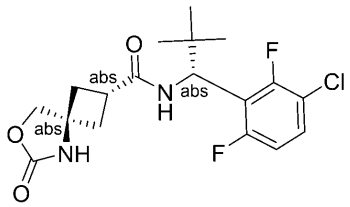
【表１－４１４】

I-1592		(400 MHz, DMSO-d6) 10.51 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.05 (dd, J = 11.0, 7.2 Hz, 1H), 3.15 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (dd, J = 12.1, 9.0 Hz, 1H), 2.59- 2.54 (m, 1H), 2.22- 2.12 (m, 2H), 1.96- 1.90 (m, 1H), 1.68 - 1.43 (m, 5H), 1.31 - 1.24 (m, 2H), 1.14- 1.06 (m, 1H).	428.25	A	A
I-1593		(400 MHz, DMSO-d6) 10.43 (s, 1H), 8.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.36 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.33 - 7.18 (m, 3H), 4.53 (dd, J = 9.9, 8.4 Hz, 1H), 2.89 (dd, J = 10.3, 8.1 Hz, 1H), 2.21 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 2.03 (ddd, J = 11.5, 7.9, 3.7 Hz, 1H), 1.93 (tp, J = 12.8, 4.7, 4.1 Hz, 2H), 1.84 - 1.63 (m, 4H), 1.61 - 1.51 (m, 2H), 1.51 - 1.37 (m, 2H), 1.31 - 1.19 (m, 2H), 1.07 (dq, J = 12.2, 8.1 Hz, 1H).	390.1	E	

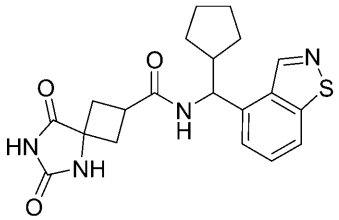
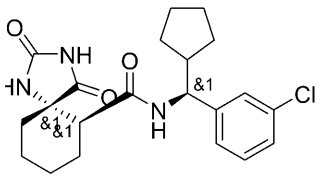
【表１－４１５】

I-1594		(400 MHz, DMSO-d6) 10.52 (m,1H), 8.60 (s, 1H), 8.43 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.06 (s, 1H), 3.15 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.68 - 2.55 (m, 2H), 2.18 (dd, J = 23.7, 10.8 Hz, 2H), 1.94 (d, J = 16.9 Hz, 1H), 1.68 - 1.42 (m, 5H), 1.26 (d, J = 19.7 Hz, 2H), 1.18- 1.06 (m, 1H).	428.25	D	
I-1595		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.39 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.62 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 9.0, 7.0 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 5.08 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.11 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.76 - 2.59 (m, 3H), 2.24 (ddd, J = 12.4, 9.0, 4.2 Hz, 1H), 2.13 (ddd, J = 12.6, 9.0, 4.2 Hz, 1H), 1.77 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 1.64 - 1.41 (m, 6H), 1.23 - 1.10 (m, 1H).	382.15	E	

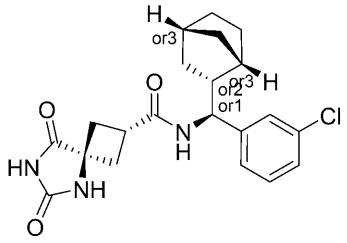
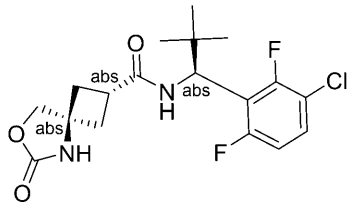
【表１－４１６】

I-1596		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.19 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35-7.26 (m, 2H), 7.23 (dt, J = 7.2, 1.7 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.24 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (dt, J = 12.0, 8.5 Hz, 2H), 2.26 (ddd, J = 12.4, 9.0, 4.2 Hz, 1H), 2.15 (ddd, J = 12.9, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 1.29 (dq, J = 15.0, 7.5 Hz, 1H), 1.15 (ddd, J = 10.2, 7.3, 3.3 Hz, 1H), 0.84 -0.77 (m, 6H), 0.75 (s, 3H).	378.25	E	
I-1597		(400 MHz, DMSO-d6) 8.17 - 8.04 (m, 2H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 4.34 (s, 2H), 2.90 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.35 (t, J = 10.3 Hz, 1H), 2.24 (dd, J = 20.0, 7.6 Hz, 3H), 0.92 (s, 9H).	387.25	E	

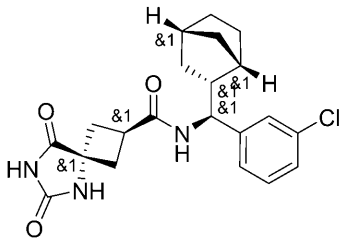
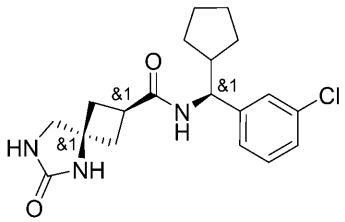
【表１－４１７】

I-1598		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 9.42 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 8.70 - 8.48 (m, 1H), 8.33 - 8.16 (m, 1H), 8.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.59 (q, J = 8.8, 7.8 Hz, 1H), 7.46 (dt, J = 22.2, 7.5 Hz, 1H), 5.22 (dt, J = 55.5, 9.7 Hz, 1H), 4.15 - 3.96 (m, 1H), 3.09 (p, J = 9.1, 8.3 Hz, 1H), 2.78 - 2.65 (m, 1H), 2.47 - 2.28 (m, 2H), 2.28 - 2.01 (m, 2H), 1.83 (d, J = 11.8 Hz, 1H), 1.54 (m, 5H), 1.40 (d, J = 21.9 Hz, 2H), 1.24 (m, 2H), 1.16 - 1.00 (m, 1H), 0.88 (t, J = 7.4 Hz, 1H).	399	D	
I-1599		(400 MHz, DMSO-d6) 10.41 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.11 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.36 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.33 - 7.27 (m, 1H), 7.24 (dt, J = 6.9, 1.8 Hz, 2H), 4.43 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.57 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 2.09 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 1.73 (dd, J = 12.3, 7.5 Hz, 1H), 1.68 - 1.35 (m, 10H), 1.31 - 1.13 (m, 3H), 1.12 - 1.00 (m, 1H).	404.1	E	

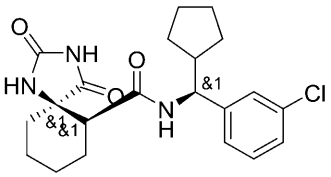
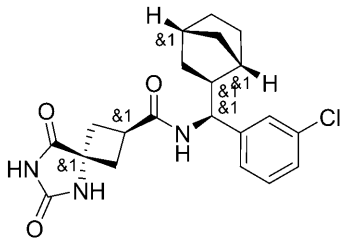
【表１－４１８】

I-1600		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.31 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.39 - 7.20 (m, 4H), 4.37 (dd, J = 11.3, 8.6 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.61 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.4, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 2.18 - 2.06 (m, 3H), 1.81 (dt, J = 12.6, 6.9 Hz, 1H), 1.58 - 1.43 (m, 1H), 1.40 (d, J = 10.7 Hz, 2H), 1.20 (dd, J = 21.0, 10.9 Hz, 1H), 1.07 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 0.90 (s, 2H).	402.15	A	B
I-1601		(400 MHz, DMSO-d6) 8.23 - 8.07 (m, 2H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 5.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.29 - 4.18 (m, 2H), 3.07 (tt, J = 9.6, 4.8 Hz, 1H), 2.44 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 2.41 - 2.32 (m, 1H), 2.28 (d, J = 12.4 Hz, 1H), 2.18 (d, J = 12.3 Hz, 1H), 0.93 (s, 9H).	387.2	A	B

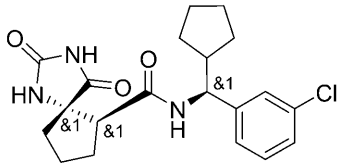
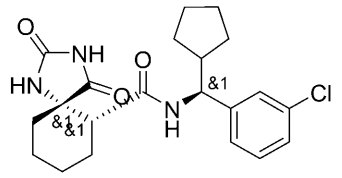
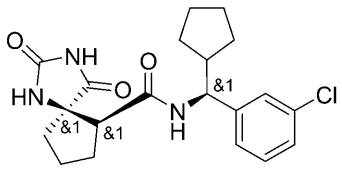
【表１－４１９】

I-1602		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.39 - 7.31 (m, 2H), 7.31 - 7.24 (m, 2H), 4.61 (dd, J = 11.7, 8.4 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.67 - 2.57 (m, 1H), 2.21 (d, J = 12.3 Hz, 1H), 2.18 (s, 2H), 2.16 - 2.05 (m, 1H), 1.75 (s, 1H), 1.62 (s, 1H), 1.56 (s, 1H), 1.49 (s, 1H), 1.29 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 1.19 (d, J = 9.2 Hz, 4H), 0.79 (d, J = 12.3 Hz, 1H).	402.1	D	
I-1603		(400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 - 7.30 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 8.8, 7.4, 1.5 Hz, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.05 (s, 1H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.24 (dd, J = 2.6, 1.1 Hz, 2H), 2.86 (tt, J = 9.4, 5.4 Hz, 1H), 2.35 (dd, J = 11.7, 9.5 Hz, 1H), 2.30 - 2.09 (m, 4H), 1.76 - 1.65 (m, 1H), 1.63 - 1.37 (m, 4H), 1.26 (ddd, J = 16.5, 8.9, 3.7 Hz, 2H), 1.14 - 1.03 (m, 1H).	362.15	B	C

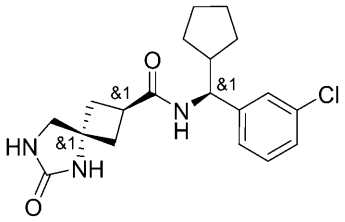
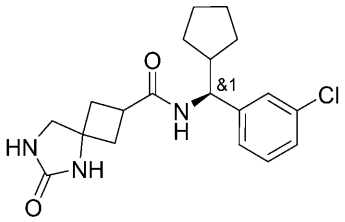
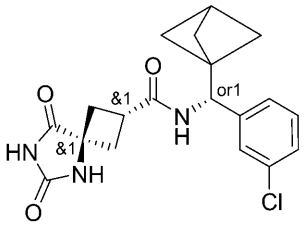
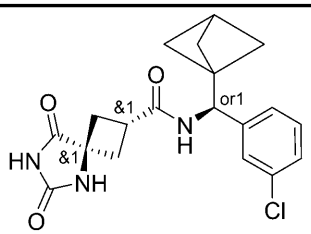
【表１－４２０】

I-1604		(400 MHz, DMSO-d6) 10.08 (s, 1H), 8.29 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.39 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.22 (m, 3H), 4.58 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.53 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 2.45 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 2.22 - 2.04 (m, 2H), 1.97 - 1.74 (m, 2H), 1.74 - 1.58 (m, 2H), 1.53 (d, J = 15.0 Hz, 3H), 1.49 - 1.34 (m, 3H), 1.25 (q, J = 12.0, 9.5 Hz, 3H), 1.16 - 0.98 (m, 1H).	404.05	E	
I-1605		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.31 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.35 - 7.27 (m, 1H), 7.30 - 7.21 (m, 2H), 4.37 (dd, J = 11.3, 8.6 Hz, 1H), 3.10 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73 - 2.58 (m, 2H), 2.23 (ddd, J = 12.4, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 2.15 (s, 3H), 2.15 - 2.06 (m, 1H), 1.82 (dt, J = 12.7, 6.9 Hz, 1H), 1.58 - 1.36 (m, 2H), 1.19 (t, J = 10.7 Hz, 1H), 1.07 (d, J = 9.7 Hz, 2H), 0.90 (s, 2H).	402.1	E	

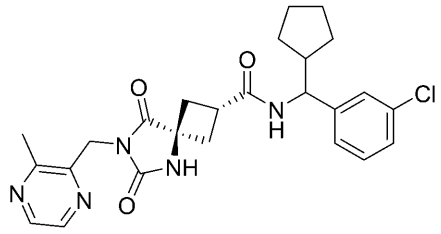
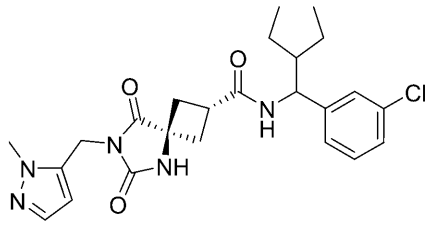
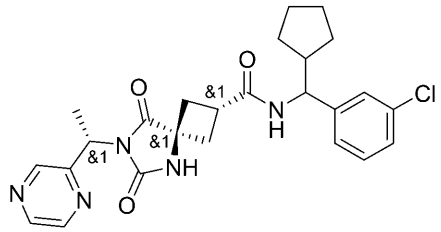
【表１－４２１】

I-1606		(400 MHz, DMSO-d6) 10.20 (s, 1H), 8.11 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.39 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.36 - 7.30 (m, 1H), 7.26 (tt, J = 7.3, 1.5 Hz, 2H), 4.52 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.83 (dt, J = 27.5, 13.8 Hz, 1H), 2.18 (q, J = 8.2 Hz, 2H), 2.11 - 1.97 (m, 1H), 1.94 - 1.80 (m, 2H), 1.78 - 1.66 (m, 3H), 1.56 (s,2H), 1.45 (dt, J = 11.7, 7.5 Hz, 2H), 1.31 - 1.18 (m, 2H), 1.06 (dq, J = 15.7, 8.0 Hz, 1H).	390.1	E	
I-1607		(400 MHz, DMSO-d6) 10.23 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.97 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50 - 6.99 (m, 4H), 4.51 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.61 - 2.55 (m, 1H), 2.17 (hept, J = 7.9, 7.5 Hz, 1H), 1.94 (d, J = 12.7 Hz, 1H), 1.77 - 1.63 (m, 3H), 1.60 - 1.38 (m, 8H), 1.36 - 1.14 (m, 3H), 1.11 - 0.88 (m, 1H).	404.1	E	
I-1608		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.50 - 7.08 (m, 4H), 4.46 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.94 (dd, J = 9.5, 8.0 Hz, 1H), 2.12 (h, J = 8.4 Hz, 1H), 2.01 - 1.86 (m, 2H), 1.84 - 1.63 (m, 5H), 1.59 - 1.50 (m, 2H), 1.50 - 1.34 (m, 2H), 1.21 (dt, J = 12.0, 7.5 Hz, 2H), 1.06 (dt, J = 12.6, 7.9 Hz, 1H).	390.05	E	

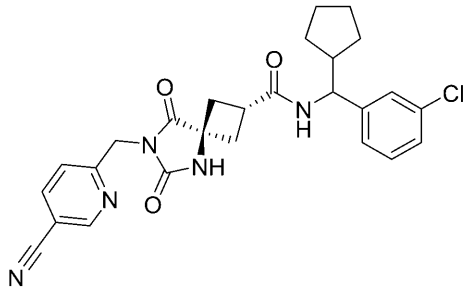
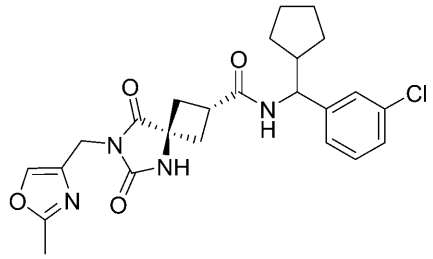
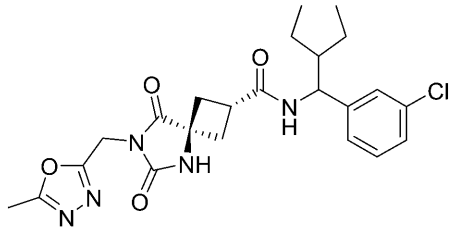
【表１－４２２】

I-1609		(400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.39 - 7.29 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 10.3, 7.6, 1.4 Hz, 2H), 6.71 (s, 1H), 6.16 (s, 1H), 4.56 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.35 (s, 2H), 2.73 - 2.60 (m, 1H), 2.30 -2.03 (m, 5H), 1.68 (dd, J = 12.1, 7.4 Hz, 1H), 1.49 (dddd, J = 34.8, 15.4, 7.9, 4.2 Hz, 4H), 1.30 - 1.21 (m, 2H), 1.15 - 1.03 (m, 1H).	362.2	D	
I-1610		(400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.41 -7.20 (m, 4H), 6.77 (d, J = 48.7 Hz, 1H), 6.17 (s, 1H), 4.56 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.35 (s, 1H), 3.29- 3.19 (m, 1H), 2.94 - 2.60 (m, 1H), 2.43 - 2.02 (m, 5H), 1.70 (td, J = 8.0, 4.2 Hz, 1H), 1.59 - 1.37 (m, 4H), 1.25 (td, J = 8.2, 4.5 Hz, 2H), 1.08 (p, J = 8.1 Hz, 1H).	362.15	C	
I-1611				E	
I-1612				B	

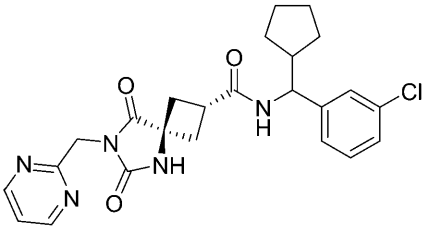
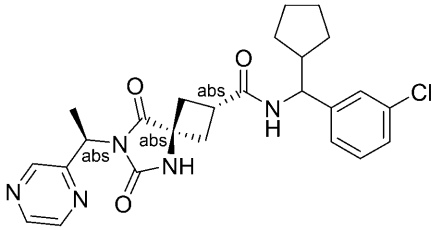
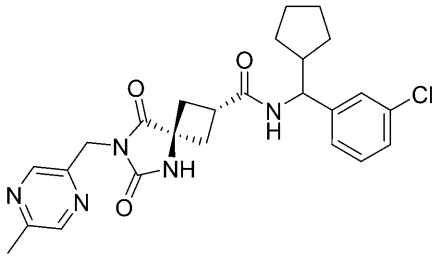
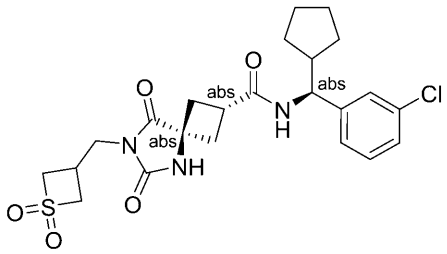
【表１－４２３】

I-1613			482.4	D	
I-1614		(400 MHz, メタノール-d4) - 7.36 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 7.35 - 7.15 (m, 3H), 6.23 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.68 (s, 2H), 4.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.21 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.89 (dt, J = 13.4, 6.8 Hz, 2H), 2.58 - 2.26 (m, 3H), 1.93 - 1.80 (m, 1H), 1.80 - 1.48 (m, 4H), 1.48 - 1.34 (m, 2H), 1.23 - 1.05 (m, 1H).	470.2	C	
I-1615		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.66 (s, 1H), 8.54 (dd, J = 7.2, 2.3 Hz, 2H), 8.30 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.35 - 7.28 (m, 1H), 7.26 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 5.34 - 5.18 (m, 1H), 4.56 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.71 (s, 1H), 3.41 (dd, J = 10.8, 2.1 Hz, 1H), 3.23 - 3.06 (m, 1H), 2.64 (d, J = 30.0 Hz, 3H), 2.29 (s, 1H), 2.26 - 2.05 (m, 2H), 1.81 - 1.65 (m, 3H), 1.66 - 1.36 (m, 4H), 1.25 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 1.19 - 0.99 (m, 1H).	482.2	D	

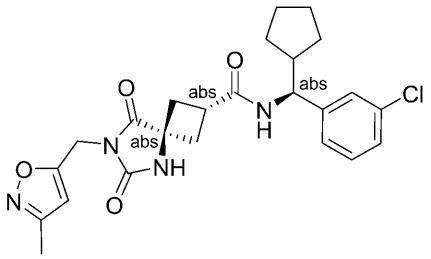
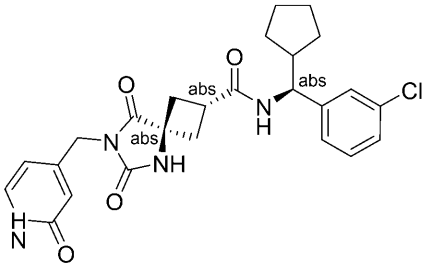
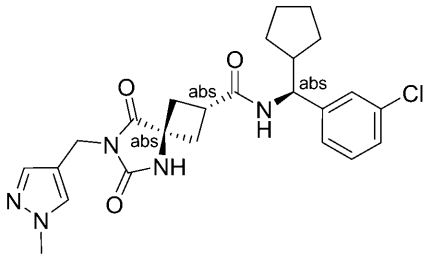
【表１－４２４】

I-1616			492	D	
I-1617		(400 MHz, メタノール-d4) - 7.68 (s, 1H), 7.35 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.34 - 7.21 (m, 3H), 4.61 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 4.50 (s, 2H), 3.22 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.91 (dt, J = 14.8, 7.7 Hz, 2H), 2.46 (ddt, J = 14.9, 9.5, 4.5 Hz, 1H), 2.40 (s, 3H), 2.39 - 2.19 (m, 2H), 1.96 - 1.82 (m, 1H), 1.77 - 1.48 (m, 4H), 1.48 - 1.35 (m, 2H), 1.15 (dq, J = 16.0, 8.3 Hz, 1H).	471.2	D	
I-1618		(400 MHz, メタノール-d4) - 7.35 (s, 1H), 7.34 - 7.10 (m, 3H), 4.84 (s, 2H), 4.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.23 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 3.02 - 2.83 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.48 - 2.36 (m, 1H), 2.30 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 1.93 - 1.81 (m, 1H), 1.78 - 1.46 (m, 4H), 1.46 - 1.30 (m, 2H), 1.15 (dt, J = 12.9, 7.5 Hz, 1H).	472.2	D	

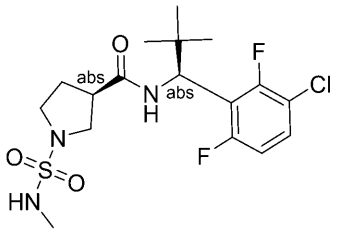
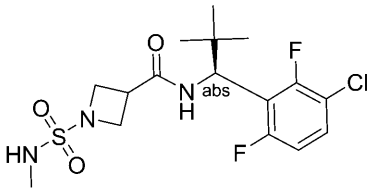
【表１－４２５】

I-1619			468.2	D	
I-1620			482.2	D	
I-1621		(400 MHz, メタノール-d4) - 8.47 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.33 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.24 (dq, J = 7.0, 1.9 Hz, 2H), 4.78 (s, 2H), 4.57 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.22 (q, J = 8.8 Hz, 1H), 2.72 - 2.55 (m, 3H), 2.54 (s, 4H), 2.32 - 2.18 (m, 1H), 1.94 - 1.82 (m, 1H), 1.75 - 1.47 (m, 4H), 1.45 - 1.29 (m, 2H), 1.13 (dd, J = 12.8, 8.1 Hz, 1H).	482.4	D	
I-1622			494.2	D	

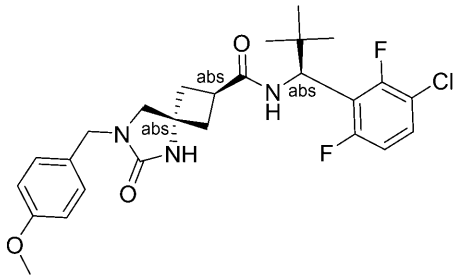
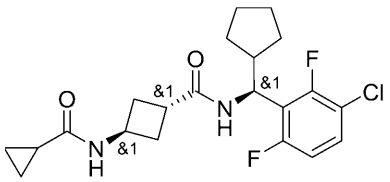
【表１－４２６】

I-1623			471.2	C	
I-1624			483.2	C	
I-1625		(400 MHz, メタノール-d4) 7.57 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.35 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.33 - 7.22 (m, 3H), 4.61 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 4.46 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.20 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.87 (dt, J = 13.3, 7.1 Hz, 2H), 2.48 - 2.27 (m, 3H), 1.92 - 1.83 (m, 1H), 1.78 - 1.47 (m, 4H), 1.41 (t, J = 10.3 Hz, 2H), 1.15 (dd, J = 13.1, 7.6 Hz, 1H).	470.2	C	

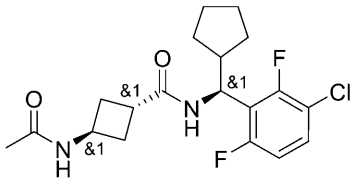
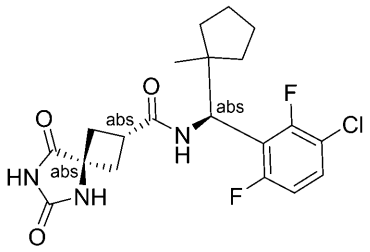
【表１－４２７】

I-1626		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.98 (br. s, 1H), 5.09 (br. d, J = 6.2 Hz, 1H), 3.34 (埋没した m, 1H), 3.27 - 3.11 (m, 3H), 3.08 - 2.96 (m, 1H), 2.44 (s, 3H), 2.13 - 2.05 (m, 1H), 2.01 - 1.91 (m, 1H), 0.94 (s, 9H).	424.2	B	
I-1627		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.32 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 1H), 7.08 (q, J = 4.8 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.80 (app. d, J = 7.7 Hz, 2H), 3.77 - 3.68 (m, 2H), 3.53 - 3.44 (m, 1H), 2.54 (d, J = 4.9 Hz, 3H), 0.93 (s, 9H).	410.3	C	

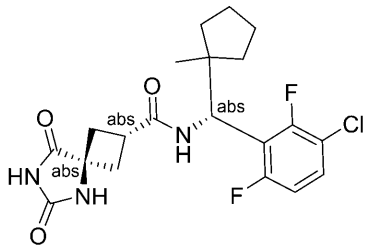
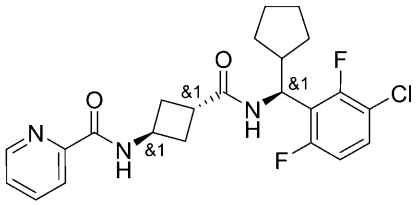
【表１－４２８】

I-1628		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 88.5, 5.6 Hz 1H), 7.15 - 7.05 (m, 3H), 7.04 (s, 1H), 690 - 6.85 (m, 2H), 5.07 - 5.01 (m, 1H), 4.11 (AB の d A, JAB = 15.1 Hz, 1H), 4.06 (AB の d B, JAB = 14.9 Hz, 1H), 3.73 (s, 1H, 3H), 3.16 - 3.06 (m, 2H), 3.02 (ddt, J = 13.6, 9.4, 4.5 Hz, 1H), 2.36 (app. t, J = 10.7 Hz, 1H), 2.28 (app. t, J = 10.9 Hz, 1H), 2.16 - 2.10 (m, 1H), 2.05 (br. d, J = 11.4 Hz, 1H), 0.89 (s, 9H). 6% の副生成物。	506.4	A	B
I-1629		(400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.26 (h, J = 7.9 Hz, 1H), 2.99 - 2.89 (m, 1H), 2.41 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.28 (tt, J = 7.9, 4.0 Hz, 1H), 2.19 - 1.96 (m, 3H), 1.89 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 1.66 (s, 2H), 1.64 - 1.22 (m, 5H), 1.01 (dd, J = 12.4, 7.7 Hz, 1H), 0.61 (dq, J = 6.2, 2.3, 1.6 Hz, 4H).	411.15	B	C

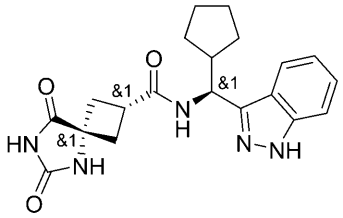
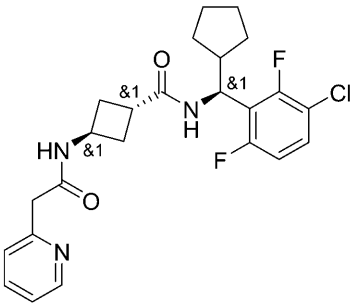
【表１－４２９】

I-1630		(400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.22 (h, J = 7.8 Hz, 1H), 2.97 - 2.88 (m, 1H), 2.41 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.27 (td, J = 8.0, 4.1 Hz, 1H), 2.17 - 1.99 (m, 3H), 1.99 - 1.83 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.60 (s, 1H), 1.59 (s, 2H), 1.57 - 1.43 (m, 1H), 1.40 - 1.20 (m, 2H), 1.01 (t, J = 10.3 Hz, 1H).	385.1	B	D
I-1631		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.25 - 7.05 (m, 1H), 5.21 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.28 - 3.17 (m, 1H), 2.74 - 2.55 (m, 2H), 2.31 - 2.13 (m, 2H), 1.67 - 1.54 (m, 5H), 1.50 (dd, J = 11.9, 7.3 Hz, 1H), 1.36 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 1.22 (dd, J = 11.9, 5.6 Hz, 1H), 0.96 (s, 3H).	426.05	A	A

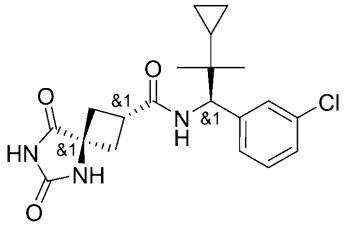
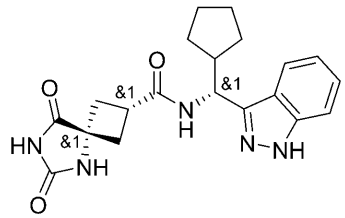
【表１－４３０】

I-1632		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.19 - 7.10 (m, 1H), 5.21 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.25 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.72 - 2.55 (m, 2H), 2.22 (dddd, J = 25.3, 12.7, 9.1, 4.1 Hz, 2H), 1.65 - 1.58 (m, 5H), 1.50 (dd, J = 12.2, 7.2 Hz, 1H), 1.36 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.26 - 1.17 (m, 1H), 0.96 (s, 3H).	426.05	D	
I-1633		(400 MHz, DMSO-d6) 8.97 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.64 (dt, J = 4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.04 - 7.94 (m, 2H), 7.64 - 7.49 (m, 2H), 7.14 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.88 (dd, J = 11.2, 7.5 Hz, 1H), 4.56 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 3.02 - 2.93 (m, 1H), 2.38 (dq, J = 29.2, 9.9 Hz, 4H), 2.17 (td, J = 8.1, 4.1 Hz, 1H), 1.91 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 1.62 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 1.61 - 1.44 (m, 2H), 1.41 - 1.23 (m, 2H), 1.02 (s, 1H).	448.15	B	C

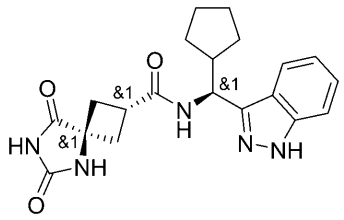
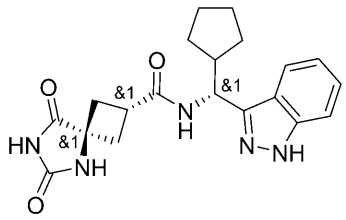
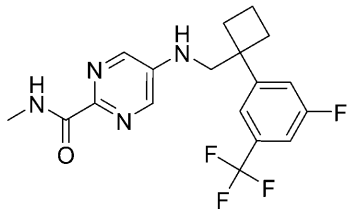
【表１－４３１】

I-1634		(400 MHz, DMSO-d6) 12.74 (s, 1H), 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.31 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.06 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 5.14 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.14 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.72 (d, J = 10.8 Hz, 2H), 2.64 (t, J = 10.7 Hz, 1H), 2.21 (s, 1H), 2.10 (s, 1H), 1.80 (s, 1H), 1.58 (s, 2H), 1.56 - 1.43 (m, 3H), 1.38 (d, J = 10.9 Hz, 1H), 1.24 (s, 1H), 1.16 (s, 2H).	382.3	E	
I-1635		(400 MHz, DMSO-d6) 8.46 (dd, J = 5.0, 1.9 Hz, 1H), 8.36 (dd, J = 11.4, 7.5 Hz, 2H), 7.71 (td, J = 7.7, 1.9 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 7.6, 4.9 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.24 (h, J = 7.9 Hz, 1H), 3.55 (s, 2H), 2.96 (td, J = 9.6, 8.9, 4.2 Hz, 1H), 2.44 - 2.35 (m, 1H), 2.29 (ddt, J = 11.7, 7.8, 3.7 Hz, 1H), 2.14 (dt, J = 13.7, 8.7 Hz, 2H), 2.09 - 1.98 (m, 1H), 1.90 (dt, J = 13.1, 5.8 Hz, 1H), 1.68 - 1.41 (m, 4H), 1.40 - 1.20 (m, 2H), 1.00 (dd, J = 12.6, 7.7 Hz, 1H).	462.2	B	B

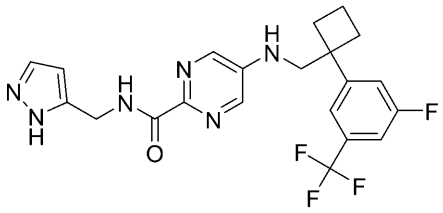
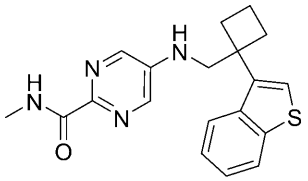
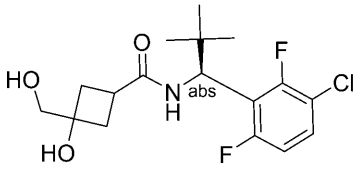
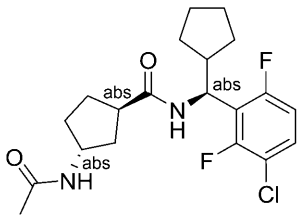
【表１－４３２】

I-1636		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.20 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.36 - 7.24 (m, 3H), 4.87 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 3.24 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69 (ddd, J = 12.1, 9.1, 5.3 Hz, 2H), 2.28 (ddd, J = 12.6, 9.1, 4.3 Hz, 1H), 2.16 (ddd, J = 12.8, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 0.66 (d, J = 25.2 Hz, 7H), 0.19 (ddq, J = 19.8, 9.2, 4.9, 4.2 Hz, 2H), 0.14- 0.01 (m, 2H).	390.15	E	
I-1637		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.63 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.73 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.20 (dd, J = 8.6, 6.5 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 8.4, 6.5 Hz, 1H), 5.12 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 4.76 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 3.03 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.41 (d, J = 8.9 Hz, 4H), 2.19 - 2.00 (m, 4H), 1.93 (q, J = 6.9, 6.3 Hz, 2H), 1.68 (s, 2H).	382.3	E	

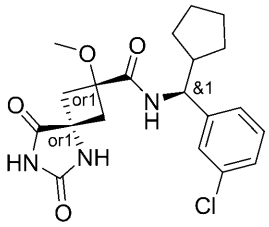
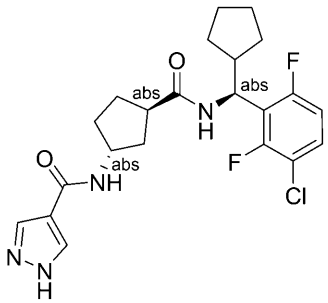
【表１－４３３】

I-1638		(400 MHz, DMSO-d6) 12.74 (s, 1H), 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.31 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.06 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 5.14 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.15 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72 (d, J = 10.9 Hz, 1H), 2.63 (d, J = 10.8 Hz, 2H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.10 (m, 1H), 1.80 (m, 1H), 1.71 - 1.33 (m, 6H), 1.24 (m, 1H), 1.17 (m, 2H), 0.85 (d, J = 7.3 Hz, 1H).	382.3	E	
I-1639		(400 MHz, DMSO-d6) 10.47 (s, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.50 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 7.74 (dt, J = 8.4, 1.1 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 8.7, 1.0 Hz, 1H), 7.20 (ddd, J = 8.7, 6.6, 1.1 Hz, 1H), 7.00 (ddd, J = 8.4, 6.6, 0.9 Hz, 1H), 5.13 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 4.77 (d, J = 5.5 Hz, 2H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.76 - 2.66 (m, 2H), 2.25 - 1.99 (m, 6H), 1.98 - 1.86 (m, 2H), 1.68 (q, J = 5.5, 4.6 Hz, 2H).	382.3	E	
I-1640				D	

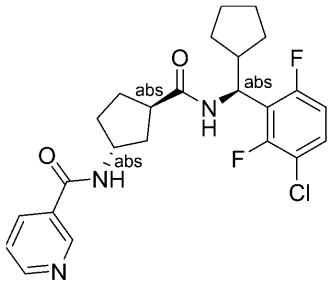
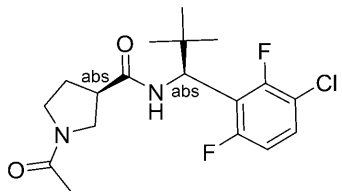
【表１－４３４】

I-1641				C	
I-1642				D	
I-1643				D	
I-1644		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.36 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 7.78 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 7.57 - 7.48 (m, 1H), 7.17 - 7.07 (m, 1H), 4.81 (dt, J = 10.0, 8.1 Hz, 1H), 4.06 - 3.94 (m, 1H), 2.87 - 2.75 (m, 1H), 2.45 - 2.35 (m, 1H), 1.96 - 1.71 (m, 7H), 1.66 - 1.41 (m, 6H), 1.39 - 1.20 (m, 3H), 1.06 - 0.93 (m, 1H).	399.4	A	B

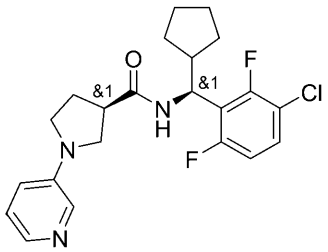
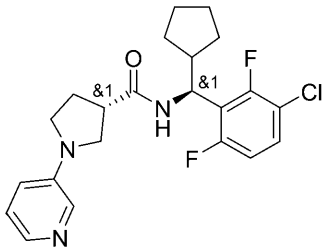
【表１－４３５】

I-1645		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 10.45 (br. s, 1H), 8.48 (dd, J = 8.4, 3.2 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.33 - 7.23 (m, 3H), 4.56 - 4.49 (m, 1H), 2.98 - 2.95 (m, 3H), 2.95 - 2.82 (m, 2H), 2.34 - 2.26 (m, 2H), 2.24 - 2.17 (m, 1H), 1.83 - 1.73 (m, 1H), 1.64 - 1.37 (m, 4H), 1.35 - 1.18 (m, 2H), 1.15 - 1.03 (m, 1H). 示された立体化学は任意である。	406.4	E	
I-1646		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 13.06 (br. s, 1H), 8.37 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.15 (br. s, 1H), 7.88 (br. s, 1H), 7.79 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.7, 1.5 Hz, 1H), 4.82 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.24 - 4.15 (m, 1H), 2.87 (app. p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.47 - 2.36 (m, 1H), 1.97 - 1.78 (m, 4H), 1.73 (ddd, J = 13.0, 8.9, 6.0 Hz, 1H), 1.66 - 1.42 (m, 6H), 1.37 - 1.21 (m, 2H), 1.05 - 0.93 (m, 1H).	451.4	A	B

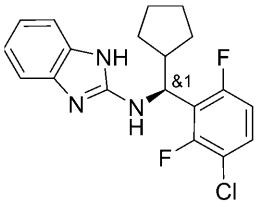
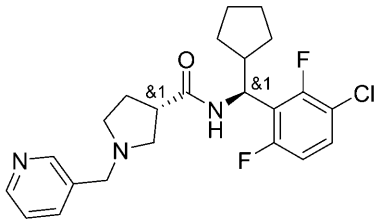
【表１－４３６】

I-1647		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.98 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.18 - 8.15 (m, 1H), 7.56 - 7.46 (m, 2H), 7.12 (td, J = 9.6, 1.2 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.0, 7.7 Hz, 1H), 4.32 - 4.23 (m, 1H), 2.95 - 2.85 (m, 1H), 2.47 - 2.36 (m, 1H), 2.03 - 1.75 (m, 5H), 1.67 - 1.43 (m, 6H), 1.39 - 1.22 (m, 2H), 1.06 - 0.95 (m, 1H). 未同定の脂肪族不純物を含有。部分的に塩の可能性。	462.4	B	B
I-1648		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.34 (d, J = 8.9 Hz, 0.5H), 8.30 (d, J = 8.9 Hz, 0.5H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.6, Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 8.9 Hz, 0.5H), 5.09 (埋没した m, 0.5H), 3.57 - 3.36 (m, 3H), 3.27 - 3.07 (m, 2H), 2.15 - 2.02 (m, 1H), 2.00 - 1.93 (m, 0.5H), 1.89 (重複する s, 1.5H), 1.86 (重複する s, 1.5H), 1.86 (埋没した m, 0.5H), 0.94 (s, 9H). 1:1 混合物の 2 つの回転異性体。	373.2	D	

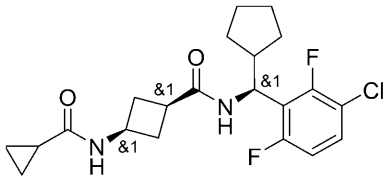
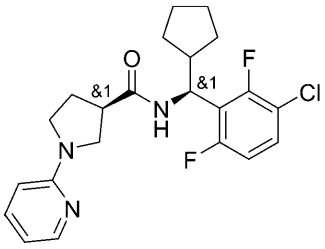
【表１－４３７】

I-1649		(400 MHz, メタノール-d4) 7.92 - 7.77 (m, 2H), 7.43 (ddd, J = 9.0, 8.3, 5.5 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 8.5, 4.7 Hz, 1H), 7.06 - 6.96 (m, 2H), 5.03 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 3.57 (dd, J = 9.4, 8.0 Hz, 1H), 3.48 - 3.45 (m, 1H), 3.44- 3.35 (m, 2H), 3.25 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.56 (dt, J = 18.9, 8.3 Hz, 1H), 2.24 (dtd, J = 12.0, 7.3, 4.6 Hz, 1H), 2.15 - 1.97 (m, 2H), 1.81 - 1.52 (m, 4H), 1.51-1.29 (m, 2H), 1.16 (dq, J = 11.5, 7.9 Hz, 1H).	420.05	D	
I-1650		(400 MHz, メタノール-d4) 7.84 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 7.80 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 7.42 (ddd, J = 9.0, 8.3, 5.6 Hz, 1H), 7.21 (ddd, J = 8.4, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.03- 6.94 (m, 2H), 5.04 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 3.51 - 3.37 (m, 3H), 3.27 - 3.22 (m, 1H), 2.61- 2.54 (m, 1H), 2.37- 2.21 (m, 2H), 2.06- 2.00 (m, 1H), 1.79 - 1.54 (m, 4H), 1.50 - 1.36 (m, 2H), 1.31 (s, 1H), 1.16 (dd, J = 12.6, 7.9 Hz, 1H).	420.35	B	

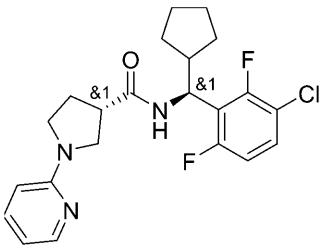
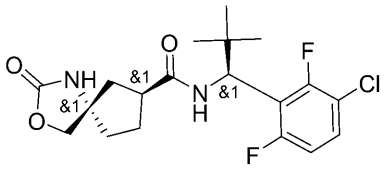
【表１－４３８】

I-1651		(400 MHz, DMSO-d6) 10.31 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.09 (m, 3H), 7.07 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.84 (s, 2H), 5.13 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 2.51 (s, 1H), 1.96 - 1.88 (m, 1H), 1.64 (s, 2H), 1.57 (dt, J = 15.2, 8.1 Hz, 2H), 1.44 (td, J = 12.5, 6.6 Hz, 2H), 1.17 - 1.09 (m, 1H).	362.05	C	
I-1652		(400 MHz, メタノール-d4) 8.52 (dd, J = 2.3, 0.8 Hz, 1H), 8.46 (dd, J = 4.9, 1.6 Hz, 1H), 7.84 (dt, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.45 - 7.38 (m, 2H), 6.98 (td, J = 9.4, 1.8 Hz, 1H), 4.99 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 3.76- 3.63 (m, 2H), 3.00 (dd, J = 11.4, 6.1 Hz, 1H), 2.78 (dd, J = 9.5, 7.8 Hz, 1H), 2.67 (q, J = 7.8 Hz, 2H), 2.57- 2.50 (m, 2H), 2.14 - 2.08 (m, 1H), 2.00 - 1.95 (m, 1H), 1.90 - 1.85 (m, 1H), 1.74 - 1.54 (m, 4H), 1.45 - 1.40 (m, 1H), 1.35 - 1.31 (m, 1H), 1.16 (d, J = 8.8 Hz, 1H).	434.3	B	D

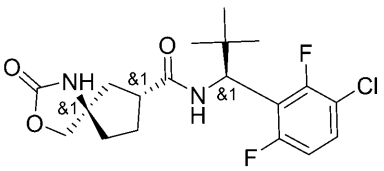
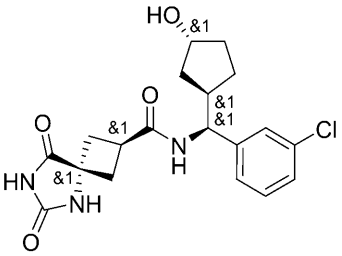
【表１－４３９】

I-1653		(400 MHz, DMSO-d6) 8.32 (dd, J = 13.7, 7.8 Hz, 2H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.09 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.78 - 2.69 (m, 1H), 2.44 - 2.35 (m, 2H), 2.32 - 2.15 (m, 1H), 1.99 (q, J = 9.9 Hz, 2H), 1.87 (q, J = 9.9 Hz, 5H), 1.64 - 1.47 (m, 1H), 1.45 (tt, J = 7.0, 5.1 Hz, 1H), 1.40 - 1.18 (m, 1H), 1.07 - 0.95 (m, 1H), 0.60 (ddd, J = 7.8, 3.8, 2.3 Hz, 4H).	411.3	C	
I-1654		(400 MHz, メタノール-d4) 7.99 (ddd, J = 5.3, 1.9, 0.8 Hz, 1H), 7.57 (ddd, J = 8.8, 7.1, 1.9 Hz, 1H), 7.43 (ddd, J = 9.0, 8.3, 5.5 Hz, 1H), 7.00 (td, J = 9.3, 1.8 Hz, 1H), 6.62 (ddd, J = 7.1, 5.2, 0.9 Hz, 1H), 6.56 (dt, J = 8.6, 1.0 Hz, 1H), 5.03 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 3.73 (dd, J = 10.2, 7.9 Hz, 1H), 3.60 - 3.50 (m, 2H), 3.43 (dt, J = 9.9, 7.5 Hz, 1H), 3.28 - 3.19 (m, 1H), 2.57 (h, J = 7.9 Hz, 1H), 2.22 (dtd, J = 11.9, 7.2, 4.6 Hz, 1H), 2.15 - 1.97 (m, 2H), 1.79 -1.53 (m, 4H), 1.51 - 1.32 (m, 2H), 1.23- 1.10 (m, 1H).	420.3	D	

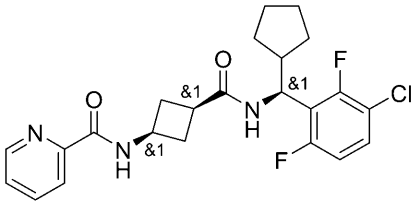
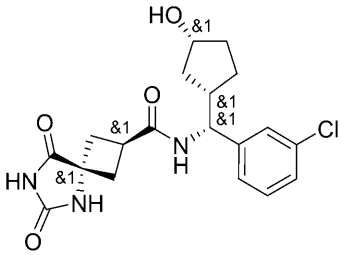
【表１－４４０】

I-1655		(400 MHz, DMSO-d6) 8.62 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.45 (ddd, J = 8.6, 6.2, 1.7 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.51 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 6.37 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.87 (dd, J = 11.2, 7.4 Hz, 1H), 3.56-3.42 (m, 2H), 3.26 (dd, J = 10.3, 6.8 Hz, 2H), 3.13 (q, J = 7.4 Hz, 1H), 2.45 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 2.18 (h, J = 7.2 Hz, 1H), 2.06 (dt, J = 12.3, 7.8 Hz, 1H), 1.96 (tt, J = 12.5, 5.6 Hz, 1H), 1.66 - 1.46 (m, 4H), 1.39 - 1.24 (m, 2H), 1.02 (dd, J = 12.8, 7.6 Hz, 1H).	420.3	B	C
I-1656		(400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.16 - 4.06 (m, 2H), 2.96 - 2.83 (m, 1H), 1.93 - 1.63 (m, 6H), 0.94 (s, 9H).	401.15	C	

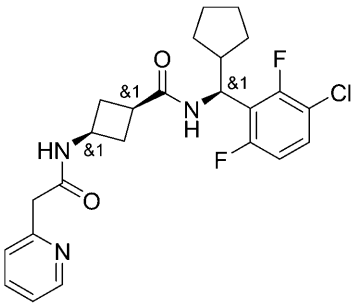
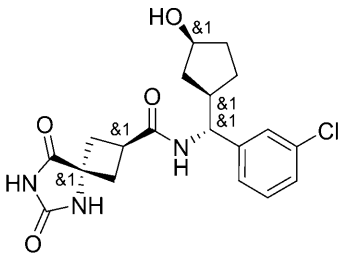
【表１－４４１】

I-1657		(400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.13 (q, J = 8.4 Hz, 2H), 2.96 - 2.84 (m, 1H), 1.98 (dd, J = 12.6, 7.7 Hz, 1H), 1.82 (dd, J = 12.6, 10.1 Hz, 1H), 1.78 - 1.54 (m, 4H), 0.94 (s, 9H).	401.15	B	C
I-1658		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.36 - 7.29 (m, 2H), 7.29 - 7.22 (m, 2H), 4.70 - 4.54 (m, 2H), 4.06 (h, J = 4.9 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.70 -2.60 (m, 2H), 2.28 - 2.07 (m, 3H), 1.89 (ddd, J = 13.9, 8.6, 5.9 Hz, 1H), 1.61 - 1.43 (m, 2H), 1.37 - 1.08 (m, 3H).	392.3	D	

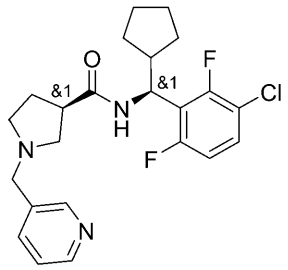
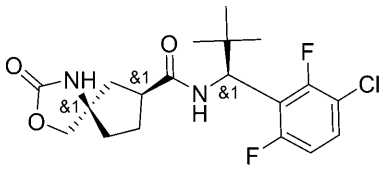
【表１－４４２】

I-1659		(400 MHz, DMSO-d6) 8.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.64 (dt, J = 4.8, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.07 - 7.91 (m, 2H), 7.59 (ddd, J = 6.3, 4.7, 2.8 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.34 (h, J = 8.4 Hz, 1H), 2.88 - 2.72 (m, 1H), 2.46 - 2.28 (m, 3H), 2.19 (dq, J = 35.5, 9.7 Hz, 2H), 1.92 (dq, J = 12.8, 7.1 Hz, 1H), 1.55 (ddt, J = 31.5, 16.6, 8.0 Hz, 4H), 1.42 - 1.20 (m, 2H), 1.02 (q, J = 10.8, 9.3 Hz, 1H).	448.35	C	
I-1660		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.36 -7.29 (m, 2H), 7.29 - 7.20 (m, 2H), 4.68 - 4.56 (m, 2H), 4.05 (p, J = 5.0 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73- 2.59 (m, 2H), 2.31 -2.09 (m, 3H), 1.89 (ddd, J = 13.9, 8.5, 5.9 Hz, 1H), 1.63 - 1.41 (m, 2H), 1.39 -1.18 (m, 3H).	392.25	E	

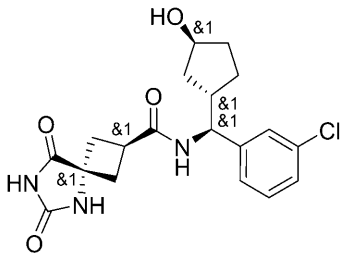
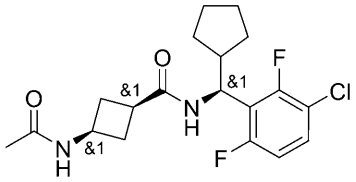
【表１－４４３】

I-1661		(400 MHz, DMSO-d6) 8.45 (ddd, J = 4.9, 1.9, 0.9 Hz, 1H), 8.36 (dd, J = 14.7, 7.6 Hz, 2H), 7.71 (td, J = 7.6, 1.9 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.8, 5.5 Hz, 1H), 7.28 (dt, J = 7.9, 1.1 Hz, 1H), 7.23 (ddd, J = 7.5, 4.9, 1.2 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.14 - 3.97 (m, 1H), 3.53 (s, 2H), 2.82 - 2.65 (m, 1H), 2.41 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 2.32 - 2.15 (m, 2H), 2.01 (q, J = 9.9 Hz, 1H), 1.89 (q, J = 9.8 Hz, 2H), 1.54 (ddt, J = 30.5, 15.9, 7.8 Hz, 4H), 1.35 (dd, J = 12.4, 7.4 Hz, 1H), 1.30 - 1.21 (m, 1H), 1.00 (dd, J = 12.4, 7.9 Hz, 1H).	462.35	C	
I-1662		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.37 - 7.31 (m, 2H), 7.29- 7.23 (m, 2H), 4.64 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.53 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 4.01 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 3.11 (q, J = 9.2 Hz, 1H), 2.64 (dd, J = 10.4, 7.5 Hz, 2H), 2.19 (ddd, J = 33.4, 14.9, 6.4 Hz, 3H), 1.62 (d, J = 5.2 Hz, 2H), 1.58 - 1.42 (m, 3H), 1.12 - 1.03 (m, 1H).	392.25	E	

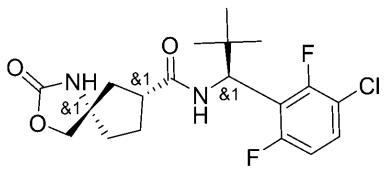
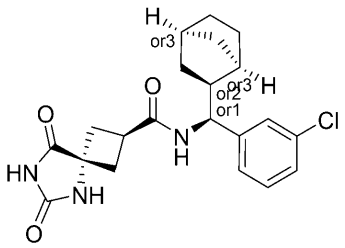
【表１－４４４】

I-1663		(400 MHz, メタノール-d4) 8.60 - 8.43 (m, 2H), 7.89 (dt, J = 7.8, 2.0 Hz, 1H), 7.51 - 7.37 (m, 2H), 6.99 (td, J = 9.3, 1.8 Hz, 1H), 4.99 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 3.82 (d, J = 2.6 Hz, 2H), 3.05 (ddt, J = 9.9, 7.5, 5.7 Hz, 1H), 2.95 (dd, J = 9.7, 7.8 Hz, 1H), 2.84 - 2.65 (m, 3H), 2.52 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 2.12 (dddd, J = 13.0, 9.9, 7.9, 6.7 Hz, 1H), 1.90 (dddd, J = 13.3, 10.9, 8.9, 5.2 Hz, 2H), 1.78 -1.51 (m, 4H), 1.47 - 1.28 (m, 2H), 1.20-1.07 (m, 1H).	434.3	D	
I-1664		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.19 - 7.10 (m, 1H), 5.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.09 (s, 2H), 3.04 (tt, J = 8.7, 6.6 Hz, 1H), 2.05 -1.91 (m, 1H), 1.90 -1.77 (m, 2H), 1.76 (s, 1H), 1.65 (ddt, J = 10.8, 7.5, 5.4 Hz, 2H), 0.94 (s, 9H).	401.15	B	B

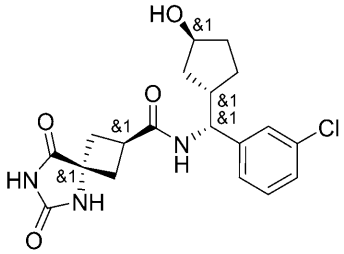
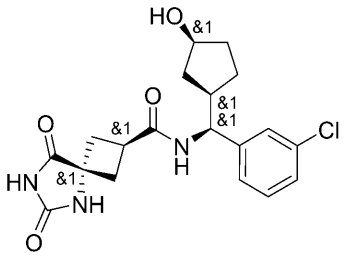
【表１－４４５】

I-1665		(400 MHz, メタノール-d4) 7.38 (s, 1H), 7.35-7.22 (m, 3H), 4.64 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 4.34 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.20 (q, J = 8.9 Hz, 1H), 2.90 (ddd, J = 12.6, 8.3, 4.1 Hz, 2H), 2.63 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.52 - 2.34 (m, 2H), 1.99 - 1.83 (m, 2H), 1.69 - 1.50 (m, 3H), 1.21 (q, J = 9.2 Hz, 1H).	392.3	E	
I-1666		(400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.8, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.14 - 3.83 (m, 1H), 2.83 - 2.60 (m, 1H), 2.41 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.31 - 2.13 (m, 2H), 1.96 (q, J = 9.9 Hz, 3H), 1.90 - 1.78 (m, 3H), 1.68 - 1.39 (m, 4H), 1.35 (dd, J = 12.3, 7.4 Hz, 1H), 1.25 (dq, J = 15.9, 7.9 Hz, 1H), 1.00 (dq, J = 16.8, 8.0 Hz, 1H).	385.25	C	

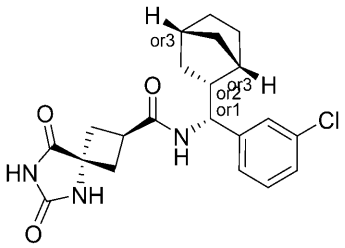
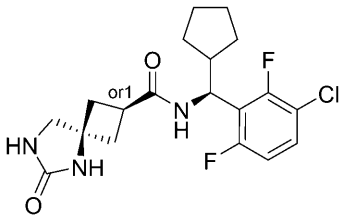
【表１－４４６】

I-1667		(400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.16 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.05 (tt, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 1.97 (dd, J = 13.4, 9.1 Hz, 1H), 1.83 (dt, J = 14.3, 7.2 Hz, 2H), 1.75 (ddd, J = 13.2, 7.9, 5.8 Hz, 1H), 1.63 (dt, J = 12.5, 7.6 Hz, 1H), 1.57 - 1.45 (m, 1H), 0.94 (s, 9H).	401.15	B	B
I-1668		(400 MHz, DMSO-d6) 10.39 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38 - 7.26 (m, 2H), 7.26 (dt, J = 7.2, 2.1 Hz, 1H), 4.53 (dd, J = 11.8, 8.6 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70 - 2.63 (m, 1H), 2.30 (s, 2H), 2.27 - 2.07 (m, 4H), 1.48 (dd, J = 23.3, 10.2 Hz, 2H), 1.27 (dt, J = 23.2, 12.0 Hz, 5H), 0.65 - 0.56 (m, 1H).	402.1	C	

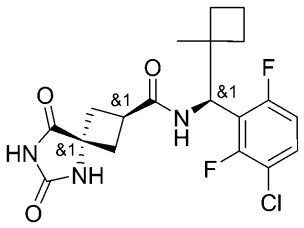
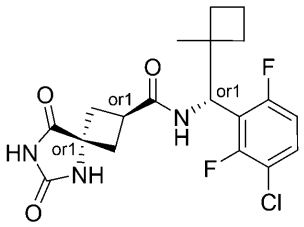
【表１－４４７】

I-1669		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 8.9, 7.6, 1.4 Hz, 2H), 4.64 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 4.53 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 4.01 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 17.8, 11.9, 9.1 Hz, 2H), 2.27 - 2.08 (m, 3H), 1.68 - 1.55 (m, 2H), 1.56 - 1.40 (m, 3H), 1.07 (ddd, J = 13.1, 8.1, 5.2 Hz, 1H).	392.25	E	
I-1670		(400 MHz, メタノール-d4) 7.38 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.34- 7.22 (m, 3H), 4.65 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 4.33 (tt, J = 5.6, 2.7 Hz, 1H), 3.21 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.98 -2.83 (m, 2H), 2.63 (hept, J = 8.1, 7.7 Hz, 1H), 2.52 - 2.33 (m, 2H), 2.02- 1.81 (m, 2H), 1.59 (dddd, J = 20.3, 16.8, 10.0, 7.3 Hz, 3H), 1.20 (tt, J = 11.8, 7.7 Hz, 1H).	392.3	E	

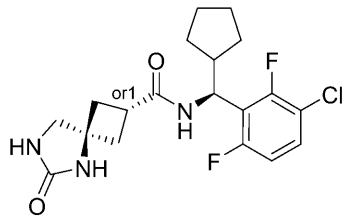
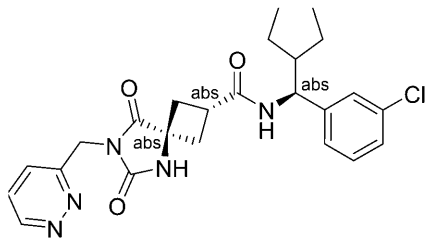
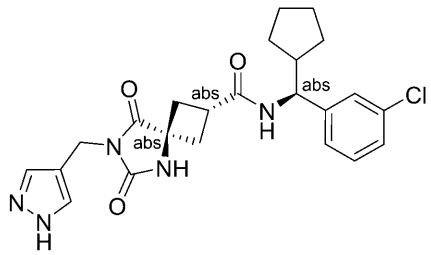
【表１－４４８】

I-1671		(400 MHz, DMSO-d6) 10.44 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.39 - 7.31 (m, 2H), 7.28 (ddt, J = 7.3, 3.9, 1.7 Hz, 2H), 4.62 (dd, J = 11.8, 8.5 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (dt, J = 12.1, 8.6 Hz, 2H), 2.26 - 2.16 (m, 3H), 2.16 - 2.05 (m, 1H), 1.75 (t, J = 12.1 Hz, 1H), 1.64 (d, J = 12.3 Hz, 1H), 1.56 (s, 1H), 1.29 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 1.21 (t, J = 12.8 Hz, 4H), 0.79 (dd, J = 12.3, 4.8 Hz, 1H).	402.1	C	
I-1672		(400 MHz, DMSO-d6) 8.32 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.16 (s, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 3.33 (s, 2H), 2.78 - 2.65 (m, 1H), 2.40 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.24 (t, J = 10.3 Hz, 1H), 2.20 - 2.01 (m, 3H), 1.89 (dt, J = 12.5, 5.8 Hz, 1H), 1.70 - 1.41 (m, 4H), 1.33 (ddd, J = 12.7, 10.3, 6.3 Hz, 1H), 1.22 (dq, J = 22.6, 7.3 Hz, 1H), 0.99 (dd, J = 13.0, 7.4 Hz, 1H).	398.2	B	B

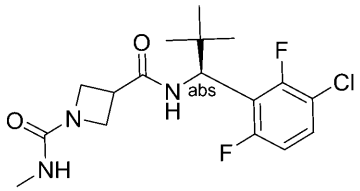
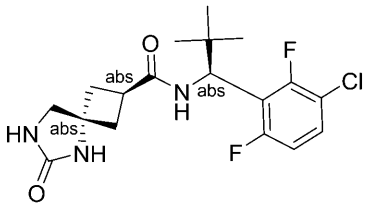
【表１－４４９】

I-1673		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.27 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 29.6, 11.9, 8.9 Hz, 2H), 2.29 - 2.15 (m, 2H), 2.06 (dq, J = 27.0, 9.4 Hz, 2H), 1.89 (dt, J = 10.9, 8.5 Hz, 1H), 1.70 (s, 1H), 1.59 (s, 1H), 1.50 (s, 1H), 1.14 (s, 3H).	412.05	A	A
I-1674		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.8, 5.5 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 5.23 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.74 - 2.59 (m, 2H), 2.31 - 2.21 (m, 2H), 2.12 - 1.95 (m, 2H), 1.95 - 1.83 (m, 1H), 1.70 (s, 1H), 1.58 (s, 1H), 1.50 (s, 1H), 1.14 (s, 3H).	412	D	D

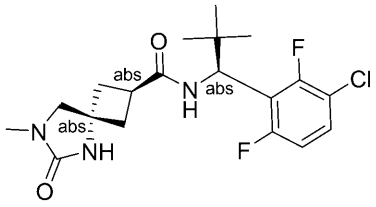
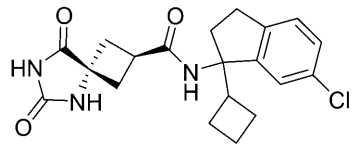
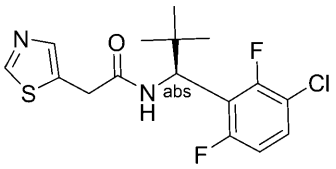
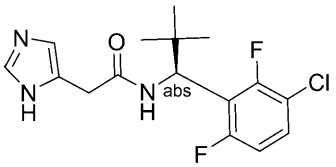
【表１－４５０】

I-1675		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.53 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.81 (s, 1H), 6.04 (s, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.21 (q, J = 9.4 Hz, 2H), 2.90 (p, J = 7.7, 6.3 Hz, 1H), 2.41 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 2.32 (t, J = 10.9 Hz, 1H), 2.23 (d, J = 9.7 Hz, 2H), 2.12 (s, 1H), 1.93 - 1.86 (m, 1H), 1.62 - 1.45 (m, 4H), 1.34 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 1.28 - 1.22 (m, 1H), 1.01 (d, J = 10.5 Hz, 1H).	398.2	B	B
I-1676		(400 MHz, メタノール-d4) - 9.11 (s, 1H), 8.55 (s, 3H), 7.70 (d, J = 3.4 Hz, 2H), 7.39 - 7.12 (m, 4H), 4.57 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 3.24 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 13.1, 10.2 Hz, 4H), 2.58 - 2.43 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.88 (s, 1H), 1.63 (s, 5H), 1.37 (s, 2H), 1.14 (s, 1H).	469.2	E	
I-1677			456.2	C	

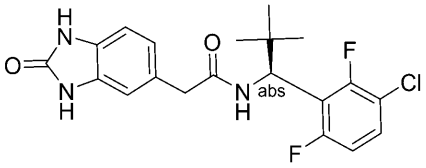
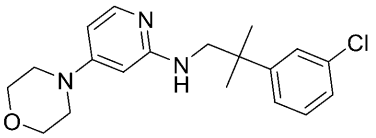
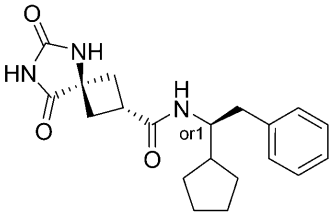
【表１－４５１】

I-1678		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.29 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.21 - 7.09 (m, 1H), 6.19 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 5.10 (br. dd, J = 8.3 Hz, 1H), 3.86 (app. t, J = 8.2 Hz, 1H), 3.81 (app. t, J = 8.2 Hz, 1H), 3.76 (dd, J = 7.6, 6.0 Hz, 1H), 3.63 (br. app. t, J = 5.7 Hz, 1H), 3.44 (tt, J = 8.7, 5.9 Hz, 1H), 2.49 (重複する d, J = 4.6 Hz, 3H), 0.93 (s, 9H).	374.2	D	
I-1679		NMR (400 MHz, DMSO d6) - 8.11 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (br. t, J = 8.4 Hz, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.04 (s, 1H), 5.12 - 5.06 (m, 1H), 3.24 (d A of AB, JAB = 9.5 Hz, 1H), 3.19 (d B of AB, JAB = 9.5 Hz, 1H), 3.04 (tt, J = 9.7, 4.9 Hz, 1H), 2.34 (app. t, J = 10.7 Hz, 1H), 2.30 - 2.23 (m, 1H), 2.23 - 2.18 (m, 1H), 2.15 - 2.07 (m, 1H), 0.92 (s, 9H). 4%の不純物。	386.2	B	B

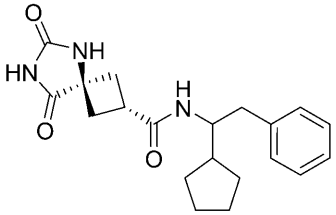
【表１－４５２】

I-1680		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.13 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (br. t, J = 8.3 Hz, 1H), 6.94 (s, 1H), 5.10 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.27 (AB の d A, JAB = 9.4 Hz, 1H), 3.22 (AB の d B, JAB = 9.5 Hz, 1H), 3.05 (app. tt, J = 9.7, 4.9 Hz, 1H), 2.53 (s, 3H), 2.40 - 2.18 (m, 3H), 2.16 - 2.07 (m, 1H), 0.92 (s, 9H). 5%の未知の不純物	400.2	A	B
I-1681		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 10.54 (br. s, 1H), 8.61 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.72 (br. s, 1H), 7.21 - 7.16 (m, 3H), 3.20 - 3.09 (m, 1H), 3.04 - 2.94 (m, 1H), 2.93 - 2.83 (m, 1H), 2.78 - 2.68 (m, 1H), 2.66 - 2.54 (m, 2H), 2.44 - 2.34 (m, 1H), 2.26 - 2.09 (m, 3H), 1.83 - 1.51 (m, 6H). 未同定の微量の脂肪族不純物を含有。	388.3	D	D
I-1682			359.13	D	D
I-1683			342.17	D	

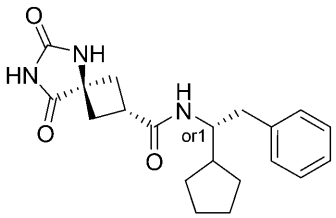
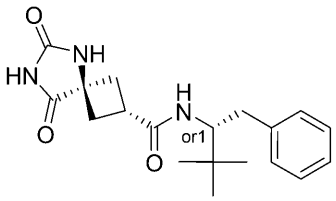
【表１－４５３】

I-1684			408.34	D	D
I-1685				E	
I-1686		(400 MHz, DMSO-d6) 10.75 - 10.47 (m, 1H), 8.57 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.26- 7.19 (m, 2H), 7.18 - 7.12 (m, 3H), 3.85 (dd, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H), 3.06 - 2.94 (m, 1H), 2.79 (dd, J = 13.7, 4.3 Hz, 1H), 2.70 - 2.54 (m, 2H), 2.47 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 2.16 - 1.99 (m, 2H), 1.89 (s, 1H), 1.77- 1.66 (m, 1H), 1.61 (ddd, J = 11.8, 7.8, 3.9 Hz, 1H), 1.57- 1.49 (m, 2H), 1.47 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 1.43 (s, 1H), 1.37 - 1.13 (m, 3H).	356.3	E	

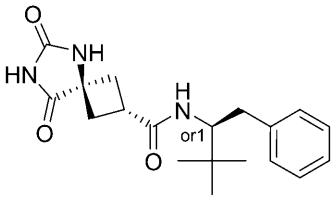
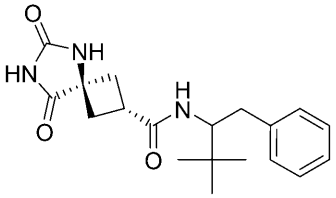
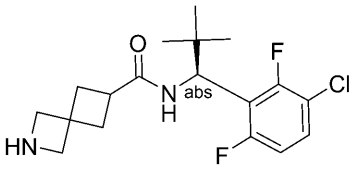
【表１－４５４】

I-1687		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.57 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 8.0, 6.7 Hz, 2H), 7.16 (dd, J = 7.5, 2.2 Hz, 3H), 3.85 (qd, J = 9.0, 4.2 Hz, 1H), 3.01 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.79 (dd, J = 13.7, 4.3 Hz, 1H), 2.70 - 2.53 (m, 3H), 2.07 (dddd, J = 29.9, 13.1, 8.8, 4.6 Hz, 2H), 1.89 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 1.76 - 1.66 (m, 1H), 1.63 (dd, J = 7.6, 4.5 Hz, 1H), 1.58 - 1.50 (m, 2H), 1.45 (dd, J = 17.8, 8.3 Hz, 2H), 1.37 - 1.15 (m, 2H).	35.15	E	

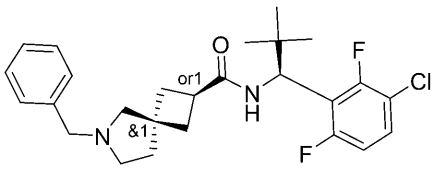
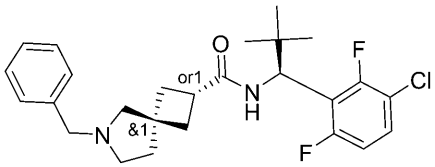
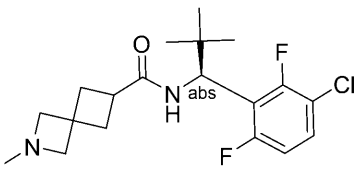
【表１－４５５】

I-1688		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.57 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.26 - 7.20 (m, 2H), 7.18 - 7.12 (m, 3H), 3.85 (qd, J = 9.2, 4.2 Hz, 1H), 3.01 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.79 (dd, J = 13.7, 4.3 Hz, 1H), 2.71 - 2.53 (m, 2H), 2.47 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 2.07 (dddd, J = 30.0, 13.2, 8.9, 4.6 Hz, 2H), 1.89 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 1.78 - 1.66 (m, 1H), 1.61 (ddd, J = 11.9, 7.8, 3.9 Hz, 1H), 1.58 - 1.49 (m, 2H), 1.47 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 1.43 (s, 1H), 1.36 - 1.12 (m, 3H).	356.3	E	
I-1689		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 7.52 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.25 - 7.07 (m, 5H), 3.74 (ddd, J = 12.0, 9.6, 2.5 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.86 (dd, J = 13.7, 2.6 Hz, 1H), 2.58 (dd, J = 11.9, 9.4 Hz, 1H), 2.41 (dd, J = 12.9, 10.9 Hz, 1H), 2.35 (dd, J = 11.2, 8.6 Hz, 1H), 2.10 (ddd, J = 12.4, 8.7, 4.6 Hz, 1H), 1.98 (ddd, J = 13.0, 8.7, 4.6 Hz, 1H), 0.92 (s, 9H).	344.15	E	

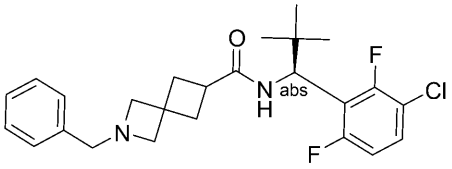
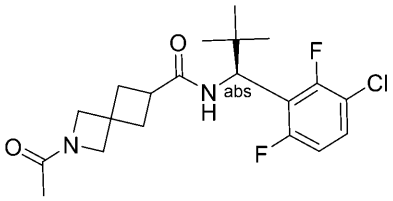
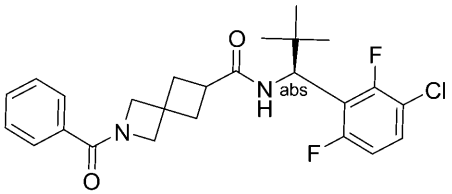
【表１－４５６】

I-1690		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 7.52 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.25 - 7.07 (m, 5H), 3.74 (ddd, J = 12.0, 9.6, 2.5 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.86 (dd, J = 13.7, 2.6 Hz, 1H), 2.58 (dd, J = 11.9, 9.4 Hz, 1H), 2.46 - 2.31 (m, 2H), 2.10 (ddd, J = 12.4, 8.8, 4.6 Hz, 1H), 1.98 (ddd, J = 13.0, 9.0, 4.6 Hz, 1H), 0.92 (s, 9H).	344.2	E	
I-1691		(400 MHz, DMSO-d6) 10.47 (s, 1H), 8.56 (s, 1H), 7.52 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.25 - 7.13 (m, 4H), 7.12 (td, J = 6.7, 1.8 Hz, 1H), 3.74 (ddd, J = 12.0, 9.6, 2.5 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.86 (dd, J = 13.7, 2.6 Hz, 1H), 2.58 (dd, J = 11.9, 9.4 Hz, 1H), 2.46 - 2.31 (m, 2H), 2.10 (ddd, J = 12.3, 8.7, 4.7 Hz, 1H), 1.98 (ddd, J = 12.9, 8.8, 4.6 Hz, 1H), 0.92 (s, 9H).	344.1	E	
I-1692		(400 MHz, DMSO-d6) 7.96 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.08 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.73 (d, J = 66.9 Hz, 1H), 3.46 (s, 1H), 3.31 - 3.26 (m, 2H), 3.06 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.28 - 2.11 (m, 3H), 2.03 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 0.92 (s, 9H).	357.1	D	

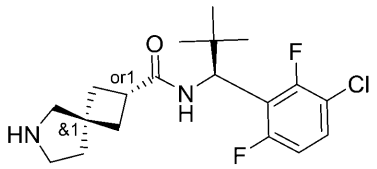
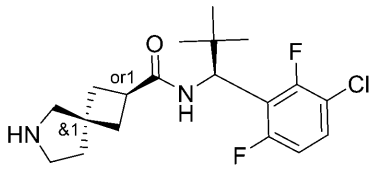
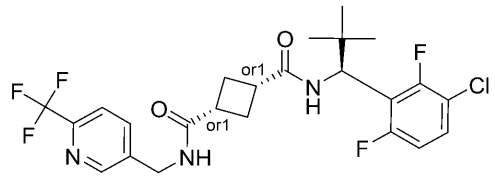
【表１－４５７】

I-1693		(400 MHz, DMSO-d6) 7.91 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 6.2 Hz, 4H), 7.24 (td, J = 6.0, 2.6 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.07 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.54 (s, 2H), 3.07 (p, J = 8.6 Hz, 1H), 2.69 - 2.57 (m, 1H), 2.45 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 2.04 (q, J = 12.9, 11.6 Hz, 2H), 1.93 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 1.73-1.65 (m, 2H), 0.90 (s, 9H).	461.4	D	D
I-1694		(400 MHz, DMSO-d6) 7.97 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.30 (q, J = 7.5 Hz, 5H), 7.13 (s, 1H), 5.07 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.52 (s, 2H), 3.15 (q, J = 8.4 Hz, 1H),2.69 -2.57(m,1H) 2.43 (s, 3H), 2.09 (dd, J = 10.9, 8.4 Hz, 1H), 1.99 (dt, J = 19.8, 9.9 Hz, 3H), 1.90 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 0.91 (s, 9H).	461.4	D	D
I-1695		(400 MHz, DMSO-d6) 7.96 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.20 - 3.05 (m, 3H), 2.99 - 2.87 (m, 2H), 2.18 - 2.09 (m, 5H), 2.08 - 1.98 (m, 2H), 0.91 (s, 9H).	371.1	C	

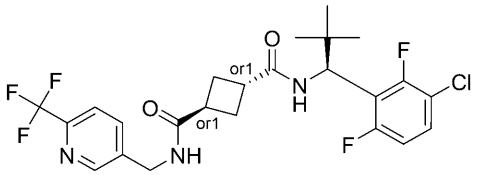
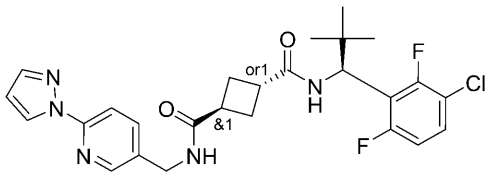
【表１－４５８】

I-1696		(400 MHz, DMSO-d6) 7.98 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.35 - 7.27 (m, 2H), 7.23 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 7.14 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.50 (s, 2H), 3.26 - 3.05 (m, 3H), 3.01 (s, 2H), 2.33 - 1.86 (m, 4H), 0.91 (s, 9H).	447.35	C	D
I-1697		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.10 (s, 1H), 4.00 - 3.90 (m, 1H), 3.81 (s, 1H), 3.71 - 3.60 (m, 1H), 3.11 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 2.30 - 2.17 (m, 3H), 2.15 - 2.06 (m, 1H), 1.70 (d, J = 10.0 Hz, 3H), 0.92 (s, 9H).	399.05	C	D
I-1698		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 7.59 (q, J = 11.3, 10.2 Hz, 3H), 7.49 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 6.7 Hz, 2H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (s, 1H), 4.30 (s, 1H), 4.16 (s, 1H), 4.05 (s, 1H), 3.91 (s, 1H), 3.20 - 3.05 (m, 1H), 2.33 (p, J = 1.9 Hz, 1H), 2.31 (s, 1H), 2.29 (s, 1H), 2.28 - 2.21 (m, 2H), 2.21 - 2.11 (m, 1H), 0.92 (s, 9H).	461.1	C	C

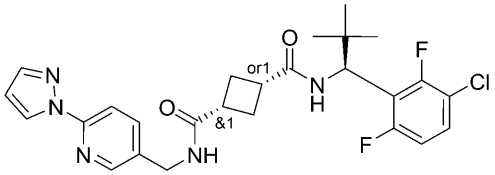
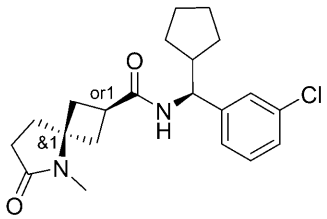
【表１－４５９】

I-1699		(400 MHz, DMSO-d6) 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.22 - 3.09 (m, 2H), 2.81 - 2.66 (m, 3H), 2.05 (dt, J = 15.2, 9.8 Hz, 2H), 1.95 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 1.59 (dd, J = 7.9, 6.5 Hz, 1H), 1.24 (s, 1H), 0.92 (s, 9H).	371.25	D	
I-1700		(400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (dd, J = 15.7, 8.8 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.22 - 3.07 (m, 2H), 2.81 - 2.61 (m, 3H), 2.10 - 1.83 (m, 5H), 1.76 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 1.24 (s, 1H), 0.92 (s, 9H).	371.25	C	
I-1701		(400 MHz, DMSO-d6)8.63 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.36 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.92-7.82 (m, 2H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 4.36 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 3.12 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.95 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.20 (dq, J = 36.9, 9.7 Hz, 4H), 0.92 (s, 9H).	518.25	C	D

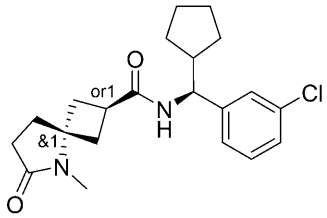
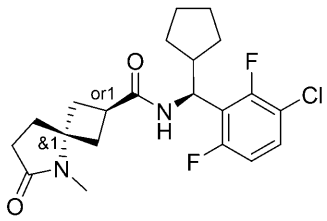
【表１－４６０】

I-1702		(400 MHz, DMSO-d6) 8.65 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.40 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.94-7.84 (m, 2H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 5.11 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.38 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 3.25 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 3.02 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 2.38-2.16 (m, 3H), 2.15-2.06 (m, 1H), 0.93 (s, 9H).	518.25	D	D
I-1703		(400 MHz, DMSO-d6) 8.60 (dd, J = 2.7, 0.7 Hz, 1H), 8.33 (t, J = 2.2 Hz, 2H), 8.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.89 (dd, J = 8.4, 0.8 Hz, 1H), 7.86-7.79 (m, 2H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.57 (dd, J = 2.6, 1.7 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.31 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 3.26 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.31-2.16 (m, 3H), 2.12-2.05 (m, 1H), 0.93 (s, 9H).	516.25	D	D

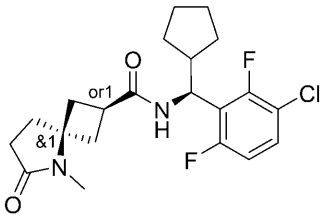
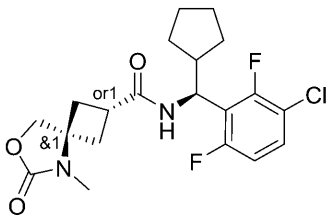
【表１－４６１】

I-1704		(400 MHz, DMSO-d6) 8.60 (dd, J = 2.6, 0.7 Hz, 1H), 8.35-8.26 (m, 2H), 8.02 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.88 (dd, J = 8.4, 0.8 Hz, 1H), 7.85-7.78 (m, 2H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.56 (dd, J = 2.6, 1.7 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.29 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 3.11 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.94 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.31-2.10 (m, 4H), 0.93 (s, 9H).	516.3	B	D
I-1705		(400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.42 - 7.31 (m, 2H), 7.27 (ddt, J = 7.6, 4.2, 1.4 Hz, 2H), 4.59 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.01 - 2.89 (m, 1H), 2.79 (s, 3H), 2.60 (tt, J = 10.1, 1.6 Hz, 1H), 2.26 - 2.08 (m, 5H), 1.97 (dd, J = 8.6, 7.5 Hz, 2H), 1.77 - 1.67 (m, 1H), 1.62 - 1.39 (m, 4H), 1.28 (ddt, J = 10.8, 8.1, 5.4 Hz, 2H), 1.16 - 1.04 (m, 1H).	375.2	D	

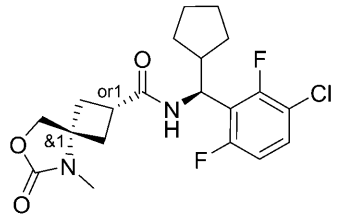
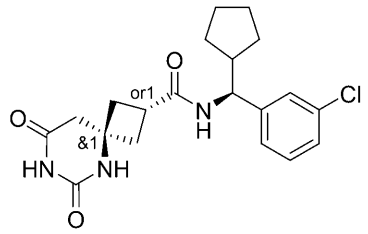
【表１－４６２】

I-1706		(400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 2H), 7.30 - 7.22 (m, 2H), 4.57 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.82 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.67 (s, 3H), 2.50 - 2.38 (m, 2H), 2.16 (dq, J = 32.2, 7.3 Hz, 5H), 2.02 (ddd, J = 11.5, 7.9, 5.1 Hz, 1H), 1.92 (ddd, J = 12.4, 7.8, 5.2 Hz, 1H), 1.74 - 1.66 (m, 1H), 1.64 - 1.36 (m, 4H), 1.33 - 1.22 (m, 2H), 1.08 (dd, J = 12.4, 7.9 Hz, 1H).	375.2	D	
I-1707		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 2.99 (tt, J = 10.0, 5.8 Hz, 1H), 2.77 (s, 3H), 2.62 - 2.52 (m, 1H), 2.51 - 2.35 (m, 2H), 2.22 - 2.13 (m, 1H), 2.15 - 2.03 (m, 3H), 2.01 - 1.86 (m, 3H), 1.67 - 1.41 (m, 4H), 1.37 - 1.21 (m, 2H), 1.01 (dd, J = 12.6, 7.8 Hz, 1H).	411.2	B	B

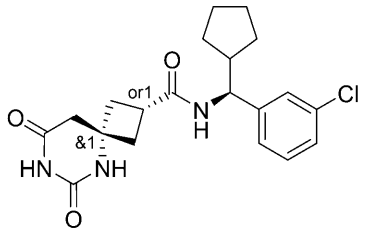
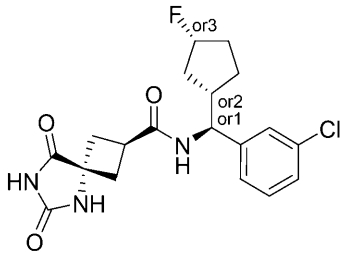
【表１－４６３】

I-1708		(400 MHz, DMSO-d6) 8.44 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 2.88 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.66 (s, 3H), 2.49 - 2.34 (m, 3H), 2.21 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 2.09 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 1.99 (dt, J = 11.3, 6.9 Hz, 1H), 1.94 - 1.79 (m, 2H), 1.67 - 1.41 (m, 4H), 1.40 - 1.14 (m, 2H), 1.07 - 0.94 (m, 1H).	411.2	C	C
I-1709		(400 MHz, DMSO-d6) 8.48 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.35 (s, 2H), 2.80 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.72 (s, 3H), 2.60 - 2.53 (m, 1H), 2.49 - 2.35 (m, 2H), 2.14 (td, J = 11.2, 9.5, 5.8 Hz, 1H), 2.07 - 1.99 (m, 1H), 1.89 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 1.67 - 1.43 (m, 4H), 1.34 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 1.29 - 1.19 (m, 1H), 1.01 (q, J = 12.0, 9.9 Hz, 1H).	413.25	B	B

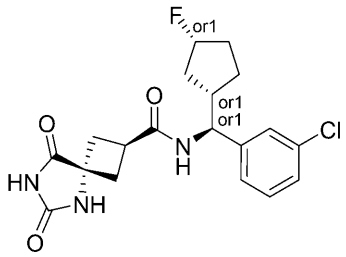
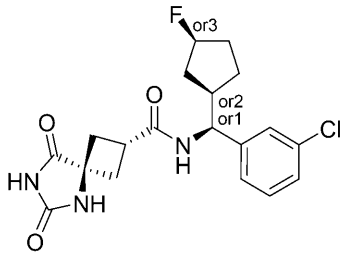
【表１－４６４】

I-1710		(400 MHz, DMSO-d6) 8.48 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.30 - 4.16 (m, 2H), 2.95 (dq, J = 9.8, 4.9 Hz, 1H), 2.82 (s, 3H), 2.75- 2.65 (m, 1H), 2.61 (dd, J = 12.9, 9.7 Hz, 1H), 2.41 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.21-2.12 (m, 1H), 2.10 - 2.01 (m, 1H), 1.88 (dt, J = 12.2, 6.7 Hz, 1H), 1.55 (ddd, J = 32.5, 14.5, 7.2 Hz, 4H), 1.30 (ddd, J = 28.6, 12.9, 6.4 Hz, 2H), 1.00 (t, J = 9.7 Hz, 1H).	413.25	B	B
I-1711		(400 MHz, DMSO-d6) 10.09-10.04 (m, 1H), 8.22 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.39-7.30 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 8.8, 7.4, 1.5 Hz, 2H), 4.56 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.81 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.64 (s, 2H), 2.26 (t, J = 10.2 Hz, 1H), 2.17 (dt, J = 18.5, 9.9 Hz, 3H), 2.13-2.02 (m, 1H), 1.71 (s, 1H), 1.56 (s, 3H), 1.45 (td, J = 13.8, 12.2, 7.8 Hz, 1H), 1.27 (dd, J = 20.2, 7.7 Hz, 1H), 1.26 (s, 1H), 1.08 (dd, J = 12.6, 8.1 Hz, 1H).	390.2	C	D

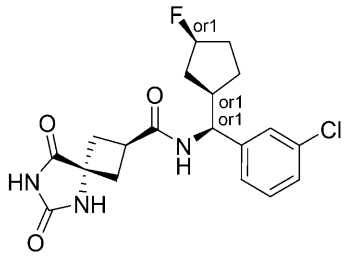
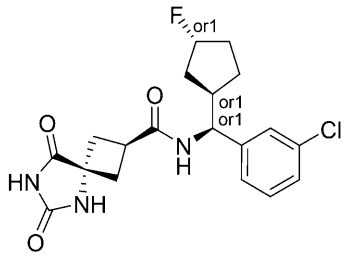
【表１－４６５】

I-1712		(400 MHz, DMSO-d6) 10.07-10.02 (m, 1H), 8.30 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.10-8.05 (m, 1H), 7.39-7.30 (m, 2H), 7.26 (ddt, J = 8.9, 7.4, 1.5 Hz, 2H), 4.57 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.00 (tt, J = 10.0, 5.6 Hz, 1H), 2.61 (s, 2H), 2.36 (t, J = 11.0 Hz, 1H), 2.25 (t, J = 10.9 Hz, 1H), 2.15 (td, J = 14.6, 13.5, 7.8 Hz, 3H), 1.75-1.65 (m, 1H), 1.57 (s, 2H), 1.55-1.40 (m, 1H), 1.44 (s, 2H), 1.27 (dd, J = 19.9, 7.6 Hz, 1H), 1.26 (s, 2H), 1.08 (s, 1H).	390.15	C	D
I-1713		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.38 - 7.32 (m, 1H), 7.32 -7.24 (m, 2H), 5.16 (d, J = 54.5 Hz, 1H), 4.63 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.66 (dt, J = 19.9, 10.9 Hz, 2H), 2.45 (s, 1H), 2.29 - 2.19 (m, 1H), 2.17 (d, J = 11.8 Hz, 1H), 2.06 - 1.86 (m, 2H), 1.79 - 1.63 (m, 1H), 1.59 - 1.49 (m, 1H), 1.44 (td, J = 13.2, 12.7, 6.7 Hz, 2H), 1.28- 1.16 (m, 1H).	392.15	C	

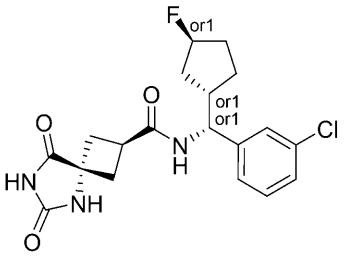
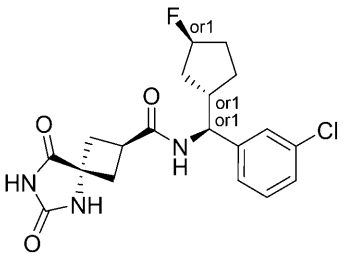
【表１－４６６】

I-1714		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.29 (s, 2H), 5.12 (d, J = 54.8 Hz, 1H), 4.66 (q, J = 9.8, 9.4 Hz, 1H), 3.12 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.66 (q, J = 12.1, 11.1 Hz, 2H), 2.27 (dd, J = 15.0, 9.6 Hz, 2H), 2.14 (d, J = 11.0 Hz, 2H), 1.95-1.45 (m, 4H), 1.42 - 1.09 (m, 3H).	394.2	E	
I-1715		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.38 - 7.32 (m, 1H), 7.31 - 7.13 (m, 2H), 5.12 (d, J = 54.6 Hz, 1H), 4.64 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.11 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.92 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 2.73-2.61 (m, 2H), 2.36- 2.23 (m, 2H), 2.15 (h, J = 10.0 Hz, 2H), 1.84 (s, 1H), 1.74 -1.49 (m, 2H), 1.31 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.16 (t, J = 7.2 Hz, 1H).	392.15	D	

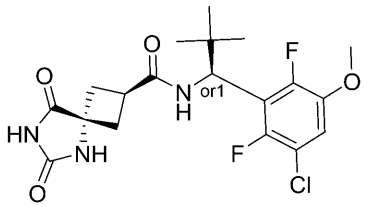
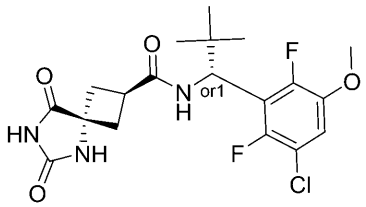
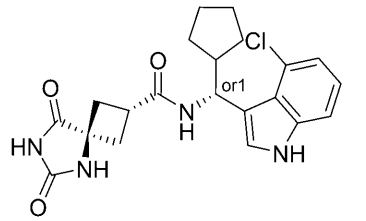
【表１－４６７】

I-1716		(400 MHz, メタノール-d4) 7.38 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35- 7.21 (m, 3H), 5.19 (s, 1H), 4.73 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 3.21 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 2.90 (dt, J = 13.2, 7.1 Hz, 2H), 2.54-2.35 (m, 3H), 2.28 - 2.16 (m, 1H), 2.03 - 1.91 (m, 1H), 1.75 (dd, J = 24.3, 9.9 Hz, 2H), 1.49 - 1.38 (m, 2H), 1.37 - 1.25 (m, 2H), 0.12 (s, 1H).	392.1	E	
I-1717		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.38 - 7.32 (m, 1H), 7.32 - 7.18 (m, 2H), 5.10 (d, J = 54.1 Hz, 1H), 4.64 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73 - 2.59 (m, 2H), 2.24 (t, J = 11.1 Hz, 1H), 2.15 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 2.05-1.94 (m, 1H), 1.94 - 1.79 (m, 2H), 1.76 (t, J = 13.6 Hz, 1H), 1.47 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.43 - 1.31 (m, 2H), 1.24 (s, 1H).	394.25	D	

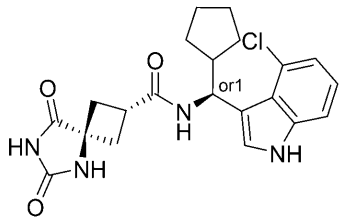
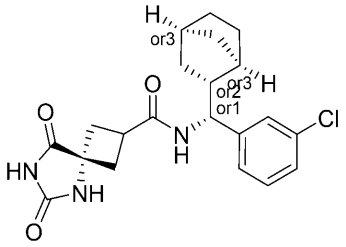
【表１－４６８】

I-1718		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.50- 7.03 (m, 4H), 5.27- 4.98 (m, 1H), 4.63 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 20.2, 11.9, 9.0 Hz, 2H), 2.46 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 2.24 (ddd, J = 12.5, 9.0, 4.1 Hz, 1H), 2.15 (ddd, J = 12.7, 9.0, 4.0 Hz, 1H), 2.07- 1.86 (m, 2H), 1.71 (ddt, J = 28.9, 14.9, 7.7 Hz, 1H), 1.59- 1.36 (m, 2H), 1.29-1.12 (m, 1H).	392.15	E	
I-1719		(400 MHz, メタノール-d4) 7.40- 7.37 (m, 1H), 7.37 - 7.23 (m, 3H), 5.08 (dd, J = 54.0, 4.7 Hz, 1H), 4.66 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 3.27 -3.16 (m, 1H), 2.94 - 2.83 (m, 2H), 2.63 (ddd, J = 17.9, 10.6, 7.6 Hz, 1H), 2.45 (dddd, J = 31.4, 13.0, 9.8, 3.6 Hz, 2H), 2.13-1.98 (m, 2H), 1.98 - 1.77 (m, 1H), 1.69 - 1.59 (m, 1H), 1.57 -1.45 (m, 1H), 1.41 - 1.32 (m, 1H), 1.31 (s, 1H), 0.91 (d, J = 9.3 Hz, 1H).	394.25	E	

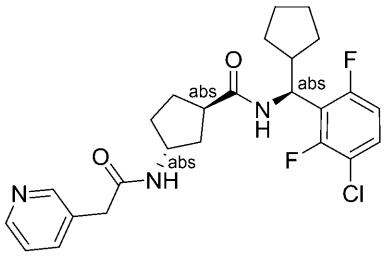
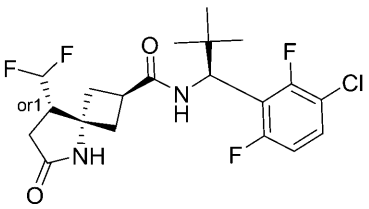
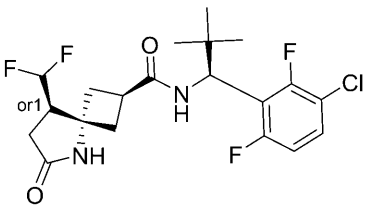
【表１－４６９】

I-1720		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.26 - 8.17 (m, 1H), 7.36 (dd, J = 8.5, 7.0 Hz, 1H), 5.10 (s, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.26 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 12.0, 9.1 Hz, 1H), 2.59 (dd, J = 12.1, 9.0 Hz, 1H), 2.29 - 2.12 (m, 2H), 0.93 (s, 9H).	430.3	E	
I-1721		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.22 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 8.5, 7.0 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.26 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 12.0, 9.0 Hz, 1H), 2.61 - 2.55 (m, 1H), 2.29- 2.13 (m, 2H), 0.93 (s, 9H).	430.3	E	
I-1722		(400 MHz, DMSO-d6) 11.28 (s, 1H), 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.59-7.25 (m, 2H), 7.11-6.83 (m, 2H), 5.69 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.13 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.71 (t, J = 10.8 Hz, 2H), 2.43-2.06 (m, 3H), 1.51 (d, J = 36.1 Hz, 7H), 1.37-1.15 (m, 1H).	415.2	E	D

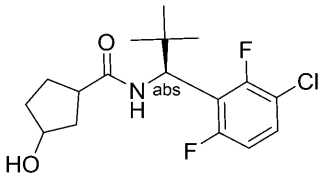
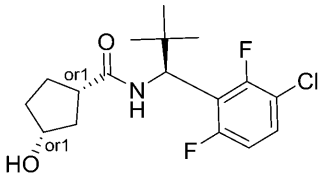
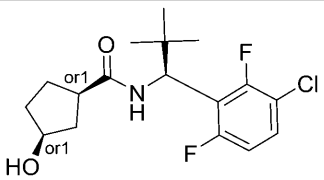
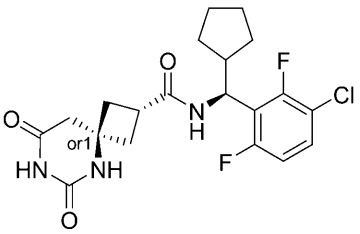
【表１－４７０】

I-1723		(400 MHz, DMSO-d6) 11.28 (s, 1H), 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.11-6.94 (m, 2H), 5.69 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.14 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.71 (d, J = 21.2 Hz, 2H), 2.40 (s, 1H), 2.30-2.02 (m, 2H), 1.51 (d, J = 37.4 Hz, 7H), 1.27 (d, J = 17.6 Hz, 1H).	415.15	B	D
I-1724		(400 MHz, DMSO-d6) 7.37 - 7.27 (m, 3H), 7.26 (dt, J = 7.2, 2.1 Hz, 1H), 4.37 (dd, J = 11.8, 8.6 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 - 2.68 (m, 1H), 2.31 (s, 2H), 2.23 - 2.04 (m, 4H), 1.43 (dd, J = 23.3, 10.2 Hz, 2H), 1.23 (dt, J = 23.2, 12.0 Hz, 5H), 0.88 - 0.79 (m, 1H).	402.15	E	

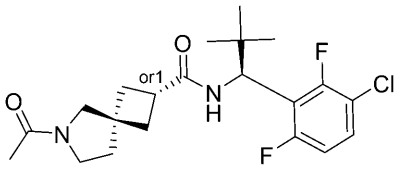
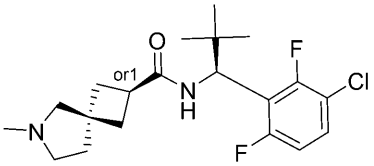
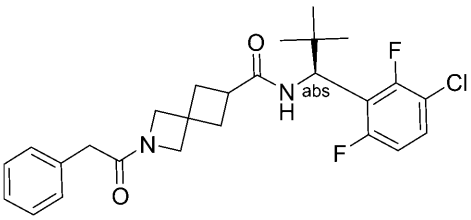
【表１－４７１】

I-1725		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.44 - 8.41 (m, 2H), 8.37 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.66 - 7.62 (m, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.32 (ddd, J = 7.8, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.11 (td, J = 9.6, 1.4 Hz, 1H), 4.80 (dd, J = 11.0, 7.5 Hz, 1H), 4.05 - 3.95 (m, 1H), 3.42 (d, AB の A, JAB = 14.7 Hz, 1H), 3.39 (d, AB の B, JAB = 14.8 Hz, 1H), 2.83 (app. p, J = 7.5 Hz, 1H), 2.47 - 2.35 (m, 1H), 1.95 - 1.75 (m, 4H), 1.66 - 1.19 (m, 9H), 1.04 - 0.93 (m, 1H).	476.4	B	B
I-1726				A	B
I-1727				B	

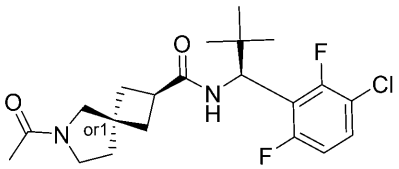
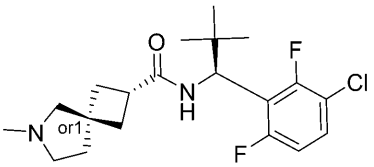
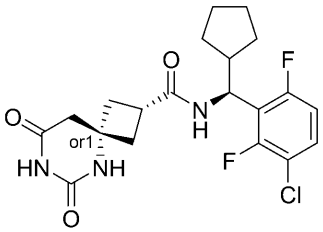
【表１－４７２】

I-1728		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.25 - 8.15 (m, 1H), 7.56 (app td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.14 (app t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.89 (br s, 1H), 4.14 - 4.06 (m, 1H), 2.79 (app p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.00 - 1.84 (m, 1H), 1.81 - 1.45 (m, 5H), 0.92 (s, 9H). 立体異性体の混合物。	346.3	D	
I-1729				D	
I-1730				D	
I-1731		(400 MHz, DMSO-d6)10.06 (s, 1H), 8.32 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 2.84 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.62 (s, 2H), 2.44-2.35 (m, 1H), 2.24 (t, J = 10.2 Hz, 1H), 2.12 (q, J = 13.7, 12.2 Hz, 2H), 2.09-2.03 (m, 1H), 1.88 (dd, J = 12.6, 5.4 Hz, 1H), 1.59 (s, 2H), 1.55 (s, 1H), 1.50 (dd, J = 14.8, 8.1 Hz, 1H), 1.38-1.30 (m, 1H), 1.25 (dd, J = 13.3, 7.1 Hz, 1H), 1.00 (s, 1H).	426.15	B	

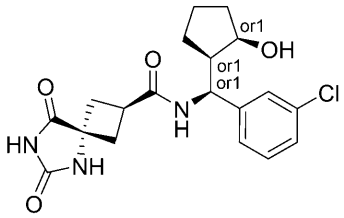
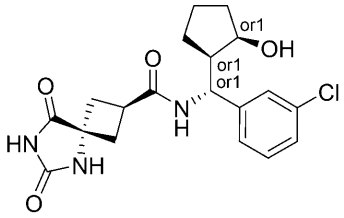
【表１－４７３】

I-1732		(400 MHz, DMSO-d6) 8.01 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.10 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.44 - 3.40 (m, 1H), 3.19 (t, J = 7.0 Hz, 4H), 2.14 - 1.67 (m, 9H), 0.93 (s, 9H).	413.15	C	
I-1733		(400 MHz, DMSO-d6) 7.98 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.08 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.18 - 3.15 (m, 1H), 2.40 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.37 - 2.29 (m, 2H), 2.14 (s, 3H), 2.02 - 1.84 (m, 5H), 1.24 (s, 1H), 0.92 (s, 9H).	385.2	C	
I-1734		(400 MHz, DMSO-d6) 8.13 - 7.98 (m, 1H), 7.68 - 7.49 (m, 1H), 7.34 - 7.25 (m, 2H), 7.25 - 7.17 (m, 3H), 7.15 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.17 (s, 1H), 4.09 - 3.98 (m, 1H), 3.85 (s, 1H), 3.77 - 3.61 (m, 1H), 3.39 (s, 1H), 3.36 (s, 1H), 3.20 - 2.99 (m, 1H), 2.28 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 2.22 (t, J = 9.4 Hz, 2H), 2.11 (s, 1H), 0.92 (s, 9H).	475.25	B	

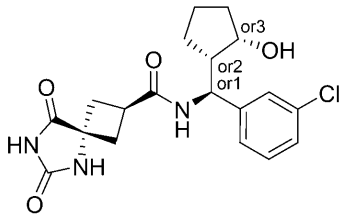
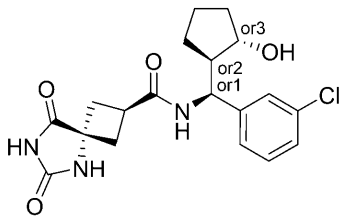
【表１－４７４】

I-1735		(400 MHz, DMSO-d6) 8.03 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (tdd, J = 7.7, 5.3, 1.8 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.43 (s, 1H), 3.30 - 3.17 (m, 3H), 3.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 2.16 - 1.73 (m, 9H), 0.93 (s, 9H).	413.1	D	
I-1736		(400 MHz, DMSO-d6) 7.95 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.08 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.11 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 2.49 (s, 1H), 2.34 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.05 (dd, J = 8.5, 2.5 Hz, 2H), 1.96 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 1.70 - 1.64 (m, 2H), 1.24 (s, 1H), 0.92 (s, 9H).	385.15	C	
I-1737		(400 MHz, DMSO-d6) 10.03 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.08-8.03 (m, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.2, 7.5 Hz, 1H), 3.03 (tt, J = 10.2, 5.5 Hz, 1H), 2.58 (s, 2H), 2.51 (p, J = 1.8 Hz, 1H), 2.44-2.35 (m, 1H), 2.32 (m, 1H), 2.26 (s, 1H), 2.17 (m, 1H), 1.93-1.85 (m, 1H), 1.53 (ddt, J = 31.4, 16.4, 7.9 Hz, 3H), 1.50 (dd, J = 14.8, 8.1 Hz, 1H), 1.38-1.20 (m, 2H), 1.01 (dd, J = 17.1, 9.8 Hz, 1H).	426.2	A	B

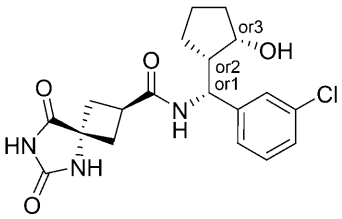
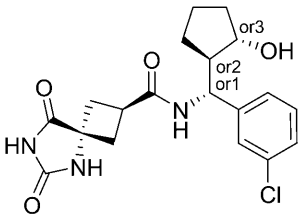
【表１－４７５】

I-1738		(400 MHz, DMSO-d6) 10.32 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.37 (q, J = 3.8, 2.9 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 (tt, J = 7.7, 1.5 Hz, 2H), 4.73 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 4.38 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.64 - 3.57 (m, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (td, J = 11.9, 9.1 Hz, 2H), 2.24 (td, J = 8.6, 8.1, 4.4 Hz, 1H), 2.14 (dtd, J = 19.6, 8.5, 8.1, 4.2 Hz, 2H), 1.76 - 1.61 (m, 3H), 1.59 -1.47 (m, 1H), 1.42 (ddd, J = 12.4, 8.1, 4.5 Hz, 1H), 1.37 - 1.31 (m, 1H), 1.24 (s, 1H).	392.05	E	
I-1739		(400 MHz, DMSO-d6) 10.48 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.30 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.37 - 7.29 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 4.95 - 4.86 (m, 1H), 4.38 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.44 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 3.08 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 - 2.58 (m, 2H), 2.21 (t, J = 11.3 Hz, 1H), 2.18 - 2.08 (m, 1H), 1.94 (s, 1H), 1.76 (s, 2H), 1.52 (dd, J = 24.1, 9.8 Hz, 4H).	392.05	E	

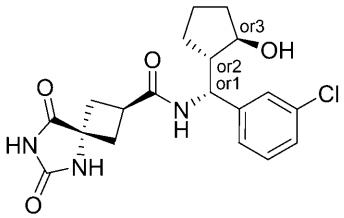
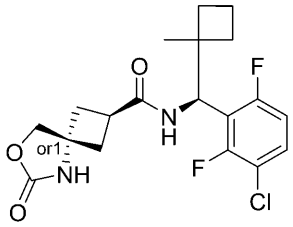
【表１－４７６】

I-1740		(400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.36 - 7.30 (m, 1H), 7.26 (ddt, J = 7.5, 4.0, 1.5 Hz, 2H), 4.64 - 4.55 (m, 2H), 3.83 (dq, J = 7.8, 4.2 Hz, 1H), 3.13 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 29.7, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.18 (dddd, J = 30.5, 12.9, 8.8, 4.4 Hz, 2H), 2.03 (dt, J = 11.9, 5.9 Hz, 1H), 1.73 (s, 1H), 1.63 - 1.41 (m, 4H), 1.16 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 0.98 (td, J = 7.9, 5.1 Hz, 1H).	392.05	E	
I-1741		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.36 - 7.30 (m, 1H), 7.27 (ddd, J = 7.2, 4.1, 1.9 Hz, 2H), 4.64 - 4.55 (m, 2H), 3.83 (dt, J = 6.5, 3.8 Hz, 1H), 3.14 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 29.5, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.28 - 2.09 (m, 2H), 2.08 -2.00 (m, 1H), 1.73 (dt, J = 12.0, 6.1 Hz, 1H), 1.63 - 1.51 (m, 1H), 1.51 - 1.39 (m, 3H), 1.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 1.05 - 0.91 (m, 1H).	392.05	E	

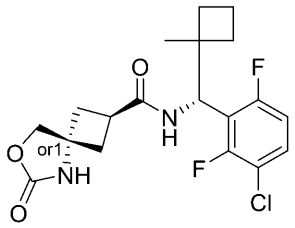
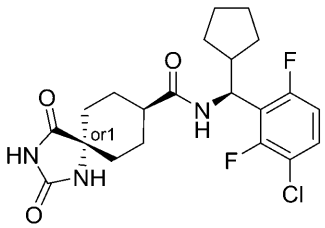
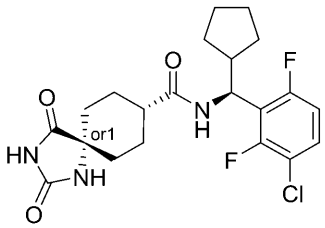
【表１－４７７】

I-1742		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.35 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.39- 7.35 (m, 1H), 7.32 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.30 - 7.22 (m, 2H), 4.79 -4.70 (m, 1H), 4.46 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.04 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 3.14 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.76 - 2.66 (m, 1H), 2.66 - 2.57 (m, 1H), 2.28 -2.10 (m, 2H), 1.98 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 1.75 - 1.55 (m, 3H), 1.45 (s, 1H), 1.34 (q, J = 10.8, 10.2 Hz, 1H), 1.17 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 1.08 - 0.83 (m, 1H).	392.05	D	
I-1743		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.32 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.30 - 7.22 (m, 2H), 4.79 - 4.70 (m, 1H), 4.46 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.04 (s, 1H), 3.13 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.76 - 2.66 (m, 1H), 2.66-2.57 (m, 1H), 2.18 (dq, J = 20.9, 7.2, 4.3 Hz, 2H), 1.98 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 1.78 - 1.54 (m, 3H), 1.46 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 1.33 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 1.16 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 1.02 (d, J = 10.1 Hz, 1H).	392.05	E	

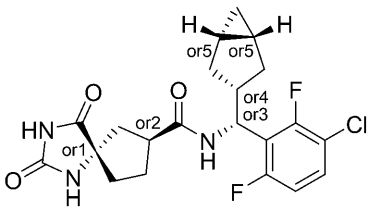
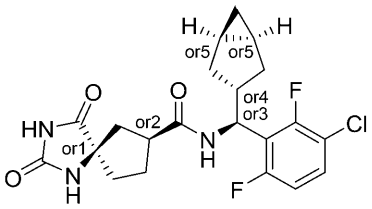
【表１－４７８】

I-1744		(400 MHz, DMSO-d6) 10.45 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.30 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.37 - 7.29 (m, 2H), 7.29 - 7.22 (m, 1H), 4.90 (dd, J = 11.2, 8.9 Hz, 1H), 4.38 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 3.44 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (td, J = 12.7, 9.2 Hz, 2H), 2.22 (s, 1H), 2.14 (td, J = 13.2, 6.6 Hz, 1H), 1.94 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 1.76 (s, 2H), 1.65 - 1.41 (m, 4H).	392.05	E	
I-1745		(400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.61 - 7.51 (m, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.21 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.34 (s, 2H), 2.91 (q, J = 8.8 Hz, 1H), 2.37 (t, J = 10.5 Hz, 1H), 2.32 - 2.20 (m, 3H), 2.03 (dq, J = 29.0, 9.5 Hz, 1H), 1.89 (q, J = 9.2, 8.6 Hz, 1H), 1.68 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 1.57 (s, 1H), 1.48 (s, 1H), 1.24 (s, 1H), 1.12 (s, 3H).	399	B	C

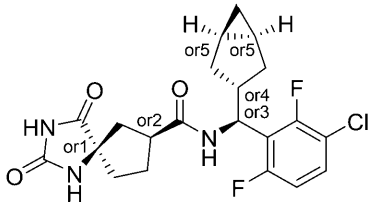
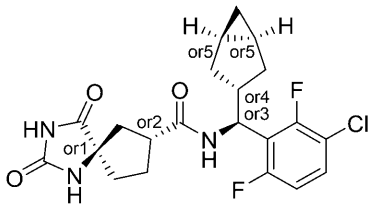
【表１－４７９】

I-1746		(400 MHz, DMSO-d6) 8.27 - 7.91 (m, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.21 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.34 (s, 2H), 2.95 - 2.86 (m, 1H), 2.42 - 2.32 (m, 1H), 2.29 - 2.19 (m, 3H), 2.04 (dq, J = 29.0, 9.6, 9.1 Hz, 1H), 1.89 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 1.69 (s, 1H), 1.57 (s, 1H), 1.48 (s, 1H), 1.24 (s, 1H), 1.12 (s, 3H).	399.1	D	
I-1747		(400 MHz, DMSO-d6) 10.43 (s, 1H), 8.30 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.2 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.6 Hz, 1H), 2.42 (q, J = 8.8 Hz, 1H), 2.28 (s, 1H), 2.10 - 1.73 (m, 5H), 1.72 - 1.15 (m, 10H), 1.02 (q, J = 11.3, 9.5 Hz, 1H).	440.1	B	C
I-1748		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.39 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 2.43 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.21 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 1.93 (td, J = 12.4, 7.9 Hz, 1H), 1.80 - 1.41 (m, 12H), 1.41 - 1.21 (m, 2H), 1.02 (dq, J = 15.6, 8.0 Hz, 1H).	440.15	D	

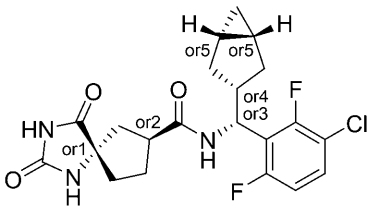
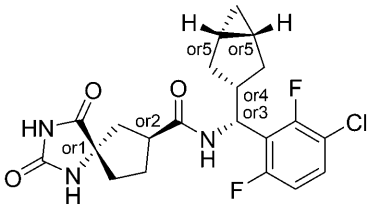
【表１－４８０】

I-1749		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.45 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.53 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.81 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 2.90 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 2.23 - 2.03 (m, 3H), 1.97 - 1.86 (m, 3H), 1.63 (s, 2H), 1.28 (dd, J = 42.4, 10.4 Hz, 5H), 0.29 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 0.14 (s, 1H).	438.15	A	B
I-1750		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.51 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 10.3, 7.4 Hz, 1H), 2.94 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.26 - 2.05 (m, 2H), 2.05 -1.86 (m, 3H), 1.85 - 1.69 (m, 3H), 1.44 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 1.34 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 1.30 - 1.15 (m, 2H), 0.29 (td, J = 7.8, 4.7 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	438.15	E	

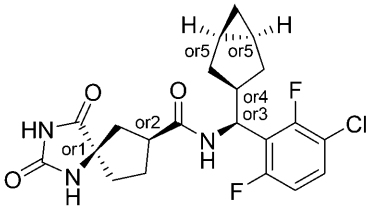
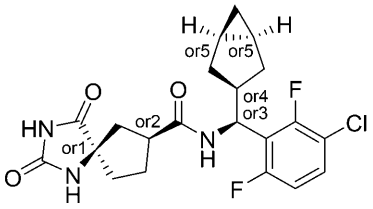
【表１－４８１】

I-1751		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.49 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.73 (dd, J = 12.0, 7.6 Hz, 1H), 2.94 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 2.83 (s, 1H), 2.22 (s, 1H), 2.12 (dd, J = 13.4, 8.2 Hz, 1H), 1.97 - 1.68 (m, 5H), 1.67 -1.56 (m, 1H), 1.44 - 1.26 (m, 3H), 1.24 (s, 1H), 0.96 (dd, J = 13.3, 5.2 Hz, 1H), 0.65 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 0.06 (d, J = 4.4 Hz, 1H).	438.15	E	
I-1752		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.51 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.77 - 7.43 (m, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.82 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.10 - 2.84 (m, 1H), 2.11 (dq, J = 14.8, 9.0, 6.7 Hz, 3H), 1.89 (td, J = 9.7, 9.2, 4.5 Hz, 3H), 1.73 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 1.62 (q, J = 7.4, 6.1 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 1.34 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 1.29 - 1.16 (m, 2H), 0.30 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 0.14 (d, J = 4.3 Hz, 1H).	438.15	E	

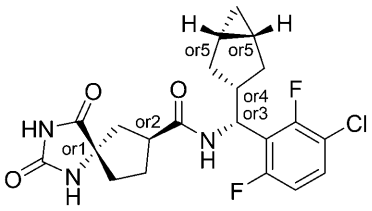
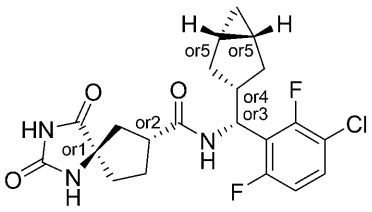
【表１－４８２】

I-1753		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.54 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.74 (dd, J = 12.0, 7.6 Hz, 1H), 2.98 - 2.89 (m, 1H), 2.84 (s, 1H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 1.99 (dd, J = 13.7, 7.5 Hz, 2H), 1.93 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 1.78 (d, J = 10.1 Hz, 4H), 1.47 - 1.25 (m, 3H), 0.96 (dd, J = 13.5, 5.2 Hz, 1H), 0.66 (s, 1H), 0.06 (d, J = 4.3 Hz, 1H).	438.2	E	
I-1754		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.45 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.28 - 7.03 (m, 1H), 4.81 (dd, J = 10.4, 7.3 Hz, 1H), 2.90 (dq, J = 16.7, 7.9 Hz, 1H), 2.23 - 2.05 (m, 3H), 2.04 - 1.83 (m, 3H), 1.80 (s, 1H), 1.72 - 1.56 (m, 2H), 1.52 -1.39 (m, 1H), 1.38 - 1.30 (m, 2H), 1.30 - 1.17 (m, 2H), 0.38 - 0.24 (m, 1H), 0.14 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	438.2	D	

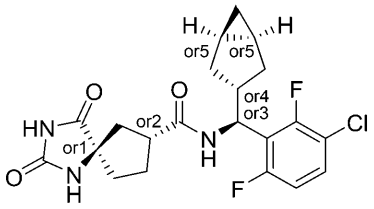
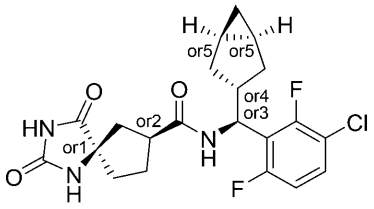
【表１－４８３】

I-1755		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.43 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.74 (dd, J = 12.1, 7.5 Hz, 1H), 2.99 - 2.79 (m, 2H), 2.29 - 2.17 (m, 1H), 1.99 (dd, J = 13.0, 10.2 Hz, 3H), 1.87 - 1.72 (m, 3H), 1.69 - 1.62 (m, 1H), 1.47 - 1.28 (m, 3H), 1.24 (s, 1H), 0.96 (dd, J = 13.6, 5.4 Hz, 1H), 0.67 (t, J = 6.5 Hz, 1H), 0.07 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	438.15	D	
I-1756		(400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s, 1H), 8.43 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.55 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.72 (dd, J = 12.1, 7.5 Hz, 1H), 2.94 - 2.85 (m, 2H), 2.23 (d, J = 12.6 Hz, 1H), 2.15- 2.05 (m, 1H), 2.03- 1.74 (m, 4H), 1.64 (dd, J = 11.0, 5.5 Hz, 2H), 1.50 - 1.19 (m, 3H), 1.00- 0.92 (m, 1H), 0.66 (s, 1H), 0.06 (d, J = 4.2 Hz, 1H).	438.15	D	

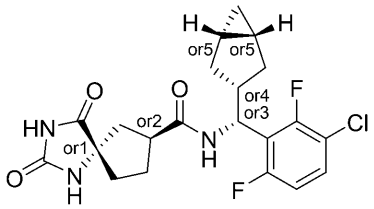
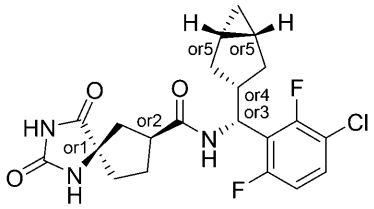
【表１－４８４】

I-1757		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.50 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.12 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 4.82 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 2.99 - 2.90 (m, 1H), 2.18- 2.05 (m, 3H), 1.89 (s, 3H), 1.73 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 1.65 - 1.59 (m, 1H), 1.44 (s, 1H), 1.34 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 1.29 - 1.19 (m, 2H), 0.28 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 0.14 (d, J = 4.4 Hz, 1H).	438.15	B	B
I-1758		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.49 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 4.73 (dd, J = 12.1, 7.5 Hz, 1H), 2.94 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.83 (s, 1H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.12 (dd, J = 13.3, 8.2 Hz, 1H), 2.02 - 1.84 (m, 3H), 1.83 - 1.68 (m, 2H), 1.67 -1.55 (m, 1H), 1.38 (dd, J = 13.8, 5.1 Hz, 1H), 1.32 (s, 1H), 1.25 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 0.96 (dd, J = 13.6, 5.3 Hz, 1H), 0.70 - 0.60 (m, 1H), 0.10- 0.03 (m, 1H).	438.1	B	C

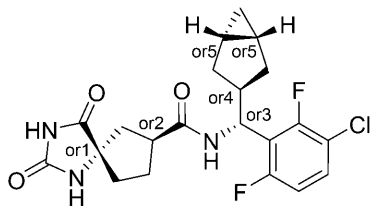
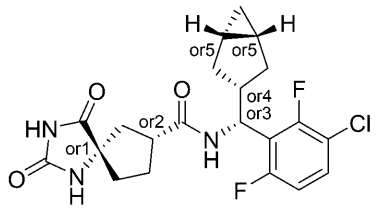
【表１－４８５】

I-1759		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.51 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.88 - 4.79 (m, 1H), 2.94 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.24 - 2.06 (m, 2H), 2.05 - 1.85 (m, 3H), 1.84 - 1.70 (m, 3H), 1.50- 1.39 (m, 1H), 1.37 - 1.31 (m, 2H), 1.29- 1.19 (m, 2H), 0.29 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	438.2	B	
I-1760		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.45 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.52 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.11 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 4.82 (dd, J = 10.4, 7.3 Hz, 1H), 2.89 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 2.22 - 2.06 (m, 2H), 1.99 (qd, J = 9.8, 9.4, 4.7 Hz, 3H), 1.78 (dd, J = 13.4, 7.5 Hz, 2H), 1.66 (dd, J = 10.7, 5.1 Hz, 1H), 1.44 (t, J = 10.8 Hz, 1H), 1.33 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.30 - 1.19 (m, 3H), 0.29 (td, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 0.15 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	438.15	A	B

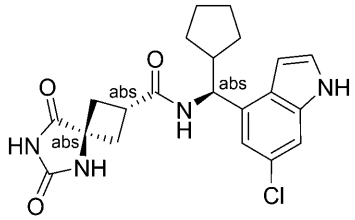
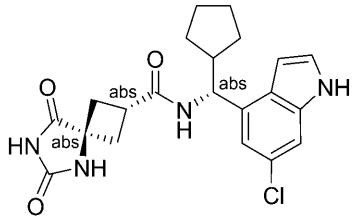
【表１－４８６】

I-1761		(400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s, 1H), 8.43 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.72 (dd, J = 12.1, 7.4 Hz, 1H), 3.01-2.73 (m, 2H), 2.21 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 2.10 (dd, J = 13.1, 10.2 Hz, 1H), 2.05 - 1.73 (m, 4H), 1.64 (dt, J = 9.5, 4.4 Hz, 2H), 1.48-1.19 (m, 3H), 0.96 (dd, J = 13.6, 5.5 Hz, 1H), 0.70 - 0.60 (m, 1H), 0.10- 0.03 (m, 1H).	438.15	B	B
I-1762		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.43 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.17 - 7.08 (m, 1H), 4.74 (dd, J = 12.1, 7.5 Hz, 1H), 2.88 (s, 2H), 2.23 (dq, J = 14.5, 7.8, 6.9 Hz, 1H), 2.06 - 1.94 (m, 3H), 1.87 - 1.72 (m, 3H), 1.69 - 1.61 (m, 1H), 1.43 - 1.30 (m, 2H), 1.26 (s, 1H), 1.24 (s, 1H), 0.96 (dd, J = 13.7, 5.4 Hz, 1H), 0.71 - 0.61 (m, 1H), 0.07 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	438.1	A	B

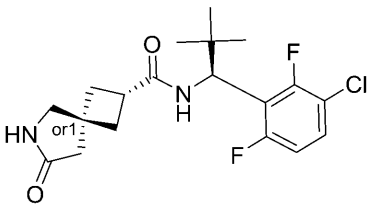
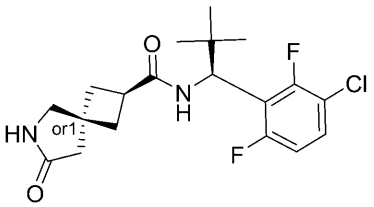
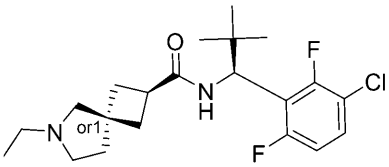
【表１－４８７】

I-1763		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.45 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.11 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.97 - 4.72 (m, 1H), 2.89 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 2.25 -2.08 (m, 2H), 1.99 (p, J = 9.3 Hz, 3H), 1.78 (dd, J = 12.8, 7.2 Hz, 2H), 1.71 - 1.58 (m, 1H), 1.46 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 1.38 - 1.30 (m, 2H), 1.30 - 1.13 (m, 2H), 0.29 (q, J = 7.4 Hz, 1H), 0.15 (d, J = 4.3 Hz, 1H).	438.2	E	
I-1764		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.59 - 7.49 (m, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.75 (dd, J = 12.1, 7.5 Hz, 1H), 2.94 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.84 (s, 1H), 2.22 (dt, J = 14.2, 8.3 Hz, 1H), 2.06 - 1.87 (m, 3H), 1.87 - 1.71 (m, 4H), 1.39 (dd, J = 13.7, 5.1 Hz, 1H), 1.32 (s, 1H), 1.24 (s, 1H), 0.96 (dd, J = 13.6, 5.4 Hz, 1H), 0.66 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 0.10 - 0.03 (m, 1H).	438.1	C	

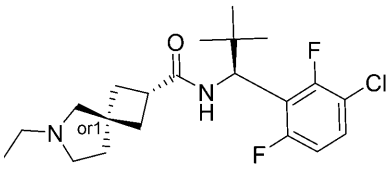
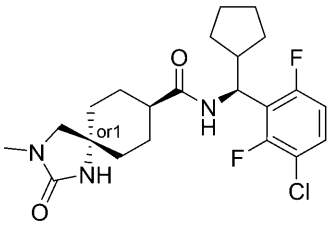
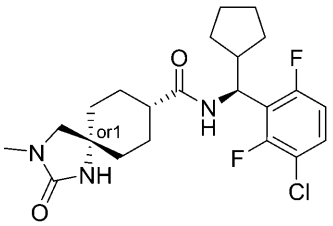
【表１－４８８】

I-1765		(400 MHz, DMSO-d6) 11.19 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.38 - 7.26 (m, 2H), 6.99 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 4.97 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 24.7, 12.0, 9.3 Hz, 2H), 2.40 (h, J = 8.3 Hz, 1H), 2.22 (ddd, J = 12.4, 8.9, 4.5 Hz, 1H), 2.10 (ddd, J = 12.8, 8.9, 4.4 Hz, 1H), 1.74 (dd, J = 13.3, 6.4 Hz, 1H), 1.52 (m, 3H), 1.48 - 1.32 (m, 2H), 1.27 (dd, J = 13.4, 6.0 Hz, 1H), 1.20 - 1.04 (m, 1H).	415.1	B	D
I-1766		(400 MHz, DMSO-d6) 11.19 (s, 1H), 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.39 - 7.24 (m, 2H), 6.99 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.62 (s, 1H), 4.97 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.3 Hz, 1H), 2.73 - 2.57 (m, 2H), 2.40 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.23 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.15 - 2.05 (m, 1H), 1.78 - 1.69 (m, 1H), 1.65 - 1.34 (m, 5H), 1.30 - 1.22 (m, 1H), 1.08 (m, 1H).	415.1	E	

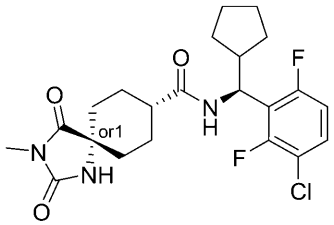
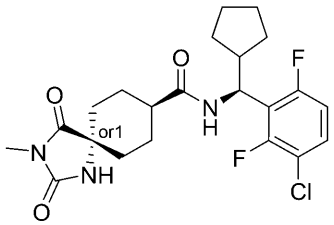
【表１－４８９】

I-1767		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.18 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 3.11 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 2.28 (s, 2H), 2.10 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 2.02 (q, J = 9.8, 8.5 Hz, 2H), 0.92 (s, 9H).	385.1	B	
I-1768		(400 MHz, DMSO-d6) 8.01 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.61 - 7.49 (m, 2H), 7.15 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H),3.30 - 3.26 (m, 2H),3.19 (t, J = 8.5 Hz, 1H), 2.10 (d, J = 9.0 Hz, 4H), 1.98 (d, J = 15.9 Hz, 2H), 0.92 (s, 9H).	385.15	B	
I-1769		(400 MHz, DMSO-d6) 7.97 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.16 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 2.44 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 2.37 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 2.31 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 2.10 (dd, J = 10.7, 8.4 Hz, 1H), 2.03 - 1.89 (m, 3H), 1.85 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 0.96 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 5.7 Hz, 9H).	399.15	D	

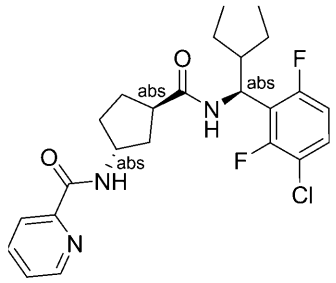
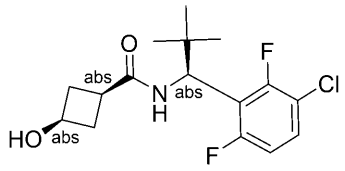
【表１－４９０】

I-1770		(400 MHz, DMSO-d6) 7.94 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.31 - 3.18 (m, 2H), 3.12 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.37 (tt, J = 7.2, 3.6 Hz, 4H), 2.00 (ddd, J = 36.5, 8.6, 2.6 Hz, 4H), 1.69 - 1.61 (m, 2H), 1.00 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (s, 9H).	399.15	C	
I-1771		(400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.17 -7.05 (m, 1H), 6.40 (s, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.6 Hz, 1H), 3.07 (s, 2H), 2.58 (s, 3H), 2.46 -2.35 (m, 1H), 2.16 (s, 1H), 1.91 (q, J = 5.7, 5.2 Hz, 1H), 1.79 -1.42 (m, 8H), 1.45 - 1.31 (m, 4H), 1.31 -1.20 (m, 2H), 1.00 (t, J = 10.1 Hz, 1H).	440.15	C	
I-1772		(400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 4.82 (dd, J = 11.2, 7.4 Hz, 1H), 3.01 (s, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.42 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.13 (dq, J = 10.7, 6.6, 5.3 Hz, 1H), 2.00- 1.85 (m, 1H), 1.81-1.43 (m, 10H), 1.43 - 1.21 (m, 4H), 1.02 (dq, J = 14.7, 7.8 Hz, 1H).	440.2	D	

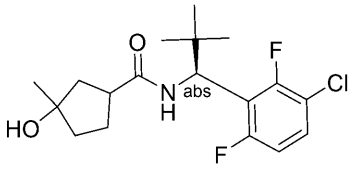
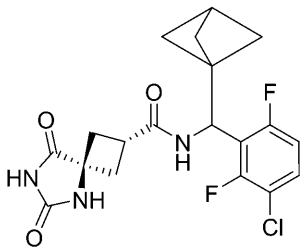
【表１－４９１】

I-1773		(400 MHz, DMSO-d6) 8.37 - 8.19 (m, 2H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.2, 7.5 Hz, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.46 - 2.35 (m, 1H), 2.31 (s, 1H), 1.90 (ddd, J = 35.1, 19.1, 11.2 Hz, 5H), 1.67 (s, 1H), 1.55 (d, J = 22.3 Hz, 4H), 1.50 - 1.09 (m, 5H), 1.03 (d, J = 8.3 Hz, 1H).	454.2	B	C
I-1774		(400 MHz, DMSO-d6) 8.66 (s, 1H), 8.26 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.83 (dd, J = 11.2, 7.5 Hz, 1H), 2.81 (s, 3H), 2.42 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.23 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 1.93 (td, J = 12.2, 7.3 Hz, 1H), 1.82 - 1.42 (m, 12H), 1.40 -1.22 (m, 2H), 1.02 (dq, J = 15.7, 8.0 Hz, 1H).	453.2	D	

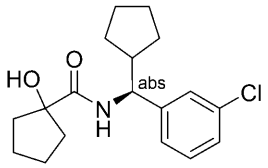
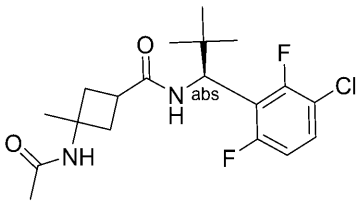
【表１－４９２】

I-1775		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.66 - 8.61 (m, 1H), 8.52 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.06 - 7.94 (m, 2H), 7.62 - 7.57 (m, 1H), 7.53 (app td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.12 (app td, J = 9.6, 1.4 Hz, 1H), 4.82 (app dt, J = 25.3, 12.7 Hz, 1H), 4.31 (app sxt, J = 6.8 Hz, 1H), 3.00 - 2.84 (m, 1H), 2.48 - 2.34 (m, 1H), 2.01 - 1.78 (m, 5H), 1.69 - 1.42 (m, 6H), 1.40 - 1.21 (m, 2H), 1.07 - 0.94 (m, 1H).	462.4	C	
I-1776		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.6, 5.6 Hz, 1H), 7.10 (app. br. t, J = 8.7 Hz, 1H), 5.05 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.01 (重複する br. s, 1H), 3.92 - 3.81 (m, 1H), 2.65 - 2.54 (m, 1H), 2.27 - 2.11 (m, 2H), 1.86 (dd, J = 18.7, 9.7 Hz, 1H), 1.76 (app. q, J = 9.5 Hz, 1H), 0.87 (s, 9H). 単一の立体異性体。	332.2	D	

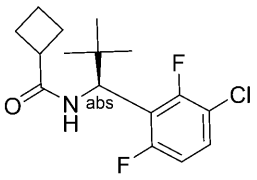
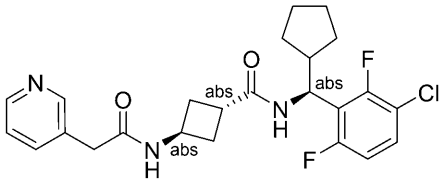
【表１－４９３】

I-1777		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.33 (d, J = 8.8 Hz, 0.5 H), 8.29 (d, J = 8.7 Hz, 0.5 H), 7.57 (app td, J = 8.6, 5.6 Hz, 1H), 7.15 (app t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.06 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.89 (埋没した br s, 0.5H), 4.88 (重複する s, 1H), 2.94 - 2.82 (m, 1H), 1.91 - 1.57 (m, 5H), 1.52 - 1.40 (m, 1H), 1.23 (s, 1.5H), 1.22 (s, 1.5H), 0.93 (s, 9H). 立体異性体の混合物。	360.4	D	
I-1778		(400 MHz, DMSO-d6) - 10.39 (br. s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.34 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.6 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.4, 1.0 Hz, 1H), 5.18 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 3.24 (app. p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.73 - 2.64 (m, 1H), 2.61 - 2.54 (m, 1H), 2.48 (s, 1H), 2.23 (dd, J = 9.8, 4.7 Hz, 1H), 2.17 (dd, J = 10.1, 4.8 Hz, 1H), 1.72 - 1.64 (m, 6H).	410.3	A	B

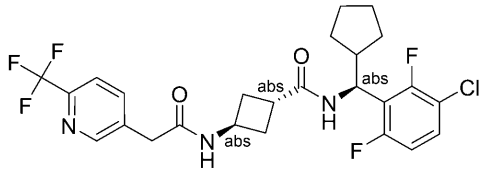
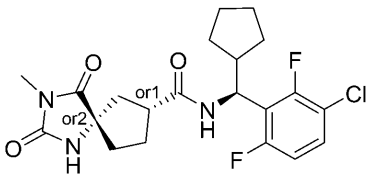
【表１－４９４】

I-1779		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.49 - 7.46 (m, 1H), 7.33 - 7.29 (m, 2H), 7.28 - 7.24 (m, 1H), 5.26 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 4.58 - 4.51 (m, 1H), 2.43 - 2.32 (m, 1H), 1.93 - 1.79 (m, 2H), 1.78 - 1.66 (m, 3H), 1.66 - 1.38 (m, 8H), 1.31 - 1.19 (m, 2H), 1.12 - 1.01 (m, 1H).	322.3	E	
I-1780		NMR (400 MHz, DMSO_d6) - 8.12 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.56 (td, J = 8.9, 5.6 Hz, 1H), 7.14 (app. br. t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.32 - 2.25 (重複する m, 1H), 2.19 (app. t, J = 9.6 Hz, 1H), 2.07 - 2.03 (埋没した m, 1H), 2.02 - 1.94 (重複する m, J = 15.0, 7.6 Hz, 1H), 1.72 (s, 3H), 1.36 (s, 3H), 0.92 (s, 9H). 2 つのジアステレオマーの 2:1 混合物。主要なものを記載。	387.3	D	

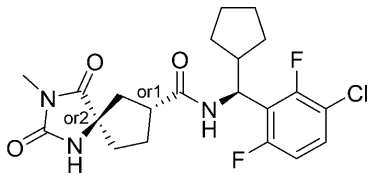
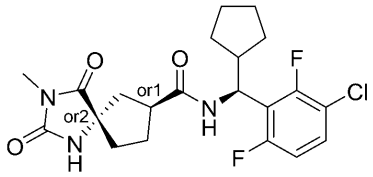
【表１－４９５】

I-1781		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 7.86 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.51 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.09 (app. br. t, J = 8.5 Hz, 1H), 5.06 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.20 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.10 - 1.87 (m, 4H), 1.87 - 1.75 (m, 1H), 1.74 - 1.63 (m, 1H), 0.87 (s, 9H).	316.1	D	
I-1782		(400 MHz, DMSO-d6) 8.46-8.30 (m, 4H), 7.64 (dt, J = 7.9, 2.0 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.32 (ddd, J = 7.8, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.22 (h, J = 7.8 Hz, 1H), 3.40 (s, 2H), 2.95 (td, J = 9.0, 4.4 Hz, 1H), 2.40 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.29 (ddt, J = 11.8, 7.9, 3.7 Hz, 1H), 2.20-2.07 (m, 2H), 2.02 (dd, J = 19.0, 9.8 Hz, 1H), 1.93-1.83 (m, 1H), 1.66-1.43 (m, 4H), 1.40-1.20 (m, 2H), 1.07 (m, 1H).	462.1	B	B

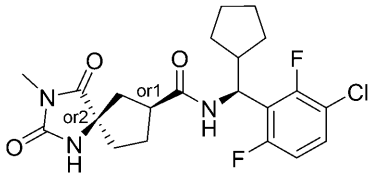
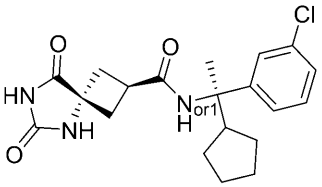
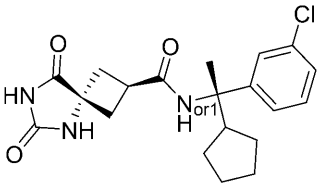
【表１－４９６】

I-1783		(400 MHz, DMSO-d6) 8.61 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 8.2, 2.1 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.24 (h, J = 7.8 Hz, 1H), 3.56 (s, 2H), 2.95 (td, J = 9.1, 4.5 Hz, 1H), 2.40 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.29 (tt, J = 7.9, 3.8 Hz, 1H), 2.14 (dtd, J = 16.9, 9.0, 8.5, 3.0 Hz, 2H), 2.04 (dd, J = 19.1, 9.7 Hz, 1H), 1.89 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 1.64-1.43 (m, 4H), 1.40-1.20 (m, 2H), 1.00 (dd, J = 12.6, 7.7 Hz, 1H).	530.1	B	C
I-1784		(400 MHz, DMSO-d6) 8.58 (s, 1H), 8.52 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.82 (dd, J = 11.2, 7.4 Hz, 1H), 2.94 (t, J = 8.5 Hz, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.43 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.14 (dd, J = 13.2, 10.3 Hz, 1H), 1.94 (ddd, J = 29.3, 12.4, 8.0 Hz, 4H), 1.77 - 1.41 (m, 6H), 1.41 - 1.11 (m, 2H), 1.07 - 0.94 (m, 1H).	440.15	B	B

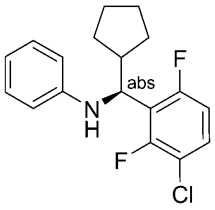
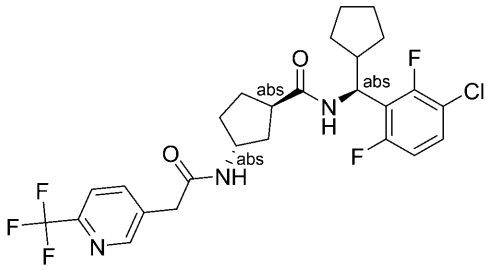
【表１－４９７】

I-1785		(400 MHz, DMSO-d6) 8.68 - 8.39 (m, 2H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.17 - 7.07 (m, 1H), 4.83 (dd, J = 11.2, 7.4 Hz, 1H), 2.98 - 2.89 (m, 1H), 2.81 (s, 3H), 2.43 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.07 - 1.90 (m, 4H), 1.87 - 1.71 (m, 2H), 1.69 - 1.39 (m, 5H), 1.41 - 1.17 (m, 2H), 1.07 - 0.95 (m, 1H).	440.1	B	
I-1786		(400 MHz, DMSO-d6) 8.57 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.80 (s, 3H), 2.41 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.02 (dd, J = 13.4, 8.0 Hz, 2H), 1.96 - 1.86 (m, 2H), 1.86 - 1.69 (m, 3H), 1.64 - 1.43 (m, 4H), 1.40 - 1.22 (m, 2H), 1.00 (dq, J = 15.1, 7.9 Hz, 1H).	440.15	D	

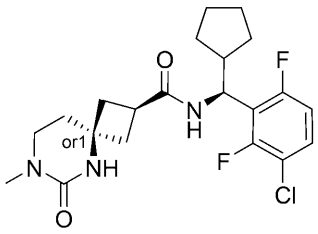
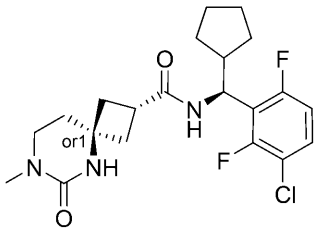
【表１－４９８】

I-1787		(400 MHz, DMSO-d6) 8.57 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.82 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.81 (s, 3H), 2.41 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.17 - 2.06 (m, 1H), 1.91 (tt, J = 13.0, 5.1 Hz, 4H), 1.81 - 1.70 (m, 1H), 1.70 - 1.40 (m, 5H), 1.40 - 1.20 (m, 2H), 1.07 - 0.96 (m, 1H).	440.15	C	
I-1788		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.32 - 7.26 (m, 1H), 7.25 -7.18 (m, 3H), 3.23 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (ddd, J = 24.9, 12.0, 9.2 Hz, 2H), 2.19 (dddd, J = 17.0, 15.1, 9.0, 4.4 Hz, 3H), 1.64 (s, 3H), 1.61 - 1.36 (m, 5H), 1.35 -1.23 (m, 2H), 1.22 - 1.09 (m, 1H).	390.05	D	
I-1789		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.30 (td, J = 7.6, 1.1 Hz, 1H), 7.30 -7.17 (m, 3H), 3.23 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (ddd, J = 24.9, 11.9, 9.2 Hz, 2H), 2.27- 2.11 (m, 3H), 1.64 (s, 3H), 1.56 (s, 1H), 1.45 (ddd, J = 24.3, 11.0, 6.9 Hz, 4H), 1.35 - 1.23 (m, 2H), 1.23 -1.09 (m, 1H).	390.05	E	

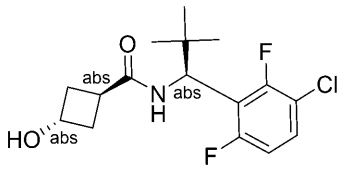
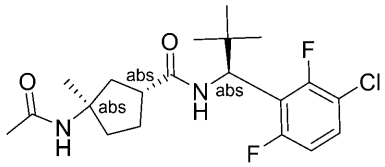
【表１－４９９】

I-1790		(400 MHz, DMSO-d6) 7.53 - 7.46 (m, 1H), 7.12 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 7.01 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 6.54 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 6.47 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.12 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.42 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 2.04 (td, J = 11.8, 7.1 Hz, 1H), 1.82 - 1.31 (m, 7H), 1.08 (p, J = 8.3 Hz, 1H).	322.1	E	
I-1791		(400 MHz, DMSO-d6) 8.63 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 8.0, 2.1 Hz, 1H), 7.85 (dd, J = 8.1, 0.8 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 11.2, 7.4 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.4 Hz, 1H), 3.57 (s, 2H), 2.85 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.42 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 1.90 (dt, J = 12.9, 7.2 Hz, 2H), 1.81 (qd, J = 9.2, 7.8, 4.3 Hz, 2H), 1.68 - 1.20 (m, 9H), 1.00 (dd, J = 12.6, 7.8 Hz, 1H).	544.2	B	D

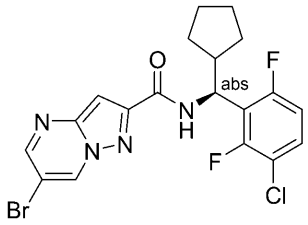
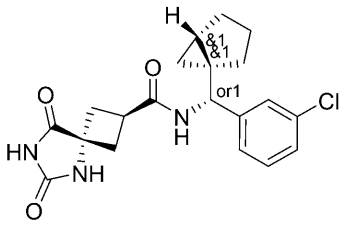
【表１－５００】

I-1792		(400 MHz, DMSO-d6)8.27 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.54 (s, 1H), 4.83 (dd, J = 11.2, 7.5 Hz, 1H), 3.14 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 2.72 (s, 3H), 2.41 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 2.26 (t, J = 11.0 Hz, 1H), 2.16 (t, J = 10.1 Hz, 1H), 2.11-2.01 (m, 2H), 2.00 (s, 1H), 1.94-1.85 (m, 1H), 1.80 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 1.64-1.51 (m, 4H), 1.49 (dd, J = 15.5, 7.5 Hz, 1H), 1.38-1.30 (m, 1H), 1.00 (s, 1H).	426.15	C	
I-1793		(400 MHz, DMSO-d6)8.37 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 6.70 (s, 1H), 4.82 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.04 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.94 (dq, J = 10.0, 4.9 Hz, 1H), 2.71 (s, 3H), 2.41 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.25 (t, J = 11.0 Hz, 1H), 2.15 (q, J = 14.3, 12.8 Hz, 2H), 2.03 (d, J = 12.6 Hz, 1H), 1.90 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 1.74 (dd, J = 7.4, 4.7 Hz, 2H), 1.59 (s, 3H), 1.51 (dt, J = 16.6, 9.3 Hz, 1H), 1.38-1.30 (m, 1H), 1.24 (s, 1H), 1.00 (s, 1H).	426.15	B	B

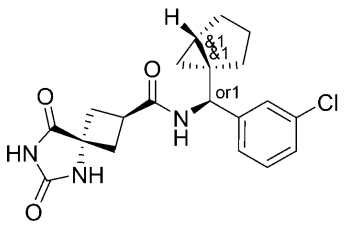
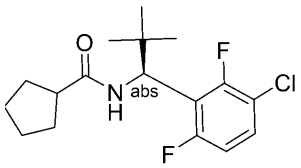
【表１－５０１】

I-1794		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.02 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.56 (app td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.19 - 7.08 (m, 1H), 5.09 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.98 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 4.18 (app sext, J = 6.8 Hz, 1H), 3.04 (tt, J = 9.8, 3.6 Hz, 1H), 2.24 (ddt, J = 11.4, 7.4, 3.7 Hz, 1H), 2.10 (ddt, J = 11.1, 7.3, 3.6 Hz, 1H), 2.04 - 1.87 (m, 2H), 0.92 (s, 9H).	332.1	D	
I-1795		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.07 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.68 (br s, J = 8.7 Hz, 1H), 7.56 (app td, J = 8.8, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (app t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 2.93 (app p, J = 8.8 Hz, 1H), 1.99 - 1.81 (m, 3H), 1.77 - 1.49 (重複する m, 3H), 1.71 (埋没した s, 3H), 1.28 (s, 3H), 0.93 (s, 9H).	401.5	D	

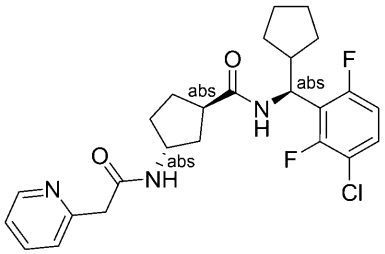
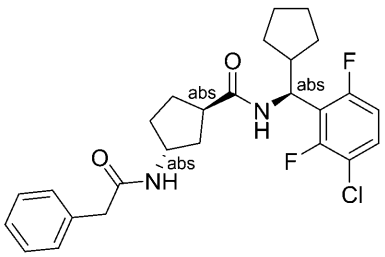
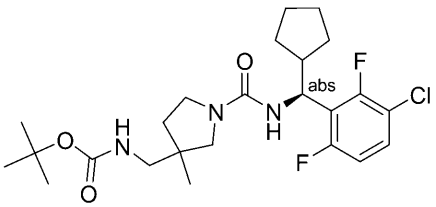
【表１－５０２】

I-1796		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 9.61 (dd,J= 2.2, 0.9 Hz, 1H), 8.72 (d,J= 2.2 Hz, 1H), 8.69 (d,J= 8.1 Hz, 1H), 7.58 (td,J= 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.19 (重複する d,J= 0.8 Hz, 1H), 7.18 (重複する td,J= 9.5, 1.5 Hz, 1H), 5.13 (dd,J= 11.1, 8.2 Hz, 1H), 2.73 - 2.57 (m, 1H), 2.04 - 1.91 (m, 1H), 1.71 - 1.47 (m, 5H), 1.46 - 1.23 (m, 2H). 一部ギ酸塩。若干の脂肪族不純物。	469.3	E	
I-1797		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.64 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.6 Hz, 0.4H, エピマーA), 8.22 (d, J = 8.8 Hz, 0.6H, エピマーB), 7.38 - 7.31 (m, 2H), 7.30 - 7.23 (m, 2H), 4.91 (d, J = 8.7 Hz, 0.6H, エピマーB), 4.83 (d, J = 8.6 Hz, 0.4H, エピマーA), 3.30 - 3.13 (m, 1H, 残留水と重複), 2.76 - 2.61 (m, 2H), 2.31 - 2.12 (m, 2H), 1.77 - 1.27 (m, 6H), 0.55 - 0.46 (m, 1H), 0.43 - 0.35 (m, 1H).	388.3	E	

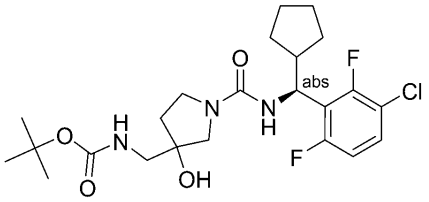
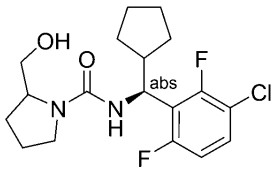
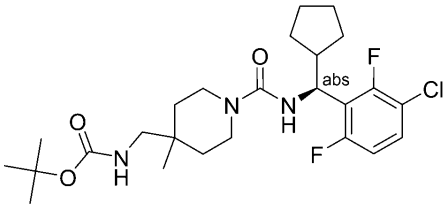
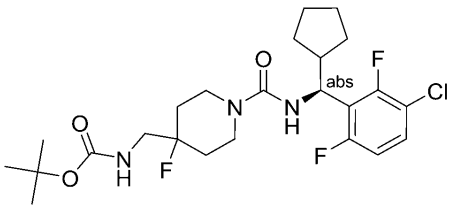
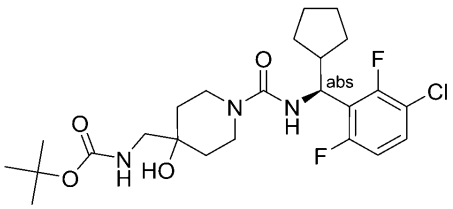
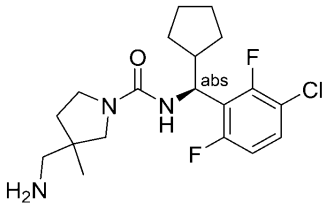
【表１－５０３】

I-1798		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.64 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.7 Hz, 0.4H, エピマーA), 8.22 (d, J = 8.8 Hz, 0.6H, エピマーB), 7.37 - 7.31 (m, 2H), 7.30 - 7.24 (m, 2H), 4.91 (d, J = 8.7 Hz, 0.6H, エピマーB), 4.83 (d, J = 8.6 Hz, 0.4H, エピマーA), 3.26 - 3.13 (m, 1H, 残留水と重複), 2.76 - 2.62 (m, 2H), 2.29 - 2.14 (m, 2H), 1.77 - 1.27 (m, 6H), 0.55 - 0.46 (m, 1H), 0.43 - 0.35 (m, 1H).	388.3	C	
I-1799		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.02 (d,J= 8.9 Hz, 1H), 7.55 (td,J= 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (app. br. t,J= 9.4 Hz, 1H), 5.09 (d,J= 8.7 Hz, 1H), 2.81 (app. p,J= 7.8 Hz, 1H), 1.80 - 1.72 (m, 1H), 1.71 - 1.38 (m, 7H), 0.93 (s, 9H).	330.3	D	

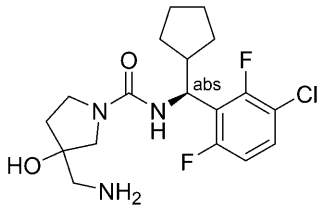
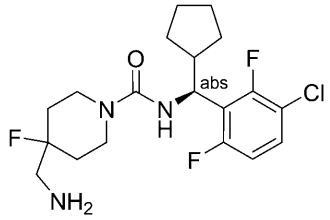
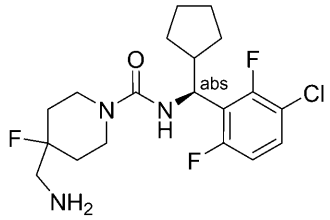
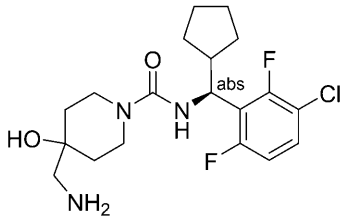
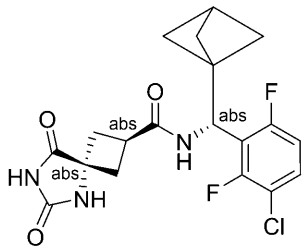
【表１－５０４】

I-1800		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.46 (app br d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.71 (app td, J = 8.9, 1.3 Hz, 1H), 7.52 (app td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.26 - 7.19 (m, 1H), 7.16 - 7.07 (m, 1H), 4.81 (dd, J = 11.0, 7.6 Hz, 1H), 4.09 - 3.96 (m, 1H), 3.58 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 3.55 (d, J = 14.5 Hz, 1H), 2.91 - 2.77 (m, 1H), 2.46 - 2.35 (m, 1H), 1.97 - 1.72 (m, 4H), 1.70 - 1.20 (m, 9H), 1.06 - 0.92 (m, 1H).	476.4	B	C
I-1801		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.36 (d,J= 7.5 Hz, 1H), 8.02 (d,J= 7.0 Hz, 1H), 7.52 (td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.31 - 7.18 (m, 5H), 7.11 (td,J= 9.6, 1.5 Hz, 1H), 4.81 (dd,J= 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.04 - 3.95 (m, 1H), 3.36 (s, 2H), 2.88 - 2.79 (m, 1H), 2.47 - 2.35 (m, 1H), 1.95 - 1.75 (m, 4H), 1.65 - 1.21 (m, 9H), 1.04 - 0.94 (m, 1H). 微量の不純物を含有。	475.5	B	C
I-1802			430.35	D	

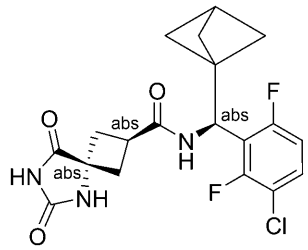
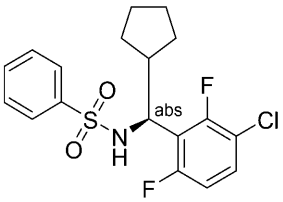
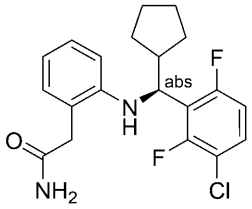
【表１－５０５】

I-1803			432.15	E	
I-1804			373.28	E	
I-1805				D	
I-1806				D	
I-1807				E	
I-1808				E	

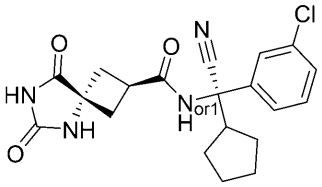
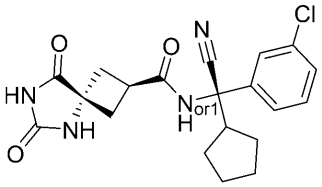
【表１－５０６】

I-1809				E	
I-1810				D	
I-1812				C	
I-1813				D	
I-1814				E	

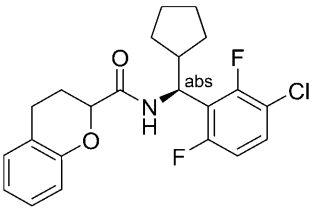
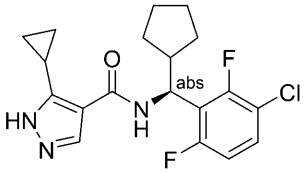
【表１－５０７】

I-1815				A	B
I-1816		(400 MHz, DMSO-d6) 8.49 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 - 7.54 (m, 2H), 7.49 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 7.44 - 7.33 (m, 3H), 6.95 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 4.26 (dd, J = 10.9, 7.0 Hz, 1H), 2.37 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 1.84 (dq, J = 12.6, 6.3 Hz, 1H), 1.56- 1.33 (m, 4H), 1.23 (dtd, J = 11.9, 7.4, 3.8 Hz, 1H), 1.16- 1.03 (m, 1H), 0.85 (p, J = 7.9 Hz, 1H).	384.05	E	
I-1817		(400 MHz, DMSO-d6) 7.69 - 7.63 (m, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.5, 1.6 Hz, 1H), 7.08 - 7.02 (m, 2H), 6.98 (td, J = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 6.54 (td, J = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.41 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.29 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 4.47 (dd, J = 10.1, 7.9 Hz, 1H), 3.31 (d, J = 3.5 Hz, 2H), 2.62 - 2.53 (m, 1H), 2.13 - 2.04 (m, 1H), 1.69 - 1.48 (m, 4H), 1.40 (tq, J = 13.4, 6.6, 5.4 Hz, 2H), 1.13 (dd, J = 12.4, 8.1 Hz, 1H).	379.15	E	

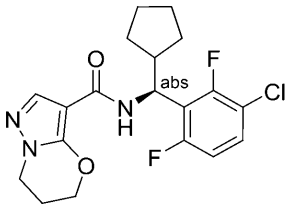
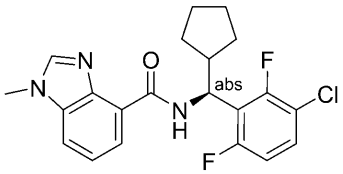
【表１－５０８】

I-1818		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.99 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 7.50 - 7.38 (m, 2H), 7.35 (dt, J = 4.6, 1.9 Hz, 2H), 3.34 (s, 1H), 2.68 (t, J = 10.9 Hz, 1H), 2.44 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 2.22 (dd, J = 12.8, 9.0 Hz, 2H), 2.05 (dd, J = 13.4, 8.0 Hz, 1H), 1.62 - 1.48 (m, 4H), 1.43 - 1.13 (m, 4H).	401.1	E	
I-1819		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.98 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 7.50 - 7.38 (m, 2H), 7.35 (dt, J = 4.3, 1.9 Hz, 2H), 3.24 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (t, J = 10.9 Hz, 1H), 2.55 (s, 1H), 2.43 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.27 - 2.17 (m, 2H), 2.15 - 1.98 (m, 1H), 1.71 - 1.38 (m, 5H), 1.30 - 1.13 (m, 2H).	401.1	D	

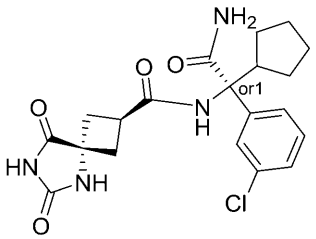
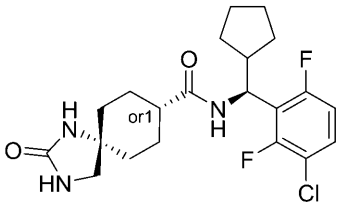
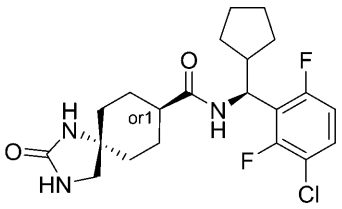
【表１－５０９】

I-1820		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 8.38 (d,J= 7.9 Hz, 0.5H), 8.21 (d,J= 8.0 Hz, 0.5H), 7.61-7.52 (m, 1H), 7.21 - 7.13 (m, 1H), 7.13 - 7.06 (m, 1H), 7.06 - 7.00 (m, 1H), 6.84 (d,J= 7.5 Hz, 1H), 6.82 - 6.77 (m, 1H), 4.91 (dt,J= 10.2, 8.3 Hz, 1H), 4.64 (dd,J= 5.0, 3.1 Hz, 0.5H), 4.62 (dd,J= 5.5, 3.2 Hz, 0.5H), 2.81 - 2.69 (m, 1H), 2.66 - 2.51 (m, 1H), 2.48 - 2.35 (m, 1H), 2.15 - 2.00 (m, 1H), 2.00 - 1.84 (m, 1.5H), 1.83 - 1.73 (m, 0.5H), 1.70 - 1.42 (m, 4H), 1.41 - 1.27 (m, 1.5H), 1.27 - 1.15 (m, 0.5H), 1.10 - 0.93 (m, 1H). 1:1 の比のジアステレオマー。	406.4	E	
I-1821		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 8.18 (d,J= 7.4 Hz, 1H), 8.14 (br s, 1H), 7.53 (td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.13 (td,J= 9.6, 1.4 Hz, 1H), 4.99 (dd,J= 11.2, 7.4 Hz, 1H), 2.63 - 2.52 (m, 2H), 2.06 - 1.97 (m, 1H), 1.71 - 1.44 (m, 4H), 1.43 - 1.24 (m, 2H), 1.05 (埋没した m, 2H), 1.02 (重複する dd,J= 6.5, 2.1 Hz, 2H), 0.76 (d,J= 6.0 Hz, 2H). 一部ギ酸塩。若干の脂肪族不純物。	378.4	E	

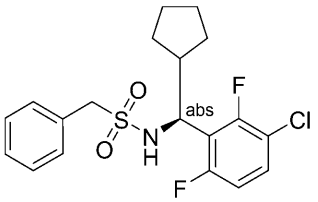
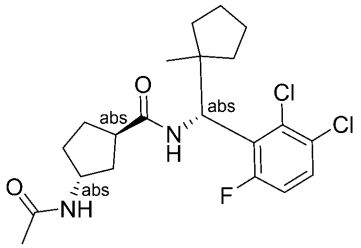
【表１－５１０】

I-1822		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 7.65 (s, 1H), 7.55 (td,J= 8.7, 5.7 Hz, 1H), 7.24 (d,J= 8.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 5.09 (dd,J= 10.4, 8.9 Hz, 1H), 4.51 - 4.41 (m, 2H), 4.07 (t,J= 6.0 Hz, 2H), 2.43 (dd,J= 17.5, 8.0 Hz, 1H), 2.26 - 2.16 (m, 2H), 1.96 - 1.82 (m, 1H), 1.69 - 1.46 (m, 4H), 1.44 - 1.23 (m, 2H), 1.09 - 1.04 (埋没した m, 1H). 一部ギ酸塩。若干の脂肪族不純物。	396.4	E	
I-1823		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 10.58 (d,J= 8.2 Hz, 1H), 8.52 (s, 1H), 7.84 (t,J= 8.0 Hz, 2H), 7.62 - 7.52 (m, 1H), 7.46 - 7.35 (m, 1H), 7.18 (t,J= 9.3 Hz, 1H), 5.36 - 5.27 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.67 - 2.52 (m, 1H), 2.00 - 1.85 (m, 1H), 1.72 - 1.37 (m, 8H). 脂肪族不純物が存在。約 85%の純度。	404.3	E	

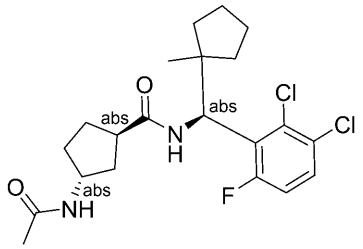
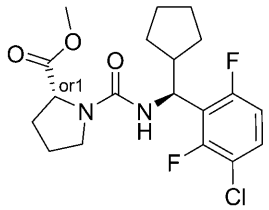
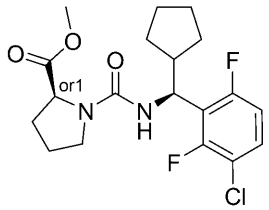
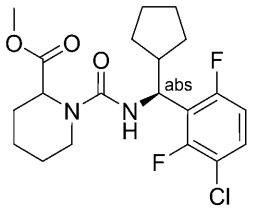
【表１－５１１】

I-1824		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 10.0 Hz, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 2.73 (s, 2H), 2.62 (s, 1H), 2.29 (d, J = 11.1 Hz, 2H), 1.59 (s, 1H), 1.42 (s, 8H).	419.15	E	
I-1825		(400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 4.82 (dd, J = 11.2, 7.5 Hz, 1H), 2.99 (d, J = 1.2 Hz, 2H), 2.41 (dd, J = 17.4, 8.8 Hz, 1H), 2.11 (td, J = 10.9, 4.3 Hz, 1H), 1.98- 1.85 (m, 1H), 1.76 - 1.41 (m, 10H), 1.39 - 1.19 (m, 4H), 1.02 (dq, J = 15.7, 7.9 Hz, 1H).	426.15	D	
I-1826		(400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.8, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.25 (s, 1H), 6.03 (s, 1H), 4.80 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 3.04 (s, 2H), 2.40 (s, 1H), 2.14 (s, 1H), 1.96- 1.85 (m, 1H), 1.65 (d, J = 13.1 Hz, 3H), 1.63 - 1.41 (m, 5H), 1.36 (dd, J = 16.4, 10.5 Hz, 4H), 1.25 (d, J = 11.4 Hz, 2H), 1.01 (d, J = 9.4 Hz, 1H).	424.05	D	

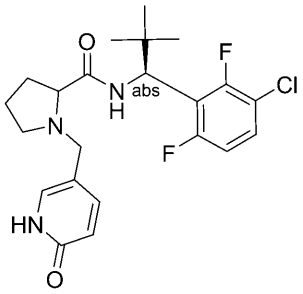
【表１－５１２】

I-1827		(400 MHz, DMSO-d6) 7.91 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.30- 7.21 (m, 3H), 7.19 - 7.10 (m, 3H), 4.42 (dd, J = 10.7, 7.7 Hz, 1H), 4.26 - 4.07 (m, 2H), 2.39 (p, J = 8.6 Hz, 1H), 1.92 (dp, J = 12.3, 6.8, 5.8 Hz, 1H), 1.69 -1.34 (m, 5H), 1.32 - 1.19 (m, 1H), 0.92 (dq, J = 12.2, 8.0 Hz, 1H).	422	E	
I-1828		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.97 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 2.96 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.94 - 1.75 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.69 (dt, J = 14.4, 7.5 Hz, 1H), 1.60 (s, 8H), 1.37 (q, J = 7.5, 6.7 Hz, 2H), 1.25 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	429.05	B	C

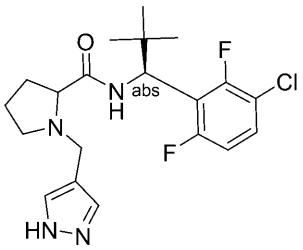
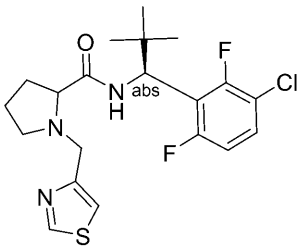
【表１－５１３】

I-1829		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.97 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.01 - 1.71 (m, 6H), 1.60 (s, 7H), 1.40 (ddd, J = 28.5, 12.1, 6.6 Hz, 3H), 1.25 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	429.05	A	A
I-1830			401.29	E	
I-1831			401.29	E	
I-1832			415.24	E	

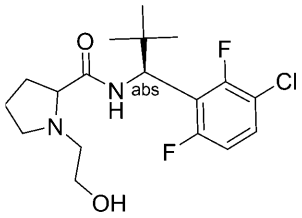
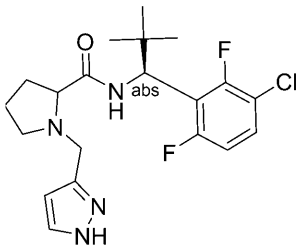
【表１－５１４】

I-1833		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 11.39 (br. s, 2H), 8.29 (br. d, J = 10.3 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 7.68 - 7.57 (m, 2H), 7.42 (dd, J = 9.4, 2.6 Hz, 1H), 7.30 - 7.28 (重複する m, 1H), 7.28 (重複する dd, J = 9.2, 2.4 Hz, 1H), 7.26 - 7.16 (m, 3H), 6.34 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.10 (dd, J = 23.6, 9.3 Hz, 1H), 5.15 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 3.56 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 3.45 - 3.26 (重複する m, 3H), 3.23 (重複する dd, J = 9.7, 4.2 Hz, 1H), 3.13 (dd, J = 9.9, 3.9 Hz, 1H), 3.04 - 2.88 (m, 2H), 2.45 - 2.32 (m, 2H), 2.19 - 2.07 (m, 1H), 2.07 - 1.94 (m, 4H), 1.83 - 1.61 (m, 1H), 1.60 - 1.51 (m, 1H), 1.51 - 1.37 (m, 1H), 0.89 (s, 9H), 0.86 (s, 9H).	438.4	E	

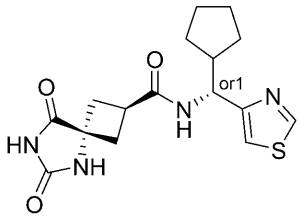
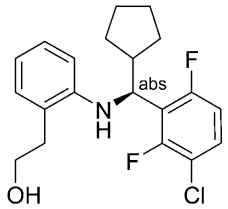
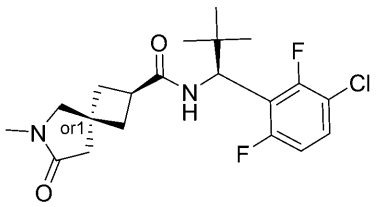
【表１－５１５】

I-1834		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.49 - 8.41 (m, 2H), 7.66 - 7.58 (m, 2H), 7.54 (s, 2H), 7.45 (s, 2H), 7.26 - 7.17 (m, 2H), 5.15 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.74 (d, J = 13.5 Hz, 1H), 3.60 (dd, J = 13.0, 1.9 Hz, 1H), 3.52 (br. d, J = 13.4 Hz, 1H), 3.40 (d, J = 13.2 Hz, 1H), 3.18 (dd, J = 9.9, 4.3 Hz, 1H), 3.09 (dd, J = 10.2, 4.0 Hz, 1H), 3.04 - 2.93 (m, 2H), 2.43 - 2.31 (m, 2H), 2.14 - 1.92 (m, 2H), 1.81 - 1.59 (m, 4H), 1.58 - 1.38 (m, 2H), 0.90 (s, 9H), 0.87 (s, 9H).	411.3	E	
I-1835		(400 MHz, d6-DMSO) - 9.10 (br s, 1H), 8.90 (d, J = 18.4 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 8.40 (br s, 1H), 7.64 - 7.56 (m, 3H), 7.48 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.21 (重複する app t, J = 8.0 Hz, 1H), 7.23 - 7.10 (m, 1H), 5.10 (s, 1H), 5.08 (s, 1H), 3.98 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 3.90 - 3.74 (m, 2H), 3.79 (重複する d, J = 12.1 Hz, 1H), 3.16 - 3.03 (m, 1H), 3.01 - 2.91 (m, 1H), 2.12 - 1.96 (m, 2H), 1.81 - 1.63 (m, 4H), 1.59 - 1.40 (m, 2H), 0.89 (s, 18H).	428.4	E	

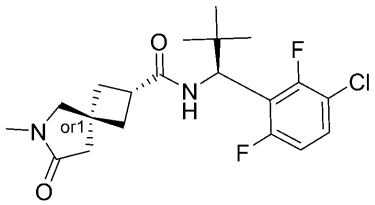
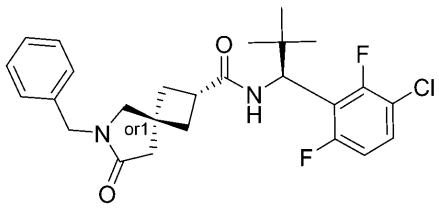
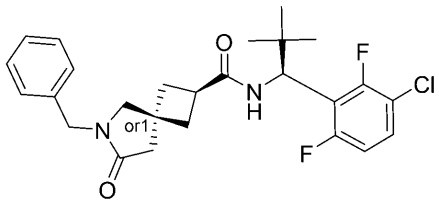
【表１－５１６】

I-1836		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.53 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 8.40 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.65 - 7.55 (m, 2H), 7.23 - 7.14 (m, 2H), 5.14 - 5.07 (m, 2H), 3.58 - 3.35 (m, 4H), 3.21 (s, 2H), 3.09 - 3.04 (m, 2H), 2.79 - 2.69 (m, 1H), 2.64 - 2.45 (重複する m, 5H), 2.43 - 2.27 (m, 2H), 2.13 - 1.89 (m, 2H), 1.83 - 1.56 (m, 4H), 1.54 - 1.39 (m, 2H), 0.93 (s, 9H), 0.90 (s, 9H).	377.3	E	
I-1837		(400 MHz, d6-DMSO) - 8.49 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 7.67 - 7.56 (m, 3H), 7.47 (d, J = 13.4 Hz, 1H), 7.26 - 7.13 (m, 2H), 6.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.11 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 3.72 (dd, J = 13.6, 4.3 Hz, 1H), 3.63 (d, J = 13.5 Hz, 1H), 3.56 (dd, J = 13.6, 6.0 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 3.24 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 3.20 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 3.05 - 2.94 (m, 2H), 2.48 - 2.37 (m, 2H), 2.13 - 1.91 (m, 2H), 1.80 - 1.58 (m, 4H), 1.58 - 1.38 (m, 2H), 0.91 (s, 9H), 0.88 (s, 9H).	411.5	E	

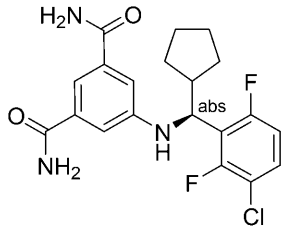
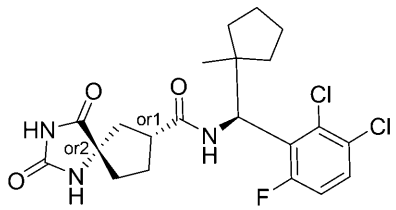
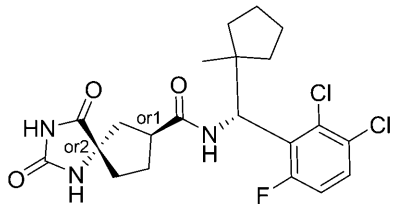
【表１－５１７】

I-1838		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 9.02 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.92 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (ddd, J = 11.8, 9.1, 2.6 Hz, 2H), 2.40 (h, J = 8.2 Hz, 1H), 2.19 (dddd, J = 33.7, 12.9, 9.1, 4.3 Hz, 2H), 1.70 - 1.59 (m, 1H), 1.59 - 1.24 (m, 6H), 1.16 (h, J = 7.9 Hz, 1H).	349.1	E	
I-1839		(400 MHz, DMSO-d6) 7.52 (td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.5, 1.6 Hz, 1H), 6.97 - 6.91 (m, 2H), 6.50 (td, J = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.41 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 5.34 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.85 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 4.49 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 3.59 (dt, J = 7.1, 5.6 Hz, 2H), 2.70 - 2.55 (m, 3H), 2.13 - 2.03 (m, 1H), 1.71 - 1.34 (m, 6H), 1.11 (dq, J = 16.2, 8.2, 6.8 Hz, 1H).	366.1	E	
I-1840		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.27 - 3.14 (m, 3H), 2.65 (s, 3H), 2.39 (s, 2H), 2.14 - 2.08 (m, 2H), 2.02 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 0.93 (s, 9H).	399.15	C	

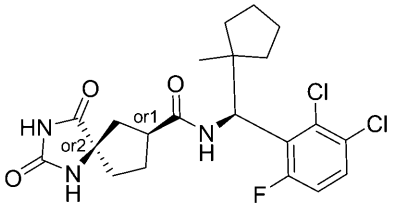
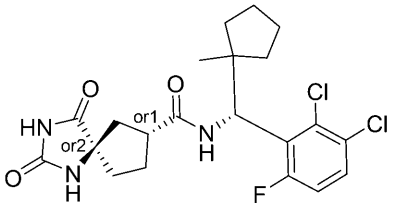
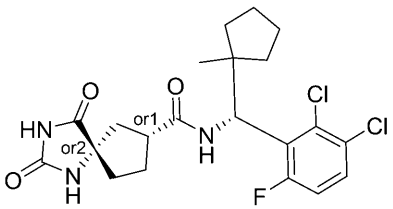
【表１－５１８】

I-1841		(400 MHz, DMSO-d6) 8.02 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.10 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.40 (s, 2H),3.21 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.71 (s, 3H), 2.20 (s, 2H), 2.12 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 2.04 (q, J = 9.5, 7.9 Hz, 2H), 0.93 (s, 9H).	399.15	C	
I-1842		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.37 - 7.29 (m, 2H), 7.29 - 7.23 (m, 1H), 7.18 - 7.06 (m, 3H), 5.06 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.37 - 4.27 (m, 2H), 3.23 - 3.10 (m, 3H), 2.49 (s, 2H), 2.12 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 2.06 (qd, J = 7.7, 3.6 Hz, 2H), 1.95 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 0.90 (s, 9H).	475.25	D	
I-1843		(400 MHz, DMSO-d6) 7.97 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 8.0, 6.6 Hz, 2H), 7.31 - 7.26 (m, 1H), 7.21 (dd, J = 7.0, 1.7 Hz, 2H), 7.13 (s, 1H), 5.08 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.36 (d, J = 2.5 Hz, 2H), 3.28 (s, 2H), 3.14 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.31 (s, 2H), 2.12 (dd, J = 11.0, 8.6 Hz, 1H), 2.07 - 1.90 (m, 3H), 0.90 (s, 9H).	475.2	B	

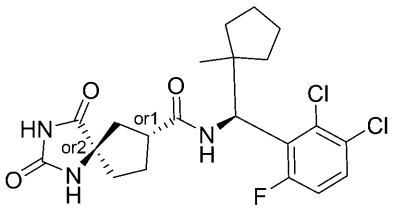
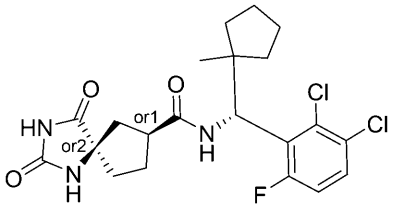
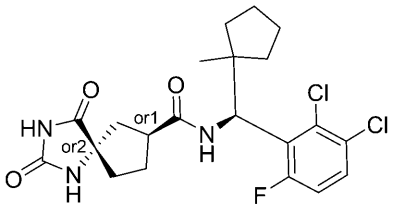
【表１－５１９】

I-1844		(400 MHz, DMSO-d6) 7.69 (s, 2H), 7.50 (td, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.24 (s, 2H), 7.18 (d, J = 1.3 Hz, 2H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.52 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.54 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 2.56 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 2.03 (s, 1H), 1.68 - 1.47 (m, 4H), 1.41 (td, J = 7.6, 3.6 Hz, 2H), 1.10 (dd, J = 12.5, 8.1 Hz, 1H).	408.15	D	
I-1845		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.37 - 8.07 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 8.9, 4.9 Hz, 1H), 7.25 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.06 (dq, J = 16.1, 8.4 Hz, 1H), 2.00 (ddt, J = 13.7, 10.1, 5.4 Hz, 3H), 1.90- 1.73 (m, 2H), 1.60 (s, 7H), 1.39 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.05-0.88 (m, 3H).	456.15	A	A
I-1846		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.21 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.04 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 2.10 - 1.93 (m, 3H), 1.82 (dd, J = 13.5, 7.6 Hz, 2H), 1.71 - 1.50 (m, 7H), 1.39 (s, 1H), 1.26 (d, J = 14.6 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	B	D

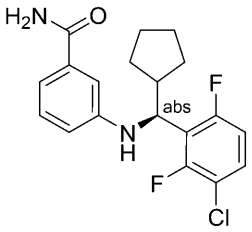
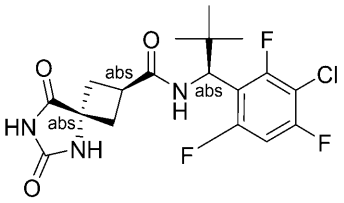
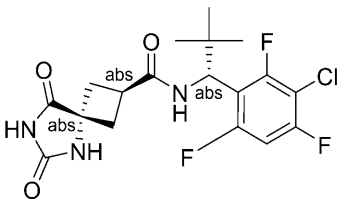
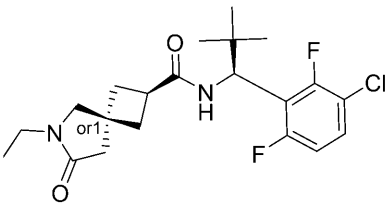
【表１－５２０】

I-1847		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.34 -7.16 (m, 1H), 5.50 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.09 - 1.89 (m, 3H), 1.87-1.70 (m, 3H), 1.60 (s, 6H), 1.44 - 1.21 (m, 2H), 0.97 (d, J = 3.0 Hz, 3H).	456.15	A	B
I-1848		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.30 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.99 - 7.94 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.13 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 2.09 - 1.89 (m, 3H), 1.88 - 1.70 (m, 3H), 1.60 (s, 6H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	C	
I-1849		(400 MHz, DMSO-d6) 10.65 - 10.60 (m, 1H), 8.28 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.21 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.10 - 3.01 (m, 1H), 2.11 (dd, J = 13.1, 10.0 Hz, 1H), 2.04 - 1.80 (m, 3H), 1.62 (d, J = 22.9 Hz, 7H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 12.8 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	456.05	E	

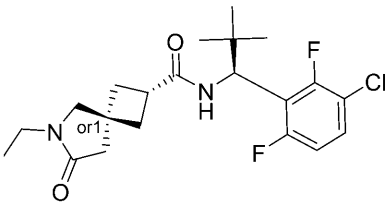
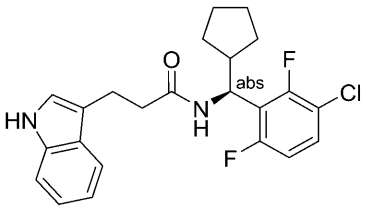
【表１－５２１】

I-1850		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 4.9 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.17 - 2.05 (m, 1H), 2.03 - 1.83 (m, 3H), 1.80 - 1.68 (m, 1H), 1.60 (q, J = 5.5, 5.0 Hz, 7H), 1.44 - 1.21 (m, 2H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	456.15	A	A
I-1851		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.20 - 3.09 (m, 1H), 2.17 - 2.06 (m, 1H), 1.96 - 1.83 (m, 3H), 1.74 (dd, J = 9.9, 7.1 Hz, 1H), 1.60 (s, 7H), 1.38 (s, 1H), 1.30 - 1.22 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.05	D	
I-1852		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.34 - 8.14 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.11 (dd, J = 13.1, 10.0 Hz, 1H), 2.06-1.79 (m, 3H), 1.62 (d, J = 22.9 Hz, 8H), 1.46- 1.20 (m, 2H), 1.04-0.88 (m, 3H).	456.15	A	A

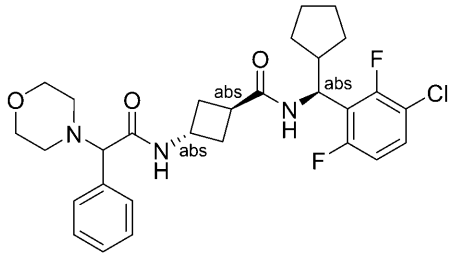
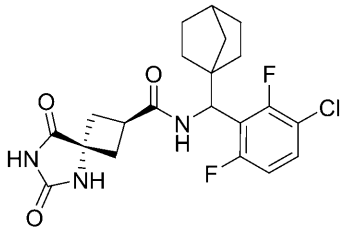
【表１－５２２】

I-1853		(400 MHz, DMSO-d6) 7.69 (s, 1H), 7.50 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.18 - 7.02 (m, 4H), 6.99 - 6.93 (m, 1H), 6.69 - 6.62 (m, 1H), 6.32 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.48 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 2.58 (s, J = 9.6 Hz, 1H), 2.03 (m, 1H), 1.58 - 1.47 (ddd, J = 35.1, 16.9, 9.4 Hz, 4H), 1.37 (m, 2H), 1.16 - 1.04 (m, 1H).	365.1	D	
I-1854		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.63 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.48 (s, 1H), 5.05 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.26 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.72 - 2.55 (m, 2H), 2.29 - 2.13 (m, 2H), 0.94 (s, 9H).	418	A	B
I-1855		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 - 10.57 (m, 1H), 8.64 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.48 (s, 1H), 5.05 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.26 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 - 2.56 (m, 2H), 2.28 - 2.15 (m, 2H), 0.94 (s, 9H).	418	E	
I-1856		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.39 (s, 2H), 3.25 - 3.14 (m, 3H), 2.20 (s, 2H), 2.11 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 2.02 (dd, J = 8.7, 4.5 Hz, 2H), 1.03 - 0.90 (m, 12H).	413.1	C	

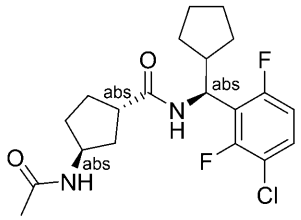
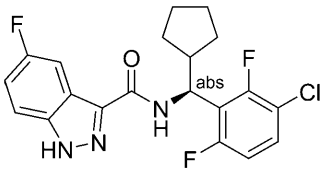
【表１－５２３】

I-1857		(400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.59 - 7.54 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 5.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.26 - 3.11 (m, 5H), 2.39 (s, 2H), 2.12 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 2.02 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 1.00 - 0.88 (m, 12H).	413.1	C	
I-1858		(400 MHz, DMSO-d6) -10.72 (br. s, 1H), 8.46 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.30 (dt, J = 8.3, 0.9 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.6, 1.5 Hz, 1H), 7.06 - 7.01 (m, 2H), 6.93 (ddd, J = 7.9, 7.1, 1.0 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.6 Hz, 1H), 2.92 - 2.78 (m, 2H), 2.50 (重複する m, 3H), 1.90 - 1.80 (m, 1H), 1.64 - 1.41 (m, 4H), 1.38 - 1.28 (m, 1H), 1.26 - 1.16 (m, 1H), 1.05 - 0.93 (m, 1H).	417.4	D	

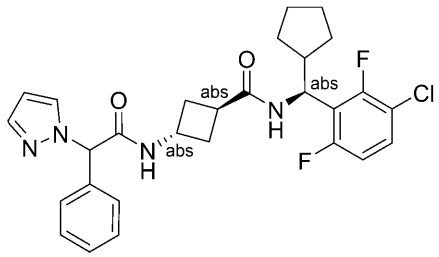
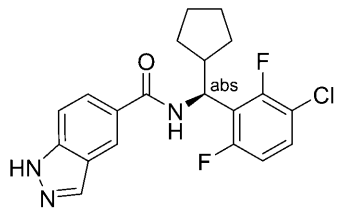
【表１－５２４】

I-1859		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 8.35 (d,J= 8.3 Hz, 1H), 8.32 (d,J= 7.8 Hz, 1H), 7.52 (dddd,J= 8.8, 7.4, 5.6, 1.5 Hz, 1H), 7.42 - 7.36 (m, 2H), 7.35 - 7.24 (m, 3H), 7.11 (tt,J= 9.5, 1.6 Hz, 1H), 4.83 (dd,J= 11.0, 7.6 Hz, 1H), 4.19 (app. sext,J= 7.8 Hz, 1H), 3.68 (s, 1H), 3.57 (app. t,J= 4.4 Hz, 4H), 2.99 - 2.88 (m, 1H), 2.45 - 2.35 (m, 1H), 2.34 - 2.17 (m, 5H), 2.19 - 1.96 (m, 3H), 1.93 - 1.80 (m, 1H), 1.67 - 1.39 (m, 4H), 1.39 - 1.18 (m, 2H), 1.06 - 0.92 (m, 1H).	546.5	B	
I-1860		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 10.58 (s, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.31 (d,J= 8.2 Hz, 1H),7.53 (app. td, J = 8.9, 5.5 Hz, 1H), 7.16 - 7.09 (m, 1H), 5.39 (d,J= 8.2 Hz, 1H), 3.26 (p,J= 9.0 Hz, 1H), 2.66 (dd,J= 11.7, 9.1 Hz, 1H), 2.57 (dd,J= 11.7, 9.1 Hz, 1H), 2.28 - 2.15 (m, 2H), 2.15 - 2.11 (m, 1H), 1.60 - 1.41 (m, 4H), 1.32 - 1.15 (m, 6H). 微量の脂肪族不純物。	438.4	A	A

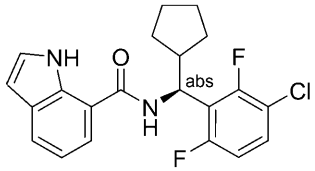
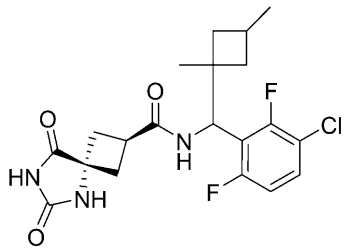
【表１－５２５】

I-1861		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.36 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.11 (td, J = 9.6, 1.3 Hz, 1H), 4.80 (dd, J = 11.0, 7.5 Hz, 1H), 4.01 - 3.92 (m, 1H), 2.80 (app. p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.47 - 2.35 (m, 1H), 1.96 - 1.79 (m, 3H), 1.74 (s, 3H), 1.71 - 1.42 (m, 7H), 1.39 - 1.21 (m, 3H), 1.04 - 0.94 (m, 1H).	399.4	A	B
I-1862		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 13.80 (br. s, 1H), 8.50 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 9.1, 2.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.1, 4.2 Hz, 1H), 7.57 (app. td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.32 (app. td, J = 9.1, 2.5 Hz, 1H), 7.18 (app. td, J = 9.6, 1.4 Hz), 5.17 (dd, J = 11.0, 8.4 Hz, 1H), 2.75 - 2.58 (m, 1H), 2.04 - 1.89 (m, 1H), 1.71 - 1.46 (m, 4H), 1.45 - 1.31 (m, 2H), 1.15 - 1.03 (m, 1H).	408.2	E	

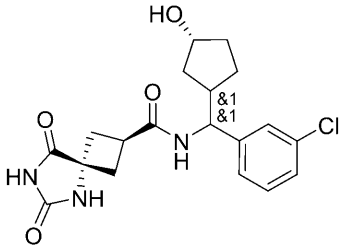
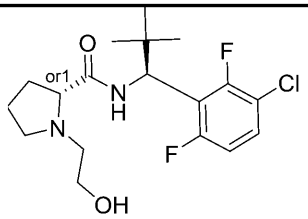
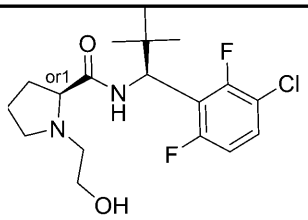
【表１－５２６】

I-1863		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 9.03 (d,J= 7.1 Hz, 1H), 8.39 (d,J= 7.4 Hz, 1H), 7.67 - 7.64 (m, 1H), 7.52 (dd,J= 14.0, 8.4 Hz, 1H), 7.47 - 7.44 (m, 1H), 7.41 - 7.33 (m, 3H), 7.33 - 7.26 (m, 2H), 7.11 (t,J= 9.3 Hz, 1H), 6.26 - 6.23 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 4.83 (dd,J= 10.3, 8.1 Hz, 1H), 4.30 - 4.19 (m, 1H), 3.04 - 2.90 (m, 1H), 2.47 - 2.34 (m, 1H), 2.34 - 2.23 (m, 1H), 2.22 - 1.95 (m, 3H), 1.92 - 1.82 (m, 1H), 1.68 - 1.40 (m, 4H), 1.39 - 1.18 (m, 2H), 1.07 - 0.91 (m, 1H).	527.5	B	
I-1864		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 13.26 (br. s, 1H), 8.90 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.82 (dd, J = 8.8, 1.3 Hz, 1H), 7.55 (重複する d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.54 (重複する ddd, J = 8.8, 8.8, 4.4 Hz, 1H), 7.14 (app. t, J = 8.7 Hz, 1H), 5.04 (dd, J = 11.3, 7.2 Hz, 1H), 2.74 - 2.60 (m, 1H), 2.14 - 2.00 (m, 1H), 1.72 - 1.45 (m, 4H), 1.45 - 1.28 (m, 2H), 1.14 - 1.00 (m, 1H).	390.5	D	

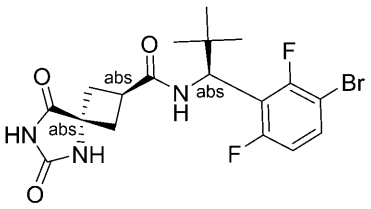
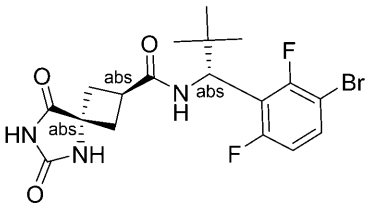
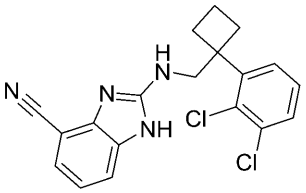
【表１－５２７】

I-1865		(400 MHz, DMSO-d6) - 11.13 (br. s, 1H), 8.94 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.73 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.28 - 7.24 (m, 1H), 7.13 (td, J = 9.6, 1.1 Hz, 1H), 7.10 - 7.05 (m, 1H), 6.46 - 6.44 (m, 1H), 5.10 (dd, J = 11.3, 7.0 Hz, 1H), 2.77 - 2.65 (m, 1H), 2.15 - 2.05 (m, 1H), 1.71 - 1.46 (m, 4H), 1.46 - 1.31 (m, 2H), 1.15 - 1.04 (m, 1H).	389.4	E	
I-1866		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 10.58 (s, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.4 Hz, 0.5H), 8.22 (d, J = 8.6 Hz, 0.5H), 7.61 - 7.51 (m, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.38 (d, J = 8.4 Hz, 0.5H), 5.15 (d, J = 8.6 Hz, 0.5H), 3.33 - 3.25 (m, 1H), 2.70 - 2.56 (m, 2H), 2.31 - 2.13 (m, 3H), 1.80 - 1.73 (m, 0.5H), 1.71 - 1.61 (m, 1H), 1.61 - 1.47 (m, 1H), 1.28 - 1.16 (m, 1H), 1.11 (s, 1.5H), 1.10 (s, 1.5H), 1.03 (d, J = 5.6 Hz, 1.5H), 0.95 (d, J = 6.4 Hz, 1.5H), 0.83 (td, J = 7.0, 2.4Hz, 0.5H). 4 つの化合物の混合物だが、正確に 1:1:1:1 の比ではない。約 15%の混合不純物。	426.4	B	

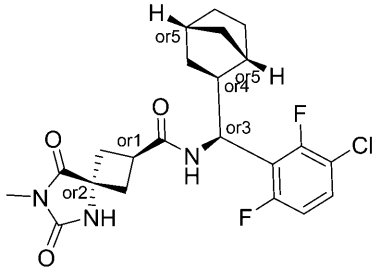
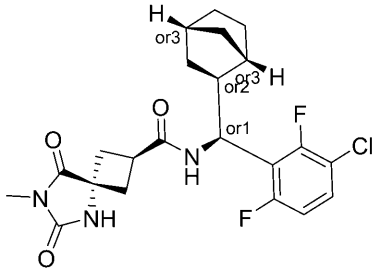
【表１－５２８】

I-1867		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 8.62 (s, 1H), 8.30 (d,J= 8.2 Hz, 0.5H), 8.26 (d,J= 8.9 Hz, 0.5H), 7.36 - 7.30 (m, 2H), 7.28 - 7.22 (m, 2H), 4.66 - 4.58 (m, 1H), 4.08 - 4.03 (m, 1H), 4.02 - 3.97 (m, 1H), 3.19 - 3.06 (重複する m, 1H), 2.65 (重複する m, 2H), 2.18 (重複する m, 3H), 1.88 (ddd,J= 13.8, 8.0, 6.1 Hz, 0.5H), 1.68 - 1.42 (m, 4.5H), 1.39 - 1.17 (m, 2H). 一部DIPEA。ギ酸塩。若干の脂肪族不純物。約1:1 の dr(ピークがオーバラップした 2 つまたは 4 つの化合物の混合物)。1H は観察されず。	392.4	D	
I-1868				E	
I-1869				E	

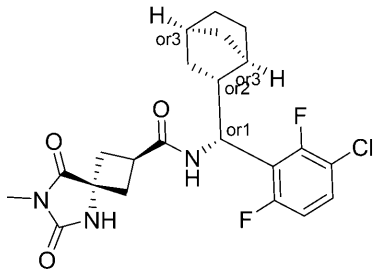
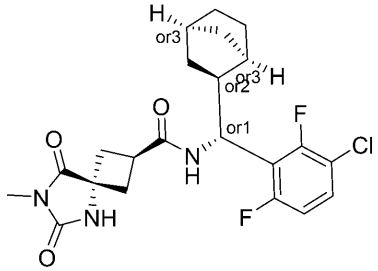
【表１－５２９】

I-1870		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.73 - 7.63 (m, 1H), 7.10 (s, 1H), 5.10 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.27 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72 - 2.58 (m, 2H), 2.29 - 2.13 (m, 2H), 0.94 (s, 9H).	444	A	A
I-1871		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.63 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.68 (td, J = 8.5, 5.7 Hz, 1H), 7.10 (s, 1H), 5.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.27 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 11.8, 9.3 Hz, 1H), 2.60 (s, 1H), 2.29 - 2.13 (m, 2H), 0.94 (s, 9H).	444	E	
I-1872		(400 MHz, DMSO-d6) 10.98 (s, 1H), 7.44 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.34-7.17 (m, 3H), 7.12 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.04 (q, J = 6.3 Hz, 1H), 6.89 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 2.54-2.32 (m, 4H), 2.16 (q, J = 9.5 Hz, 1H), 1.84-1.72 (m, 1H).	371.05	B	B

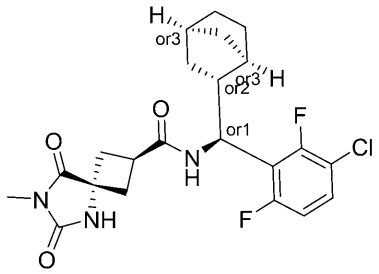
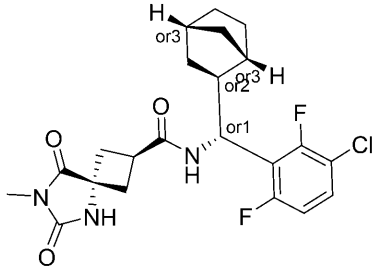
【表１－５３０】

I-1873		(400 MHz, DMSO-d6) 8.87 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.94 (dd, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.63 (dt, J = 17.8, 10.8 Hz, 2H), 2.44 (s, 2H), 2.22 (s, 1H), 2.13 (s, 2H), 1.52 (s, 1H), 1.42 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 1.35 (d, J = 11.3 Hz, 3H), 1.29 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 1.11 (s, 1H), 0.48 (d, J = 12.2 Hz, 1H).	452.15	D	
I-1874		(400 MHz, DMSO-d6) 8.89 (s, 1H), 8.55 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.16 - 7.07 (m, 1H), 4.71 (dd, J = 11.8, 7.3 Hz, 1H), 3.19 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.69 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 2H), 2.26 (dd, J = 12.1, 9.2 Hz, 3H), 2.12 (s, 2H), 1.59 - 1.46 (m, 1H), 1.44 (s, 1H), 1.33 - 1.17 (m, 2H), 1.17 - 0.99 (m, 3H), 0.75 (s, 1H).	452.3	E	

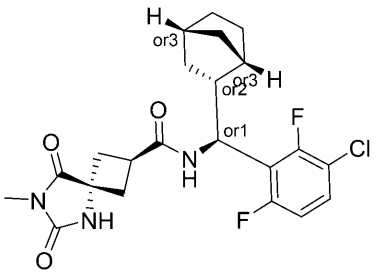
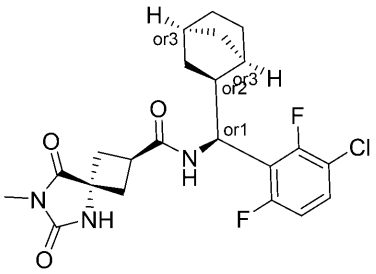
【表１－５３１】

I-1875		(400 MHz, DMSO-d6) 8.86 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.5, 9.1, 1.6 Hz, 1H), 4.92 (dd, J = 12.0, 7.2 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.63 (ddd, J = 18.5, 12.1, 9.1 Hz, 2H), 2.26 - 2.16 (m, 2H), 2.11 (ddd, J = 12.8, 8.8, 4.3 Hz, 1H), 1.87 (t, J = 12.4 Hz, 1H), 1.64 (s, 1H), 1.45 (t, J = 10.4 Hz, 2H), 1.32 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 1.22 (t, J = 7.2 Hz, 4H), 0.75 (dd, J = 12.4, 5.2 Hz, 1H).	452.3	E	
I-1876		(400 MHz, DMSO-d6) 8.89 (s, 1H), 8.54 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.11 (td, J = 9.4, 1.5 Hz, 1H), 4.71 (dd, J = 11.8, 7.2 Hz, 1H), 3.19 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.69 (dd, J = 12.1, 9.2 Hz, 1H), 2.65 - 2.56 (m, 1H), 2.28 - 2.21 (m, 1H), 2.19 (s, 2H), 2.17 - 2.08 (m, 1H), 1.59 - 1.53 (m, 2H), 1.46 -1.19 (d, J = 9.9 Hz, 3H), 1.17 - 1.04 (t, J = 10.5 Hz, 3H), 0.75 (s, 1H).	452.15	A	A

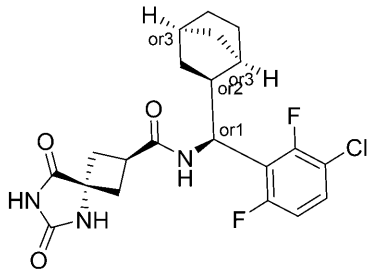
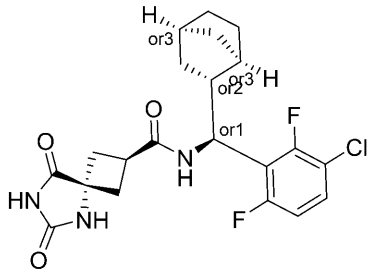
【表１－５３２】

I-1877		(400 MHz, DMSO-d6) 8.87 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.94 (dd, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.63 (ddd, J = 17.8, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.44 (s, 2H), 2.22 (ddd, J = 12.3, 9.0, 4.1 Hz, 1H), 2.14 (dt, J = 11.5, 4.4 Hz, 2H), 1.51 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 1.42 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 1.38 - 1.21 (m, 4H), 1.10 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 0.51 - 0.44 (m, 1H).	452.35	B	B
I-1878		(400 MHz, DMSO-d6) 8.86 (s, 1H), 8.36 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.19 - 7.10 (m, 1H), 4.72 (dd, J = 11.9, 7.5 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.64 (ddd, J = 20.5, 12.1, 9.1 Hz, 2H), 2.24 (d, J = 17.9 Hz, 2H), 2.14 (td, J = 13.9, 12.8, 5.1 Hz, 1H), 1.98 (s, 1H), 1.55 (s, 1H), 1.48 (t, J = 10.5 Hz, 1H), 1.44 - 1.35 (m, 3H), 1.20 - 1.08 (m, 3H), 1.00 (d, J = 12.7 Hz, 1H).	452.15	D	

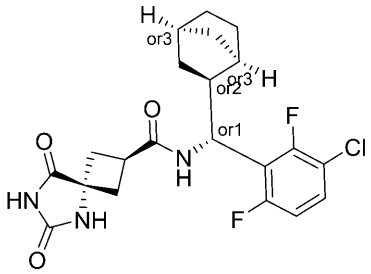
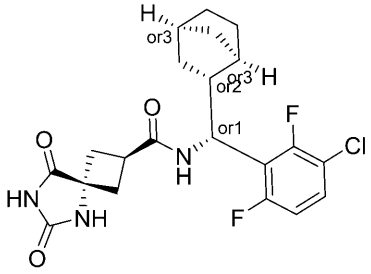
【表１－５３３】

I-1879		(400 MHz, DMSO-d6) 8.88 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.5, 5.3 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.92 (dd, J = 12.0, 7.1 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.70 - 2.56 (m, 2H), 2.21 (s, 2H), 2.11 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 1.86 (d, J = 12.3 Hz, 1H), 1.64 (s, 1H), 1.50 (s, 2H), 1.40 - 1.28 (m, 2H), 1.23 (s, 3H), 0.76 (d, J = 13.8 Hz, 1H).	452.3	B	B
I-1880		(400 MHz, DMSO-d6) 8.86 (s, 1H), 8.36 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.55 (q, J = 7.8, 7.0 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 4.72 (dd, J = 11.9, 7.5 Hz, 1H), 3.21 - 3.12 (m, 1H), 2.84 (s, 3H), 2.62 (dd, J = 20.2, 10.0 Hz, 2H), 2.23 (d, J = 16.6 Hz, 2H), 2.14 (s, 1H), 1.98 (s, 1H), 1.55 (s, 1H), 1.50 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 1.42 (s, 3H), 1.24 (s, 1H), 1.19 - 1.07 (m, 3H).	452.3	C	

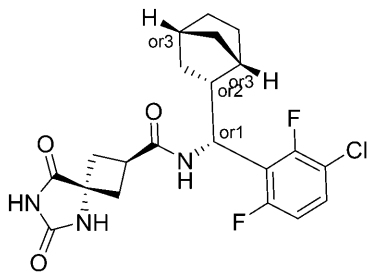
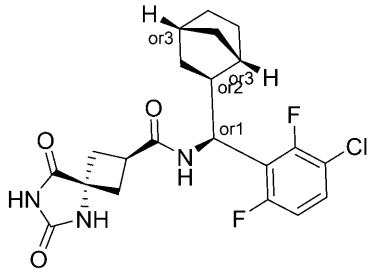
【表１－５３４】

I-1881		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.53 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.11 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.71 (dd, J = 11.9, 7.2 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 12.1, 9.0 Hz, 1H), 2.58 (dd, J = 12.1, 9.0 Hz, 1H), 2.27 - 2.17 (m, 3H), 2.13 (td, J = 8.6, 4.6 Hz, 1H), 2.08 (s, 1H), 1.59 - 1.44 (m, 2H), 1.33 - 0.99 (m, 5H), 0.74 (d, J = 12.0 Hz, 2H).	438.1	A	A
I-1882		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.46 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.58 - 7.49 (m, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.93 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 3.14 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.64 - 2.53 (m, 2H), 2.44 (s, 2H), 2.21 (s, 1H), 2.12 (s, 2H), 1.52 (s, 1H), 1.42 (d, J = 10.6 Hz, 1H), 1.38 - 1.28 (m, 4H), 1.10 (s, 1H), 0.47 (d, J = 12.3 Hz, 1H).	438.1	E	

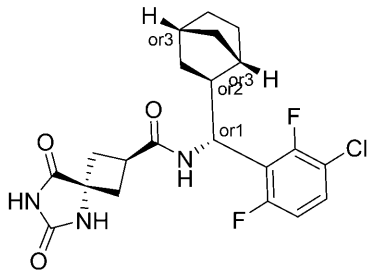
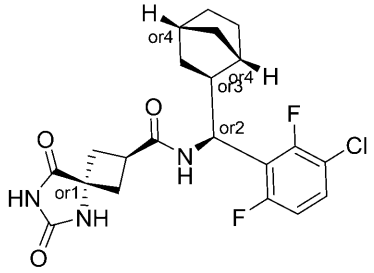
【表１－５３５】

I-1883		(400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.53 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.53 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 7.11 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.71 (dd, J = 11.9, 7.3 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.4 Hz, 1H), 2.71 - 2.62 (m, 1H), 2.62 - 2.53 (m, 1H), 2.20 (s, 5H), 1.51 (d, J = 9.7 Hz, 2H), 1.22 (t, J = 9.2 Hz, 2H), 1.08 (dt, J = 31.3, 10.0 Hz, 3H), 0.75 (s, 1H).	438.05	D	
I-1884		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.92 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.60 (dt, J = 20.1, 10.4 Hz, 3H), 2.20 (s, 2H), 2.11 (s, 1H), 1.87 (s, 1H), 1.64 (s, 1H), 1.49 (s, 2H), 1.31 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 1.21 (d, J = 10.0 Hz, 3H), 0.79 - 0.71 (m, 1H).	438.1	D	

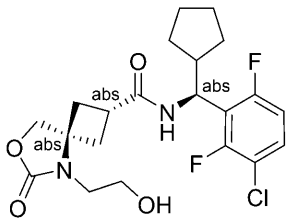
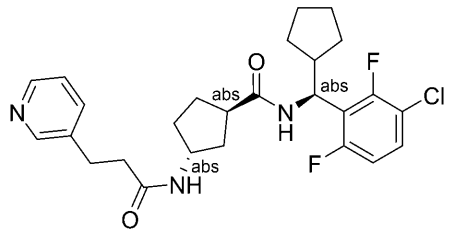
【表１－５３６】

I-1885		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.34 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.19 - 7.09 (m, 1H), 4.71 (dd, J = 11.9, 7.5 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.61 (ddd, J = 20.3, 12.2, 9.0 Hz, 2H), 2.25 (s, 2H), 2.21 - 2.09 (m, 1H), 2.01 (s, 1H), 1.54 (s, 1H), 1.48 (t, J = 10.6 Hz, 1H), 1.44 - 1.35 (m, 3H), 1.17 - 1.10 (q, J = 11.6 Hz, 3H), 1.00 (d, J = 12.0 Hz, 1H).	438.05	B	
I-1886		(400 MHz, DMSO-d6) 10.18 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.93 (dd, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.60 (ddd, J = 18.6, 12.0, 8.9 Hz, 2H), 2.44 (s, 2H), 2.21 (ddd, J = 12.5, 9.2, 4.1 Hz, 1H), 2.19 - 2.09 (m, 2H), 1.52 - 1.22 (m, 6H), 1.12 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 0.52 - 0.43 (m, 1H).	438.1	A	B

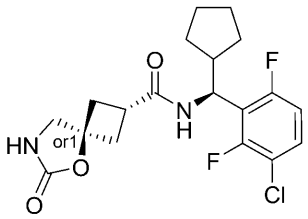
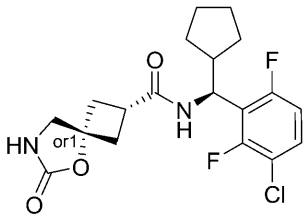
【表１－５３７】

I-1887		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.35 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 4.71 (dd, J = 11.8, 7.5 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.61 (ddd, J = 20.3, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.23 (d, J = 16.5 Hz, 2H), 2.14 (td, J = 13.5, 12.5, 4.7 Hz, 1H), 1.98 (s, 1H), 1.53 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 1.47 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 1.44 - 1.35 (m, 3H), 1.19 - 1.06 (m, 3H), 1.01 (s, 1H).	438.05	D	
I-1888		(400 MHz, DMSO-d6) 10.15 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.18 - 7.08 (m, 1H), 4.92 (dd, J = 12.0, 7.2 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.61 (ddd, J = 19.1, 12.0, 8.9 Hz, 2H), 2.25 - 2.16 (m, 2H), 2.11 (ddd, J = 12.7, 8.9, 4.1 Hz, 1H), 1.87 (t, J = 12.1 Hz, 1H), 1.64 (s, 1H), 1.52 - 1.47 (m, 2H), 1.32 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 1.23 (q, J = 9.6, 8.9 Hz, 4H), 0.80 - 0.71 (m, 1H).	438.1	A	B

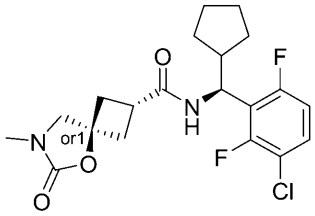
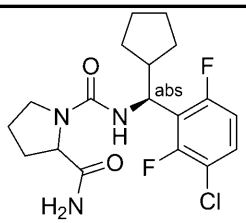
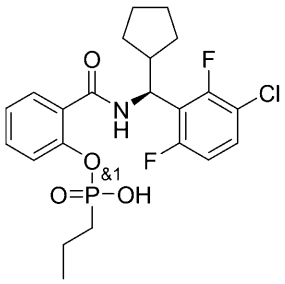
【表１－５３８】

I-1889		(400 MHz, DMSO-d6) 8.48 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.88 - 4.76 (m, 2H), 4.34 (s, 2H), 3.45 (q, J = 6.1 Hz, 2H), 3.19 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.76 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.48 - 2.32 (m, 3H), 2.17 (ddd, J = 12.0, 7.9, 5.1 Hz, 1H), 2.06 (ddd, J = 12.3, 7.8, 5.0 Hz, 1H), 1.88 (s, 1H), 1.64 - 1.42 (m, 4H), 1.38 - 1.18 (m, 2H), 0.99 (dq, J = 15.4, 7.9 Hz, 1H).	443.1	B	B
I-1890		(400 MHz, DMSO-d6) 8.44 - 8.33 (m, 3H), 7.77 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dt, J = 7.9, 2.0 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 7.8, 4.7 Hz, 1H), 7.17 - 7.07 (m, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.86 - 2.71 (m, 3H), 2.48 - 2.39 (m, 1H), 2.35 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 1.96 - 1.68 (m, 4H), 1.67 - 1.20 (m, 9H), 1.00 (dd, J = 12.6, 8.0 Hz, 1H).	490.2	B	B

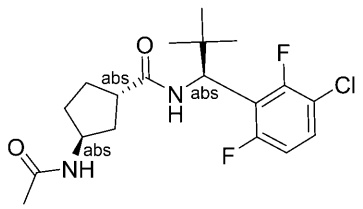
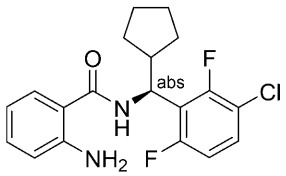
【表１－５３９】

I-1891		(400 MHz, DMSO-d6) 8.49 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 3.48 - 3.37 (m, 2H), 3.08 (tt, J = 9.5, 5.8 Hz, 1H), 2.43 (tt, J = 13.4, 9.1 Hz, 3H), 2.37 - 2.28 (m, 1H), 2.27 - 2.17 (m, 1H), 1.89 (td, J = 12.2, 8.5 Hz, 1H), 1.71 - 1.42 (m, 4H), 1.40 - 1.14 (m, 2H), 1.07 - 0.95 (m, 1H).	399.05	B	B
I-1892		(400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.5, 5.6 Hz, 2H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 3.54 (s, 2H), 2.78 - 2.67 (m, 1H), 2.47 - 2.37 (m, 2H), 2.37 - 2.29 (m, 2H), 2.24 (ddd, J = 11.0, 7.8, 4.9 Hz, 1H), 1.88 (td, J = 12.4, 7.7 Hz, 1H), 1.69 - 1.40 (m, 4H), 1.40 - 1.19 (m, 2H), 1.07 - 0.95 (m, 1H).	399.1	B	B

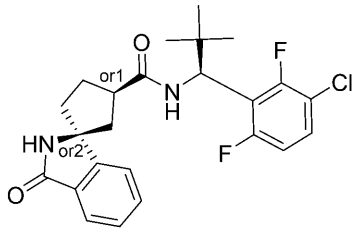
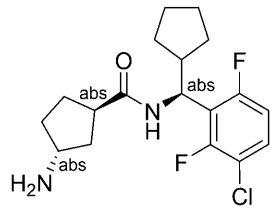
【表１－５４０】

I-1893		(400 MHz, DMSO-d6) 8.52 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (dd, J = 8.8, 5.9 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.58 - 3.47 (m, 2H), 3.08 (tt, J = 9.7, 5.4 Hz, 1H), 2.69 (s, 3H), 2.54 (d, J = 11.0 Hz, 1H), 2.44 (t, J = 10.9 Hz, 2H), 2.38 - 2.29 (m, 1H), 2.22 (dd, J = 12.4, 5.2 Hz, 1H), 1.90 (dd, J = 11.9, 4.8 Hz, 1H), 1.54 (ddd, J = 32.5, 13.8, 6.5 Hz, 4H), 1.37 - 1.19 (m, 2H), 1.01 (q, J = 11.4, 9.5 Hz, 1H).	413.15	B	
I-1894			386.28	E	
I-1895		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 9.66 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 7.8, 1.5 Hz, 1H), 7.53 (app td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.38 - 7.32 (m, 1H), 7.13 (td, J = 9.5, 1.4 Hz, 1H), 7.05 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 5.07 (dd, J = 10.9, 7.3 Hz, 1H), 2.62 - 2.51 (m, 2H), 2.14 - 2.02 (m, 1H), 1.70 - 1.44 (m, 8H), 1.42 - 1.29 (m, 2H), 1.10 - 0.97 (m, 1H), 0.96 - 0.87 (m, 3H).	472.3	E	

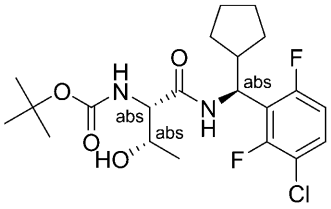
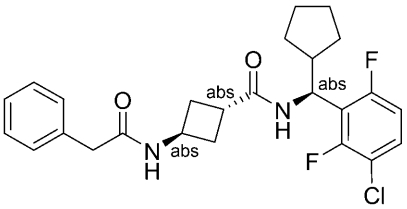
【表１－５４１】

I-1896		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.07 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.56 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (app. t, J = 9.6 Hz, 1H), 5.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.01 - 3.92 (m, 1H), 3.01 - 2.92 (m, 1H), 1.95 - 1.80 (m, 2H), 1.75 (s, 3H), 1.73 - 1.64 (m, 1H), 1.63 - 1.50 (m, 2H), 1.43 - 1.32 (m, 1H), 0.93 (s, 9H). 脂肪族不純物を含有。	387.4	B	C
I-1897		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.62 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 8.0, 1.4 Hz, 1H), 7.53 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.17 - 7.09 (m, 2H), 6.65 (dd, J = 8.2, 1.0 Hz, 1H), 6.55 - 6.48 (m, 1H), 6.26 (s, 2H), 4.97 (dd, J = 11.3, 7.1 Hz, 1H), 2.72 - 2.55 (m, 1H), 2.09 - 1.96 (m, 1H), 1.69 - 1.43 (m, 4H), 1.42 - 1.23 (m, 2H), 1.13 - 0.97 (m, 1H).	365.3	E	

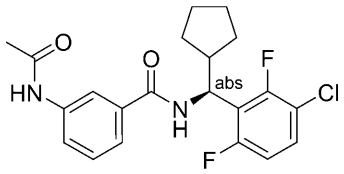
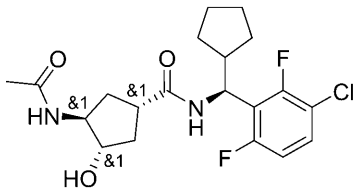
【表１－５４２】

I-1898		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.55 (s, 0.5H), 8.51 (br. s, 0.5H), 8.28 (d,J= 8.5 Hz, 0.5H), 8.26 (d,J= 8.5 Hz, 0.5H), 7.65 - 7.52 (m, 4H), 7.51 - 7.43 (m, 1H), 7.17 (重複する app. br. t,J= 9.4 Hz, 0.5H), 7.12 (埋没した br. s, 0.5H), 5.15 (d,J= 8.6 Hz, 1H), 3.42 (埋没した m, 1H), 2.25 - 2.12 (m, 1H), 2.10 - 1.97 (m, 2H), 1.98 - 1.86 (m, 3H), 0.96 (s, 4.5H), 0.94 (s, 4.5H). 2つのジアステレオマーの 1:1 混合物。示された立体化学は任意割り当てである。極微量の DMF を含有。	447.2	A	B
I-1899		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.51 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.20 (br. s, 3H), 7.51 (dt, J = 14.2, 7.2 Hz, 1H), 7.14 - 7.08 (m, 1H), 4.79 (dd, J = 11.0, 7.5 Hz, 1H), 3.47 (重複する m, 1H), 3.00 - 2.90 (m, 1H), 2.48 - 2.36 (m, 1H), 2.04 (ddd, J = 13.6, 7.5, 6.3 Hz, 1H), 1.97 - 1.85 (m, 3H), 1.84 - 1.75 (m, 1H), 1.65 - 1.38 (m, 6H), 1.37 - 1.20 (m, 2H), 1.04 - 0.93 (m, 1H). 微量の不純物を含有。	340.3	D	

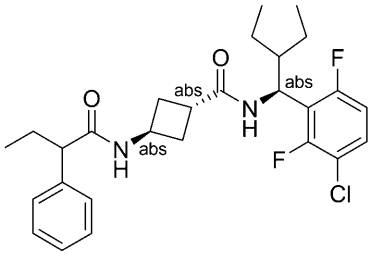
【表１－５４３】

I-1900		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.07 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.53 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.11 (app. tt, J = 9.0 Hz, 1H), 6.68 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.90 (dd, J = 10.9, 8.2 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 3.91 (dd, J = 8.7, 5.9 Hz, 1H), 3.85 - 3.76 (m, 1H), 2.46 - 2.33 (m, 1H), 1.96 - 1.84 (m, 1H), 1.65 - 1.42 (m, 4H), 1.37 (s, 9H), 1.40 - 1.18 (m, 2H), 1.07 - 0.97 (m, 1H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz, 3H).	447.2	E	
I-1901		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.32 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.52 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.30 - 7.25 (m, 2H), 7.24 - 7.17 (m, 3H), 7.12 (app. td, J = 9.6, 1.5 Hz, 1H), 4.84 (dd, J = 11.0, 7.6 Hz, 1H), 4.21 (app. sext, J = 7.8 Hz, 1H), 3.34 (s, 2H), 2.98 - 2.91 (m, 1H), 2.46 - 2.34 (m, 1H), 2.28 (ddt, J = 11.6, 7.7, 3.6 Hz, 1H), 2.17 - 1.96 (m, 3H), 1.93 - 1.83 (m, 1H), 1.66 - 1.41 (m, 4H), 1.37 - 1.20 (m, 2H), 1.05 - 0.94 (m, 1H).	461.5	B	C

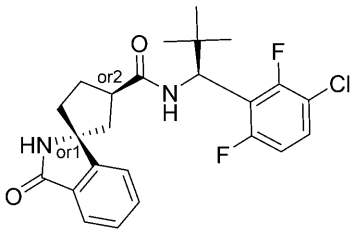
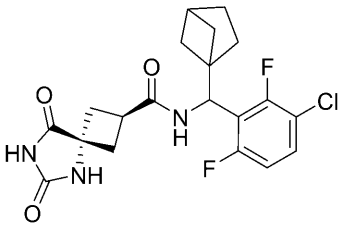
【表１－５４４】

I-1902		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 10.16 (s, 1H), 8.88 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.75 (br d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.59 - 7.46 (m, 2H), 7.35 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.14 (app. br. t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.99 (dd, J = 10.9, 7.4 Hz, 1H), 2.63 (app. sext., J = 7.8 Hz, 1H), 2.07 - 1.98 (重複する m, 1H) 2.04 (d, J = 0.7 Hz, 3H), 1.70 - 1.44 (m, 4H), 1.42 - 1.25 (m, 2H), 1.15 - 0.98 (m, 1H). 微量の脂肪族不純物。	407.4	E	
I-1903		(400 MHz, DMSO-d6) - ジアステレオマーの約1:1 混合物として- 8.36 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.53 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 2H), 7.12 (app. td, J = 9.7, 1.3 Hz, 2H), 5.00 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 4.97 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 4.82 (dd, J = 10.5, 7.9 Hz, 2H), 3.81 - 3.68 (m, 4H), 2.83 - 2.74 (m, 2H), 2.46 - 2.34 (m, 2H), 2.09 - 1.80 (m, 6H), 1.78 (s, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.66 - 1.39 (m, 12H), 1.38 - 1.21 (m, 4H), 1.05 - 0.95 (m, 2H). 示されたシクロペンタノール環の立体化学は任意割り当てである。	415.4	B	B

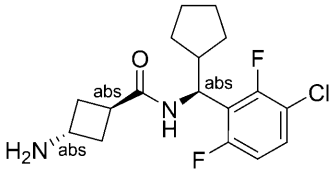
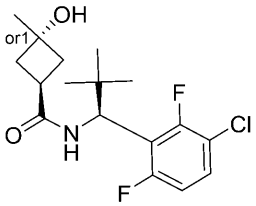
【表１－５４５】

I-1904		(400 MHz, DMSO-d6) - ジアステレオマーの1:1 混合物として- 8.30 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 8.24 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 7.56 - 7.48 (m, 2H), 7.30 - 7.24 (m, 8H), 7.23 - 7.16 (m, 2H), 7.15 - 7.08 (m, 2H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.6 Hz, 2H), 4.22 - 4.11 (m, 2H), 3.23 (mz, 2H), 2.97 - 2.88 (m, 2H), 2.45 - 2.34 (m, 2H), 2.34 - 2.26 (m, 1H), 2.25 - 2.11 (m, 2H), 2.10 - 1.96 (m, 4H), 1.95 - 1.82 (m, 5H), 1.65 - 1.41 (m, 10H), 1.37 - 1.19 (m, 4H), 1.04 - 0.94 (m, 2H), 0.78 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.77 (t, J = 7.3 Hz, 3H).	489.5	B	

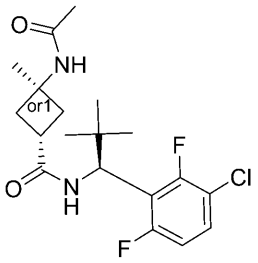
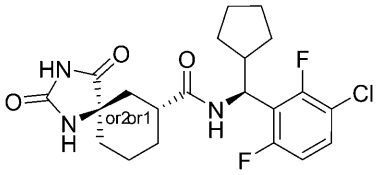
【表１－５４６】

I-1905		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.98 (s, 0.5H), 8.97 (s, 0.5H), 8.28 (br. d,J= 8.7 Hz, 1H), 7.61 - 7.50 (m, 4H), 7.47 - 7.40 (m, 1H), 7.17 (重複する app. br. t,J= 9.4 Hz, 0.5H), 7.11 (埋没した br. s, 0.5H), 5.13 (app br. t,J= 7.1 Hz, 1H), 3.27 (埋没した m, 1H), 2.27 (dd,J= 12.9, 9.1 Hz, 0.5H), 2.20 - 1.98 (m, 3.5H), 1.97 - 1.84 (m, 1H), 1.76 - 1.63 (m, 1H), 0.96 (s, 4.5H), 0.93 (s, 4.5H). 2 つのジアステレオマーの 1:1 混合物。示された立体化学は任意割り当てである。	447.2	A	B
I-1906		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 10.55 (br s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.54 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.13 (app. td, J = 9.6, 1.4 Hz, 1H), 5.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.25 (app. p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.74 - 2.63 (m, 2H), 2.37 - 2.33 (m, 1H), 2.25 - 2.17 (m, 2H), 1.63 - 1.52 (m, 4H), 1.52 - 1.31 (m, 4H). 約 30%の単一の不純物を含有。	424.4	A	B

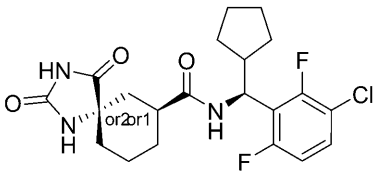
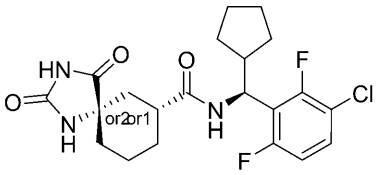
【表１－５４７】

I-1907		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 8.49 (d,J= 7.4 Hz, 1H), 8.27 (br s, 3H), 7.53 (td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.13 (app td,J= 9.6, 1.3 Hz 1H), 4.83 (dd,J= 11.0, 7.5 Hz, 1H), 3.73 - 3.62 (m, 1H), 3.15 - 3.06 (m, 1H), 2.47 - 2.21 (重複する m, 4H), 2.19 - 2.07 (m, 1H), 1.96 - 1.83 (m, 1H), 1.67 - 1.40 (m, 4H), 1.39 - 1.18 (2 つの重複する m, 2H), 1.06 - 0.91 (m, 1H). 残留 DMF+ジオキサンが存在(各約 6%w/w)。	343.5	C	
I-1908		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 7.98 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.81 (s), 3.15 (tt, J = 9.3, 6.7 Hz, 1H), 2.16 - 1.99 (m, 3H), 1.95 (app. dd, J = 11.1, 6.3 Hz, 1H), 1.12 (s, 3H), 0.92 (s, 9H).	346.2	D	

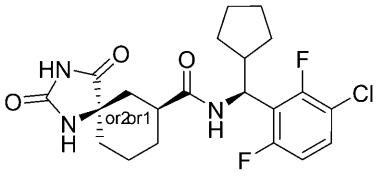
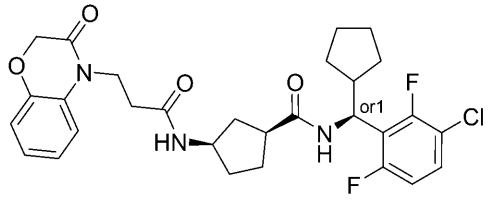
【表１－５４８】

I-1909		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.03 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (app. br. t, J = 10.2 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.25 - 3.16 (m, 1H), 2.42 - 2.35 (m, J = 10.4 Hz, 1H), 2.32 (ddd, J = 12.0, 7.8, 3.1 Hz, 1H), 1.99 (dd, J = 11.6, 7.6 Hz, 1H), 1.92 - 1.83 (m, 1H), 1.78 (s, 3H), 1.21 (s, 3H), 0.91 (s, 9H). 2 つのジアステレオマーの 95:5 の混合物	387.3	D	
I-1910		(400 MHz, DMSO-d6) 10.70 - 10.58 (m, 1H), 8.48 - 8.31 (m, 2H), 7.59 - 7.45 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.17 - 7.05 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.89 - 4.72 (dd, J = 11.2, 7.3 Hz, 1H), 2.48 - 2.27 (m, 2H), 2.05 - 1.84 (h, J = 7.9, 7.1 Hz, 1H), 1.81 - 1.36 (m, 11H), 1.35 - 1.14 (m, 3H), 1.08 - 0.78 (dq, J = 16.2, 8.0 Hz, 1H).	440.15	D	

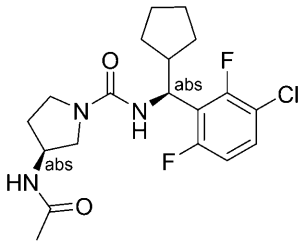
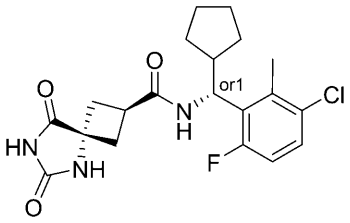
【表１－５４９】

I-1911		(400 MHz, DMSO-d6) 10.51 - 10.41 (m, 1H), 8.63 - 8.55 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.85 - 7.76 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.57 - 7.47 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.17 - 7.06 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.90 - 4.70 (dd, J = 11.1, 7.3 Hz, 1H), 3.04 - 2.78 (m, 1H), 2.48 - 2.28 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 1.99 - 1.83 (td, J = 12.6, 11.7, 4.4 Hz, 2H), 1.82- 1.71 (d, J = 12.0 Hz, 2H), 1.68 - 1.38 (m, 8H), 1.36 - 1.23 (m, 2H), 1.22 - 1.11 (dd, J = 12.6, 3.5 Hz, 1H), 1.06 - 0.92 (dq, J = 16.2, 8.0 Hz, 1H).	440.05	D	
I-1912		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 - 10.42 (m, 1H), 8.65 - 8.50 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.91 - 7.79 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.58 - 7.44 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.18 -7.06 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.82 - 4.72 (dd, J = 11.1, 7.3 Hz, 1H), 3.02 - 2.84 (m, 1H), 2.47 - 2.30 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 1.96 - 1.83 (m, 2H), 1.83 - 1.72 (m, 2H), 1.67 - 1.40 (m, 7H), 1.39 - 1.17 (m, 3H), 1.10 - 0.91 (ddd, J = 21.3, 12.6, 8.5 Hz, 2H).	440.15	D	

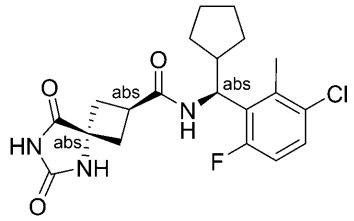
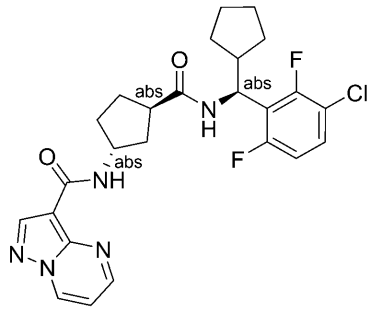
【表１－５５０】

I-1913		(400 MHz, DMSO-d6) 10.69 - 10.52 (s, 1H), 8.51 - 8.33 (m, 2H), 7.62 - 7.46 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.22 - 7.00 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.85 - 4.69 (dd, J = 11.2, 7.2 Hz, 1H), 2.48 - 2.36 (m, 2H), 2.02 - 1.88 (td, J = 12.2, 7.3 Hz, 1H), 1.83 - 1.72 (d, J = 12.6 Hz, 1H), 1.70 - 1.40 (m, 10H), 1.38 - 1.18 (m, 3H), 1.08 - 0.90 (dq, J = 17.7, 7.8 Hz, 1H).	440.15	D	
I-1914		(400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.18 - 6.98 (m, 4H), 4.82 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.63 (s, 2H), 4.08 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 4.00 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 2.79 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.40 (dt, J = 14.9, 8.3 Hz, 3H), 1.96 - 1.73 (m, 4H), 1.63 - 1.37 (m, 6H), 1.34 (t, J = 6.5 Hz, 1H), 1.29 (s, 2H), 1.02 (q, J = 11.2, 9.4 Hz, 1H).	560.25	B	C

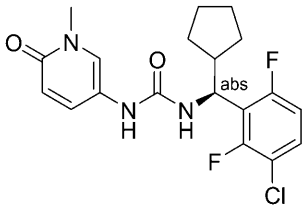
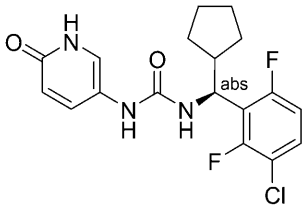
【表１－５５１】

I-1915		(400 MHz, DMSO-d6) 8.11 - 7.98 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.55 - 7.46 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 - 7.00 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 6.42 - 6.31 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 4.85 - 4.72 (dd, J = 11.3, 7.6 Hz, 1H), 4.21 - 4.11 (h, J = 6.0 Hz, 1H), 3.47 - 3.38 (dd, J = 10.6, 6.4 Hz, 1H), 3.31 - 3.22 (m, 2H), 3.10 - 2.96 (dd, J = 10.6, 4.4 Hz, 1H), 2.50 - 2.43 (s, 1H), 2.05 - 1.87 (dq, J = 13.0, 7.1 Hz, 2H), 1.82 - 1.77 (s, 3H), 1.74 - 1.64 (dq, J = 12.3, 6.1 Hz, 1H), 1.64 - 1.42 (m, 4H), 1.35 - 1.24 (m, 2H), 1.06 - 0.93 (dq, J = 15.6, 8.1 Hz, 1H).	400	E	
I-1916		(400 MHz, メタノール-d4) 7.30 (dd, J = 8.8, 5.0 Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 10.9, 8.8 Hz, 1H), 5.02 (dd, J = 11.2, 1.6 Hz, 1H), 3.29-3.15 (m, 1H), 2.93-2.79 (m, 2H), 2.77-2.60 (m, 1H), 2.59 (s, 3H), 2.52-2.33 (m, 2H), 2.08-1.93 (m, 1H), 1.79-1.50 (m, 4H), 1.47-1.28 (m, 2H), 1.09 (dq, J = 12.8, 8.1 Hz, 1H).	408.25	D	

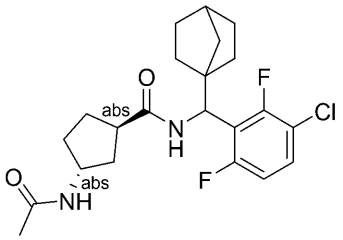
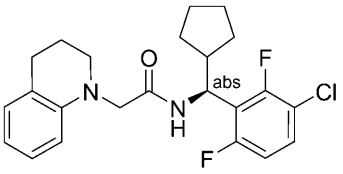
【表１－５５２】

I-1917		(400 MHz, メタノール-d4) 7.30 (dd, J = 8.8, 5.1 Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 10.9, 8.8 Hz, 1H), 5.02 (dd, J = 11.2, 1.6 Hz, 1H), 3.22 (tt, J = 9.6, 8.4 Hz, 1H), 2.93-2.85 (m, 1H), 2.88-2.80 (m, 1H), 2.77-2.60 (m, 1H), 2.59 (s, 3H), 2.51-2.33 (m, 2H), 2.08-1.93 (m, 1H), 1.80-1.50 (m, 4H), 1.49-1.35 (m, 2H), 1.16-1.03 (m, 1H).	408.1	A	B
I-1918		(400 MHz, DMSO-d6) 9.33 (s, 1H), 8.83 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.57 - 7.51 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.14 (s, 1H), 4.85 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 4.36 (s, 1H), 2.94 (s, 1H), 2.42 (s, 1H), 2.02 (s, 2H), 1.89 (s, 3H), 1.56 (s, 6H), 1.32 (s, 2H), 1.01 (s, 1H).	502.2	B	B

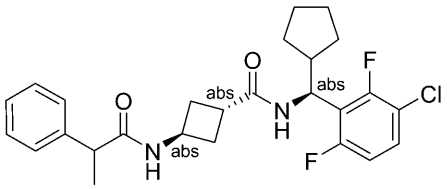
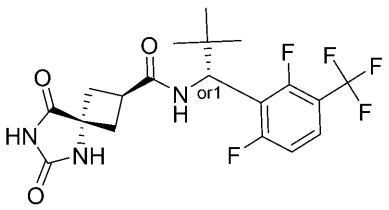
【表１－５５３】

I-1919		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (s, 1H), 7.81 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.56 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 9.6, 2.9 Hz, 1H), 7.16 (app. td, J = 9.7, 1.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.31 (d, J= 9.6 Hz, 1H), 4.86 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 3.34 (重複する br. s, 3H), 2.42-2.27 (m, 1H), 1.91-1.78 (m, 1H), 1.69-1.44 (m, 4H), 1.43-1.31 (m, 2H), 1.10-0.98 (m, 1H). 約 6～7%の二量体の不純物	396.4	C	
I-1920		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 11.26 (br s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.56 (app. td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 9.6, 2.9 Hz, 1H), 7.16 (app. td, J = 9.7, 1.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.27 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.86 (dd, J = 10.1, 9.2 Hz, 1H), 2.41-2.28 (m, 1H), 1.91-1.78 (m, 1H), 1.70-1.45 (m, 4H), 1.44-1.30 (m, 2H), 1.12-0.95 (m, 1H). 一部ギ酸塩、微量の不純物。ヒドロキシピリジンに互変異性化した可能性がある。	382.3	B	

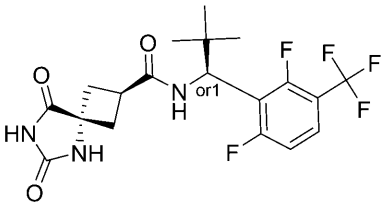
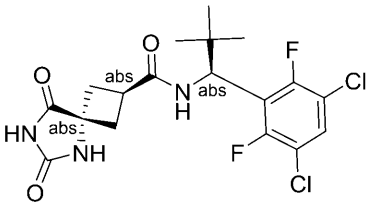
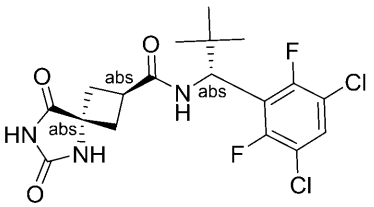
【表１－５５４】

I-1921		(400 MHz, DMSO-d6) - ジアステレオマーの1:1 混合物として- 8.15-8.08 (m, 2H), 7.76 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 7.53 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 2H), 7.15-7.08 (m, 2H), 5.39 (dd, J = 8.3, 2.2 Hz, 2H), 4.03-3.92 (m, 2H), 2.94 (app. p, J = 7.9 Hz, 2H), 2.16-2.12 (m, 2H), 1.92-1.78 (重複する m, 4H), 1.76 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 1.73-1.42 (m, 14H), 1.42-1.31 (m, 2H), 1.29-1.16 (重複する m, 12H). 7～10%の未知の不純物に加え、他の微量の脂肪族不純物を含有。	425.5	A	B
I-1922		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.46 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.6, 1.4 Hz, 1H), 6.87 - 6.79 (m, 2H), 6.45 (td, J = 7.3, 0.6 Hz, 1H), 6.30 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 10.9, 7.9 Hz, 1H), 3.89 (AB の dA, JAB = 17.0 Hz, 1H), 3.83 (AB の dB, JAB = 17.0 Hz, 1H), 3.32 (埋没した t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.66 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 2.47 - 2.35 (m, 1H), 1.95 - 1.80 (m, 3H), 1.65 --1.42 (m, 4H), 1.39 - 1.22 (m, 2H), 1.07 - 0.96 (m, 1H).	419.2	E	

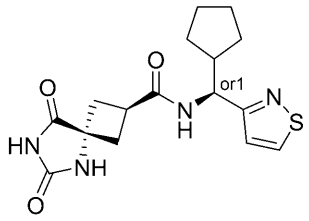
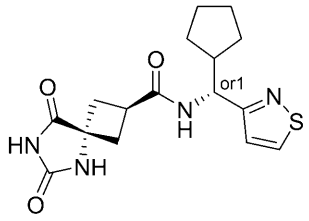
【表１－５５５】

I-1923		(400 MHz, DMSO-d6) - ジアステレオマーの1:1 混合物として- 8.31 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 8.19 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.56 - 7.48 (m, 2H), 7.29 - 7.26 (m, 8H), 7.23 - 7.17 (m, 2H), 7.15 - 7.08 (m, 2H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.6 Hz, 2H), 4.24 - 4.13 (m, 2H), 3.50 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 2.96 - 2.88 (m, 2H), 2.44 - 2.33 (m, 2H), 2.33 - 1.82 (m, 10H), 1.66 - 1.41 (m, 8H), 1.28 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.37 - 1.19 (m, 4H), 1.28 (d, J = 7.1 Hz, 3H), 1.04 - 0.93 (m, 2H).	475.5	B	C
I-1924		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 - 10.55 (m, 1H), 8.63 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.79 (td, J = 8.4, 5.5 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 23.4 Hz, 1H), 5.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.28 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (dd, J = 12.0, 9.0 Hz, 1H), 2.59 (dd, J = 12.1, 9.0 Hz, 1H), 2.21 (dddd, J = 24.9, 12.8, 9.1, 4.2 Hz, 2H), 0.95 (s, 9H).	434.05	E	

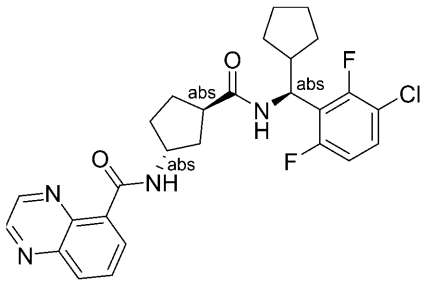
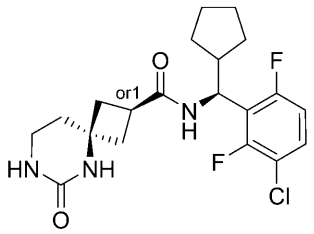
【表１－５５６】

I-1925		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 - 10.56 (m, 1H), 8.63 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.79 (td, J = 8.4, 5.5 Hz, 1H), 7.31 (s, 1H), 5.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.29 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.63 (ddd, J = 35.4, 12.0, 8.9 Hz, 2H), 2.21 (dddd, J = 24.9, 12.8, 9.1, 4.1 Hz, 2H), 0.95 (s, 9H).	434.05	A	B
I-1926		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.94 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 5.08 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.28 (dd, J = 18.6, 9.4 Hz, 1H), 2.68 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 2.65 - 2.55 (m, 1H), 2.31 - 2.14 (m, 2H), 0.95 (s, 9H).	434.1	C	
I-1927		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.96 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 5.08 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.26 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.64 (dt, J = 26.0, 10.6 Hz, 2H), 2.26 (t, J = 12.5 Hz, 1H), 2.18 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 0.95 (s, 9H).	434.1	E	

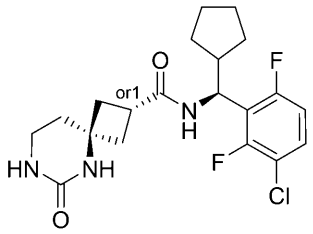
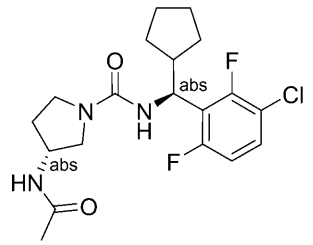
【表１－５５７】

I-1928		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.98 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 4.93 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (dt, J = 11.9, 8.4 Hz, 2H), 2.35 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 2.27- 2.13 (m, 2H), 1.67 (h, J = 6.4 Hz, 1H), 1.59- 1.28 (m, 6H), 1.21 - 1.10 (m, 1H).	349.3	E	
I-1929		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.98 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 4.93 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.68 (dt, J = 12.0, 8.4 Hz, 2H), 2.35 (h, J = 8.1 Hz, 1H), 2.20 (dddd, J = 29.7, 12.9, 9.1, 4.3 Hz, 2H), 1.71- 1.62 (m, 1H), 1.54 (ddt, J = 11.8, 8.7, 4.2 Hz, 2H), 1.49 -1.28 (m, 4H), 1.21 - 1.11 (m, 1H).	349.3	E	

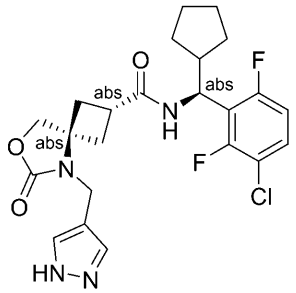
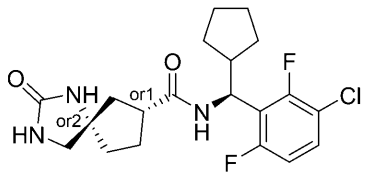
【表１－５５８】

I-1930		(400 MHz, DMSO-d6) 9.87 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 9.08 (q, J = 1.9 Hz, 2H), 8.48 - 8.40 (m, 2H), 8.27 (dd, J = 8.3, 1.6 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 8.4, 7.3 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.40 (q, J = 6.3 Hz, 1H), 2.95 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.43 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.12 - 1.98 (m, 2H), 1.89 (dtd, J = 13.5, 8.7, 4.5 Hz, 3H), 1.68 - 1.43 (m, 6H), 1.40 - 1.21 (m, 2H), 1.01 (dd, J = 11.9, 7.3 Hz, 1H).	513.2	C	
I-1931		(400 MHz, メタノール-d4) 7.41 (td, J = 8.5, 5.5 Hz, 1H), 6.99 (td, J = 9.3, 1.8 Hz, 1H), 5.00 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 3.25 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 2.85 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.53 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.40 - 2.17 (m, 4H), 1.94 (dt, J = 28.2, 5.5 Hz, 2H), 1.89 (s, 1H), 1.70 (s, 1H), 1.66 (ddt, J = 30.5, 22.5, 8.2 Hz, 1H),1.59 (s, 2H), 1.35 (s, 1H), 1.34-1.29 (m, 1H), 1.15 (dt, J = 13.0, 8.1 Hz, 1H).	412.15	B	C

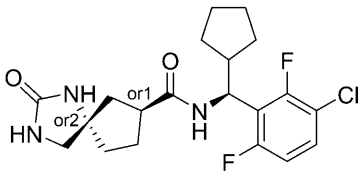
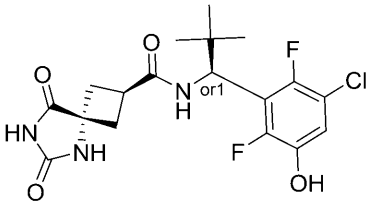
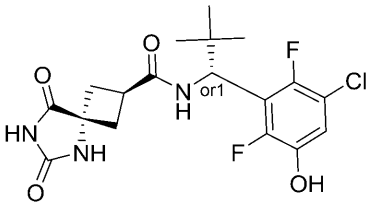
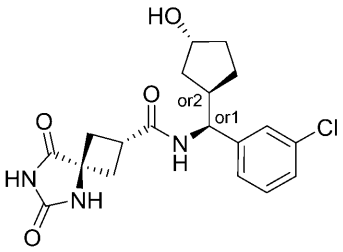
【表１－５５９】

I-1932		(400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.58-7.47 (m, 1H), 7.12 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.61 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 4.86-4.77 (m, 1H), 2.95 (s, 3H), 2.50-2.41 (s, 1H).2.31-2.15 (m, 3H), 2.11-1.80 (d, J = 55.6 Hz, 2H), 1.64 (d, J = 5.5 Hz, 1H),1.62 (s, 2H),1.60-1.40 (m, 2H), 1.35 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 1.24 (s, 2H), 1.00 (s, 1H).	412.15	B	B
I-1933		(400 MHz, DMSO-d6) 8.15 - 7.98 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.56 - 7.44 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 - 7.04 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 6.44 - 6.31 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.83 - 4.69 (dd, J = 11.3, 7.6 Hz, 1H), 4.23 - 4.14 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 3.52 - 3.39 (dd, J = 10.5, 6.4 Hz, 1H), 3.32 - 3.17 (m, 2H), 3.04 - 2.95 (dd, J = 10.5, 4.6 Hz, 1H), 2.50 - 2.36 (s, 1H), 2.04 - 1.89 (m, 2H), 1.82 - 1.76 (s, 3H), 1.73 - 1.41 (m, 5H), 1.35 - 1.24 (dt, J = 12.3, 7.5 Hz, 2H), 1.06 - 0.92 (dq, J = 15.1, 8.2 Hz, 1H).	400.05	E	

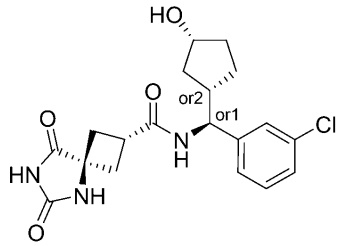
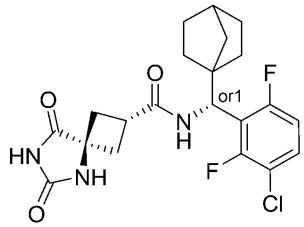
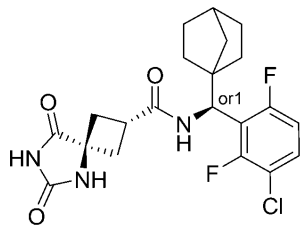
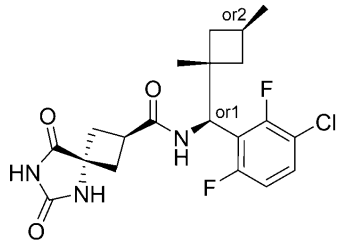
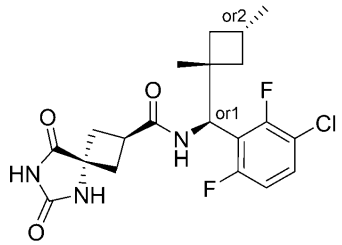
【表１－５６０】

I-1934		(400 MHz, DMSO-d6) 12.67 (s, 1H), 8.46 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.69 - 7.28 (m, 3H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.85 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.42 - 4.22 (m, 4H), 2.77 (p, J = 8.7 Hz, 1H), 2.57 - 2.52 (m, 1H), 2.50 - 2.45 (m, 1H), 2.39 (dt, J = 17.8, 8.8 Hz, 1H), 2.15 (ddd, J = 12.1, 8.0, 4.9 Hz, 1H), 2.05 (ddd, J = 12.4, 7.7, 4.8 Hz, 1H), 1.91 - 1.83 (m, 1H), 1.71 - 1.41 (m, 4H), 1.41 - 1.11 (m, 2H), 1.00 (dd, J = 12.5, 7.9 Hz, 1H).	479.1	A	B
I-1935		(400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 6.33 (s, 1H), 6.13 (s, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.6 Hz, 1H), 3.18 - 3.08 (m, 2H), 2.75 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 2.40 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 1.89 (dt, J = 12.2, 7.4 Hz, 2H), 1.76 - 1.43 (m, 9H), 1.40 - 1.19 (m, 2H), 1.05 - 0.98 (m, 1H).	412.05	B	B

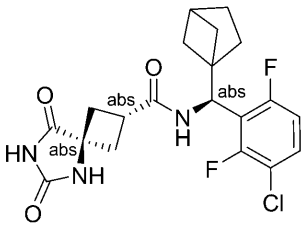
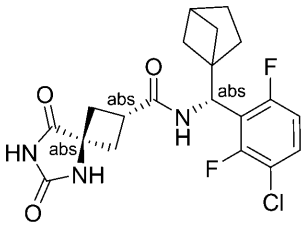
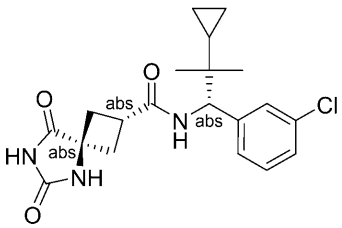
【表１－５６１】

I-1936		(400 MHz, DMSO-d6) 8.41 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.54 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.53 (s, 1H), 6.06 (s, 1H), 4.80 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.28 - 3.07 (m, 2H), 2.86 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 2.42 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 1.91 (s, 2H), 1.81 - 1.72 (m, 2H), 1.71 - 1.42 (m, 7H), 1.33 (s, 1H), 1.21 - 1.07 (m, 1H), 1.04 - 0.98 (m, 1H).	412.05	B	
I-1937		(400 MHz, DMSO-d6) 10.40 (d, J = 142.8 Hz, 2H), 8.62 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.01 (dd, J = 8.6, 7.2 Hz, 1H), 5.09 (s, 1H), 3.26 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.64 (ddd, J = 22.2, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.22 (dddd, J = 26.0, 12.7, 9.1, 4.1 Hz, 2H), 0.93 (s, 9H).	416	A	B
I-1938		(400 MHz, DMSO-d6) 10.40 (d, J = 143.4 Hz, 2H), 8.62 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.01 (dd, J = 8.6, 7.3 Hz, 1H), 5.09 (s, 1H), 3.26 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.77 - 2.57 (m, 2H), 2.31 - 2.13 (m, 2H), 0.93 (s, 9H).	416	D	
I-1939				E	

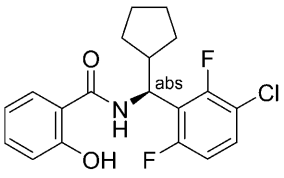
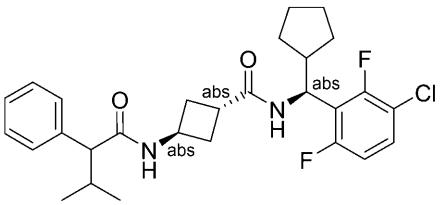
【表１－５６２】

I-1940				D	
I-1941				D	
I-1942				A	A
I-1943				E	
I-1944				A	B

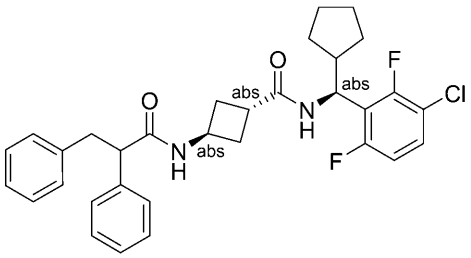
【表１－５６３】

I-1945				A	A
I-1946				E	
I-1947		(400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.20 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.29 (qd, J = 5.6, 4.8, 2.9 Hz, 3H), 4.87 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 3.25 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69 (ddd, J = 12.0, 9.0, 5.3 Hz, 2H), 2.28 (ddd, J = 12.5, 9.1, 4.3 Hz, 1H), 2.16 (ddd, J = 12.8, 9.0, 4.3 Hz, 1H), 0.79 -0.66 (m, 4H), 0.62 (s, 3H), 0.27 - 0.14 (m, 2H), 0.13 - 0.01 (m, 2H).	390.2	B	C

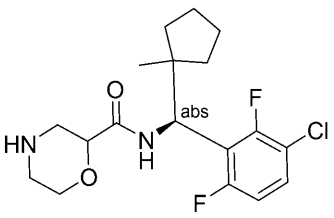
【表１－５６４】

I-1948		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 11.88 (br s, 1H), 9.21 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 8.3, 1.7 Hz, 1H), 7.58 (app td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.44 - 7.33 (m, 1H), 7.18 (app td, J = 9.6, 1.6 Hz, 1H), 6.91 (重複する d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.92 - 6.88 (重複する m, 1H), 5.15 (dd, J = 10.9, 7.9 Hz, 1H), 2.63 -2.52 (m, 1H), 2.00 - 1.89 (m, 1H), 1.70 - 1.47 (m, 4H), 1.46 - 1.31 (m, 2H), 1.16 - 1.03 (m, 1H).	364.2	E	
I-1949		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 8.30 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.51 (dddd, J = 8.7, 8.7 5.7, 5.7 Hz, 1H), 7.32 - 7.23 (m, 4H), 7.22 - 7.16 (m, 1H), 7.16 - 7.07 (m, 1H), 4.83 (dd, J = 11.0, 7.6 Hz, 1H), 4.20 - 4.05 (m, 1H), 2.99 - 2.85 (重複する m, 1H), 2.90 (重複する d, J = 10.7 Hz, 1H), 2.45 - 2.25 (m, 2H), 2.25 - 2.11 (m, 2H), 2.11 - 2.01 (m, 1H), 2.01 - 1.94 (m, 1H), 1.94 - 1.80 (m, 1H), 1.66 - 1.40 (m, 4H), 1.38 - 1.17 (m, 2H), 1.05 - 0.94 (m, 1H), 0.91 (dd, J = 6.4, 3.8 Hz, 3H), 0.59 (d, J = 6.6 Hz, 3H).	503.4	B	

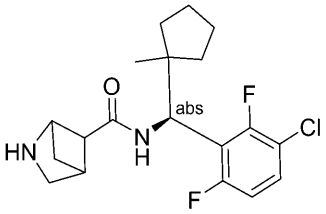
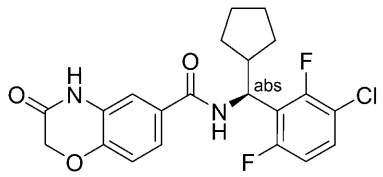
【表１－５６５】

I-1950		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 8.28 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.52 (dddd, J = 8.7, 8.7 6.0, 6.0 Hz, 1H), 7.35 - 7.30 (m, 2H), 7.27 (app td, J = 7.4, 1.7 Hz, 2H), 7.24 - 7.17 (m, 3H), 7.17 - 7.07 (m, 4H), 4.82 (dd, J = 11.0, 7.7 Hz, 1H), 4.18 - 4.02 (m, 1H), 3.66 (dd, J = 9.0, 6.2 Hz, 1H), 3.25 (dd, J = 12.9, 9.6 Hz, 1H), 2.90 - 2.80 (m, 2H), 2.45 - 2.31 (m, 1H), 2.26 - 2.12 (m, 1H), 2.11 - 1.98 (m, 1H), 1.97 - 1.75 (m, 3H), 1.66 - 1.40 (m, 4H), 1.37 - 1.17 (m, 2H), 1.06 - 0.92 (m, 1H).	551.7	B	D

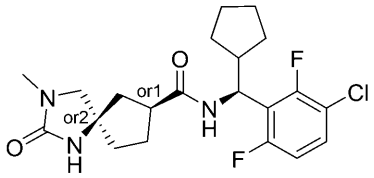
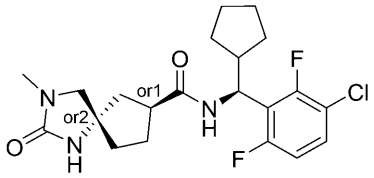
【表１－５６６】

I-1951		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.69 - 9.29 (m, 2H), 8.09 (d, J = 9.4 Hz, 0.5H), 8.05 (d, J = 9.4 Hz, 0.5H), 7.65 - 7.58 (m, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 5.28 (d, J = 4.8 Hz, 0.5H), 5.26 (d, J = 4.8 Hz, 0.5H), 4.50 - 4.43 (m, 0.5H), 4.42 - 4.36 (m, 0.5H), 4.12 - 3.98 (m, 1H), 3.93 - 3.80 (m, 1H), 3.32 - 3.28 (埋没した m, 1H), 3.21 - 3.11 (m, 1H), 3.11 - 2.91 (m, 2H), 1.69 - 1.58 (m, 3H), 1.58 - 1.43 (m, 2H), 1.41 - 1.33 (m, 1H), 1.32 - 1.25 (m, 1H), 1.25 - 1.16 (m, 1H), 0.94 (s, 3H). 1:1 の比のジアステレオマー;若干の脂肪族不純物。HCl 塩。	373.4	E	

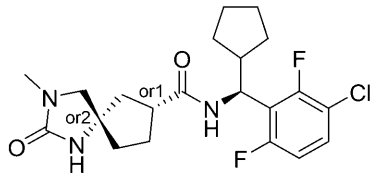
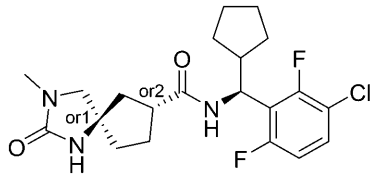
【表１－５６７】

I-1952		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.97 - 9.47 (m, 1H), 8.74 (t, J = 7.2 Hz, 0.5H), 8.70 (t, J = 6.1 Hz, 0.5H), 8.18 (br s, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.7 Hz, 1H), 7.19-7.11 (m, 1H), 5.15 (d, J = 8.6 Hz, 0.5H), 5.09 (d, J = 8.0 Hz, 0.5H), 4.25 (d, J = 5.4 Hz, 0.5H), 4.19 (app d, J = 3.2 Hz, 0.5H), 3.27 - 3.10 (m, 2H), 3.06 - 3.00 (m, 0.5H), 2.86 - 2.75 (m, 0.5H), 1.89 - 1.80 (m, 1H), 1.67 - 1.55 (m, 5H), 1.55 - 1.43 (重複する m, 1H), 1.42 - 1.26 (m, 2H), 1.25 - 1.16 (m, 1H), 0.96 (s, 3H).1:1の比のジアステレオマー。約 5～7%不純物、若干の脂肪族不純物。	369.4	D	
I-1953		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.84 (s, 1H), 8.80 (d,J= 7.1 Hz, 1H), 7.54 (重複する appt td, J = 8.6, 5.3 Hz 1H), 7.50 (重複する dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J= 2.0 Hz, 1H), 7.13 (td, J= 9.6, 1.3 Hz, 1H), 6.99 (d, J= 8.4 Hz, 1H), 4.98 (dd, J= 11.3, 7.1 Hz, 1H), 4.62 (s, 2H), 2.69 - 2.55 (m, 1H), 2.10 - 1.97 (m, 1H), 1.70 -1.45 (m, 4H), 1.43 - 1.25 (m, 2H), 1.10 - 0.97 (m, 1H). 若干の脂肪族不純物。	421.4	D	

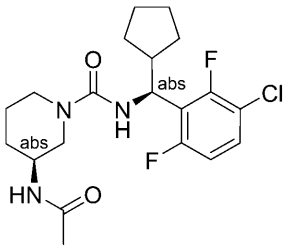
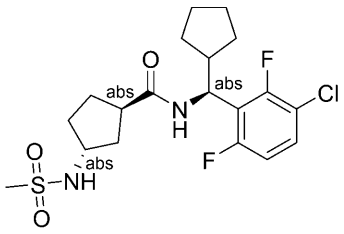
【表１－５６８】

I-1954		(400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 6.48 (s, 1H), 4.84 (dd, J = 11.2, 7.6 Hz, 1H), 3.15 (q, J = 8.6 Hz, 2H), 2.78 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 2.60 (s, 3H), 2.40 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 1.89 (dt, J = 12.3, 5.2 Hz, 2H), 1.82 - 1.44 (m, 9H), 1.40 -1.19 (m, 2H), 1.07 - 0.96 (m, 1H).	426.05	B	B
I-1955		(400 MHz, DMSO-d6) 8.42 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 6.68 (s, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.21 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.12 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 2.88 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 2.58 (s, 3H), 2.42 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 1.96 - 1.73 (m, 4H), 1.71 - 1.43 (m, 7H), 1.40 - 1.21 (m, 2H), 1.00 (s, 1H).	426.1	B	B

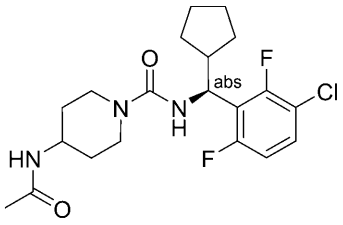
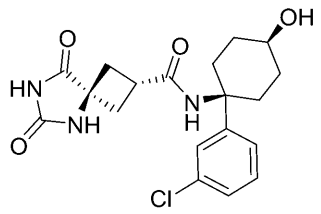
【表１－５６９】

I-1956		(400 MHz, DMSO-d6) 8.42 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 6.65 (s, 1H), 4.81 (dd, J = 11.2, 7.4 Hz, 1H), 3.10 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 2.86 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.55 (s, 3H), 2.43 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 1.90 (td, J = 10.9, 9.3, 4.0 Hz, 2H), 1.75 (dd, J = 13.2, 9.2 Hz, 1H), 1.72 - 1.42 (m, 8H), 1.40 - 1.19 (m, 2H), 1.00 (dd, J = 12.8, 7.4 Hz, 1H).	426.05	B	B
I-1957		(400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 4.82 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 3.18 - 3.08 (m, 2H), 2.78 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.59 (s, 3H), 2.40 (p, J = 8.6 Hz, 1H), 1.97 - 1.87 (m, 1H), 1.84 - 1.67 (m, 3H), 1.70 - 1.44 (m, 7H), 1.40 - 1.21 (m, 2H), 1.08 - 0.96 (m, 1H).	426.05	C	

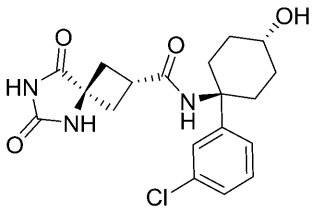
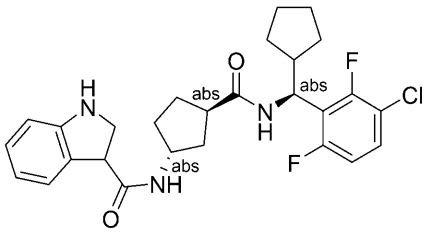
【表１－５７０】

I-1958		(400 MHz, DMSO-d6) 7.79 - 7.71 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.54 - 7.45 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 - 7.05 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 6.74 - 6.68 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 4.80 - 4.68 (dd, J = 11.3, 7.2 Hz, 1H), 3.84 - 3.75 (dd, J = 12.8, 4.1 Hz, 1H), 3.73 - 3.63 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 3.58 - 3.44 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 2.81 - 2.66 (ddd, J = 13.2, 10.2, 3.0 Hz, 1H), 2.61- 2.53 (m, 1H), 2.49 - 2.40 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 2.01 - 1.89 (tt, J = 13.2, 6.6 Hz, 1H), 1.83 - 1.71 (s, 4H), 1.68 - 1.41 (m, 5H), 1.37 - 1.20 (ddt, J = 14.0, 8.2, 4.6 Hz, 4H), 1.06 - 0.92 (dq, J = 16.5, 8.1 Hz, 1H).	414.05	E	
I-1959		(400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.67 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 2.88 (s, 4H), 2.42 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 2.00 - 1.63 (m, 4H), 1.62 - 1.20 (m, 9H), 1.00 (dd, J = 12.7, 7.6 Hz, 1H).	435.15	B	

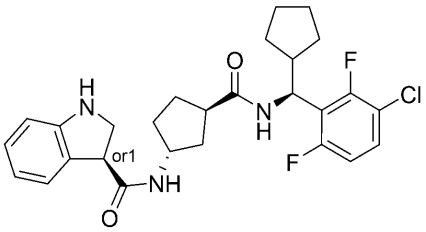
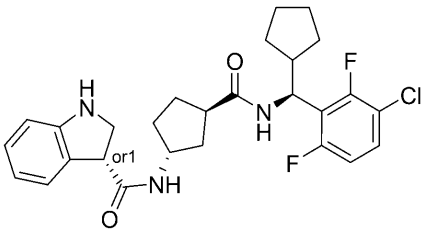
【表１－５７１】

I-1960		(400 MHz, DMSO-d6) 7.76 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.50 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.10 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 4.73 (dd, J = 11.3, 7.3 Hz, 1H), 3.87 (d, J = 13.5 Hz, 2H), 3.75 - 3.60 (m, 1H), 2.74 (tdd, J = 13.9, 10.0, 2.7 Hz, 2H), 2.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.97 (td, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H), 1.77 (s, 3H), 1.69 - 1.41 (m, 6H), 1.36 - 1.21 (m, 2H), 1.15 (q, J = 11.6 Hz, 2H), 0.99 (dq, J = 15.6, 8.2 Hz, 1H).	414.05	D	
I-1961		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.38 - 7.27 (m, 3H), 7.24 (dt, J = 7.4, 1.9 Hz, 1H), 4.42 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.80 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 3.27 - 3.14 (m, 1H), 2.70 - 2.59 (m, 2H), 2.25 - 2.15 (m, 2H), 2.04 (s, 4H), 1.68 (d, J = 11.0 Hz, 2H), 1.49 (d, J = 13.4 Hz, 2H).	392.1	E	

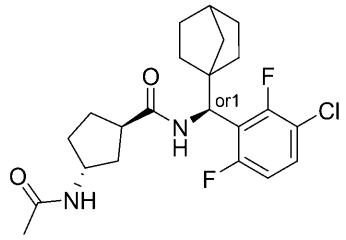
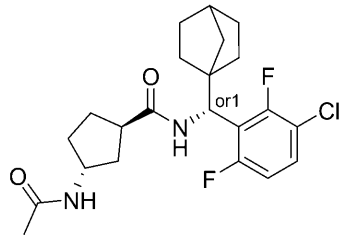
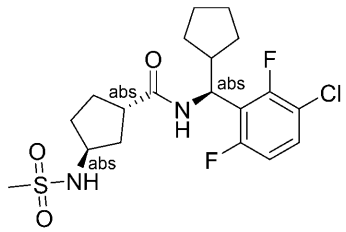
【表１－５７２】

I-1962		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.65 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.34 - 7.25 (m, 3H), 7.23 (dt, J = 6.9, 1.8 Hz, 1H), 4.67 - 4.53 (m, 1H), 3.68 (d, J = 8.6 Hz, 0H), 3.48 (qt, J = 9.3, 4.2 Hz, 1H), 3.48 (s, 1H), 3.26 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (td, J = 9.5, 2.8 Hz, 2H), 2.36 - 2.28 (m, 2H), 2.22 (dd, J = 12.9, 9.5 Hz, 2H), 1.72 - 1.58 (m, 4H), 1.50 - 1.38 (m, 2H).	392.15	E	
I-1963		(400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.53 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 6.51 (dd, J = 16.6, 7.7 Hz, 2H), 5.50 (s, 1H), 4.83 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 4.11 - 4.05 (m, 1H), 3.92 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 3.68 (s, 1H), 3.48 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 2.89 (s, 1H), 2.43 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 1.98 - 1.90 (m, 2H), 1.85 (s, 2H), 1.60 (s, 3H), 1.50 - 1.44 (m, 4H), 1.33 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 1.01 (s, 1H).	502.25	B	

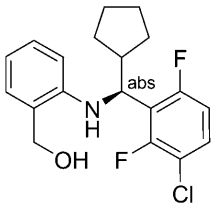
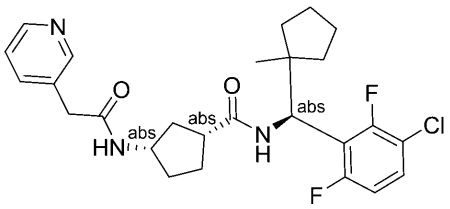
【表１－５７３】

I-1964		(400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.52 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.58 - 6.47 (m, 2H), 5.68 (s, 1H), 4.83 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.10 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.94 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.70 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.50 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 2.91 (q, J = 7.9, 7.4 Hz, 1H), 2.44 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 1.90 (dp, J = 28.4, 9.5, 8.4 Hz, 4H), 1.70 - 1.43 (m, 7H), 1.37 - 1.21 (m, 2H), 1.01 (t, J = 9.9 Hz, 1H).	502.25	B	B
I-1965		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.18 - 7.08 (m, 1H), 7.01 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.54 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.49 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 5.57 (s, 1H), 4.82 (dd, J = 11.0, 7.4 Hz, 1H), 4.08 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.92 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.67 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.49 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 2.93 - 2.85 (m, 1H), 2.43 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 1.95 (dq, J = 14.0, 7.2 Hz, 2H), 1.91 - 1.81 (m, 2H), 1.73 - 1.41 (m, 7H), 1.33 (dt, J = 12.4, 6.0 Hz, 2H), 1.02 (d, J = 9.7 Hz, 1H).	502.25	B	

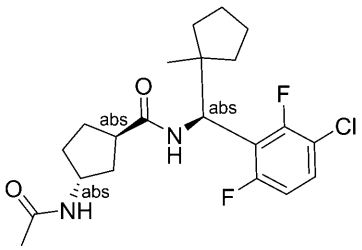
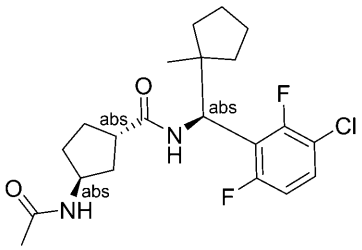
【表１－５７４】

I-1966				E	
I-1967				A	A
I-1968		(400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.56 - 7.49 (m, 1H), 7.12 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.65 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.85 (s, 3H), 2.83 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 2.42 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 1.90 (tt, J = 11.6, 5.1 Hz, 3H), 1.80 (dt, J = 13.5, 6.9 Hz, 1H), 1.66 - 1.41 (m, 7H), 1.38 - 1.21 (m, 2H), 1.00 (dq, J = 15.8, 8.1 Hz, 1H).	435.05	B	B

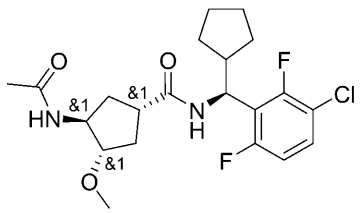
【表１－５７５】

I-1969		(400 MHz, DMSO-d6) 7.53 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.21-7.11 (m, 1H), 7.07- 6.97 (m, 2H), 6.52 (td, J = 7.3, 1.0 Hz, 1H), 6.45 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.29 (dd, J = 5.8, 4.9 Hz, 1H), 4.57-4.38 (m, 3H), 2.55 (s, 1H), 2.01 (td, J = 11.8, 7.1 Hz, 1H), 1.63 (ddd, J = 18.4, 9.4, 5.9 Hz, 2H), 1.59-1.33 (m, 4H) ,1.13 (dd, J = 12.5, 7.6 Hz, 1H).	352.1	E	
I-1970		(400 MHz, d6-DMSO) - 8.44 - 8.39 (m, 2H), 8.11 (dd, J = 10.5, 7.9 Hz, 2H), 7.63 (app. dt, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.55 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.32 (ddd, J = 7.3, 4.8, 0.4 Hz, 1H), 7.13 (app. t, J = 8.8 Hz, 1H), 5.19 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.03 - 3.94 (m, 1H), 3.42 (d, J = 14.8 Hz, 1H), 3.38 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 2.99 (app. p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.98 - 1.82 (m, 2H), 1.75 (app dt, J = 13.1, 7.5 Hz, 1H), 1.68 - 1.32 (m, 10H), 1.25 - 1.16 (m, 1H), 0.95 (s, 3H).	490.3	A	B

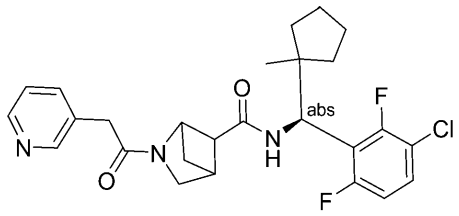
【表１－５７６】

I-1971		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.55 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 - 7.10 (m, 1H), 5.19 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.04 - 3.95 (m, 1H), 2.96 (app. p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.88 - 1.75 (m, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.66 - 1.54 (m, 6H), 1.52 - 1.42 (m, 2H), 1.41 - 1.30 (m, 2H), 1.24 - 1.16 (m, 1H), 0.95 (s, 3H).	413.4	A	B
I-1972		(400 MHz, d6-DMSO) - 8.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.55 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (app. t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.19 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.03 - 3.90 (m, 1H), 2.96 (app p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.95 - 1.79 (m, 2H), 1.75 (s, 3H), 1.70 (app. dt, J = 13.3, 7.4 Hz, 1H), 1.65 - 1.44 (m, 8H), 1.40 - 1.32 (m, 2H), 1.24 - 1.16 (m, 1H), 0.95 (s, 3H).	413.7	A	B

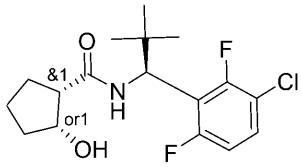
【表１－５７７】

I-1973		(400 MHz, DMSO-d6) - ジアステレオマーの約1:1 混合物として- 8.32 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.52 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 2H), 7.12 (app. td, J = 9.5, 1.1 Hz, 2H), 4.81 (dd, J = 10.9, 7.6 Hz, 1H), 4.80 (dd, J = 10.9, 7.7 Hz, 1H), 3.93 - 3.84 (m, 2H), 3.57 - 3.50 (m, 2H), 3.21 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 2.79 (app. p, J = 8.5 Hz, 2H), 2.47 - 2.34 (m, 2H), 2.18 (ddd, J = 13.5, 8.3, 7.0 Hz, 1H), 2.08 (ddd, J = 13.2, 8.5, 7.0 Hz, 1H), 1.95 - 1.85 (m, 3H), 1.83 - 1.75 (重複する m, 1H), 1.78 (s, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.66 - 1.41 (m, 12H), 1.38 - 1.20 (m, 4H), 1.05 - 0.94 (m, 2H).	429.5	B	B

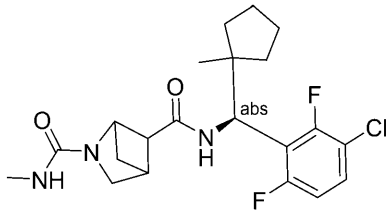
【表１－５７８】

I-1974		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 8.44 - 8.28 (m, 2H), 8.08 (dd,J= 16.7, 8.8 Hz, 0.5H), 7.97 (dd,J= 8.7, 4.8 Hz, 0.5H), 7.59 - 7.45 (m, 2H), 7.34 - 7.20 (m, 1H), 7.13 (t,J= 9.4 Hz, 1H), 5.22 - 5.04 (m, 1H), 4.88 (t,J= 6.6 Hz, 0.5H), 4.73 (t,J= 6.3 Hz, 0.5H), 3.81 - 3.68 (m, 1H), 3.64 - 3.49 (m, 1H), 3.48 - 3.30 (m, 2H), 3.26 (dd,J= 18.1, 9.8 Hz, 1H), 3.16 - 3.05 (m, 1H), 3.03 - 2.97 (m, 0.5H), 2.94 - 2.90 (m, 0.5H), 1.68 - 1.56 (m, 4H), 1.55 - 1.31 (m, 4H), 1.25 - 1.14 (m, 1H), 0.99 - 0.83 (m, 3H). 約1:1:0.5:0.5 の比のジアステレオマー。約 10%の混合不純物	488.5	D	

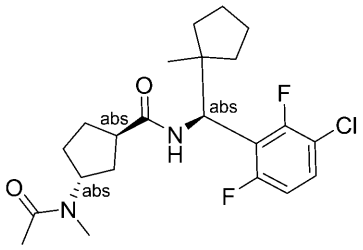
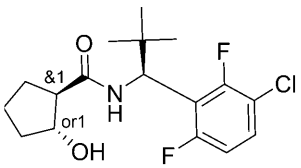
【表１－５７９】

I-1975		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.04 (d, J = 9.1 Hz, 0.5H), 7.96 (d, J = 9.1 Hz, 0.5H), 7.60 - 7.51 (m, 1H), 7.15 (app. t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.20 - 5.07 (m, 1H), 4.93 (br. s, 0.5H), 4.77 (s, 0.5H), 4.06 (app. dt, J = 11.9, 6.2 Hz, 0.5H), 4.00 (br. s, 0.5H), 2.65 (app. td, J = 14.2, 7.6 Hz, 1H), 1.94 - 1.84 (m, 0.5H), 1.80 - 1.65 (m, 1H), 1.65 - 1.36 (m, 4H), 0.94 (s, 4.5H), 0.91 (s, 4.5H). ジアステレオマーの 1:1 混合物。立体化学は任意割り当て。5%の不純物。	346.3	E	

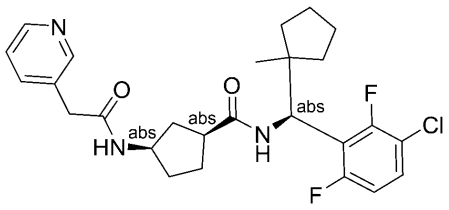
【表１－５８０】

I-1976		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 7.75 (d,J= 9.2 Hz, 0.5H), 7.61 (d,J= 9.3 Hz, 0.5H), 7.58 - 7.48 (m, 1H), 7.19 - 7.05 (m, 1H), 6.20 (q,J= 4.3 Hz, 0.5H), 6.01 (q,J= 4.3 Hz, 0.5H), 5.18 (d,J= 9.2 Hz, 1H), 4.60 (d,J= 6.8 Hz, 0.5H), 4.48 (d,J= 6.7 Hz, 0.5H), 3.27 (重複する dd,J= 10.8, 8.0 Hz, 1H), 3.08 (d,J= 7.7 Hz, 0.5H), 3.00 (d,J= 7.8 Hz, 0.5H), 2.97 (埋没した m, 0.5H), 2.95 - 2.90 (m, 0.5H), 2.77 - 2.73 (m, 0.5H), 2.73 - 2.68 (m, 0.5H), 2.55 (重複する d, 1.5H), 2.41 (d,J= 4.5 Hz, 1.5H), 1.71 - 1.62 (m, 1H), 1.63 - 1.55 (m, 4H), 1.56 - 1.40 (m, 2H), 1.37 - 1.25 (m, 1H), 1.24 - 1.09 (m, 1H), 1.08 - 0.97 (m, 1H), 0.91 (重複する s, 1.5H), 0.90 (重複する s, 1.5H). 1:1 の比のジアステレオマー。一部ギ酸塩。残留 DMSO が存在。微量の不純物。	426.5	D	

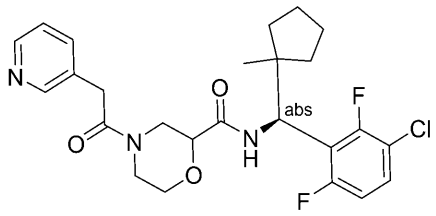
【表１－５８１】

I-1977		(400 MHz, DMSO-d6) - 回転異性体の約 1:1 混合物として- 8.16 (d, J = 8.9 Hz, 0.5H), 8.12 (d, J = 8.6 Hz, 0.5H), 7.59 - 7.52 (m, 1H), 7.17 - 7.11 (m, 1H), 5.20 (d, J = 8.4 Hz, 0.5H), 5.20 (d, J = 8.5 Hz, 0.5H), 4.91 - 4.82 (m, 0.5H), 4.29 (app. p, J = 8.1 Hz, 0.5H), 3.06 - 2.95 (m, 1H), 2.80 (s, 1.5H), 2.66 (s, 1.5H), 1.99 (s, 1.5H), 1.95 (s, 1.5H), 1.93 - 1.33 (m, 13H), 1.25 - 1.15 (m, 1H), 0.95 (s, 3H). 約 5～9%の未同定の不純物を含有。	427.5	A	B
I-1978		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.35 (2 重複する br. d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.61 - 7.53 (m, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 5.18 (重複する d, J = 4.4 Hz, 0.5H), 5.16 (d, J = 4.2 Hz, 0.5H), 5.04 (d, J = 3.4 Hz, 0.5H), 4.99 (d, J = 5.5 Hz, 0.5H), 4.27 - 4.23 (重複する m, 0.5H), 4.23 - 4.19 (重複する m, 0.5H), 2.55 (埋没した td, J = 13.2, 4.8 Hz, 1H), 1.84 - 1.45 (m, 6H), 0.92 (s, 9H). 2 つのジアステレオマーの 1:1 混合物。立体化学は任意割り当て。	346.3	D	

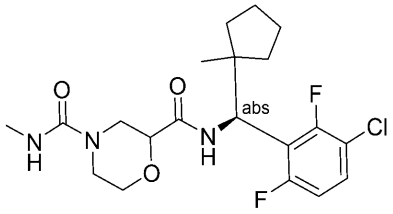
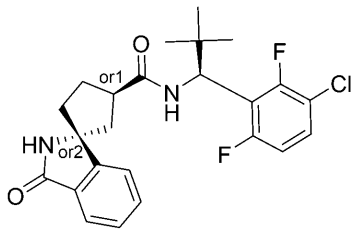
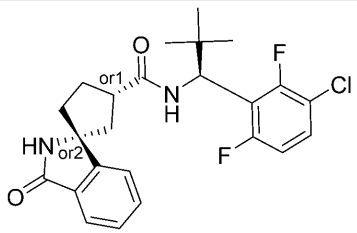
【表１－５８２】

I-1979		(400 MHz, DMSO-d6) - 8.44 - 8.41 (m, 2H), 8.14 - 8.09 (m, 2H), 7.65 (dt, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.55 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.32 (ddd, J = 7.8, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.17 - 7.10 (m, 1H), 5.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.05 - 3.96 (m, 1H), 3.43 (d, AB の A, JAB = 15.1 Hz, 1H), 3.39 (d, AB の B, JAB = 15.1 Hz, 1H), 3.04 - 2.94 (m, 1H), 1.94 - 1.77 (m, 3H), 1.67 - 1.53 (m, 6H), 1.52 - 1.32 (m, 4H), 1.23 - 1.15 (m, 1H), 0.95 (s, 3H).	490.5	A	B

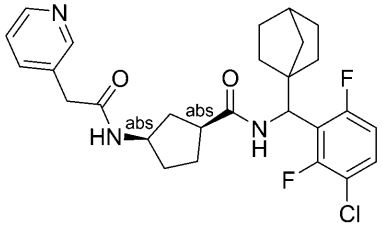
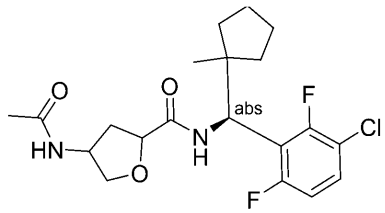
【表１－５８３】

I-1980		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 8.48 - 8.33 (m, 2H), 8.05 - 7.80 (m, 1H), 7.67 - 7.54 (m, 2H), 7.39 - 7.29 (m, 1H), 7.21 (app. t,J= 9.5 Hz, 1H), 5.31 (d,J= 8.9 Hz, 0.5H), 5.27 (d,J= 8.9 Hz, 0.5H), 4.37 (app. t,J= 14.2 Hz, 0.5H), 4.15 (ddd,J= 11.6, 9.2, 1.9 Hz, 0.5H), 4.08 - 3.94 (m, 2H), 3.95 - 3.84 (m, 1H), 3.83 - 3.68 (m, 2H), 3.59 - 3.46 (m, 1H), 3.31 - 3.07 (m, 1H), 3.04 - 2.78 (m, 0.5H), 2.68 - 2.54 (m, 0.5H), 1.72 - 1.55 (m, 4H), 1.56 - 1.43 (m, 2H), 1.43 - 1.29 (m, 1H), 1.28 - 1.13 (m, 1H), 0.94 (s, 1.5H), 0.92 (s, 1.5H). 1:1 の比のジアステレオマー。残留 DMF 溶媒	492.5	E	

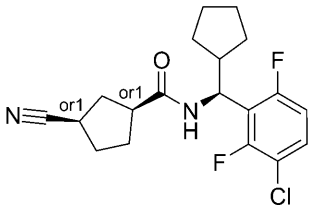
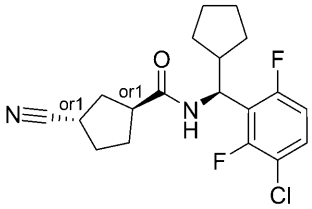
【表１－５８４】

I-1981		NMR (400 MHz, DMSO-d6)- 7.77 (d,J= 9.5 Hz, 0.5H), 7.71 (d,J= 10.0 Hz, 0.5H), 7.68 - 7.57 (m, 1H), 7.28 - 7.16 (m, 1H), 6.64 - 6.51 (m, 1H), 5.33 (d,J= 9.9 Hz, 0.5H), 5.29 (d,J= 9.6 Hz, 0.5H), 4.10 - 3.86 (m, 3H), 3.77 - 3.63 (m, 1H), 3.56 - 3.43 (m, 1H), 2.94 - 2.72 (m, 1H), 2.61 (埋没した m, 1H), 2.55 (重複する m, 3H), 1.70 - 1.57 (m, 4H), 1.57 - 1.40 (m, 2H), 1.41 - 1.28 (m, 1H), 1.28 - 1.12 (m, 1H), 0.92 (s, 3H). 1:1 の比のジアステレオマー。残留 DMSO。微量の不純物	430.5	E	
I-1982				B	C
I-1983				A	B

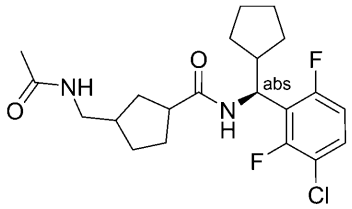
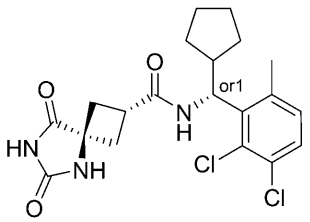
【表１－５８５】

I-1984		(400 MHz, DMSO-d6) - ジアステレオマーの約1:1 混合物として- 8.44 - 8.41 (m, 4H), 8.14 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 8.11 (dd, J = 6.9, 1.9 Hz, 2H), 7.66 - 7.62 (m, 2H), 7.53 (app. td, J = 8.6, 5.5 Hz, 2H), 7.34 - 7.30 (m, 2H), 7.15 - 7.09 (m, 2H), 5.39 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 4.05 - 3.93 (m, 2H), 3.45 - 3.36 (m, 4H), 3.02 - 2.92 (m, 2H), 2.15 - 2.12 (m, 2H), 1.95 - 1.70 (m, 6H), 1.65 - 1.34 (m, 14H), 1.29 - 1.16 (m, 12H).	502.5	A	B
I-1985		NMR (400 MHz, d6-DMSO) - 8.14 (d, J = 6.5, 0.1H), 8.11 (d, J = 6.6, 0.1H), 8.03 (d, J = 5.9 Hz, 0.4H), 7.94 (d, J = 9.7 Hz, 0.4H), 7.91 - 7.80 (m, 1H), 7.65 - 7.57 (m, 1H), 7.24 - 7.16 (m, 1H), 5.32 - 5.21 (m, 1H), 4.55 - 4.32 (m, 1H), 4.29 - 4.13 (m, 1H), 4.04 - 3.86 (m, 1H), 3.69 - 3.54 (m, 1H), 2.47 - 2.36 (m, 1H), 1.81 - 1.69 (m, 3H), 1.68 (s, 1H), 1.66 - 1.57 (m, 4H), 1.57 - 1.43 (m, 2H), 1.41 - 1.29 (m,1H), 1.25 - 1.15 (m, 1H), 0.97 - 0.90 (m, 3H).	415.1	C	

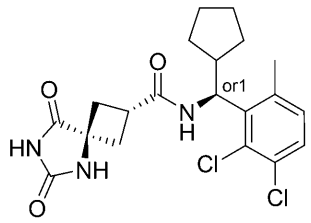
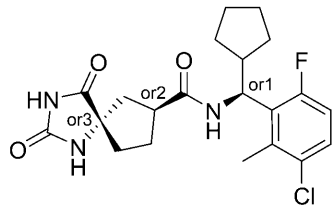
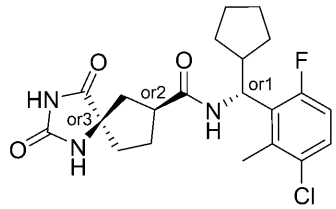
【表１－５８６】

I-1986		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.51 (d,J= 7.4 Hz, 1H), 7.57 - 7.47 (m, 1H), 7.16 - 7.08 (m, 1H), 4.82 (dd,J= 10.6, 7.8 Hz, 0.5H), 4.79 (dd,J= 10.8, 7.9 Hz, 0.5H), 3.09 - 2.97 (m, 1H), 2.97 - 2.85 (m, 1H), 2.47 - 2.33 (m, 1H), 2.08 - 1.80 (m, 4.5H), 1.79 - 1.40 (m, 6.5H), 1.39 - 1.20 (m, 2H), 1.05 - 0.93 (m, 1H). 2 つのジアステレオマーの 1:1 混合物。8%の主な副生成物。立体化学は任意割り当て。	367.3	C	
I-1987		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d,J= 7.2 Hz, 1H), 7.56 - 7.49 (m, 1H), 7.16 - 7.09 (m, 1H), 4.86 - 4.80 (m, 0.4H), 4.81 (dd,J= 10.9, 7.9 Hz, 0.6H), 3.00 - 2.90 (m, 1H), 2.80 - 2.70 (m, 1H), 2.47 - 2.35 (m, 1H), 2.23 (dt,J= 12.7, 8.1 Hz, 0.6H), 2.13 (dt,J= 12.7, 8.1 Hz, 0.4H), 2.01 - 1.67 (m, 5.4H), 1.66 - 1.42 (m, 4.6H), 1.39 - 1.21 (m, 2H), 1.06 - 0.93 (m, 1H). 9:1 の比の 2 対のジアステレオマー。2 つのジアステレオマーの 3:2 混合物として主要な対を記載。立体化学は任意割り当て	367.3	C	

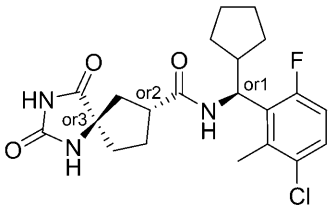
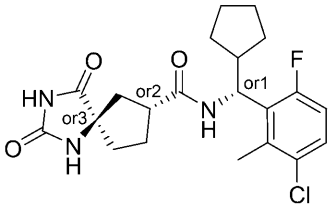
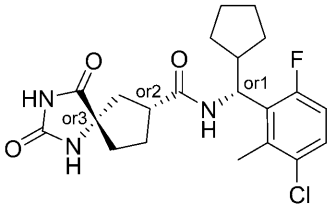
【表１－５８７】

I-1988		NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.28 (d,J= 7.5 Hz, 1H), 7.82 - 7.72 (m, 1H), 7.48 (app. td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.08 (app. td,J= 9.5, 1.1 Hz, 1H), 4.82 - 4.72 (m, 1H), 2.98 - 2.83 (m, 2H), 2.72 - 2.58 (m, 1H), 2.43 - 2.31 (m, 1H), 2.03 - 1.77 (m, 2H), 1.74 (s, 0.5H), 1.73 (s, 1H), 1.72 (s, 0.5H), 1.71 (s, 1H), 1.70 - 1.34 (m, 8H), 1.34 - 1.15 (m, 3H), 1.15 - 1.02 (m, 1H), 1.01 - 0.88 (m, 1H). 4つのジアステレオマーの 2:2:1:1 混合物	413.3	C	
I-1989		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.36 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.20 - 7.03 (m, 1H), 5.40 - 4.76 (m, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.84 (s, 1H), 2.62 (dt, J = 28.4, 10.4 Hz, 3H), 2.39 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 2.28- 2.09 (m, 2H), 2.03- 1.92 (m, 1H), 1.70 - 1.35 (m, 4H), 1.35 - 0.79 (m, 4H).	424.05	D	

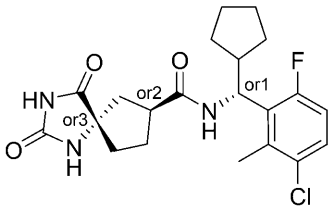
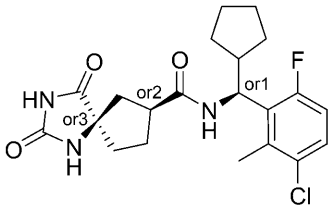
【表１－５８８】

I-1990		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.48 - 7.33 (m, 1H), 7.26 - 6.96 (m, 1H), 5.05 (d, J = 169.9 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.84 (s, 1H), 2.62 (dt, J = 28.5, 10.8 Hz, 3H), 2.38 (s, 1H), 2.26- 2.09 (m, 2H), 1.97 (dt, J = 12.1, 6.0 Hz, 1H), 1.68 - 1.38 (m, 4H), 1.35-0.63 (m, 4H).	424.05	B	
I-1991		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.35 (dd, J = 8.8, 4.9 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 10.7, 8.7 Hz, 1H), 4.80 (dd, J = 11.1, 7.3 Hz, 1H), 2.97 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.49 (s, 4H), 2.11 (dd, J = 13.3, 8.2 Hz, 1H), 1.97-1.80 (m, 4H), 1.78-1.67 (m, 1H), 1.66-1.41 (m, 5H), 1.31-1.14 (m, 2H), 0.96 (dd, J = 12.6, 7.9 Hz, 1H).	422.15	A	B
I-1992		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.34 (dd, J = 9.0, 4.8 Hz, 1H), 7.03 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 4.81 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.95-2.86 (m, 1H), 2.49 (s, 4H), 2.05-1.91 (m, 4H), 1.78 (p, J = 8.2, 7.4 Hz, 2H), 1.72-1.40 (m, 5H), 1.25 (q, J = 9.8, 7.1 Hz, 2H), 0.96 (s, 1H).	422.15	D	

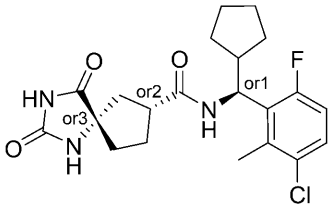
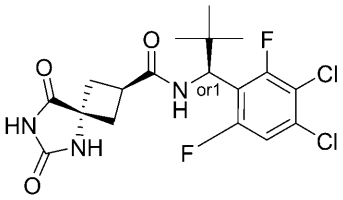
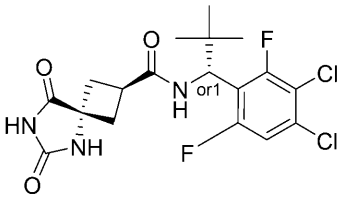
【表１－５８９】

I-1993		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.34 (dd, J = 9.1, 4.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 10.7, 8.8 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.3 Hz, 1H), 2.95-2.87 (m, 1H), 2.49 (s, 4H), 2.05-1.98 (m, 2H), 2.02-1.88 (m, 2H), 1.84-1.72 (m, 2H), 1.69-1.41 (m, 5H), 1.31-1.20 (m, 2H), 0.96 (dq, J = 15.7, 8.0 Hz, 1H).	422.25	A	B
I-1994		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.35 (dd, J = 8.8, 5.0 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 10.7, 8.8 Hz, 1H), 4.80 (dd, J = 11.2, 7.3 Hz, 1H), 2.97 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.49 (s, 4H), 2.11 (dd, J = 13.3, 8.2 Hz, 1H), 1.99-1.80 (m, 4H), 1.78-1.60 (m, 4H), 1.59 (s, 2H), 1.33-1.14 (m, 2H), 1.03-0.90 (m, 1H).	422.15	E	
I-1995		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.35 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 10.7, 8.8 Hz, 1H), 4.86-4.77 (m, 1H), 2.95 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 2.49 (s, 4H), 2.06-1.88 (m, 4H), 1.88-1.71 (m, 3H), 1.65-1.41 (m, 4H), 1.33-1.14 (m, 2H), 0.96 (dq, J = 16.1, 8.1 Hz, 1H).	422.15	E	

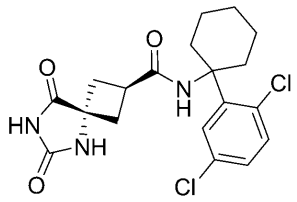
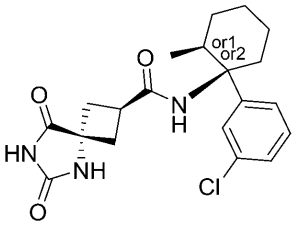
【表１－５９０】

I-1996		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.35 (dd, J = 8.8, 4.9 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 10.7, 8.8 Hz, 1H), 4.84-4.75 (m, 1H), 2.92 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.50 (s, 4H),2.11 (dd, J = 13.1, 10.2 Hz, 1H), 2.03-1.91 (m, 2H), 1.93-1.81 (m, 2H), 1.71-1.58 (m, 5H), 1.58-1.41 (m, 1H), 1.31-1.18 (m, 2H), 0.96 (s, 1H).	422.15	D	
I-1997		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.34 (dd, J = 8.9, 4.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 10.7, 8.8 Hz, 1H), 4.82 (dd, J = 11.1, 7.2 Hz, 1H), 2.96 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.49 (s, 3H), 2.06-1.88 (m, 4H), 1.88-1.71 (m, 3H), 1.63-1.41 (m, 4H), 1.31-1.22 (m, 3H), 0.96 (dq, J = 16.0, 8.0 Hz, 1H).	422.25	C	

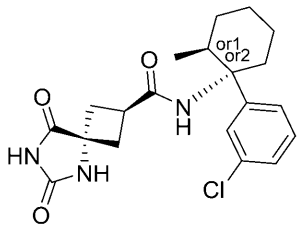
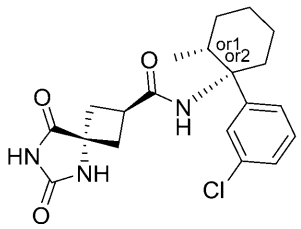
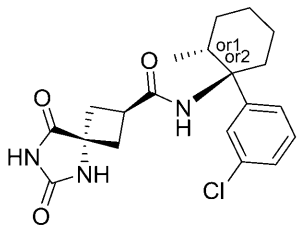
【表１－５９１】

I-1998		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.35 (dd, J = 8.5, 4.6 Hz, 1H), 7.05 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 4.80 (dd, J = 11.1, 7.2 Hz, 1H), 2.96-2.87 (m, 1H), 2.49 (s, 4H), 2.11 (dd, J = 13.1, 10.2 Hz, 1H), 2.03-1.82 (m, 4H), 1.66-1.43 (m, 6H), 1.24 (s, 2H), 0.96 (s, 1H).	422.2	A	A
I-1999		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 5.04 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.26 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72 - 2.55 (m, 2H), 2.22 (dddd, J = 21.7, 12.9, 9.2, 3.9 Hz, 2H), 0.94 (s, 9H).	434	A	B
I-2000		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 5.04 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.26 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 - 2.54 (m, 2H), 2.22 (dddd, J = 21.9, 13.1, 9.7, 4.0 Hz, 2H), 0.94 (s, 9H).	434	E	

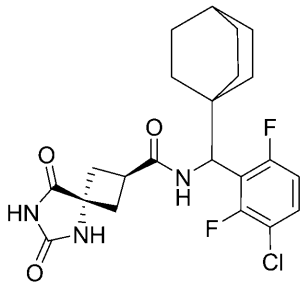
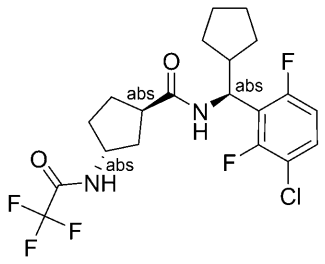
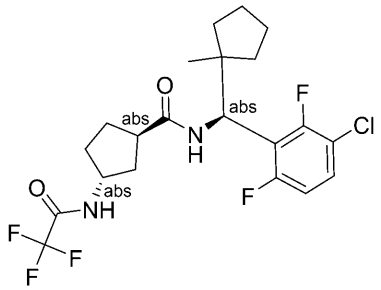
【表１－５９２】

I-2001		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.46 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 2.67 - 2.55 (m, 4H), 2.17 (td, J = 9.5, 2.9 Hz, 2H), 2.08 (s, 1H), 1.59 (d, J = 33.3 Hz, 7H), 1.24 (s, 1H).	410.1	D	
I-2002		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.28 (dd, J = 15.0, 9.8 Hz, 2H), 7.08 (d, J = 8.2 Hz, 3H), 3.83 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 3.15 - 2.94 (m, 1H), 2.92 - 2.62 (m, 3H), 2.27-2.00 (m, 2H), 1.93 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 1.75 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 1.60 (s, 2H), 1.44 (t, J = 17.3 Hz, 2H), 1.39-1.21 (m, 1H), 0.97 (s, 3H).	390.15	E	

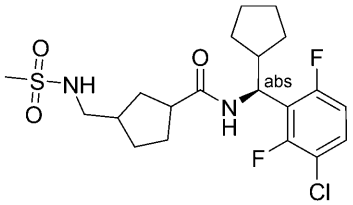
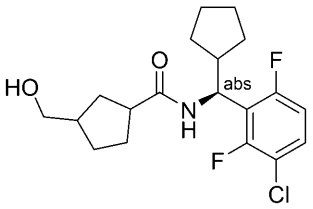
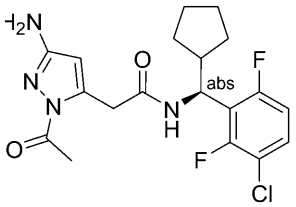
【表１－５９３】

I-2003		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.63 (d, J = 16.3 Hz, 1H), 7.35-7.16 (m, 3H), 7.15-7.05 (m, 2H), 3.83 (dd, J = 13.3, 3.4 Hz, 1H),3.01 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.80-2.62 (m, 3H), 2.30 (s, 1H), 2.08 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 2H), 1.93 (q, J = 13.1 Hz, 1H), 1.75 (d, J = 12.6 Hz, 1H), 1.66-1.55 (m, 2H), 1.45 (dd, J = 22.6, 12.8 Hz, 2H), 1.32 (t, J = 12.7 Hz, 1H), 0.97 (s, 2H).	390.1	E	
I-2004		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.49 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.36-7.23 (m, 3H), 6.57 (s, 1H), 3.25 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.69-2.58 (m, 2H), 2.48 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 2.28 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 2.24-2.13 (m, 3H), 1.73 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 1.49 (d, J = 10.7 Hz, 2H), 1.36 (q, J = 14.1, 13.6 Hz, 2H), 1.24 (s, 3H), 1.20 (s, 1H)	390.2	E	
I-2005		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.60 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.36-7.23 (m, 3H), 6.57 (s, 1H), 3.24 (q, J = 9.1 Hz, 1H), 2.69-2.58 (m, 2H), 2.47 (s, 1H), 2.28 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 2.24-2.14 (m, 3H), 1.78-1.69 (m, 1H), 1.49 (d, J = 10.6 Hz, 2H), 1.36 (q, J = 13.7 Hz, 2H), 1.24 (s, 3H), 1.20 (s, 1H).	390.15	E	

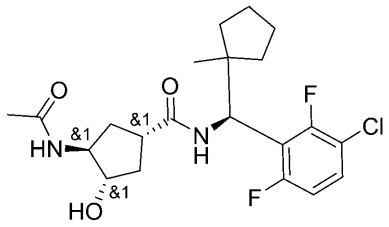
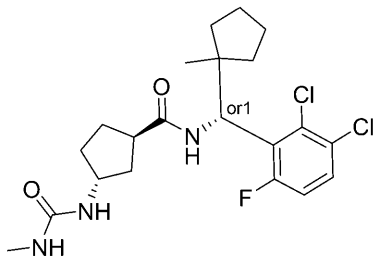
【表１－５９４】

I-2006		(500 MHz, d6-DMSO) 10.55 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.13 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.54 (app td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.16 - 7.06 (m, 1H), 4.96 (br s, 1H), 3.24 (app p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.65 (dd, J = 11.6, 9.0 Hz, 1H), 2.60 - 2.53 (m, 1H), 2.26 - 2.20 (m, 1H), 2.16 (ddd, J = 16.1, 9.2, 4.2 Hz, 1H), 1.55 - 1.34 (m, 13H).	452	A	A
I-2007		(400 MHz, DMSO-d6) 9.30 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.52 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.12 (app. td, J = 9.5, 1.5 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 4.16 - 4.06 (m, 1H), 2.91 - 2.83 (m, 1H), 2.47 - 2.36 (m, 1H), 2.00 - 1.79 (m, 4H), 1.73 (ddd, J = 13.1, 8.9, 6.1 Hz, 1H), 1.66 - 1.40 (m, 6H), 1.38 - 1.21 (m, 2H), 1.05 - 0.95 (m, 1H).	453.4	A	B
I-2008		(400 MHz, DMSO-d6) 9.30 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.55 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 - 7.11 (m, 1H), 5.19 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.16 - 4.07 (m, 1H), 3.07 - 2.98 (m, 1H), 2.00 - 1.92 (m, 1H), 1.92 - 1.82 (m, 2H), 1.75 (ddd, J = 13.2, 8.9, 6.3 Hz, 1H), 1.64 - 1.41 (m, 8H), 1.40 - 1.33 (m, 1H), 1.24 - 1.16 (m, 1H), 0.95 (s, 3H). 一部ギ酸塩 (＜5%)。	467.4	A	B

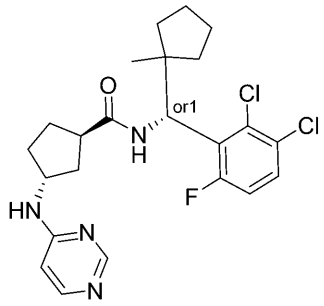
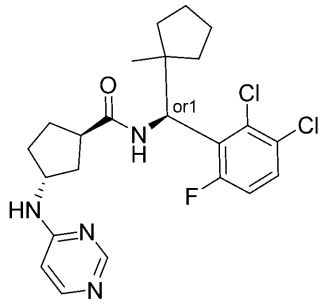
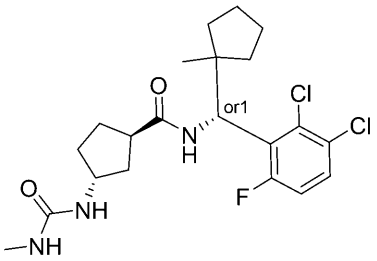
【表１－５９５】

I-2009		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d,J= 7.5 Hz, 1H), 7.82 - 7.72 (m, 1H), 7.48 (app. td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.08 (app. td,J= 9.5, 1.1 Hz, 1H), 4.82 - 4.72 (m, 1H), 2.98 - 2.83 (m, 2H), 2.72 - 2.58 (m, 1H), 2.43 - 2.31 (m, 1H), 2.03 - 1.77 (m, 2H), 1.74 (s, 0.5H), 1.73 (s, 1H), 1.72 (s, 0.5H), 1.71 (s, 1H), 1.70 - 1.34 (m, 8H), 1.34 - 1.15 (m, 3H), 1.15 - 1.02 (m, 1H), 1.01 - 0.88 (m, 1H). 4 つのジアステレオマーの 2:2:1:1 混合物	449.3	B	
I-2010		(500 MHz, DMSOd6) 8.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.52 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.11 (app. t, J = 9.3 Hz, 1H), 4.85 - 4.78 (m, 1H), 4.42 (br. s, 1H), 3.21 (重複する m, 2H), 2.74 - 2.60 (m, 1H), 2.47 - 2.34 (m, 1H), 2.07 - 1.84 (m, 2H), 1.81 - 1.38 (m, 8H), 1.37 - 1.21 (m, 3H), 1.20 - 1.08 (m, 1H), 1.04 - 0.94 (m, 1H). 2 つのジアステレオマーの 5:4 の比の混合物と思われる。	372.2	C	
I-2012		(500 MHz, DMSOd6) 8.66 (d,J= 7.6 Hz, 1H), 7.53 (app. td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.12 (app td,J= 9.6, 1.3 Hz, 1H), 6.52 (br. s, 2H), 5.19 (s, 1H), 4.85 (dd,J= 11.0, 7.8 Hz, 1H), 3.33 (重複する AB の dA,JAB= 14.7 Hz, 1H), 3.28 (AB の dB ,JAB= 14.8 Hz, 1H), 2.46 (s, 3H), 2.43 (重複する m, 1H), 1.96 - 1.87 (m, 1H), 1.66 - 1.43 (m, 4H), 1.38 - 1.26 (m, 2H), 1.05 - 0.96 (m, 1H). 主要な位置異性体を記載(4:1 の比)	411.2	D	

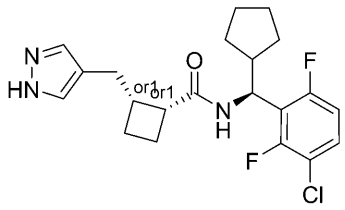
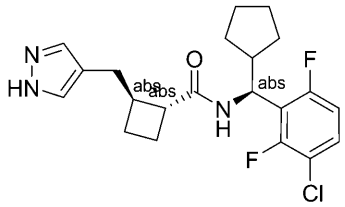
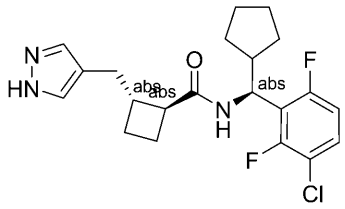
【表１－５９６】

I-2013		(500 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの約 1:1 混合物及び回転異性体の約 9:1 混合物として, 8.19 - 8.12 (m, 2H), 7.76 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 7.55 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 2H), 7.17 - 7.12 (m, 2H), 5.20 - 5.15 (m, 3H), 5.13 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 3.85 - 3.74 (m, 4H), 2.95 - 2.87 (m, 2H), 2.06 (ddd, J = 13.2, 9.0, 6.0 Hz, 1H), 2.03 - 1.96 (m, 2H), 1.93 - 1.87 (m, 1H), 1.81 - 1.77 (m, J = 3.4 Hz, 6H), 1.64 - 1.43 (m, 16H), 1.38 - 1.32 (m, 2H), 1.22 - 1.16 (m, 2H), 0.95 - 0.92 (m, 6H).	429.4	A	B
I-2014		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.79 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.84 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.95 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.84 (dh, J = 12.1, 5.5 Hz, 2H), 1.65 (dd, J = 12.8, 7.1 Hz, 1H), 1.60 (s, 9H), 1.51 (ddd, J = 13.3, 8.9, 5.3 Hz, 1H), 1.36 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 1.34 - 1.24 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	444.15	D	

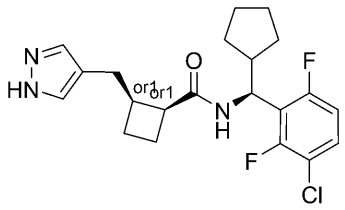
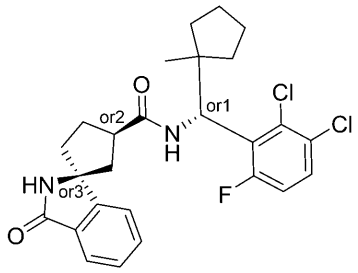
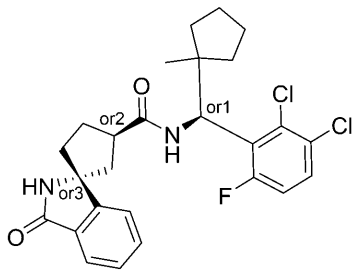
【表１－５９７】

I-2015		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (s, 1H), 8.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.42 (dd, J = 6.1, 1.3 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.22 (s, 1H), 3.01 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 1.96 (tt, J = 13.4, 7.1 Hz, 3H), 1.73 (ddd, J = 13.4, 8.8, 5.3 Hz, 1H), 1.60 (s, 6H), 1.54-1.46 (m, 2H),1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.15	A	A
I-2016		(400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.3-7.21 (m, 1H), 6.40 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.19 (s, 1H), 1.97 (s, 3H), 1.81 (dt, J = 13.8, 7.2 Hz, 1H), 1.60 (s, 9H), 1.49 (s, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.15	B	
I-2017		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.25 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.81 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 5.56 (s, 1H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.88 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.99-2.91 (m, 1H), 2.53 (s, 3H), 1.88-1.70 (m, 3H), 1.68-1.57 (m, 7H), 1.44 (dd, J = 12.6, 7.5 Hz, 1H), 1.37 (s, 1H), 1.35-1.24 (m, 2H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	444.15	A	B

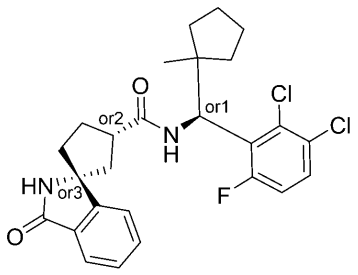
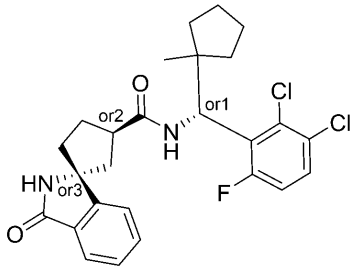
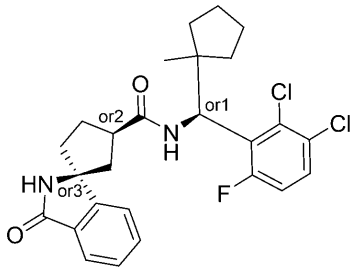
【表１－５９８】

I-2018		(400 MHz, DMSO-d6) 12.62 (s, 1H), 8.43 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 2H), 7.13 (td, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 6.22 (dd, J = 46.3, 11.6 Hz, 3H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 2.47- 2.35 (m, 1H), 2.24 - 1.99 (m, 4H), 1.98 - 1.86 (m, 1H), 1.71 - 1.41 (m, 6H), 1.39 - 1.21 (m, 2H), 1.00 (dq, J = 16.2, 8.0 Hz, 1H).	408.2	D	
I-2019		(400 MHz, DMSO-d6) 12.49 (s, 1H), 8.16 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.36 (s, 2H), 7.12 (td, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.79 (dd, J = 11.2, 7.5 Hz, 1H), 2.77 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 2.55 (dd, J = 9.8, 6.3 Hz, 2H), 2.48 - 2.29 (m, 2H), 1.91 - 1.71 (m, 4H), 1.68-1.39 (m, 5H), 1.32 (dtd, J = 11.6, 7.4, 3.9 Hz, 1H), 1.19 (dq, J = 15.9, 7.7 Hz, 1H), 0.98 (dq, J = 15.7, 7.9 Hz, 1H).	408.15	C	D
I-2020		(400 MHz, DMSO-d6) 12.43 (s, 1H), 8.17 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.28 (s, 2H), 7.16- 7.05 (m, 1H), 4.81 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 2.76 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 2.50 - 2.32 (m, 4H), 1.96 - 1.74 (m, 4H), 1.70 - 1.41 (m, 5H), 1.40 - 1.18 (m, 2H), 1.00 (dd, J = 12.2, 8.2 Hz, 1H).	408.2	D	

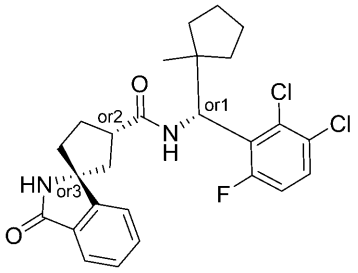
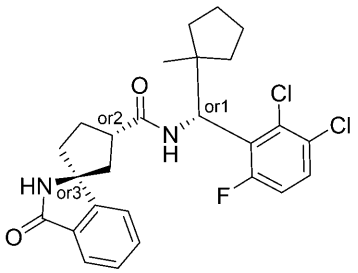
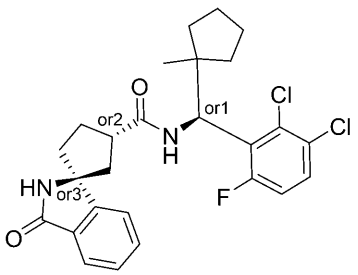
【表１－５９９】

I-2021		(400 MHz, DMSO-d6) 12.66 (d, J = 65.9 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 2H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 6.41 -6.05 (m, 3H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.5 Hz, 1H), 2.40 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.12 (dddd, J = 31.3, 16.8, 14.1, 7.3 Hz, 4H), 1.99 - 1.84 (m, 1H), 1.76 -1.40 (m, 6H), 1.40-1.20 (m, 2H), 1.00 (p, J = 8.0 Hz, 1H).	408.15	C	
I-2022		(400 MHz, DMSO-d6) 8.51 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.67 - 7.57 (m, 4H), 7.47 (ddd, J = 8.0, 5.5, 2.6 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.42 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 2.26 - 2.13 (m, 1H), 2.12 - 1.87 (m, 5H), 1.63 (s, 6H), 1.40 (s, 1H), 1.29 (s, 1H), 1.00 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	489.05	A	A
I-2023		(400 MHz, DMSO-d6) 8.97 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.70- 7.54 (m, 4H), 7.51 - 7.41 (m, 1H), 7.29 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.28 (dd, J = 13.2, 5.1 Hz, 1H), 2.39 - 2.22 (m, 1H), 2.20 - 1.98 (m, 3H), 1.97 - 1.86 (m, 1H), 1.77 - 1.65 (m, 1H), 1.58 (s, 6H), 1.36 (s, 1H), 1.26 (d, J = 13.2 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	489.05	D	

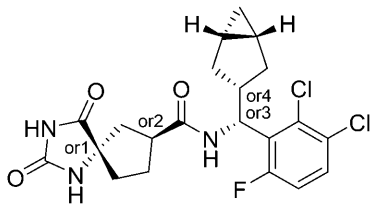
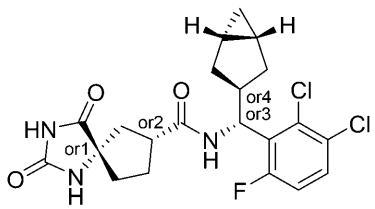
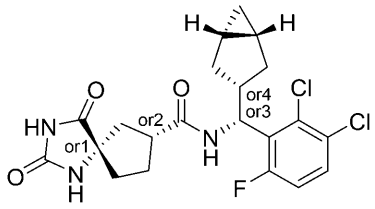
【表１－６００】

I-2024		(400 MHz, DMSO-d6) 8.96 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.64 -7.49 (m, 4H), 7.43 (td, J = 7.0, 1.6 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.55 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.31-3.20 (m, 1H), 2.26 - 2.00 (m, 4H), 1.96 - 1.85 (m, 1H), 1.79-1.67 (m, 1H), 1.62 (s, 6H), 1.41 (s, 1H), 1.30 (s, 1H), 1.00 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	489.05	C	
I-2025		(400 MHz, DMSO-d6) 8.95 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.8, 6.2 Hz, 2H), 7.56 - 7.49 (m, 2H), 7.43 (td, J = 7.0, 1.6 Hz, 1H), 7.21 (ddd, J = 10.7, 8.9, 1.7 Hz, 1H), 5.55 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.29 (dd, J = 8.5, 5.9 Hz, 1H), 2.28 - 2.00 (m, 4H), 1.90 (dd, J = 13.3, 8.1 Hz, 1H), 1.79 - 1.68 (m, 1H), 1.62 (s, 6H), 1.40 (s, 1H), 1.29 (s, 1H), 0.99 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	489.05	A	B
I-2026		(400 MHz, DMSO-d6) 8.55 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.68 - 7.56 (m, 4H), 7.47 (ddd, J = 8.0, 4.6, 3.5 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.42 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 2.23 - 2.01 (m, 3H), 1.92 (ddt, J = 17.8, 14.3, 5.5 Hz, 3H), 1.59 (s, 6H), 1.32 (d, J = 39.9 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	489.05	D	

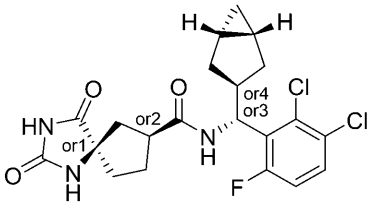
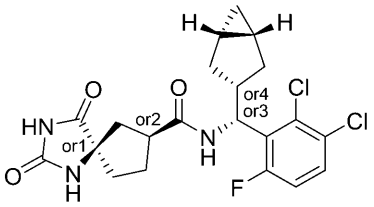
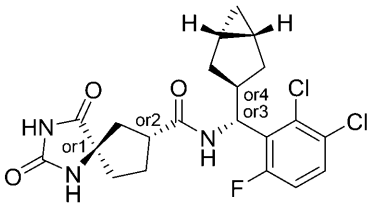
【表１－６０１】

I-2027		(400 MHz, DMSO-d6) 8.97 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.74- 7.52 (m, 4H), 7.45 (dt, J = 6.7, 4.2 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.28 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 2.28 (dd, J = 13.1, 9.0 Hz, 1H), 2.19- 1.98 (m, 3H), 1.97 -1.84 (m, 1H), 1.68 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 1.58 (s, 6H), 1.32 (d, J = 37.4 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	489.05	A	A
I-2028		(400 MHz, DMSO-d6) 8.55 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.68 - 7.58 (m, 4H), 7.53 -7.43 (m, 1H), 7.30 (dd, J = 10.8, 8.7 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.42 (q, J = 8.0, 7.6 Hz, 1H), 2.22- 2.01 (m, 3H), 2.01 -1.81 (m, 3H), 1.59 (s, 6H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	489.05	A	A
I-2029		(400 MHz, DMSO-d6) 8.51 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.5 Hz, 4H), 7.47 (ddd, J = 7.9, 5.6, 2.6 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.42 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 2.20 (dq, J = 14.7, 6.9 Hz, 1H), 2.10 - 1.99 (m, 2H), 1.98 - 1.85 (m, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.40 (s, 1H), 1.29 (s, 1H), 1.00 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	489.05	D	

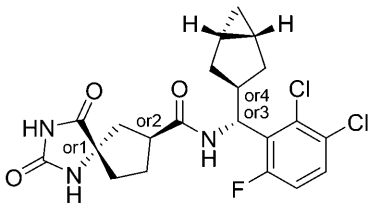
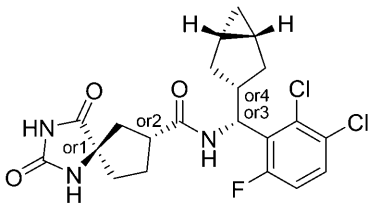
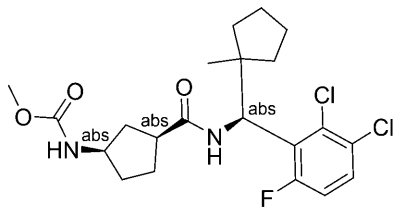
【表１－６０２】

I-2030		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.09-5.01 (m, 1H), 2.95 (t, J = 8.5 Hz, 1H), 2.24 (s, 1H), 2.10 (dt, J = 13.6, 6.7 Hz, 2H), 1.88 (p, J = 8.5 Hz, 3H), 1.78 - 1.67 (m, 1H), 1.66- 1.54 (m, 1H), 1.45 (q, J = 6.8, 4.0 Hz, 2H), 1.34-1.10 (m, 3H), 0.28 (td, J = 7.9, 4.8 Hz, 1H), 0.13 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	454	E	
I-2031		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.58 (ddd, J = 9.0, 5.3, 2.1 Hz, 1H), 7.30 - 7.20 (m, 1H), 5.05 (s, 1H), 2.95 (s, 1H), 2.24 (s, 1H), 2.10 (dt, J = 13.7, 6.6 Hz, 2H), 1.88 (td, J = 12.2, 9.5, 5.5 Hz, 3H), 1.73 (dd, J = 16.6, 8.8 Hz, 1H), 1.59 (s, 1H), 1.45 (d, J = 11.4 Hz, 2H), 1.38 - 1.08 (m, 3H), 0.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 0.13 (d, J = 4.6 Hz, 1H).	454	A	B
I-2032		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.07 (s, 1H), 2.93 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.24 (s, 1H), 2.11 (dd, J = 12.2, 6.9 Hz, 1H), 2.06 - 1.87 (m, 3H), 1.86 -1.66 (m, 3H), 1.46 (s, 2H), 1.33 - 1.19 (m, 3H), 1.17 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 0.28 (td, J = 7.9, 4.9 Hz, 1H), 0.13 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	454	D	

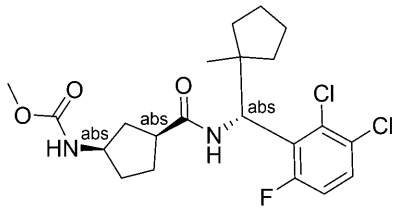
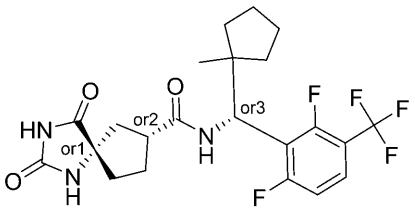
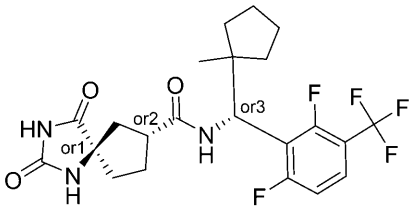
【表１－６０３】

I-2033		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.62- 7.54 (m, 1H), 7.24 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.05 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.90 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.25 (s, 1H), 2.13 (dd, J = 12.1, 7.1 Hz, 1H), 1.96 (ddd, J = 16.8, 11.6, 8.9 Hz, 3H), 1.83 - 1.74 (m, 2H), 1.65 (dd, J = 10.8, 5.6 Hz, 1H), 1.45 (q, J = 7.1, 3.9 Hz, 2H), 1.36 - 1.11 (m, 3H), 0.29 (s, 1H), 0.17 - 0.11 (m, 1H).	454	A	B
I-2034		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.04 (s, 1H), 2.90 (s, 1H), 2.25 (s, 1H), 2.19 - 2.05 (m, 2H), 2.02 - 1.81 (m, 3H), 1.62 (d, J = 4.4 Hz, 2H), 1.44 (s, 2H), 1.37 - 1.14 (m, 3H), 0.28 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 0.13 (d, J = 4.4 Hz, 1H).	454	D	
I-2035		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.05 (s, 1H), 2.90 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 2.25 (s, 1H), 2.19 - 2.03 (m, 2H), 1.91 (ddd, J = 21.6, 13.6, 9.0 Hz, 3H), 1.71 - 1.55 (m, 2H), 1.45 (d, J = 11.3 Hz, 2H), 1.37 - 1.13 (m, 3H), 0.33 - 0.23 (m, 1H), 0.13 (d, J = 4.4 Hz, 1H).	454	A	B

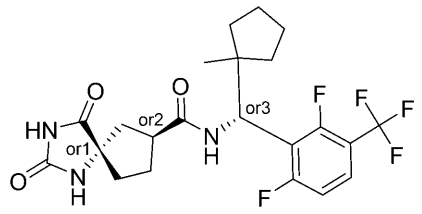
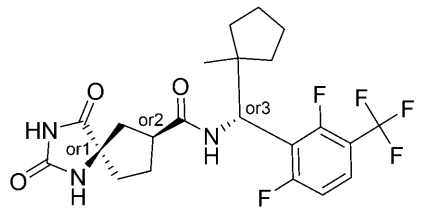
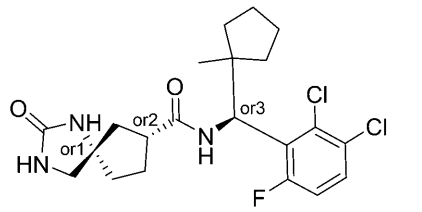
【表１－６０４】

I-2036		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.58 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.07 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 2.94 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.24 (s, 1H), 2.12 (dd, J = 12.3, 7.0 Hz, 1H), 2.05 - 1.94 (m, 2H), 1.94 - 1.87 (m, 1H), 1.77 (dddd, J = 22.7, 19.2, 14.4, 9.2 Hz, 3H), 1.46 (s, 2H), 1.37 - 1.15 (m, 3H), 0.28 (td, J = 7.9, 4.9 Hz, 1H), 0.13 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	454	B	
I-2037		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.42 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.62 - 7.54 (m, 1H), 7.24 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 5.05 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 2.96 - 2.84 (m, 1H), 2.25 (s, 1H), 2.13 (dd, J = 12.2, 6.9 Hz, 1H), 1.97 (ddd, J = 17.1, 13.6, 8.7 Hz, 3H), 1.79 (dd, J = 13.1, 8.6 Hz, 2H), 1.65 (dd, J = 10.9, 5.5 Hz, 1H), 1.51 - 1.41 (m, 2H), 1.36 - 1.09 (m, 3H), 0.29 (td, J = 7.9, 4.8 Hz, 1H), 0.18 - 0.11 (m, 1H).	454	C	
I-2038		(400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.79 (q, J = 6.6 Hz, 4H), 3.50 (s, 3H), 2.96 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.85 (ddt, J = 16.2, 11.9, 5.1 Hz, 2H), 1.73-1.54 (m, 8H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	445.1	D	

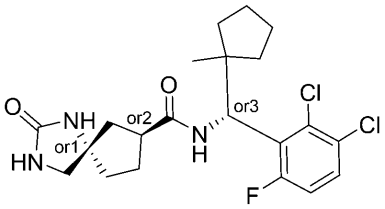
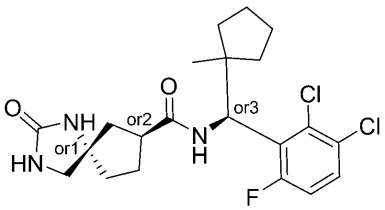
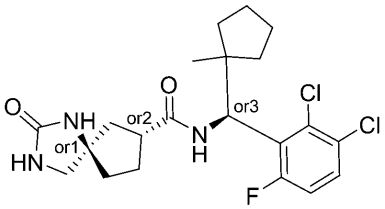
【表１－６０５】

I-2039		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.87-3.78 (m, 1H), 3.51 (s, 3H), 2.95 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 1.90-1.70 (m, 3H),1.60 (s, 7H), 1.39 (s, 3H), 1.25 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	445.15	A	B
I-2040		(400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s, 1H), 8.37 - 8.29 (m, 2H), 7.78 (td, J = 8.4, 5.5 Hz, 1H), 7.31 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.11 - 3.03 (m, 1H), 2.12 (dd, J = 13.1, 10.1 Hz, 1H), 2.01 - 1.88 (m, 3H), 1.69 - 1.45 (m, 8H), 1.42 - 1.34 (m, 1H), 1.22 (dd, J = 11.4, 5.2 Hz, 1H), 0.97 (s, 3H).	474.1	C	
I-2041		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.41 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.78 (td, J = 8.4, 5.5 Hz, 1H), 7.30 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.21 - 3.08 (m, 1H), 2.12 (dd, J = 13.2, 8.1 Hz, 1H), 1.91 (td, J = 9.6, 3.5 Hz, 3H), 1.82 - 1.69 (m, 1H), 1.61 (dp, J = 10.3, 5.1, 4.7 Hz, 6H), 1.53 - 1.43 (m, 1H), 1.39 (t, J = 6.4 Hz, 1H), 1.22 (dd, J = 11.3, 5.2 Hz, 1H), 0.96 (s, 3H).	474.1	D	

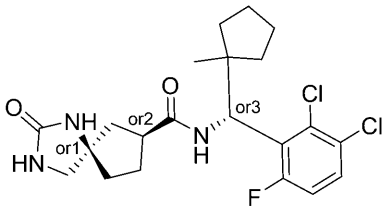
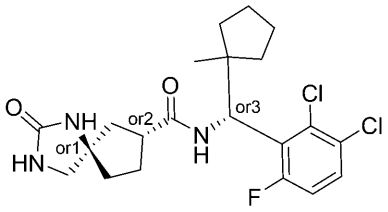
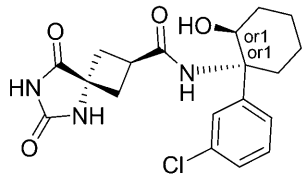
【表１－６０６】

I-2042		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.38 - 8.28 (m, 2H), 7.77 (td, J = 8.4, 5.5 Hz, 1H), 7.29 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.25 - 5.18 (m, 1H), 3.06 (dtd, J = 10.1, 7.9, 4.3 Hz, 1H), 2.07 - 1.97 (m, 2H), 2.01 - 1.87 (m, 1H), 1.87 - 1.73 (m, 2H), 1.73 - 1.55 (m, 6H), 1.49 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 1.39 (dd, J = 9.1, 4.5 Hz, 1H), 1.26 - 1.17 (m, 1H), 0.97 (s, 3H).	474.1	B	
I-2043		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.76 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 7.30 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.20 - 3.08 (m, 1H), 2.03 (dt, J = 21.0, 8.2 Hz, 2H), 1.97 - 1.87 (m, 1H), 1.90 - 1.72 (m, 3H), 1.61 (dt, J = 12.1, 6.1 Hz, 5H), 1.49 (s, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.22 (dd, J = 11.3, 5.4 Hz, 1H), 0.96 (s, 3H).	474.1	D	
I-2044		(400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.33 (s, 1H), 6.12 (s, 1H), 5.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.21 - 3.09 (m, 2H), 2.96 - 2.87 (m, 1H), 1.90 (dd, J = 12.4, 7.8 Hz, 1H), 1.76 - 1.50 (m, 11H), 1.41 - 1.33 (m, 1H), 1.26 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	442.1	E	

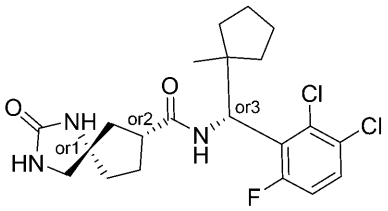
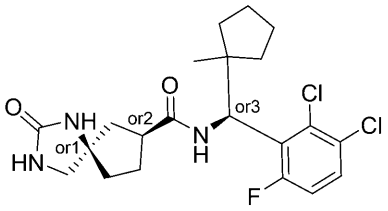
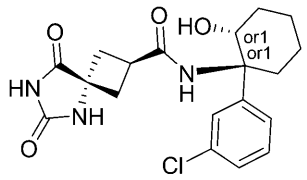
【表１－６０７】

I-2045		(400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.33 (s, 1H), 6.12 (s, 1H), 5.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.21 - 3.08 (m, 2H), 2.91 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 1.90 (dd, J = 12.3, 7.8 Hz, 1H), 1.78 - 1.50 (m, 11H), 1.31 (dt, J = 45.9, 7.2 Hz, 2H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	442.1	A	A
I-2046		(400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.28 (s, 1H), 6.11 (s, 1H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.18 - 3.07 (m, 2H), 2.98 - 2.85 (m, 1H), 1.77 (p, J = 7.5 Hz, 3H), 1.70 - 1.49 (m, 9H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	442.1	D	
I-2047		(400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.06 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.21 (dd, J = 8.8, 1.3 Hz, 1H), 3.10 (dd, J = 8.8, 1.1 Hz, 1H), 3.01 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.90 (dd, J = 13.1, 9.4 Hz, 1H), 1.76 (dd, J = 12.8, 7.4 Hz, 2H), 1.70 - 1.45 (m, 9H), 1.39 (s, 1H), 1.25 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 0.99 - 0.82 (m, 3H)	442.1	B	

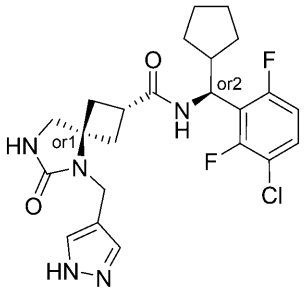
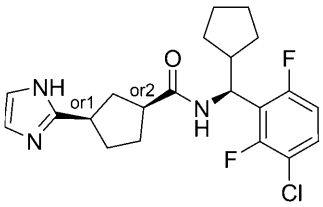
【表１－６０８】

I-2048		(400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.06 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.25 - 3.06 (m, 2H), 3.01 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 1.90 (dd, J = 13.1, 9.4 Hz, 1H), 1.76 (dd, J = 12.9, 7.5 Hz, 2H), 1.70 - 1.45 (m, 9H), 1.39 (s, 1H), 1.25 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	442.1	A	A
I-2049		(400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.65 - 7.57 (m, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 6.48 (s, 1H), 6.03 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.19 - 3.07 (m, 2H), 3.01 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.90 (s, 1H), 1.78 (dd, J = 13.2, 9.4 Hz, 1H), 1.64 (dd, J = 31.1, 7.7 Hz, 10H), 1.37 (s, 1H), 1.25 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	442.1	A	A
I-2050		(400 MHz, DMSO-d6) |AE 10.71 - 10.35 (s, 1H), 8.71 - 8.39 (s, 1H), 7.67 - 6.92 (m, 5H), 5.36 - 5.15 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 3.68 - 3.58 (q, J = 7.8, 5.4 Hz, 1H), 3.50 - 3.37 (m, 1H), 2.79 - 2.66 (dt, J = 12.9, 9.6 Hz, 2H), 2.64 - 2.54 (d, J = 13.3 Hz, 1H), 2.42 - 2.21 (dd, J = 10.5, 6.3 Hz, 2H), 1.87 - 1.53 (dq, J = 24.8, 12.4 Hz, 4H), 1.50 - 1.28 (m, 3H).	392.1	E	

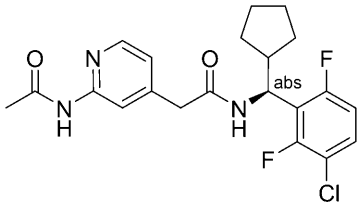
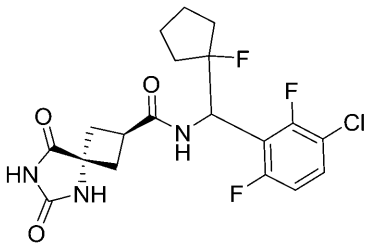
【表１－６０９】

I-2051		(400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.28 (s, 1H), 6.11 (s, 1H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.18 - 3.08 (m, 2H), 2.98 - 2.85 (m, 1H), 1.83 - 1.73 (m, 3H), 1.72 - 1.47 (m, 9H), 1.32 (d, J = 42.9 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	442.1	A	B
I-2052		(400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.03 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.18 - 3.06 (m, 2H), 3.05 - 2.96 (m, 1H), 1.91 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 1.78 (dd, J = 13.1, 9.4 Hz, 1H), 1.73 - 1.57 (m, 10H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	442.1	C	
I-2053		(400 MHz, DMSO-d6) |AE 10.68 - 10.51 (s, 1H), 8.72 - 8.55 (s, 1H), 7.49 - 7.10 (m, 5H), 5.36 - 5.17 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 3.72 - 3.56 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.51 - 3.38 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.80 - 2.65 (dt, J = 13.0, 9.7 Hz, 2H), 2.63 - 2.55 (d, J = 13.3 Hz, 1H), 2.40 - 2.22 (dd, J = 10.4, 6.2 Hz, 2H), 1.91 - 1.53 (dq, J = 24.3, 12.5 Hz, 4H), 1.51 - 1.26 (m, 3H).	392.1	E	

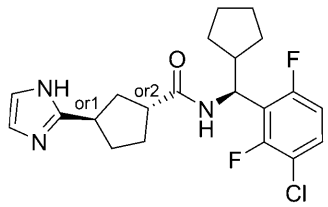
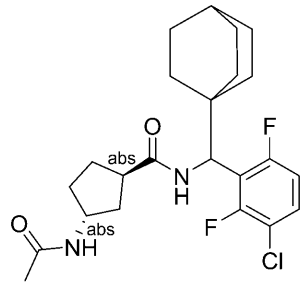
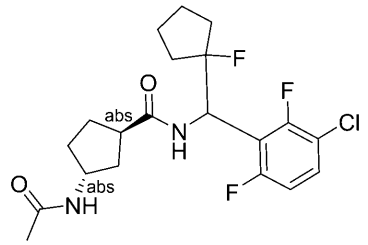
【表１－６１０】

I-2054		(400 MHz, DMSO-d6) 12.65 - 12.86 (m, 1H), 8.54 - 8.28 (m, 2H), 7.53 (q, J = 8.3 Hz, 3H), 7.12 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.23 (s, 1H), 4.91 - 4.75 (m, 1H), 4.24 (s, 2H), 3.25 - 3.08 (m, 3H), 2.92 (d, J = 10.2 Hz, 2H), 2.07 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 1.98 (m, 1H), 1.86 (m, 1H),1.66 - 1.40 (m, 5H), 1.33 (s, 1H), 1.24 (s, 2H), 1.98 (d, J = 13.1 Hz, 1H).	478.1	D	
I-2055		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.87 (重複する d,J= 6.3 Hz, 1H), 8.86 (重複する d,J= 6.7 Hz, 1H),8.28 (br. ss, 1H), 7.56 - 7.47 (m, 1H), 7.16 - 7.08 (m, 1H), 6.85 (重複する br. s, 1H), 6.83 (重複する br. s, 1H), 4.84 (br. dd,J= 10.9, 7.6 Hz, 1H), 3.14 (重複する m, 1H), 2.83 - 2.72 (m, 1H), 2.44 (重複する m, 1H), 2.24 - 2.13 (m, 0.5H), 2.13 - 2.03 (m, 0.5H), 1.99 - 1.67 (m, 6H), 1.65 - 1.41 (m, 4H), 1.39 - 1.20 (m, 2H), 1.07 - 0.95 (m, 1H). 2 対のジアステレオマーの 4:1 混合物(シス/トランス)。立体化学は任意割り当て。	408.3	A	C

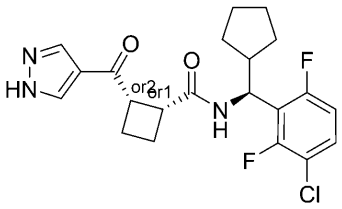
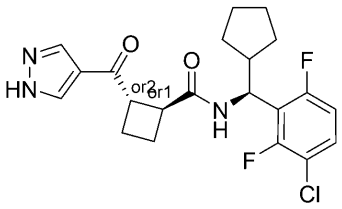
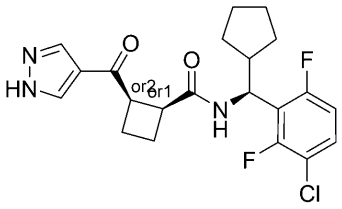
【表１－６１１】

I-2056		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.38 (s, 1H), 8.81 (d,J= 7.5 Hz, 1H), 8.15 (d,J= 5.1 Hz, 1H), 7.95 (br. s, 1H), 7.52 (app. td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.11 (app. td,J= 9.6, 1.5 Hz, 1H), 6.90 (dd,J= 5.1, 1.4 Hz, 1H), 4.81 (dd,J= 11.0, 7.6 Hz, 1H), 3.51 (AB の dA,JAB= 13.9 Hz, 1H), 3.43 (AB の dB,JAB= 13.9 Hz, 1H), 2.93 (s, 3H), 2.49 - 2.38 (m, 1H), 1.98 - 1.86 (m, 1H), 1.66 - 1.41 (m, 4H), 1.39 - 1.21 (m, 2H), 1.05 - 0.94 (m, 1H). 5% の微量の不純物	422.2	D	
I-2057		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 8.67 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 7.60 (app td, J = 8.7, 5.6 Hz), 7.17 (app td, J = 9.4, 1.2 Hz), 5.42 (dd, J = 26.3, 8.4 Hz, 1H), 3.30 (重複する m, 1H) 2.68 (dd, J = 12.0, 8.9 Hz, 1H), 2.60 (dd, J = 11.9, 8.9 Hz, 1H), 2.30 - 2.15 (m, 2H), 2.05 - 1.62 (m, 7H), 1.61 - 1.48 (m, 1H). ヒダントイン中の 1 つの NH は観察されなかった。	410.3	A	B

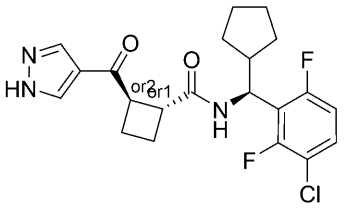
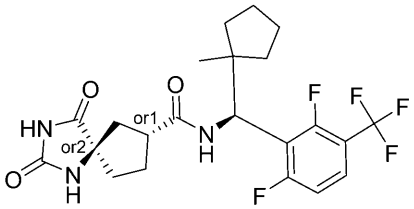
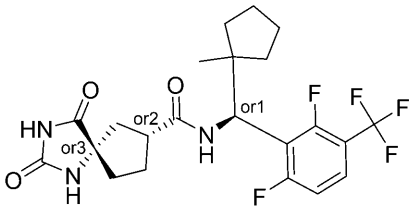
【表１－６１２】

I-2058		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (d,J= 7.4 Hz, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.48 (app. td,J= 8.5, 4.3 Hz, 1H), 7.08 (app. t,J= 9.3 Hz, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.79 (s, 1H), 4.78 (dd,J= 10.8, 7.7 Hz, 1H), 3.18 - 3.05 (m, 1H), 2.89 - 2.79 (m, 1H), 2.42 - 2.34 (m, 1H), 2.03 - 1.62 (m, 6H), 1.62 - 1.36 (m, 5H), 1.35 - 1.16 (m, 2H), 1.01 - 0.87 (m, 1H). 2つのジアステレオマーの 95:5 混合物(トランス/シス)。立体化学は任意割り当て。	408.3	A	B
I-2059		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (重複する br s, 0.6H), 7.98 (重複する br s, 0.4H), 7.80 - 7.72 (m, 1H), 7.60 - 7.49 (m, 1H), 7.19 - 7.05 (m, 1H), 5.01 - 4.88 (m, 1H), 4.06 - 3.89 (m, 1H), 2.99 - 2.87 (m, 1H), 1.92 - 1.70 (重複する m, 2H), 1.78 - 1.74 (重複する m, 3H), 1.68 - 1.55 (m, 1H), 1.56 - 1.44 (m, 7H), 1.45 - 1.34 (m, 8H). およそ 3:2 の dr	439.3	A	A
I-2060		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 8.54 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.60 (app td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.17 (app td, J = 9.7, 1.4 Hz, 1H), 5.41 (ddd, J = 26.6, 8.5, 3.6 Hz, 1H), 4.04 - 3.93 (m, 1H), 2.99 (app p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.05 - 1.76 (m, 5H, 重複), 1.76 (s, 1.5H), 1.75 (s, 1.5H), 1.74 - 1.28 (m, 9H, 重複).	397.6	B	D

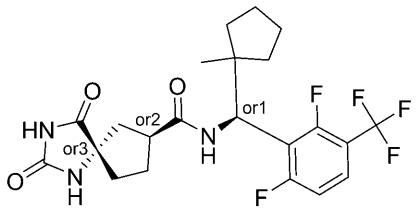
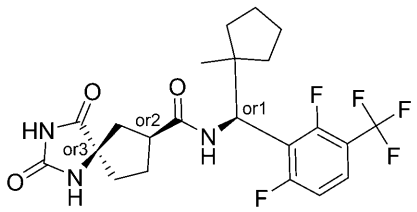
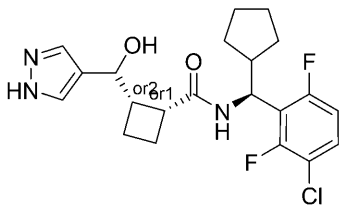
【表１－６１３】

I-2061		(400 MHz, DMSO-d6) 13.39 (s, 1H), 8.51 - 8.15 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.24 - 6.87 (m, 1H), 4.84 (dd, J = 11.1, 7.4 Hz, 1H), 3.93 (q, J = 8.9 Hz, 1H), 3.29 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.35 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 2.17 - 1.98 (m, 2H), 1.97 - 1.79 (m, 2H), 1.78 - 1.67 (m, 1H), 1.58 (td, J = 12.1, 11.5, 7.1 Hz, 2H), 1.47 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 1.33 (dd, J = 12.5, 7.0 Hz, 1H), 1.13 (dq, J = 15.0, 7.9, 7.4 Hz, 1H), 0.99 (dt, J = 13.0, 7.7 Hz, 1H).	422.15	E	
I-2062		(400 MHz, DMSO-d6) 13.31 (s, 1H), 8.41- 8.14 (m, 2H), 7.77 (s, 1H), 7.52 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.09 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 4.86 (dd, J = 11.1, 7.6 Hz, 1H), 3.87 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 2.39 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 2.25 - 1.94 (m, 4H), 1.93- 1.81 (m, 1H), 1.71- 1.39 (m, 4H), 1.38-1.18 (m, 2H), 1.00 (q, J = 11.1, 9.4 Hz, 1H).	422.15	D	
I-2063		(400 MHz, DMSO-d6) 13.06 (s, 1H), 8.09 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.41 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 4.71 (dd, J = 11.2, 7.8 Hz, 1H), 3.82 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 3.56 (d, J = 12.7 Hz, 1H), 2.43 (q, J = 9.4, 8.9 Hz, 1H), 2.11 (q, J = 9.7 Hz, 1H), 2.03- 1.88 (m, 2H), 1.83 (dd, J = 12.0, 5.8 Hz, 1H), 1.72 - 1.30 (m, 4H), 1.23 (d, J = 9.8 Hz, 2H), 0.89 (d, J = 11.6 Hz, 1H).	422.15	E	

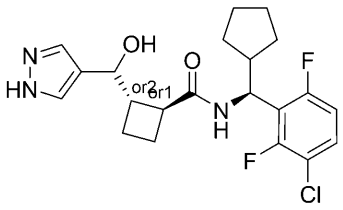
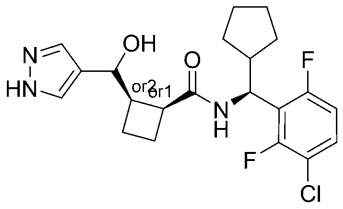
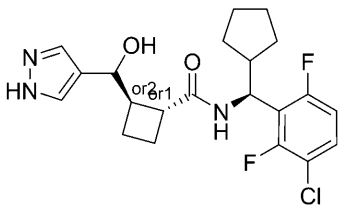
【表１－６１４】

I-2064		(400 MHz, DMSO-d6) 13.30 (s, 1H), 8.19 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.50 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.09 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.54 (dd, J = 11.0, 7.4 Hz, 1H), 3.87 (q, J = 8.8 Hz, 1H), 3.65 - 3.54 (m, 1H), 2.21 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.12 - 2.00 (m, 1H), 1.90 (dt, J = 13.7, 10.1 Hz, 1H), 1.74 (dq, J = 10.5, 5.6, 5.0 Hz, 1H), 1.65 -1.30 (m, 5H), 1.20 (dt, J = 31.5, 6.5 Hz, 2H), 0.86 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 0.72 (dd, J = 12.8, 7.4 Hz, 1H).	422.15	D	
I-2065		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.40 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.77 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 7.30 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 8.7, 8.1 Hz, 1H), 2.12 (dd, J = 13.2, 8.0 Hz, 1H), 1.91 (pd, J = 8.0, 4.2, 3.8 Hz, 3H), 1.75 (q, J = 9.8, 9.4 Hz, 1H), 1.65 - 1.58 (m, 6H), 1.52 - 1.45 (m, 1H), 1.39 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 1.21 (d, J = 12.8 Hz, 1H), 0.96 (s, 3H).	474.15	B	
I-2066		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.37 - 8.28 (m, 2H), 7.77 (s, 1H), 7.29 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.22 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.07 (s, 1H), 2.00 (s, 3H), 1.87 - 1.77 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.49 (s, 1H), 1.39 (s, 1H), 1.22 (s, 1H), 0.97 (s, 3H).	474.2	A	B

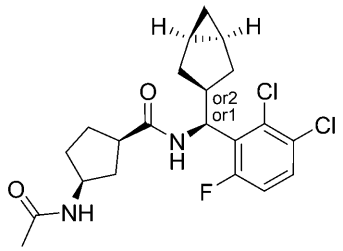
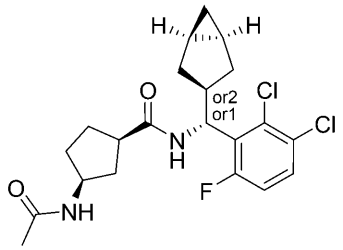
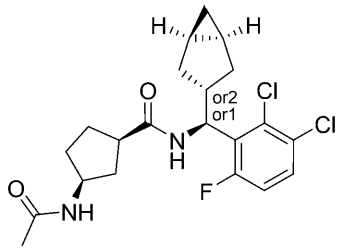
【表１－６１５】

I-2067		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.78 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 7.30 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.08 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 2.17 - 2.07 (m, 1H), 1.95 (dp, J = 16.6, 9.6, 8.6 Hz, 3H), 1.71 - 1.56 (m, 7H), 1.48 (s, 1H), 1.39 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.21 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 0.97 (s, 3H).	474.2	A	B
I-2068		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.77 (td, J = 8.4, 5.5 Hz, 1H), 7.29 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.14 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.02 (dt, J = 15.4, 7.8 Hz, 2H), 1.93 (dt, J = 11.1, 3.7 Hz, 1H), 1.90 - 1.72 (m, 3H), 1.63 (tt, J = 11.7, 8.2, 6.9 Hz, 5H), 1.59 - 1.45 (m, 1H), 1.38 (dd, J = 9.2, 4.5 Hz, 1H), 1.21 (dt, J = 12.0, 4.8 Hz, 1H), 0.96 (s, 3H).	474.2	C	
I-2069		(400 MHz, DMSO-d6) 12.60 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 102.6, 7.8 Hz, 1H), 7.65 -7.32 (m, 3H), 7.13 (tdd, J = 9.3, 5.2, 1.6 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 4.85 (ddd, J = 45.7, 10.9, 7.8 Hz, 1H), 4.51 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.93 (p, J = 9.7, 9.3 Hz, 1H), 2.70 - 2.54 (m, 1H), 2.43- 2.25 (m, 1H), 1.94 -1.70 (m, 3H), 1.68 - 1.41 (m, 6H), 1.39-1.14 (m, 2H), 1.03 (dt, J = 20.3, 8.4 Hz, 1H).	446.15	D	

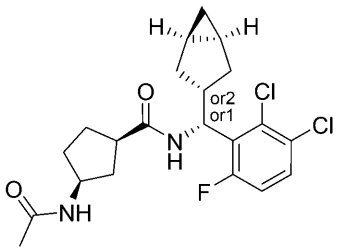
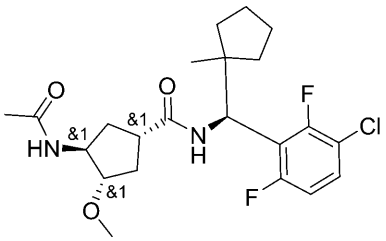
【表１－６１６】

I-2070		(400 MHz, DMSO-d6) 12.56 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 97.4, 7.8 Hz, 1H), 7.53 (tt, J = 8.7, 5.8 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 27.9 Hz, 2H), 7.14 (tdd, J = 9.0, 7.2, 1.6 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 4.87 (ddd, J = 29.1, 10.9, 7.8 Hz, 1H), 4.46 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.97 (q, J = 8.8 Hz, 1H), 2.48- 2.29 (m, 2H), 2.10 -1.72 (m, 3H), 1.71 - 1.41 (m, 6H), 1.32 (dddd, J = 28.5, 16.2, 12.4, 7.9 Hz, 2H), 1.02 (dp, J = 18.8, 10.2, 9.1 Hz, 1H).	446.15	E	
I-2071		(400 MHz, DMSO-d6) 12.50 (s, 1H), 8.31 (dd, J = 8.0, 2.9 Hz, 1H), 7.52 (tdd, J = 8.9, 5.5, 3.7 Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.17 - 7.01 (m, 2H), 4.96 -4.70 (m, 1H), 4.48 (dt, J = 17.0, 10.0 Hz, 2H), 3.16 (dt, J = 22.2, 7.6 Hz, 1H), 2.75 - 2.57 (m, 1H), 2.41 (dt, J = 16.7, 8.6 Hz, 1H), 2.19 - 1.77 (m, 4H), 1.73 - 1.40 (m, 5H), 1.30 (ddt, J = 21.6, 16.2, 7.7 Hz, 2H), 1.07 - 0.90 (m, 1H).	446.15	D	
I-2072		(400 MHz, DMSO-d6) 12.55 (s, 1H), 8.30 (dd, J = 54.2, 7.3 Hz, 1H), 7.69 -7.26 (m, 3H), 7.19 -7.02 (m, 1H), 5.00- 4.57 (m, 3H), 3.15 (td, J = 8.5, 5.1 Hz, 1H), 2.75 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.35 (dq, J = 52.6, 8.8 Hz, 1H), 2.08 - 1.76 (m, 3H), 1.72 - 1.10 (m, 8H), 0.98 (ddt, J = 27.2, 19.6, 9.5 Hz, 1H).	446.15	D	

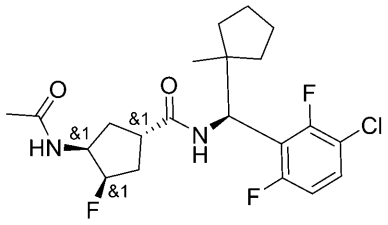
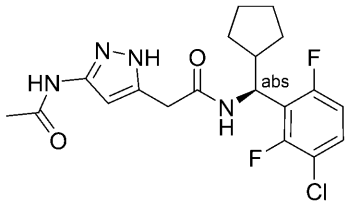
【表１－６１７】

I-2073		(400 MHz, DMSO-d6) 8.26 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.00 - 4.91 (m, 1H), 3.94 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.94 (s, 1H), 2.68 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.23 (ddd, J = 14.5, 9.3, 5.8 Hz, 1H), 2.06 (dt, J = 12.4, 7.4 Hz, 1H), 1.75 (s, 5H), 1.59 (dddd, J = 15.7, 13.4, 10.0, 6.8 Hz, 2H), 1.51 - 1.17 (m, 5H), 1.02 (dd, J = 13.5, 5.4 Hz, 1H), 0.66 (td, J = 8.2, 4.5 Hz, 1H), 0.15 (q, J = 4.2 Hz, 1H).	427.05	B	
I-2074		(400 MHz, DMSO-d6) 8.29 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.07 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.95 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 2.69 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.24 (s, 1H), 2.17- 1.96 (m, 2H), 1.75 (s, 4H), 1.67 - 1.52 (m, 2H), 1.45 (qd, J = 8.9, 3.9 Hz, 3H), 1.39 - 1.13 (m, 4H), 0.29 (td, J = 7.9, 4.8 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	427.05	B	
I-2075		(400 MHz, メタノール-d4) 7.48 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.14 (d, J = 12.1 Hz, 1H), 4.17 - 4.10 (m, 1H), 3.08 (s, 1H), 2.82 (s, 1H), 2.33 (ddd, J = 14.6, 9.4, 6.1 Hz, 1H), 2.10 (dt, J = 13.0, 7.7 Hz, 1H), 1.99 - 1.76 (m, 7H), 1.61 (s, 1H), 1.49 (dd, J = 14.2, 5.5 Hz, 2H), 1.43 (m, 1H), 1.31 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 1.17 (dd, J = 13.5, 5.5 Hz, 1H), 0.73 (s, 1H), 0.23 (t, J = 4.3 Hz, 1H).	427	D	

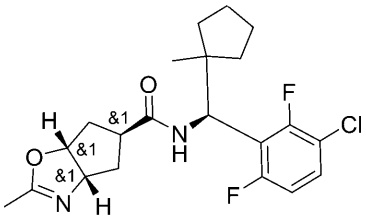
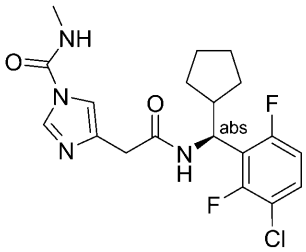
【表１－６１８】

I-2076		(400 MHz, メタノール-d4) 7.48 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 4.14 (s, 1H), 2.83 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 2.40 - 2.33 (m, 1H), 2.21- 2.05 (m, 2H), 1.99 - 1.80 (m, 6H), 1.69 - 1.51 (m, 3H), 1.45 (dt, J = 14.2, 7.7 Hz, 1H), 1.41 -1.30 (m, 2H), 1.27 (dp, J = 8.2, 4.1 Hz, 1H), 0.33 (td, J = 7.9, 5.0 Hz, 1H), 0.22 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	427	E	
I-2077		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの約 1.2:1 混合物として，8.09 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.88 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 7.56 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 2H), 7.14 (br. app. t, J = 9.3 Hz, 2H), 5.18 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 3.96 - 3.87 (m, 2H), 3.60 - 3.53 (m, 2H), 3.23 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 2.94 (app. p, J = 8.6 Hz, 2H), 2.24 - 2.16 (m, 1H), 2.11 (ddd, J = 13.4, 8.4, 6.7 Hz, 1H), 1.96 - 1.76 (重複する m, 2H), 1.79 (s, 3H), 1.78 (s, 3H), 1.65 - 1.44 (m, 16H), 1.39 - 1.32 (m, 2H), 1.24 - 1.16 (m, 2H), 0.96 - 0.93 (m, 6H). 最大 10%の未知の不純物を含有。一部ギ酸塩の可能性。	443.4	A	B

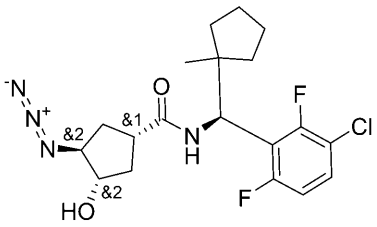
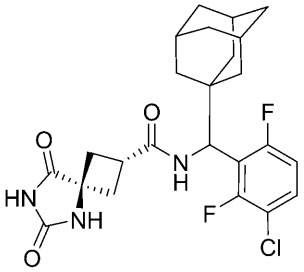
【表１－６１９】

I-2078		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの約 1:1 混合物として, 8.18 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.59 - 7.52 (m, 2H), 7.18 - 7.11 (m, 2H), 5.19 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 4.94 - 4.87 (m, 1H), 4.81 - 4.73 (m, 1H), 4.12 - 3.98 (m, 2H), 3.08 - 2.99 (m, 2H), 2.39 - 2.14 (m, 2H), 2.04 - 1.95 (m, 2H), 1.80 (s, 3H), 1.92 - 1.76 (m, 2H), 1.79 (s, 3H), 1.75 - 1.67 (m, 1H), 1.66 - 1.44 (m, 13H), 1.39 - 1.33 (m, 2H), 1.27 - 1.16 (m, 2H), 0.95 (s, 6H). 炭化水素グリースに由来する不純物及び他の未知の物質を含有。	429.4	A	A
I-2079		NMR (400 MHz, DMSOd6) 12.00 (br. s, 1H), 10.23 (s, 1H), 8.68 (d,J= 7.6 Hz, 1H), 7.53 (app. td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.12 (app. td,J= 9.5, 1.5 Hz, 1H), 6.25 (br. s, 1H), 4.83 (dd,J= 11.0, 7.6 Hz, 1H), 3.48 (AB の dA,JAB= 15.3 Hz, 1H), 3.40 (重複する AB の dB,JAB= 15.3 Hz, 1H), 2.48 - 2.37 (m, 1H), 1.95 (s, 3H), 1.94 - 1.86 (m, 1H), 1.66 - 1.43 (m, 4H), 1.37 - 1.22 (m, 2H), 1.04 - 0.93 (m, 1H).	411.2	D	

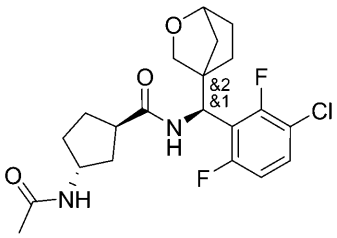
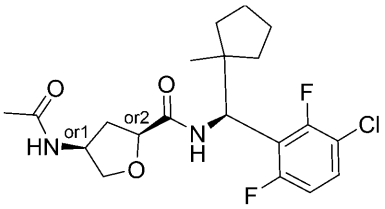
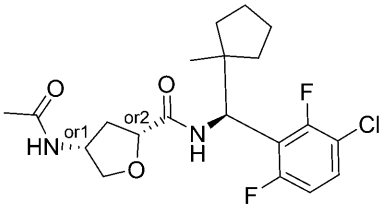
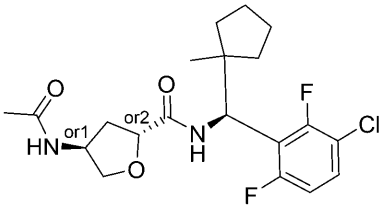
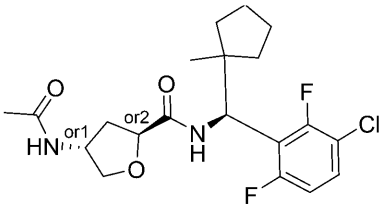
【表１－６２０】

I-2080		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの約 1:1 混合物として, 8.35 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.55 (app. td, J = 8.6, 5.5 Hz, 2H), 7.16 - 7.10 (m, 2H), 5.21 - 5.16 (m, 2H), 4.92 - 4.87 (m, 2H), 4.45 - 4.38 (m, 2H), 2.87 - 2.77 (m, 2H), 1.92 (ddd, J = 13.5, 6.0, 1.1 Hz, 1H), 1.89 - 1.66 (m, 11H), 1.61 (s, 14H), 1.38 - 1.32 (m, 2H), 1.22 - 1.17 (m, 2H), 0.95 (s, 6H).	411.4	B	D
I-2081		NMR (400 MHz,) 8.60 (d,J= 7.7 Hz, 1H), 8.39 (br. q,J= 4.1 Hz, 1H), 8.10 (d,J= 1.3 Hz, 1H), 7.53 (app. td,J= 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.40 (d,J= 1.0 Hz, 1H), 7.13 (app. td,J= 9.5, 1.5 Hz, 1H), 4.87 (dd,J= 11.0, 7.7 Hz, 1H), 3.43 (AB の dA,JAB= 16.0 Hz, 1H), 3.36 (重複する AB の dB,JAB= 16.2 Hz, 1H), 2.77 (d,J= 4.4 Hz, 3H), 2.47 - 2.36 (m, 1H), 1.94 - 1.84 (m, 1H), 1.65 - 1.41 (m, 4H), 1.39 - 1.23 (m, 2H), 1.05 - 0.93 (m, 1H). 8.22ppm に一部ギ酸塩。	411.3	D	

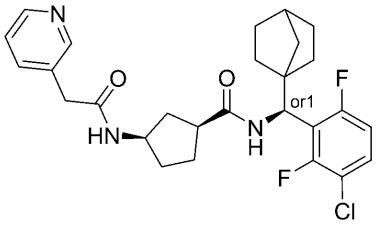
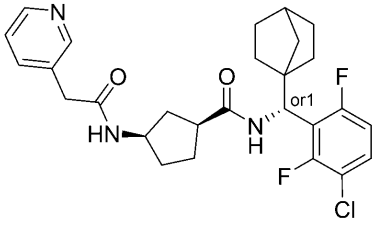
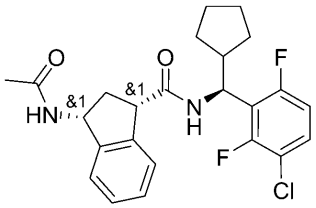
【表１－６２１】

I-2082		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの約 1.2:1 混合物として，8.21 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.56 (app. td, J = 8.7, 5.6 Hz, 2H), 7.14 (app. t, J = 9.4 Hz, 2H), 5.32 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 5.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 5.17 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.90 - 3.81 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 3.00 - 2.90 (m, 2H), 2.13 (ddd, J = 13.1, 8.7, 6.6 Hz, 1H), 2.09 - 1.99 (m, 2H), 1.95 - 1.87 (m, 1H), 1.74 - 1.39 (m, 16H), 1.39 - 1.31 (m, 2H), 1.23 - 1.16 (m, 2H), 0.94 (s, 6H).	413.4	C	
I-2083		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの約 1:1 混合物として，9.55 (br. s, 2H), 8.63 (s, 2H), 8.19 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.56 (app. td, J = 8.6, 5.5 Hz, 2H), 7.18 - 7.08 (m, 2H), 4.96 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 4.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.27 (app. p, J = 9.3 Hz, 1H), 3.26 (app. p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.70 - 2.63 (m, 2H), 2.58 (app. t, J = 11.7 Hz, 1H), 2.56 (app. t, J = 11.7 Hz, 1H), 2.28 - 2.14 (m, 4H), 1.93 (br. s, 6H), 1.68 - 1.48 (m, 24H).	478.5	D	

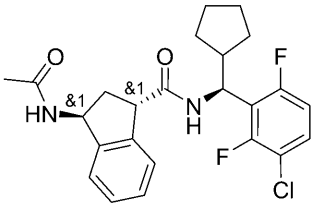
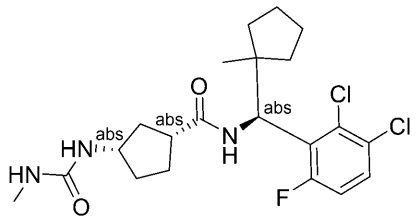
【表１－６２２】

I-2084		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.31 (2 つの重複する d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.57 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (app. td, J = 9.6, 1.4 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 0.5H), 5.49 (d, J = 8.2 Hz, 0.5H), 4.21 (br s, 1H), 4.05 - 3.94 (m, 1H), 3.55 (d, J = 6.8 Hz, 0.5H), 3.49 (d, J = 6.8 Hz, 0.5H), 3.46 -3.42 (m, 1H), 2.92 (app. p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.92 - 1.77 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.72 - 1.51 (m, 6H), 1.50 - 1.29 (m, 4H). 微量の脂肪族不純物。9:9:1:1 の比の約 4 つのエピマー。	427.3	D	
I-2085				D	
I-2086				B	C
I-2087				C	
I-2088				D	

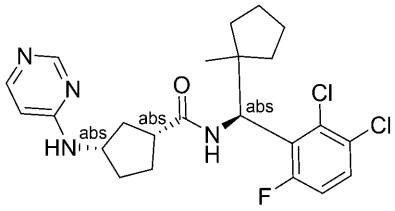
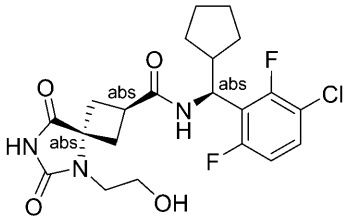
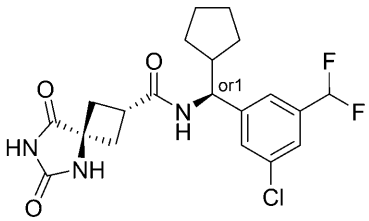
【表１－６２３】

I-2089				D	
I-2090				A	A
I-2091		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.00 (d,J= 7.2 Hz, 0.5H), 8.96 (d,J= 7.5 Hz, 0.5H), 8.20 (d,J= 8.4 Hz, 0.5H), 8.19 (d,J= 8.3 Hz, 0.5H), 7.59 - 7.50 (m, 1H), 7.29 - 7.21 (m, 1.5H), 7.20 - 7.07 (m, 3H), 6.93 (app. d,J= 7.5 Hz, 0.5H), 5.29 - 5.20 (m, 1H), 4.91 (dd,J= 11.5, 7.5 Hz, 0.5H), 4.88 (dd,J= 11.7, 7.3 Hz, 0.5H), 3.94 (app. dt,J= 11.1, 8.1 Hz, 1H), 2.55 (重複する m, 1H), 2.42 (重複する m, 1H), 2.15 - 1.89 (m, 2H), 1.87 (s, 1.5H), 1.86 (s, 1.5H), 1.72 - 1.45 (m, 4H), 1.45 - 1.29 (m, 2H), 1.10 - 0.96 (m, 1H). ジアステレオマーのシスとトランスの対の 80:20 混合物。4 つのジアステレオマーの 1:1:0.4:0.1 混合物。立体化学は任意割り当て。	447.2	D	

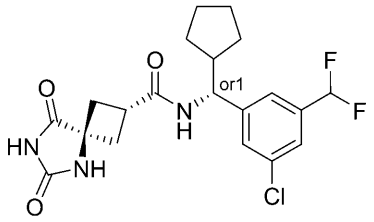
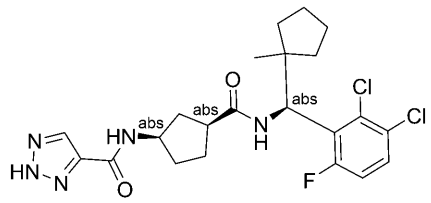
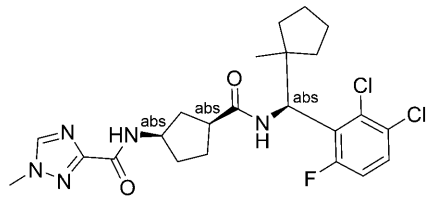
【表１－６２４】

I-2092		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.89 (d,J= 7.3 Hz, 0.6H), 8.85 (d,J= 7.5 Hz, 0.4H), 8.16 (d,J= 8.2 Hz, 0.4H), 8.15 (d,J= 8.1 Hz, 0.6H), 7.55 (app. td,J= 8.7, 5.6 Hz, 0.4H), 7.46 (app. td,J= 8.7, 5.6 Hz, 0.6H), 7.42 - 7.38 (m, 0.4H), 7.29 - 7.21 (m, 0.8H), 7.20 - 7.12 (m, 3.2H), 7.07 (app. td,J= 9.1, 1.1 Hz, 0.6H), 5.50 - 5.38 (m, 1H), 4.78 重複(dd,J= 10.9, 7.2 Hz, 0.6H), 4.74 (重複する dd,J= 10.5, 6.9 Hz, 0.4H), 4.11 (dd,J= 8.5, 2.8 Hz, 1H), 4.07 (dd,J= 8.4, 2.6 Hz, 1H), 3.30 (埋没した m, 1H), 2.54 (重複する m, 0.6H), 2.39 (ddd,J= 12.6, 7.9, 2.8 Hz, 0.4H), 2.00 (m, 1H), 1.87 (埋没した m, 1H), 1i.84 (重複する s, 3H), 1.70 - 1.42 (m, 4H), 1.40 - 1.29 (m, 1.6H), 1.27 - 1.17 (m, 0.4H), 1.07 - 0.93 (m, 1H). 2つのジアステレオマーの3:2 混合物、トランス立体化学は任意割り当て。	447.2	B	C
I-2093		(400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.1, 4.9 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.80 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 5.55 (s, 1H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.84 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.95 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.83 (tt, J = 11.9, 5.7 Hz, 2H), 1.70-1.57 (m, 8H), 1.51 (ddt, J = 13.4, 8.8, 5.3 Hz, 1H), 1.40-1.24 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	444.15	A	A

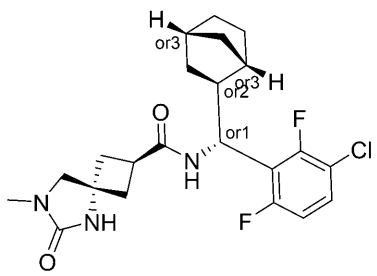
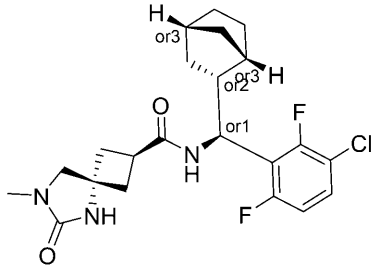
【表１－６２５】

I-2094		(400 MHz, DMSO-d6) 8.36 (s, 1H), 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.40 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.03 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 1.96 (s, 2H), 1.81 (dt, J = 13.9, 7.3 Hz, 1H), 1.65 (s, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.15	A	A
I-2095		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.38 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.21 -7.03 (m, 1H), 4.97 -4.72 (m, 2H), 3.61 (q, J = 5.9 Hz, 2H), 3.42 (t, J = 6.1 Hz, 2H), 3.19 (q, J = 9.3 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 21.6, 12.6, 8.7 Hz, 3H), 2.47 -2.33 (m, 2H), 1.88 (dt, J = 12.4, 5.1 Hz, 1H), 1.69 -1.42 (m, 4H), 1.32 (ddd, J = 26.8, 12.2, 6.2 Hz, 2H), 1.02 (d, J = 9.8 Hz, 1H).	456.1	D	
I-2096		(400 MHz, DMSO-d6) 10.39 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.38 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 6.96 (d, J = 55.6 Hz, 1H), 4.63 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 14.0, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.28 - 2.10 (m, 3H), 1.78 - 1.69 (m, 1H), 1.58 (dh, J = 9.2, 5.1, 4.5 Hz, 2H), 1.46 (dtd, J = 15.5, 9.0, 7.6, 2.8 Hz, 2H), 1.32 - 1.21 (m, 2H), 1.11 (dt, J = 12.3, 7.8 Hz, 1H).	426.1	B	

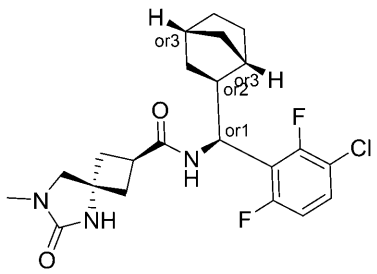
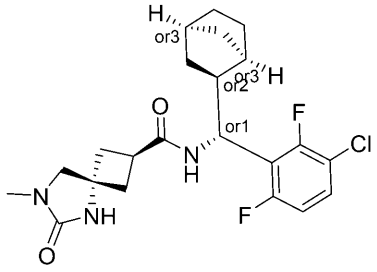
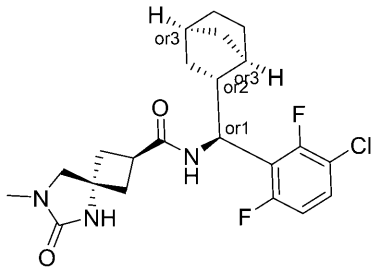
【表１－６２６】

I-2097		(400 MHz, DMSO-d6) 10.52 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.38 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.58 - 7.47 (m, 3H), 7.03 (t, J = 55.6 Hz, 1H), 4.66 - 4.60 (m, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 14.1, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.27 - 2.12 (m, 3H), 1.74 (dtd, J = 15.6, 7.4, 6.6, 3.7 Hz, 1H), 1.57 (dtq, J = 10.0, 6.2, 2.9 Hz, 2H), 1.45 (dtd, J = 20.3, 9.1, 7.9, 3.8 Hz, 2H), 1.33 - 1.22 (m, 2H), 1.15 - 1.05 (m, 1H).	426.1	E	
I-2098		(400 MHz, DMSO-d6) 8.31 (s, 1H), 8.25 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (ddt, J = 8.3, 4.6, 2.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 11.0, 8.8 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.28 (h, J = 7.0 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.98 - 1.79 (m, 4H), 1.65 - 1.45 (m, 8H), 1.38 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	482.05	A	B
I-2099		(400 MHz, DMSO-d6) 8.57 (s, 1H), 8.18 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.25 (h, J = 7.0 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.04 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.96 - 1.78 (m, 4H), 1.63 - 1.55 (m, 7H), 1.51 - 1.44 (m, 1H), 1.38 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 1.27 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	496.1	A	A

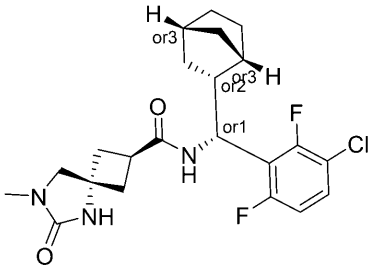
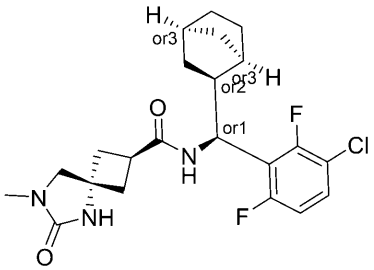
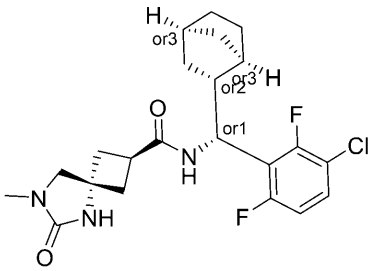
【表１－６２７】

I-2100		(400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.12 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 4.71 (dd, J = 11.8, 7.3 Hz, 1H), 3.28 - 3.18 (m, 2H), 2.91 (tt, J = 9.8, 5.1 Hz, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.34 (t, J = 11.0 Hz, 1H), 2.29 - 2.19 (m, 2H), 2.20 (d, J = 11.0 Hz, 2H), 2.16 - 2.08 (s, 2H), 1.60 - 1.39 (m, 2H), 1.32 - 1.24 (m, 1H), 1.22 - 0.99 (m, 4H), 0.73 (d, J = 12.3 Hz, 1H).	438.15	A	A
I-2101		(400 MHz, DMSO-d6) 8.35 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.18 - 7.09 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 4.93 (dd, J = 11.9, 7.3 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 3.22 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 2.86 (tt, J = 9.7, 5.1 Hz, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.51 (t, J = 10.7 Hz, 1H), 2.32 (t, J = 10.7 Hz, 1H), 2.21 (q, J = 6.2, 4.7 Hz, 3H), 2.20 - 2.07 (m, 1H), 1.87 (t, J = 12.3 Hz, 1H), 1.65 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 1.49 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 1.32 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 1.21 (d, J = 9.2 Hz, 3H), 0.74 (dq, J = 12.2, 2.2 Hz, 1H).	438.2	A	B

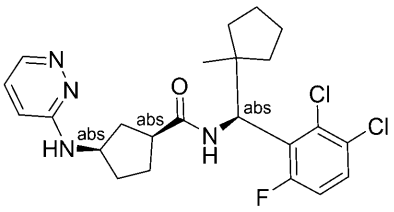
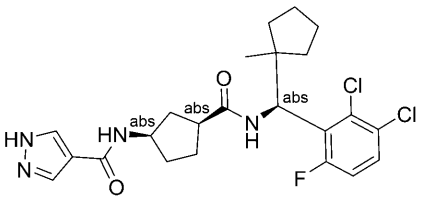
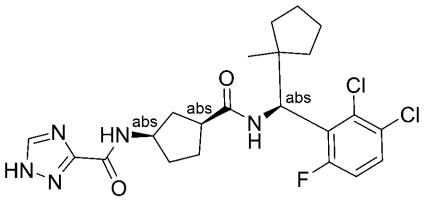
【表１－６２８】

I-2102		(400 MHz, DMSO-d6) 8.48 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.17 - 7.07 (m, 1H), 6.95 (s, 1H), 4.71 (dd, J = 11.8, 7.3 Hz, 1H), 3.28 - 3.18 (m, 2H), 2.91 (tt, J = 9.7, 5.2 Hz, 1H), 2.54 (s, 2H), 2.34 (t, J = 10.8 Hz, 1H), 2.29 - 2.16 (m, 3H), 2.09 (s, 2H), 1.59 - 1.46 (m, 1H), 1.44 (s, 1H), 1.30 (q, J = 17.8, 13.9 Hz, 2H), 1.25 (q, J = 17.8, 13.9 Hz, 1H), 1.15 - 0.99 (m, 4H), 0.73 (d, J = 12.2 Hz, 1H).	438.15	D	
I-2103		(400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 4.72 (dd, J = 11.9, 7.6 Hz, 1H), 3.24 (q, J = 9.5 Hz, 2H), 2.89 (tt, J = 9.7, 5.0 Hz, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.33 (dd, J = 12.3, 9.3 Hz, 1H), 2.22 (dd, J = 19.6, 10.0 Hz, 3H), 2.20 - 2.08 (m, 1H), 1.97 (s, 1H), 1.57 - 1.48 (m, 1H), 1.42 (s, 4H), 1.10 (d, J = 9.2 Hz, 3H), 1.01 (t, J = 8.6 Hz, 1H).	438.15	D	
I-2104		(400 MHz, DMSO-d6) 8.36 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.18 - 7.09 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 4.93 (dd, J = 11.9, 7.3 Hz, 1H), 3.24 (q, J = 9.4 Hz, 2H), 2.86 (tt, J = 9.7, 5.0 Hz, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.32 (t, J = 10.8 Hz, 1H), 2.21 (h, J = 7.9, 7.3 Hz, 3H), 2.11 (dd, J = 11.6, 4.5 Hz, 1H), 1.87 (t, J = 12.3 Hz, 1H), 1.64 (s, 1H), 1.50 (s, 2H), 1.32 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 1.21 (q, J = 13.5, 9.8 Hz, 4H), 0.74 (dd, J = 12.2, 5.2 Hz, 1H).	438.15	E	

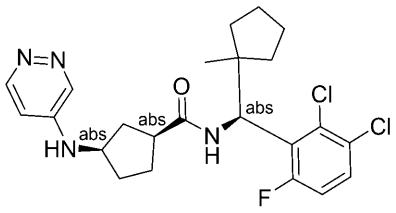
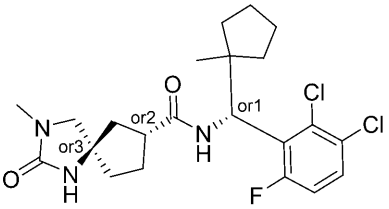
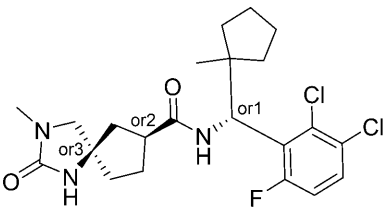
【表１－６２９】

I-2105		(400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 4.72 (dd, J = 11.9, 7.6 Hz, 1H), 3.24 (q, J = 9.5 Hz, 2H), 2.89 (tt, J = 9.7, 5.0 Hz, 1H), 2.54 (s, 2H), 2.33 (t, J = 10.8 Hz, 1H), 2.25 (d, J = 10.7 Hz, 2H), 2.25 - 2.16 (m, 1H), 2.12 (dt, J = 12.0, 4.1 Hz, 1H), 1.97 (s, 1H), 1.57 - 1.44 (m, 2H), 1.40 (dd, J = 16.4, 6.8 Hz, 3H), 1.26 (d, J = 13.4 Hz, 1H), 1.13 (q, J = 9.4, 8.8 Hz, 3H), 1.01 (t, J = 8.6 Hz, 1H).	438.15	B	
I-2106		(400 MHz, DMSO-d6) 8.41 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 4.94 (dd, J = 12.2, 7.4 Hz, 1H), 3.24 (s, 2H), 2.88 (tt, J = 9.6, 4.8 Hz, 1H), 2.51 (p, J = 1.9 Hz, 3H), 2.43 (s, 2H), 2.34 (t, J = 10.9 Hz, 1H), 2.28 - 2.12 (d, J = 4.2 Hz, 4H), 1.55 - 1.47 (m, 1H), 1.42 - 1.26 (m, 5H), 1.11 (s, 1H), 0.48 (d, J = 11.6 Hz, 1H).	438.2	A	B
I-2107		(400 MHz, DMSO-d6) 8.41 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.58 - 7.44 (m, 1H), 7.23 - 7.08 (m, 1H), 6.95 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 4.94 (dd, J = 12.3, 7.5 Hz, 1H), 3.24 (s, 2H), 2.88 (tt, J = 9.7, 4.8 Hz, 1H), 2.54 (d, J = 3.4 Hz, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.30 - 2.17 (m, 1H), 2.15 (s, 2H), 2.12 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 1.52 (s, 1H), 1.41 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 1.39 - 1.22 (m, 4H), 1.10 (s, 1H), 0.48 (d, J = 10.2 Hz, 1H).	438.15	B	

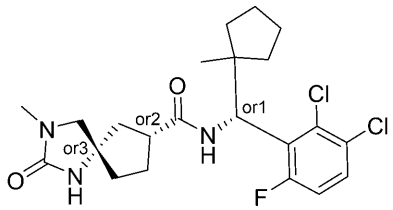
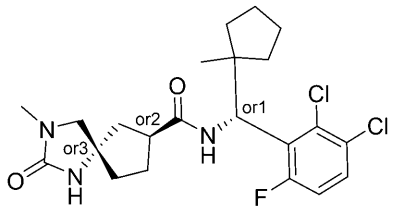
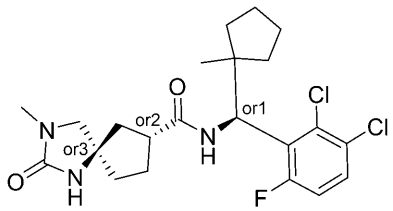
【表１－６３０】

I-2108		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (dd, J = 4.4, 1.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.30-7.15 (m, 2H), 6.79-6.70 (m, 2H), 5.50 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.20 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 3.04 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 2.07-1.93 (m, 2H), 1.82 (dt, J = 14.1, 7.3 Hz, 1H), 1.70 (dd, J = 12.6, 8.0 Hz, 1H), 1.60 (s, 7H), 1.52 (s, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 12.1 Hz, 2H), 0.97 (s, 3H).	465.15	B	
I-2109		(400 MHz, DMSO-d6) 13.07 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.80 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.20 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.00 - 1.81 (m, 2H), 1.81 - 1.69 (m, 1H), 1.60 (s, 7H), 1.50 (tq, J = 13.5, 7.9 Hz, 2H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	481.2	A	A
I-2110		(400 MHz, DMSO-d6) 14.60 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.28 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.10 - 3.01 (m, 1H), 1.98 - 1.79 (m, 4H), 1.66 - 1.45 (m, 8H), 1.37 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 1.26 (q, J = 8.7, 7.8 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	482.1	A	B

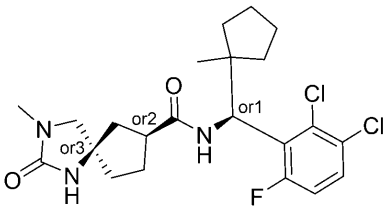
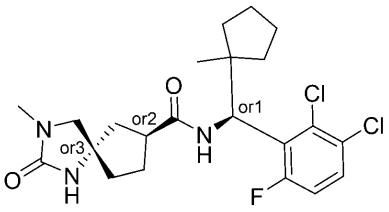
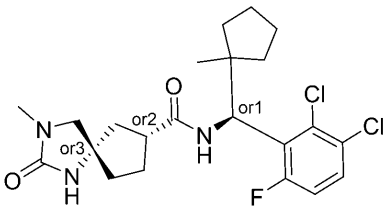
【表１－６３１】

I-2111		(400 MHz, DMSO-d6) 8.5-8.49 (m, 1H), 8.47 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 6.49 (dd, J = 6.2, 3.1 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.79 (s, 1H), 3.03 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 2.01 (ddt, J = 23.9, 13.0, 6.1 Hz, 1H), 1.86 (dt, J = 14.1, 7.4 Hz, 1H), 1.69 (dd, J = 12.5, 7.8 Hz, 1H), 1.60 (s, 8H), 1.49 (dt, J = 12.9, 6.7 Hz, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 11.3 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.15	B	
I-2112		(400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.63 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.17 - 3.06 (m, 2H), 3.06 - 2.98 (m, 1H), 2.56 (s, 3H), 1.92 (td, J = 9.0, 8.5, 5.6 Hz, 1H), 1.82 - 1.54 (m, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	A	B
I-2113		(400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 6.65 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.22 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.12 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.58 (s, 3H), 1.89 (dd, J = 13.2, 9.3 Hz, 1H), 1.78 (dt, J = 13.0, 5.9 Hz, 2H), 1.72 - 1.44 (m, 9H), 1.38 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 1.31 - 1.22 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	A	A

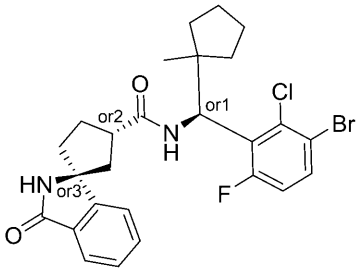
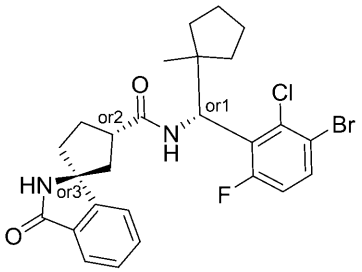
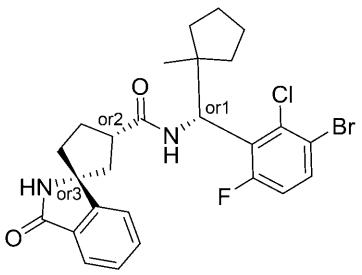
【表１－６３２】

I-2114		(400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.31 - 7.21 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.14 (q, J = 8.5 Hz, 2H), 2.94 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.51 (p, J = 1.8 Hz, 3H), 1.85 - 1.71 (m, 3H), 1.71 - 1.50 (m, 9H), 1.41 - 1.33 (m, 1H), 1.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	A	B
I-2115		(400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 6.49 (s, 1H), 5.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.19 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.13 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 2.98 - 2.90 (m, 1H), 2.61 (s, 3H), 1.89 (dd, J = 12.4, 7.8 Hz, 1H), 1.79 - 1.49 (m, 10H), 1.40 - 1.33 (m, 1H), 1.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	A	A
I-2116		(400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.65 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.22 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.12 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.58 (s, 3H), 1.94 - 1.74 (m, 3H), 1.73 - 1.46 (m, 9H), 1.38 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 1.25 (d, J = 11.6 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	B	

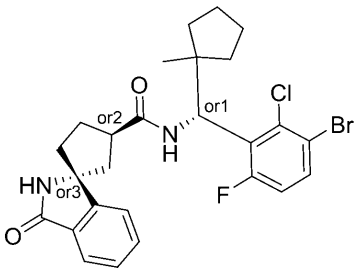
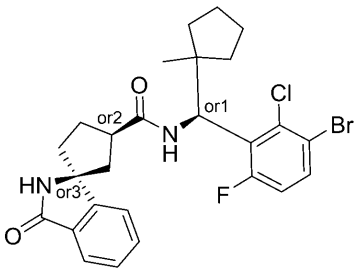
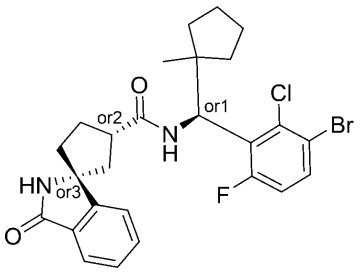
【表１－６３３】

I-2117		(400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 6.63 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.17 - 3.06 (m, 2H), 3.06 - 2.98 (m, 1H), 2.56 (s, 3H), 1.97 - 1.87 (m, 1H), 1.82 - 1.64 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	E	
I-2118		(400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.44 (s, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.14 (q, J = 8.5 Hz, 2H), 3.01 - 2.88 (m, 1H), 2.60 (s, 3H), 1.83 - 1.70 (m, 3H), 1.69 - 1.50 (m, 9H), 1.38 (s, 1H), 1.30 - 1.24 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	456.1	D	
I-2119		(400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.49 (s, 1H), 5.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.19 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.13 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.95 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.61 (s, 3H), 1.89 (dd, J = 12.4, 7.8 Hz, 1H), 1.79 - 1.48 (m, 11H), 1.41 - 1.33 (m, 1H), 1.26 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	456.1	D	

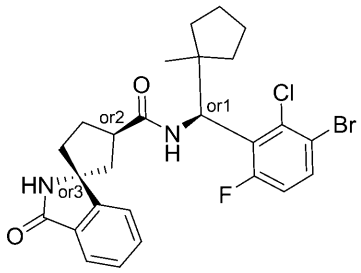
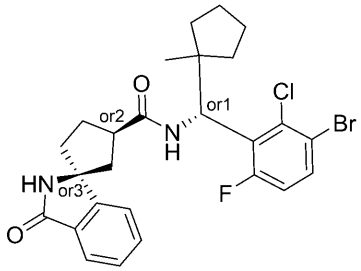
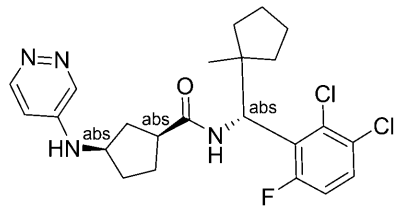
【表１－６３４】

I-2120		(400 MHz, DMSO-d6) 8.56 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.67 - 7.58 (m, 3H), 7.53 - 7.42 (m, 1H), 7.23 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.41 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 2.20 - 2.10 (m, 1H), 2.09 - 2.02 (m, 2H), 2.01 - 1.82 (m, 3H), 1.63 - 1.56 (m, 6H), 1.38 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	535.15	A	A
I-2121		(400 MHz, DMSO-d6) 8.52 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.65 - 7.57 (m, 3H), 7.51 - 7.43 (m, 1H), 7.18 (dd, J = 10.9, 8.9 Hz, 1H), 5.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.45 - 3.36 (m, 1H), 2.19 (dt, J = 13.8, 6.6 Hz, 1H), 2.12 - 1.98 (m, 2H), 1.95 (t, J = 6.8 Hz, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.40 (s, 1H), 1.29 (s, 1H), 0.99 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	535.1	B	
I-2122		(400 MHz, DMSO-d6) 8.96 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.61 - 7.49 (m, 3H), 7.47 - 7.39 (m, 1H), 7.15 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.57 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 2.23 - 2.10 (m, 3H), 2.05 (s, 1H), 1.90 (dd, J = 13.2, 7.9 Hz, 1H), 1.70 (d, J = 13.0 Hz, 1H), 1.62 (s, 6H), 1.40 (s, 1H), 1.30 (s, 1H), 0.99 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	535.1	D	

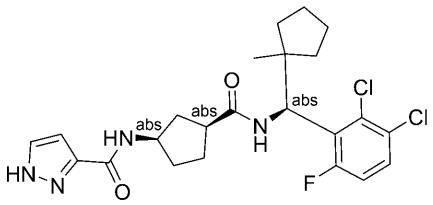
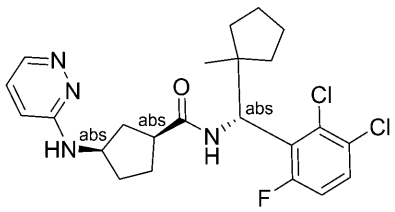
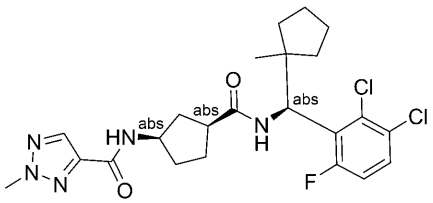
【表１－６３５】

I-2123		(400 MHz, DMSO-d6) 8.98 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 4.1 Hz, 3H), 7.46 (dd, J = 7.5, 4.4 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.33 - 3.22 (m, 1H), 2.28 (dd, J = 13.1, 9.1 Hz, 1H), 2.19 - 1.98 (m, 3H), 1.89 (d, J = 11.7 Hz, 1H), 1.69 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 1.58 (s, 6H), 1.36 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	535.05	C	
I-2124		(400 MHz, DMSO-d6) 8.52 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.67 - 7.56 (m, 3H), 7.47 (ddd, J = 7.9, 5.5, 2.6 Hz, 1H), 7.17 (dd, J = 10.9, 8.9 Hz, 1H), 5.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.41 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.20 (dq, J = 14.9, 6.9 Hz, 1H), 2.01 (dd, J = 8.6, 4.1 Hz, 2H), 1.97 - 1.87 (m, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.40 (s, 1H), 1.29 (s, 1H), 0.99 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	535.1	A	A
I-2125		(400 MHz, DMSO-d6) 8.97 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 8.8, 5.3 Hz, 1H), 7.63 - 7.57 (m, 3H), 7.49 - 7.41 (m, 1H), 7.22 (dd, J = 10.9, 8.9 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.32 - 3.23 (m, 1H), 2.28 (dd, J = 13.1, 9.1 Hz, 1H), 2.05 (ddd, J = 29.1, 13.0, 6.8 Hz, 3H), 1.91 (s, 1H), 1.69 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 1.58 (s, 6H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	535.1	A	B

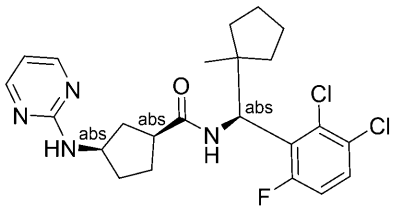
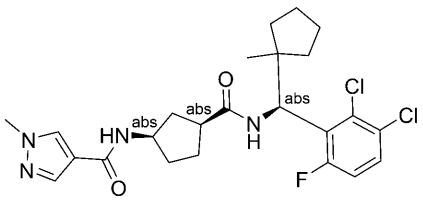
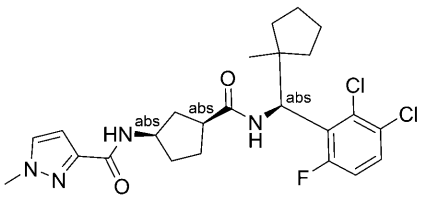
【表１－６３６】

I-2126		(400 MHz, DMSO-d6) 8.96 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.61 - 7.49 (m, 3H), 7.43 (ddd, J = 8.3, 6.8, 1.6 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 2.14 (dt, J = 19.9, 7.4 Hz, 3H), 2.05 (s, 1H), 1.90 (dd, J = 13.2, 8.1 Hz, 1H), 1.77 - 1.66 (m, 1H), 1.62 (s, 7H), 1.40 (s, 1H), 1.29 (s, 1H), 0.99 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	535.05	A	B
I-2127		(400 MHz, DMSO-d6) 8.56 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.65 - 7.58 (m, 3H), 7.52 - 7.43 (m, 1H), 7.23 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.41 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 2.22 - 2.12 (m, 1H), 2.11 - 2.02 (m, 2H), 2.00 - 1.84 (m, 3H), 1.59 (s, 6H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	535	D	
I-2128		(400 MHz, DMSO-d6) 8.53 (dd, J = 3.1, 1.0 Hz, 1H), 8.48 (dd, J = 6.1, 1.0 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 6.53 (dd, J = 6.2, 3.1 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.82 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 3.02 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.00 (dt, J = 14.4, 7.3 Hz, 2H), 1.71 (ddd, J = 12.8, 8.3, 4.3 Hz, 1H), 1.59 (s, 7H), 1.56-1.39 (m, 2H), 1.37 (s, 1H), 1.25 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.1	A	A

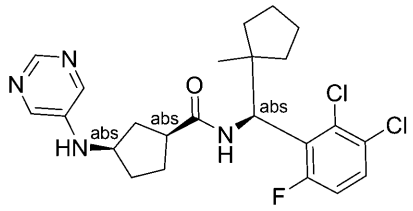
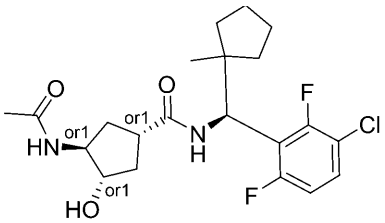
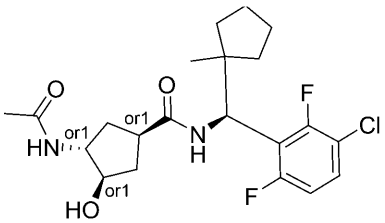
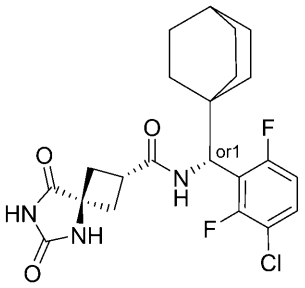
【表１－６３７】

I-2129		(400 MHz, DMSO-d6) 13.20 (s, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.65-7.57 (m, 1H), 7.26 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 6.62 (s, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.26 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 1.91 (s, 2H), 1.90-1.78 (m, 2H), 1.62-1.44 (m, 8H), 1.38 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 1.27 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	484.1	A	B
I-2130		(400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (dd, J = 4.4, 1.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 7.20 (dd, J = 9.0, 4.4 Hz, 1H), 6.80-6.71 (m, 2H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.23 (p, J = 6.0 Hz, 1H), 3.04 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.00 (dt, J = 12.7, 7.4 Hz, 2H), 1.92-1.73 (m, 2H), 1.60 (t, J = 4.5 Hz, 6H), 1.58-1.42 (m, 2H), 1.38 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	465.15	A	A
I-2131		(400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 14.1 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.26 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 4.21 (s, 3H), 3.04 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.96 - 1.79 (m, 4H), 1.65 - 1.53 (m, 7H), 1.52 - 1.42 (m, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	496.1	A	A

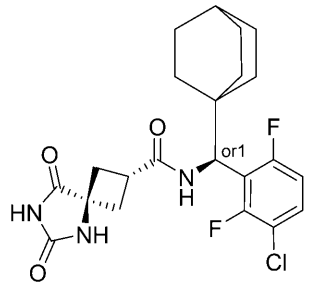
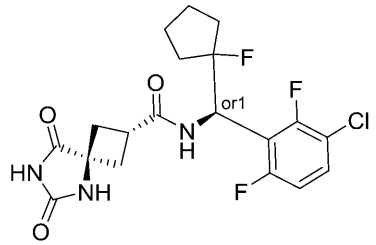
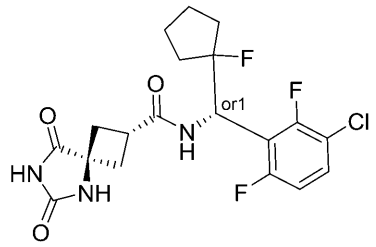
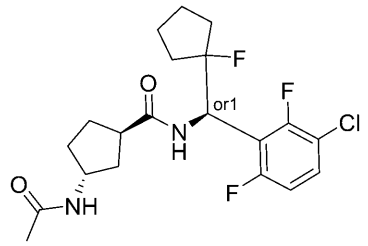
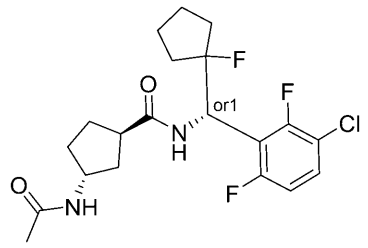
【表１－６３８】

I-2132		(400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 4.7 Hz, 2H), 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.26 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 6.53 (t, J = 4.7 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.24 - 4.16 (m, 1H), 3.06 - 2.98 (m, 1H), 1.93 (dd, J = 13.3, 6.5 Hz, 2H), 1.90 - 1.71 (m, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.50 (s, 2H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	465.3	A	B
I-2133		(400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 16.7 Hz, 2H), 7.82 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.19 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.06-2.98 (m, 1H), 1.99-1.87 (s, 3H), 1.79-1.68 (m, 1H), 1.60 (s, 6H), 1.48 (s, 2H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	495.2	A	A
I-2134		(400 MHz, アセトニトリル-d3) 7.56-7.46 (m, 2H), 7.11 (dd, J = 11.0, 8.9 Hz, 1H), 6.96 (t, J = 10.7 Hz, 2H), 6.63 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 5.71 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.37 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.04-2.90 (m, 1H), 2.16-1.97 (m, 2H), 1.96-1.81 (m, 2H), 1.66 (dt, J = 12.5, 6.1 Hz, 7H), 1.64-1.52 (m, 1H), 1.47-1.39 (m, 1H), 1.35-1.27 (m, 1H), 1.01 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	495.15	A	B

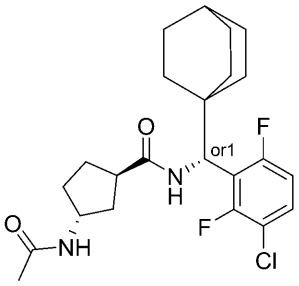
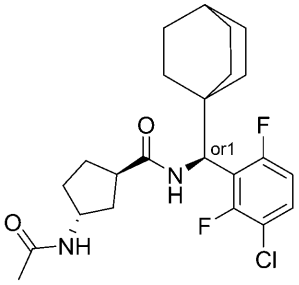
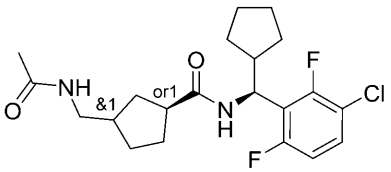
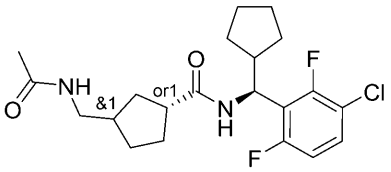
【表１－６３９】

I-2135		(400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.12 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.81 (h, J = 6.0 Hz, 1H), 3.04 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 3.52 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.00 (dt, J = 12.7, 7.3 Hz, 2H), 1.87 (dq, J = 8.1, 5.5, 3.3 Hz, 1H), 1.71 (ddd, J = 12.7, 8.3, 4.2 Hz, 1H), 1.63 - 1.47 (m, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.25 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.1	A	A
I-2136				A	B
I-2137				A	B
I-2138				D	

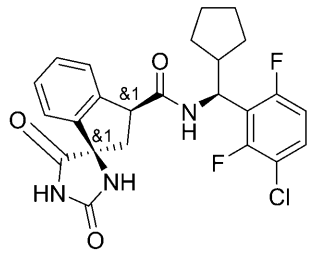
【表１－６４０】

I-2139				A	A
I-2140				E	
I-2141				A	B
I-2142				D	
I-2143				B	B

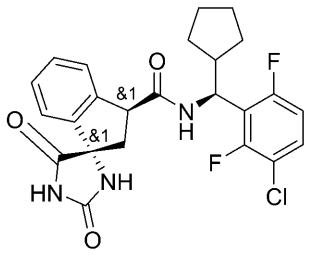
【表１－６４１】

I-2144				A	A
I-2145				D	
I-2146				C	
I-2147				C	

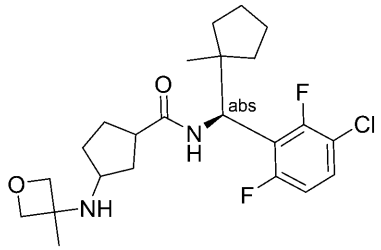
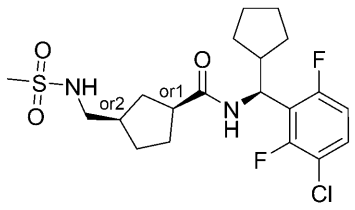
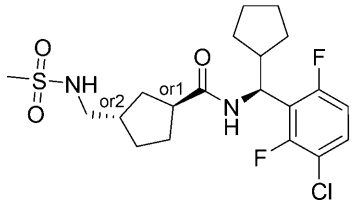
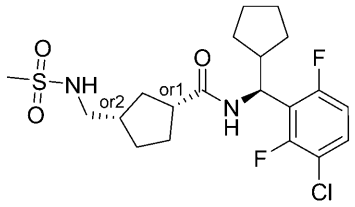
【表１－６４２】

I-2148		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.68 (br. s, 1H), 9.15 (d,J= 7.1 Hz, 0.5H), 9.10 (d,J= 7.4 Hz, 0.5H), 8.40 (s, 0.5H), 8.36 (s, 0.5H), 7.59 - 7.49 (m, 1H), 7.38 (td,J= 7.4, 1.1 Hz, 0.5H), 7.34 - 7.25 (m, 1H), 7.25 - 7.11 (m, 3H), 6.98 (app. d,J= 7.4 Hz, 0.5H), 4.91 (重複する dd,J= 11.2, 7.7 Hz, 0.5H), 4.86 (重複する dd,J= 11.3, 7.2 Hz, 0.5H), 4.27 (app. q,J= 7.7 Hz, 1H), 2.54 (埋没した m, 2.5H), 2.36 (dd,J= 12.9, 9.2 Hz, 0.5H), 2.16 - 2.07 (m, 0.5H), 2.05 - 1.96 (m, 0.5H), 1.72 - 1.28 (m, 6H), 1.11 - 0.98 (m, 1H). 2 つのジアステレオマーの約 1:1 混合物。	474.3	B	

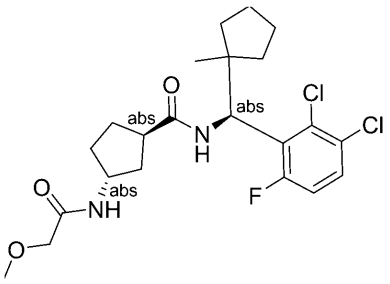
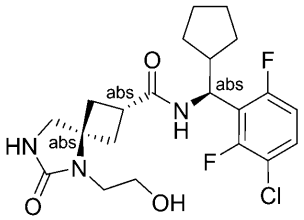
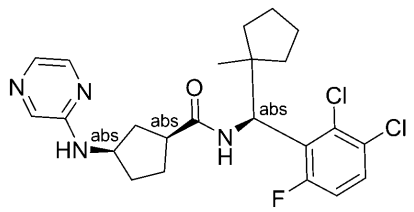
【表１－６４３】

I-2149		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.76 (br. s, 1H), 9.07 (d,J= 7.0 Hz, 0.6H), 9.00 (d,J= 7.4 Hz, 0.4H), 8.58 (重複する s, 0.6H), 8.57 (重複する s, 0.4H), 7.58 - 7.50 (m, 1H), 7.38 (td,J= 7.5, 1.1 Hz, 0.4H), 7.33 - 7.21 (m, 2H), 7.20 - 7.10 (m, 2H), 7.04 - 7.00 (m, 0.6H), 4.89 (重複する dd,J= 11.1, 7.4 Hz, 0.4H), 4.85 (重複する dd,J= 11.1, 7.0 Hz, 0.6H), 4.25 - 4.16 (m, 1H), 2.90 (dd,J= 13.7, 8.4 Hz, 0.6H), 2.78 (dd,J= 13.6, 8.5 Hz, 0.4H), 2.55 (submerge m, 1H), 2.29 (重複する dd,J= 13.5, 7.7 Hz, 0.6H), 2.24 (重複する dd,J= 13.3, 7.5 Hz, 0.4H), 2.16 - 2.03 (m, 0.4H), 2.00 - 1.89 (m, 0.6H), 1.74 - 1.22 (m, 6H), 1.11 - 0.96 (m, 1H). 2 つのジアステレオマーの 3:2 の比の混合物。	474.3	A	B

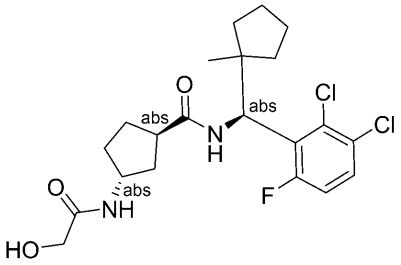
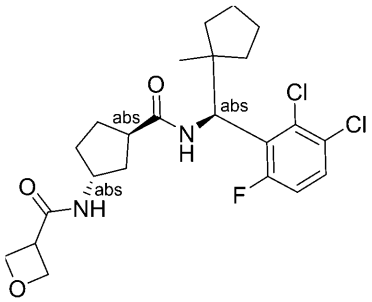
【表１－６４４】

I-2150		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.2 Hz, 0.5H), 8.07 (d, J = 8.4 Hz, 0.5H), 7.60 - 7.50 (m, 1H), 7.14 (app. t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 9.1 Hz, 0.3H), 5.20 (d, J = 8.8 Hz, 0.3H), 5.18 (d, J = 9.0 Hz, 0.2H), 5.17 (d, J = 9.3 Hz, 0.2H), 4.40 - 4.30 (m, 2H), 4.17 - 4.08 (m, 2H), 3.16 - 3.01 (m, 1H), 3.00 - 2.91 (m, 0.4H), 2.86 - 2.74 (m, 0.6H), 2.35 (br. s, 1H), 1.97 - 1.41 (m, 10H), 1.38 (重複する s, 0.9H), 1.36 (重複する s, 1.5H), 1.34 (埋没した m, 2H), 1.32 (重複する s, 0.6H), 1.30 - 1.13 (m, 2H), 0.94 (s, 3H).	441.3	B	
I-2151				C	
I-2152				B	
I-2153				B	C

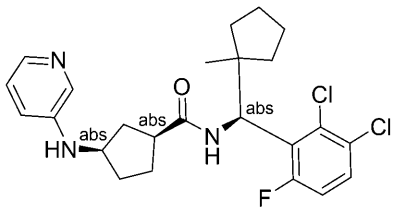
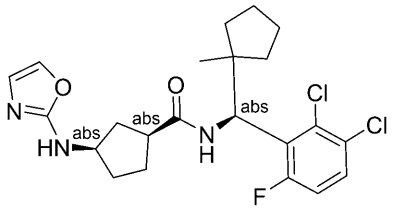
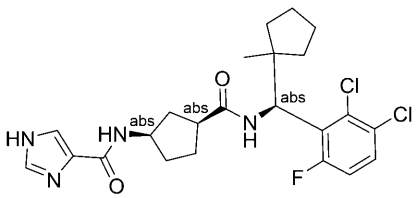
【表１－６４５】

I-2154		(400 MHz, DMSO-d6) 8.13 - 7.98 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.67-7.50 (m, 2H), 7.32 - 7.20 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.52 - 5.42 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.19 - 4.00 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.81 - 3.70 (s, 2H), 3.31 - 3.22 (s, 3H), 3.08 - 2.91 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.94 - 1.76 (m, 3H), 1.74 - 1.52 (m, 7H), 1.51 - 1.34 (m, 3H), 1.31 - 1.18 (s, 1H), 1.08 - 0.87 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	459.1	A	B
I-2155		(400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 6.22 (s, 1H), 4.96 - 4.55 (m, 2H), 3.63- 3.38 (m, 2H), 3.32 - 3.05 (m, 4H), 2.93 (tt, J = 9.7, 4.9 Hz, 1H), 2.56 (d, J = 11.6 Hz, 1H), 2.49 - 2.32 (m, 2H), 2.14 (dd, J = 10.2, 6.1 Hz, 1H), 2.04 (dd, J = 12.5, 4.6 Hz, 1H), 1.89 (ddd, J = 24.7, 15.5, 9.3 Hz, 1H), 1.73-1.40 (m, 4H), 1.40 -1.19 (m, 2H), 1.02 (d, J = 9.9 Hz, 1H).	442.25	B	
I-2156		(400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.97 - 7.86 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 7.2, 3.8 Hz, 2H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.14 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.96 (dq, J = 13.4, 7.0 Hz, 2H), 1.91 - 1.80 (m, 1H), 1.74 (ddd, J = 13.2, 8.6, 5.0 Hz, 1H), 1.57 (dt, J = 22.0, 6.2 Hz, 6H), 1.52 - 1.42 (m, 2H), 1.38 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.2	A	A

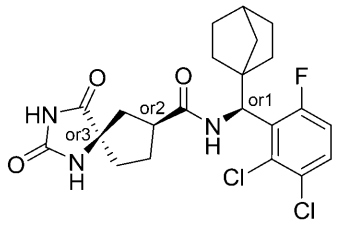
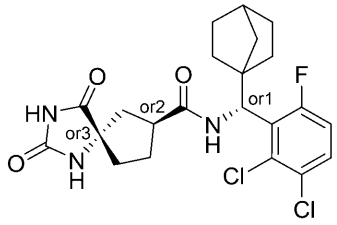
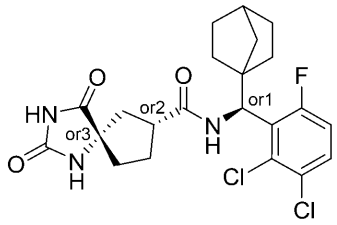
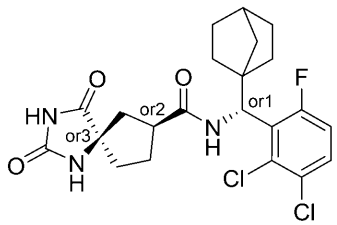
【表１－６４６】

I-2157		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 - 7.88 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.68 - 7.59 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.52 - 7.42 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.32 - 7.16 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.58 - 5.47 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.46 - 5.31 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 4.50 - 4.02 (m, 1H), 3.83 - 3.70 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 3.12 - 2.92 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.94 - 1.75 (m, 3H), 1.74 - 1.66 (ddd, J = 12.8, 8.9, 6.2 Hz, 1H), 1.65 - 1.52 (t, J = 4.0 Hz, 6H), 1.51 - 1.42 (tdd, J = 9.7, 8.5, 7.3, 3.5 Hz, 2H), 1.41 - 1.34 (m, 1H), 1.32 - 1.23 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 1.05 - 0.89 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	445.05	A	B
I-2158		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 - 7.99 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.87 - 7.77 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.66 - 7.57 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.34 - 7.19 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.55 - 5.41 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.70 - 4.53 (m, 4H), 4.12 - 3.97 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.75 - 3.60 (m, 1H), 3.06 - 2.89 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.95 - 1.71 (m, 3H), 1.69 - 1.50 (m, 7H), 1.48 - 1.32 (ddt, J = 25.3, 12.8, 7.1 Hz, 3H), 1.31 - 1.21 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.02 - 0.90 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	471.1	A	B

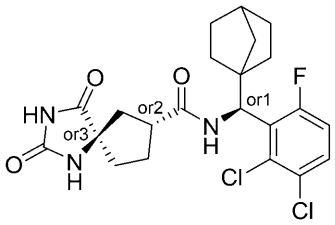
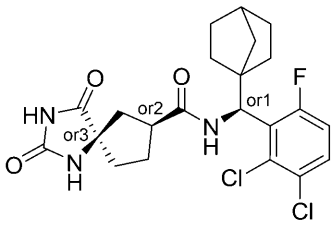
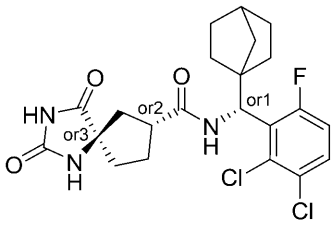
【表１－６４７】

I-2159		(400 MHz, DMSO-d6) 8.23 - 8.04 (m, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.73 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.2, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 8.5, 4.6 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.75 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.98 (dt, J = 13.7, 7.2 Hz, 2H), 1.92 - 1.78 (m, 1H), 1.75-1.66 (m, 1H), 1.64 - 1.41 (m, 8H), 1.38 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 1.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 0.97 (s, 3H).	464.3	A	B
I-2160		(400 MHz, DMSO-d6) 8.37-7.99 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 6.73 (s, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.92 (h, J = 6.0 Hz, 1H), 3.01 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.90 (dq, J = 11.1, 5.8, 4.6 Hz, 2H), 1.80 (ddd, J = 18.4, 9.2, 5.6 Hz, 2H), 1.71-1.16 (m, 10H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	454.25	A	B
I-2161		(400 MHz, DMSO-d6) 12.45 (s, 1H), 8.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.60 (dt, J = 12.7, 7.8 Hz, 3H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.25 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.09-3.01 (m, 1H), 1.96-1.74 (m, 2H), 1.81 (s, 2H), 1.60 (s, 7H), 1.58-1.44 (m, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	481.15	A	A

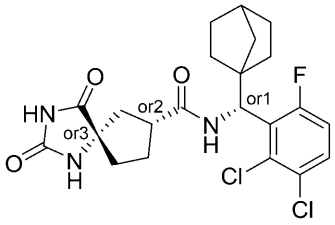
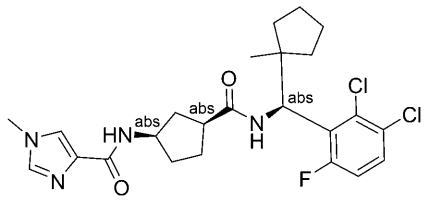
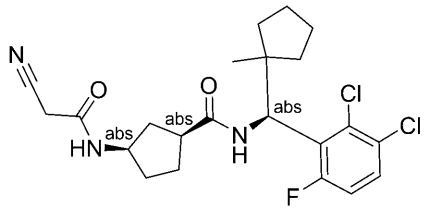
【表１－６４８】

I-2162		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.23 - 2.98 (m, 1H), 2.14 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 2.10 - 1.88 (m, 3H), 1.87- 1.70 (m, 3H), 1.66 -1.45 (m, 3H), 1.35 (t, J = 10.2 Hz, 3H), 1.30 - 1.09 (m, 4H).	468.15	A	B
I-2163		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.15 - 3.06 (m, 1H), 2.14 (s, 1H), 2.10 - 1.88 (m, 3H), 1.87 - 1.69 (m, 3H), 1.53 (d, J = 20.9 Hz, 3H), 1.35 (t, J = 10.1 Hz, 3H), 1.23 (dd, J = 21.7, 9.1 Hz, 4H).	468	E	
I-2164		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.12 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 2.16 - 2.06 (m, 2H), 1.96 - 1.84 (m, 3H), 1.73 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 1.56 (t, J = 22.7 Hz, 4H), 1.33 (d, J = 10.3 Hz, 3H), 1.30 - 1.15 (m, 4H).	468.2	A	A
I-2165		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.10 - 2.97 (m, 1H), 2.14 (s, 1H), 2.08 - 1.92 (m, 3H), 1.87 - 1.74 (m, 2H), 1.66 (dd, J = 11.1, 5.5 Hz, 1H), 1.53 (d, J = 19.4 Hz, 3H), 1.44 - 1.15 (m, 7H).	468.05	B	

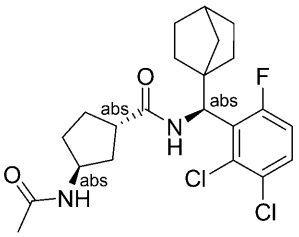
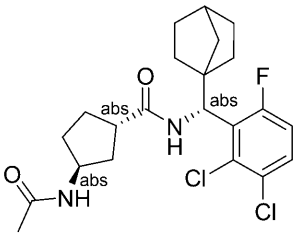
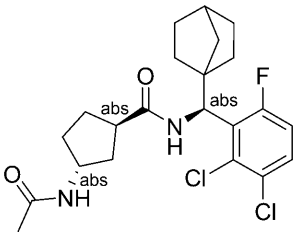
【表１－６４９】

I-2166		(400 MHz, DMSO-d6) 10.52 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.10 - 2.97 (m, 1H), 2.15 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 1.98 (dddd, J = 13.3, 9.6, 7.1, 3.1 Hz, 3H), 1.89 - 1.74 (m, 2H), 1.73 - 1.59 (m, 1H), 1.53 (d, J = 23.1 Hz, 3H), 1.35 (dd, J = 14.9, 9.2 Hz, 4H), 1.24 (dd, J = 20.7, 9.4 Hz, 3H).	468.15	A	A
I-2167		(400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.17 - 2.07 (m, 2H), 2.03 - 1.86 (m, 3H), 1.65 (p, J = 6.1, 5.4 Hz, 2H), 1.52 (d, J = 20.3 Hz, 3H), 1.33 (q, J = 11.7, 9.2 Hz, 4H), 1.28 - 1.18 (m, 3H).	468.15	A	A
I-2168		(400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.23 - 2.08 (m, 2H), 2.03 - 1.86 (m, 3H), 1.65 (p, J = 6.3 Hz, 2H), 1.52 (d, J = 19.7 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 13.8 Hz, 3H), 1.24 (d, J = 13.1 Hz, 4H).	468	D	

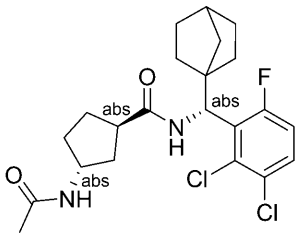
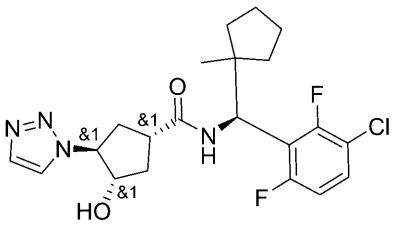
【表１－６５０】

I-2169		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.31 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.12 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.16 - 2.06 (m, 2H), 1.96 - 1.84 (m, 3H), 1.75 (q, J = 9.0, 8.6 Hz, 1H), 1.68 - 1.44 (m, 4H), 1.35 (t, J = 10.0 Hz, 3H), 1.23 (dd, J = 20.3, 9.1 Hz, 4H).	468	C	
I-2170		(400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.6-7.53 (m, 4H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.23 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 3.68 (s, 3H), 3.04 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 1.90 (dt, J = 13.6, 7.2 Hz, 1H), 1.84-1.73 (m, 1H), 1.60 (s, 7H), 1.53 (s, 1H), 1.54-1.41 (m, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 10.9 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	495.15	A	B
I-2171		(400 MHz, DMSO-d6) 8.28 - 8.16 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.13 - 7.98 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.69 - 7.55 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.33 - 7.19 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.57 - 5.44 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.10 - 3.92 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.66 - 3.47 (d, J = 2.7 Hz, 2H), 3.14 - 2.90 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.02 - 1.76 (m, 3H), 1.72 - 1.51 (m, 7H), 1.48 - 1.33 (m, 3H), 1.31 - 1.19 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 1.02 - 0.91 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	454.1	A	A

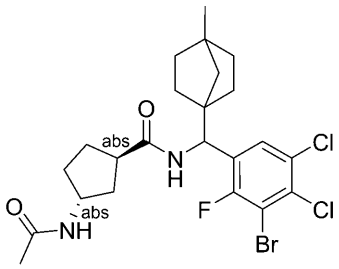
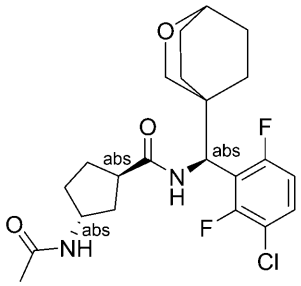
【表１－６５１】

I-2172		(400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.97 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 2.94 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.13 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 1.95- 1.81 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.73 - 1.45 (m, 6H), 1.37 (ddd, J = 23.6, 13.4, 6.8 Hz, 4H), 1.23 (dd, J = 19.7, 9.3 Hz, 4H).	441.05	A	A
I-2173		(400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.94 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.14 (s, 1H), 1.92-1.76 (m, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.66-1.42 (m, 5H), 1.37 (ddd, J = 21.4, 15.3, 8.7 Hz, 4H), 1.26 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 1.22 (s, 2H).	441.15	B	
I-2174		(400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.94 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.14 (t, J = 3.9 Hz, 1H), 1.96 - 1.72 (m, 6H), 1.68 - 1.41 (m, 5H), 1.35 (ddt, J = 15.4, 10.8, 3.9 Hz, 4H), 1.23 (dd, J = 20.4, 8.8 Hz, 4H).	441.1	A	A

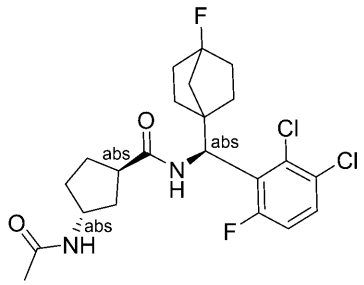
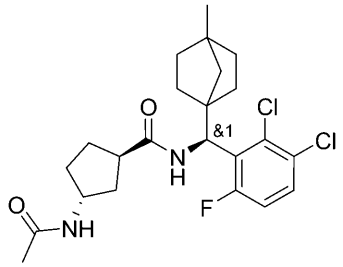
【表１－６５２】

I-2175		(400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.97 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.94 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.17 - 2.06 (m, 1H), 1.87 (tt, J = 11.6, 10.0, 4.2 Hz, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.73 - 1.46 (m, 6H), 1.37 (ddd, J = 23.9, 13.5, 6.9 Hz, 4H), 1.23 (dd, J = 19.2, 9.0 Hz, 4H).	441.1	B	
I-2176		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの約 1.2:1 混合物として，8.29 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.17 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.73 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.61 - 7.53 (m, 2H), 7.19 - 7.11 (m, 2H), 5.38 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 5.34 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 5.22 (重複する d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.20 (重複する d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.71 - 4.63 (m, 2H), 4.34 - 4.25 (m, 2H), 3.23 - 3.13 (m, 2H), 2.37 - 2.06 (m, 6H), 1.70 (dt, J = 12.7, 8.9 Hz, 1H), 1.65 - 1.45 (m, 13H), 1.40 - 1.33 (m, 2H), 1.23 - 1.17 (m, 2H), 0.96 (s, 6H).	439.4	B	B

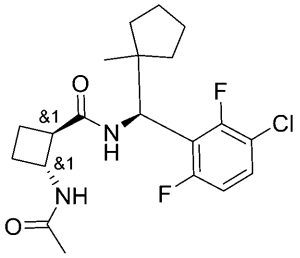
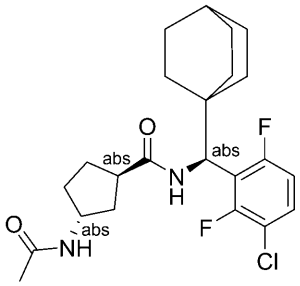
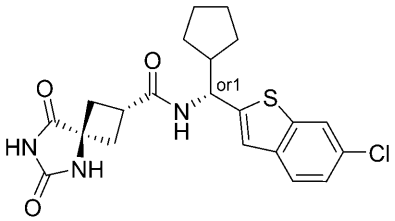
【表１－６５３】

I-2177		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d,J= 8.0 Hz, 0.7H), 8.11 (d,J= 7.9 Hz, 0.3H), 8.05 (d,J= 6.5 Hz, 0.6H), 7.80 (d,J= 10.7 Hz, 0.4H), 7.77 (d,J= 6.8 Hz, 1H), 5.56 (d,J= 7.7 Hz, 0.7H), 5.49 (d,J= 7.9 Hz, 0.3H), 4.04 - 3.93 (m, 1H), 3.00 - 2.87 (m, 1H), 1.91 - 1.78 (重複する m, 2H), 1.76 (重複する s, 3H), 1.73 - 1.53 (m, 2H), 1.49 - 1.22 (m, 10H), 1.18 - 1.08 (m, 1H), 1.06 (s, 3H). 混合不純物が存在。芳香族のピーク比に基づくと、P2B:P2A の 3:2 混合物及び 7:3 の dr。	533.3	B	D
I-2178		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.57 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (app br. t, J = 9.0 Hz, 1H), 5.04 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.04 - 3.93 (m, 1H), 3.61 (埋没した m, 2H), 3.41 (br. s, 1H), 2.92 (app. p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.88 - 1.78 (m, 4H), 1.76 (重複する s, 3H), 1.73 - 1.28 (m, 9H). 2 つのジアステレオマーの 9:1 混合物。	441.2	C	

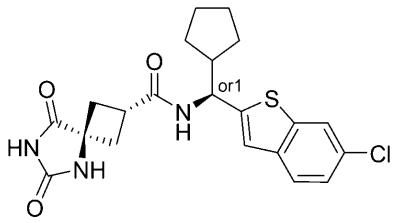
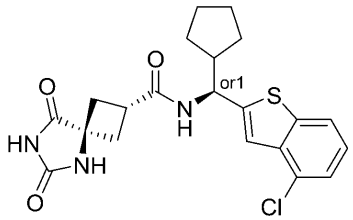
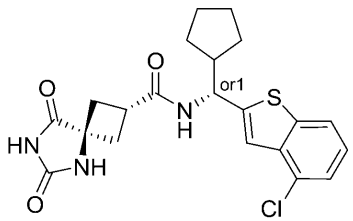
【表１－６５４】

I-2179		HNMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d,J= 8.0 Hz, 1H), 7.77 (d,J= 6.3 Hz, 1H), 7.62 (dd,J= 8.6, 4.8 Hz, 1H), 7.26 (t,J= 9.8 Hz, 1H), 5.50 (d,J= 7.9 Hz, 1H), 4.04 - 3.92 (m, 1H), 2.97 - 2.85 (m, 1H), 1.84 (重複する m, 5H), 1.76 (重複する d,J= 1.1 Hz, 3H), 1.69 (重複する m, 3H), 1.66 - 1.46 (m, 6H), 1.46 - 1.30 (m, 2H). 約 9:1 のジアステレオマー比。若干の脂肪族不純物及び残留 DMSO。	459.4	A	A
I-2180		NMR (400 MHz, DMSO-d6)(主要なジアステレオマーを記載) 8.06 (d,J= 8.2 Hz,1H), 7.77 (d,J= 6.7 Hz, 1H), 7.59 (dd,J= 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.23 (dd,J= 10.3, 9.3 Hz, 1H), 5.57 (d,J= 8.2 Hz, 1H), 4.04 - 3.94 (m, 1H), 2.98 - 2.88 (m, 1H), 1.90 - 1.78 (重複する m, 2H), 1.76 (重複する s, 3H), 1.73 - 1.53 (m, 2H), 1.49 - 1.21 (m, 10H), 1.17 - 1.10 (m, 1H), 1.05 (s, 3H). 約 85:15 のジアステレオマー比。若干の混合不純物及び残留 DMSO が存在。	455.4	A	B

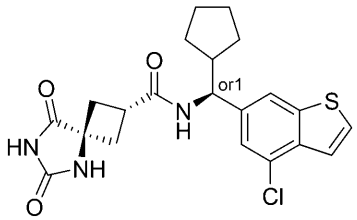
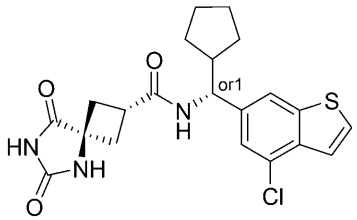
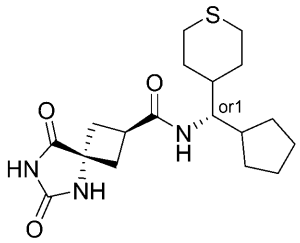
【表１－６５５】

I-2181		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.84 (d, J = 8.7 Hz, 0.5H), 8.65 (d, J = 8.5 Hz, 0.5H), 8.35 (重複する d, J = 7.1 Hz, 0.5H), 8.34 (重複する d, J = 7.8 Hz, 0.5H), 7.59 - 7.50 (m, 1H), 7.17 - 7.09 (m, 1H), 5.21 (d, J = 8.8 Hz, 0.5H), 5.17 (d, J = 8.6 Hz, 0.5H), 4.19 - 4.03 (m, 1H), 3.00 - 2.88 (m, 1H), 2.07 - 1.96 (m, 1H), 1.85 (埋没した m, 2H), 1.85 (重複する s, 1.5H), 1.82 (重複する s, 1.5H), 1.76 - 1.45 (m, 7H), 1.42 - 1.31 (m, 1H), 1.25 - 1.16 (m, 1H), 0.99 - 0.93 (s, 3H). 2 つのトランスジアステレオマーの約 1:1 混合物。	399.2	E	
I-2182		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 7.99 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.54 (app td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.20 - 7.04 (m, 1H), 4.95 (br s, 1H), 4.03 - 3.92 (m, 1H), 2.94 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.87 - 1.72 (重複する m, 2H), 1.76 (重複する s, 3H), 1.68 - 1.65 (m, 1H), 1.56 - 1.44 (m, 8H), 1.43 - 1.32 (m, 8H).	439.7	A	A
I-2183		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.45 - 7.21 (m, 2H), 4.95 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 (dt, J = 12.0, 8.3 Hz, 2H), 2.37 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.21 (dddd, J = 21.6, 13.0, 9.1, 4.3 Hz, 2H), 1.82 - 1.72 (m, 1H), 1.65 - 1.42 (m, 5H), 1.34 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 1.33 - 1.17 (m, 1H).	432.15	E	

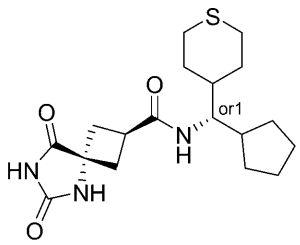
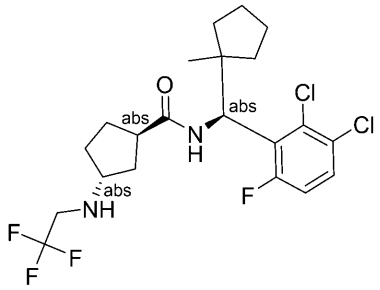
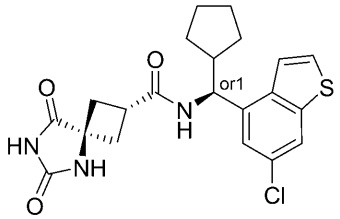
【表１－６５６】

I-2184		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.45 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 8.5, 2.0 Hz, 1H), 7.29 (s, 1H), 4.95 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.17 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 (dt, J = 11.9, 8.3 Hz, 2H), 2.38 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 2.21 (dddd, J = 21.5, 12.9, 9.0, 4.2 Hz, 2H), 1.83 - 1.73 (m, 1H), 1.63 - 1.42 (m, 5H), 1.40 - 1.27 (m, 1H), 1.27 - 1.18 (m, 1H).	432.15	E	
I-2185		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.50 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.36 - 7.27 (m, 2H), 4.99 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.18 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 (dt, J = 11.7, 9.0 Hz, 2H), 2.38 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.22 (dddd, J = 22.1, 12.9, 9.0, 4.2 Hz, 2H), 1.78 (dt, J = 12.0, 6.2 Hz, 1H), 1.65 - 1.44 (m, 5H), 1.33 (dt, J = 14.9, 7.4 Hz, 1H), 1.28 - 1.21 (m, 1H).	432.15	D	
I-2186		(400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.36 - 7.27 (m, 2H), 4.99 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.18 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.71 (dt, J = 11.4, 9.1 Hz, 2H), 2.38 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.22 (dddd, J = 22.1, 12.9, 9.1, 4.1 Hz, 2H), 1.77 (td, J = 10.0, 9.0, 4.3 Hz, 1H), 1.64 - 1.44 (m, 5H), 1.35 (dt, J = 13.1, 7.1 Hz, 1H), 1.28 - 1.21 (m, 1H).	432.15	D	

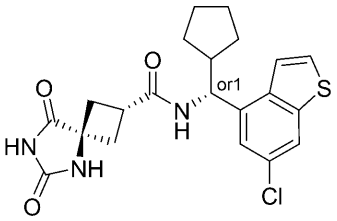
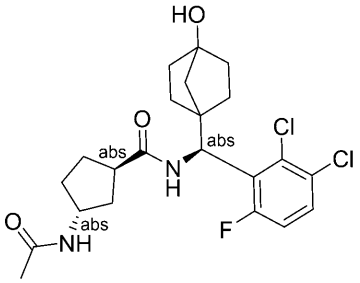
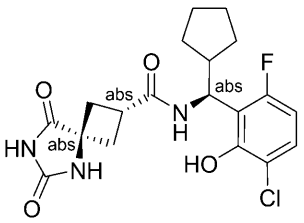
【表１－６５７】

I-2187		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.93 - 7.85 (m, 2H), 7.48 - 7.37 (m, 2H), 4.68 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 16.4, 12.1, 9.1 Hz, 2H), 2.34 - 2.19 (m, 2H), 2.14 (ddd, J = 13.0, 9.1, 4.3 Hz, 1H), 1.76 (td, J = 7.8, 4.1 Hz, 1H), 1.66 - 1.39 (m, 4H), 1.38 - 1.20 (m, 2H), 1.11 (dq, J = 12.4, 8.0 Hz, 1H).	432.05	B	
I-2188		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.93 - 7.85 (m, 2H), 7.48 - 7.41 (m, 2H), 4.68 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 16.4, 12.0, 9.1 Hz, 2H), 2.34 - 2.19 (m, 2H), 2.14 (ddd, J = 12.7, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 1.75 (dp, J = 7.4, 4.3 Hz, 1H), 1.66 - 1.39 (m, 4H), 1.38 - 1.20 (m, 2H), 1.11 (dq, J = 12.5, 8.1 Hz, 1H).	432.05	D	
I-2189		(400 MHz, DMSO-d6)10.56 (s, 1H),8.62 (s, 1H), 7.47 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.58 (td, J = 9.3, 4.5 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72 (s, 1H), 2.70-2.62 (m, 1H), 2.62-2.52 (m, 3H), 2.25-2.15 (m, 2H), 2.03-1.91 (m, 1H), 1.91-1.80 (m, 2H), 1.70-1.46 (m, 8H), 1.38-1.24 (m, 2H), 1.20-1.06 (m, 2H).	336.2	D	

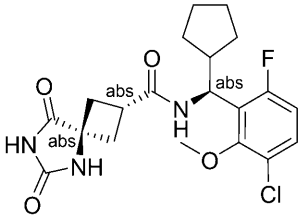
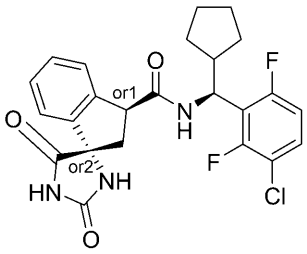
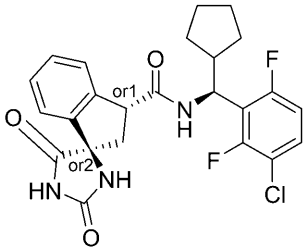
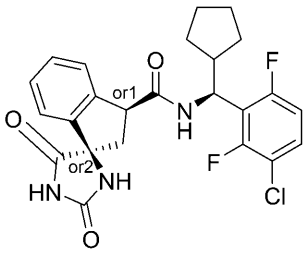
【表１－６５８】

I-2190		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 7.47 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 3.58 (td, J = 9.2, 4.3 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.72 (dd, J = 10.2, 6.7 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 18.2, 5.9 Hz, 1H), 2.62-2.52 (m, 3H), 2.20 (td, J = 9.2, 4.0 Hz, 2H), 1.98 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 1.94-1.91 (m, 1H), 1.91-1.80 (m, 1H), 1.58 (s, 3H), 1.50-1.40 (m, 5H), 1.36-1.22 (m, 2H), 1.20-1.05 (m, 2H).	336.2	E	
I-2191		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 - 7.98 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.67 - 7.54 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.33 - 7.19 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.50 - 5.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.30 - 3.09 (m, 3H), 3.07 - 2.88 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.31 - 2.19 (s, 1H), 1.88 - 1.67 (ddt, J = 17.0, 12.1, 6.8 Hz, 3H), 1.65 - 1.49 (m, 5H), 1.47 - 1.12 (m, 4H), 1.06 - 0.84 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	469.1	B	
I-2192		(400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.41 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 5.16 - 5.07 (m, 1H), 3.12 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (ddd, J = 27.0, 12.1, 9.1 Hz, 2H), 2.39 (h, J = 8.1 Hz, 1H), 2.24 (ddd, J = 12.5, 9.0, 4.4 Hz, 1H), 2.11 (ddd, J = 14.2, 9.6, 5.1 Hz, 1H), 1.77 (q, J = 5.6, 5.1 Hz, 1H), 1.70 - 1.33 (m, 4H), 1.27 (dtd, J = 12.1, 7.4, 4.0 Hz, 1H), 1.04 (dq, J = 12.5, 8.0 Hz, 1H).	432.05	B	C

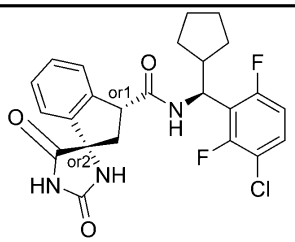
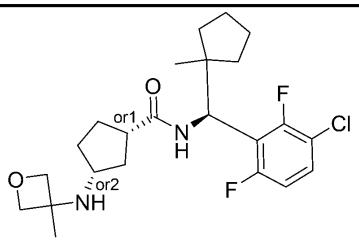
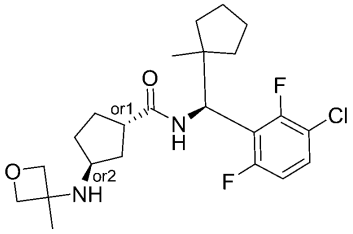
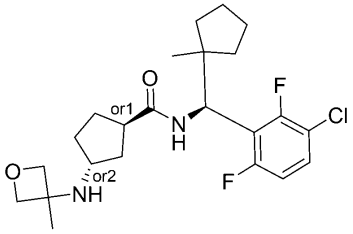
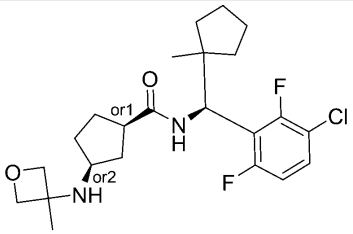
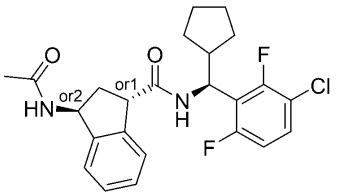
【表１－６５９】

I-2193		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.42 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 5.12 (dd, J = 9.9, 8.5 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 27.0, 12.1, 9.1 Hz, 2H), 2.47 - 2.32 (m, 1H), 2.25 (ddd, J = 12.5, 9.1, 4.4 Hz, 1H), 2.11 (ddd, J = 17.4, 8.9, 4.4 Hz, 1H), 1.77 (tq, J = 7.4, 4.7, 3.7 Hz, 1H), 1.70 - 1.33 (m, 5H), 1.27 (dtd, J = 12.0, 7.4, 4.0 Hz, 1H), 1.04 (dq, J = 12.6, 8.0 Hz, 1H).	432.05	E	
I-2194				B	C
I-2195		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの 19:1 混合物として, 10.45 (br. s, 1H), 9.79 (br. s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.35 (br. s, 1H), 7.24 (dd, J = 8.8, 5.9 Hz, 1H), 6.63 (app. t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.96 (dd, J = 10.7, 8.3 Hz, 1H), 3.14 (app. p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.65 (app. t, J = 12.6 Hz, 1H), 2.62 (app. t, J = 12.6 Hz, 1H), 2.58 - 2.50 (重複する m, 1H), 2.26 - 2.18 (m, 1H), 2.18 - 2.10 (m, 1H), 1.85 - 1.76 (m, 1H), 1.64 - 1.38 (m, 4H), 1.33 - 1.21 (m, 2H), 1.10 - 0.98 (m, 1H). 極微量の DMF を含有。	410.4	B	C

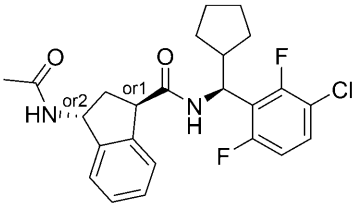
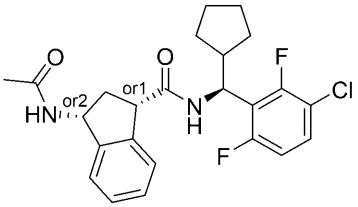
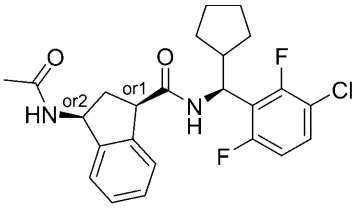
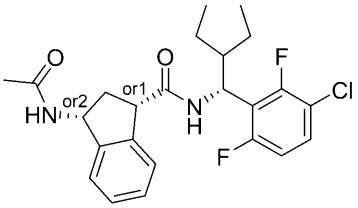
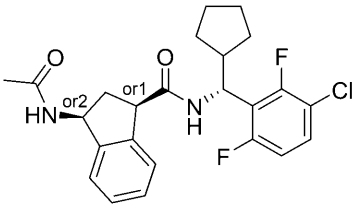
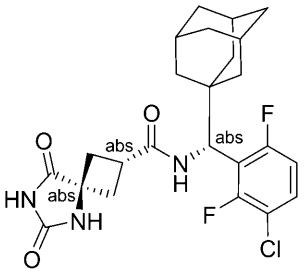
【表１－６６０】

I-2196		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの 19:1 混合物として, 10.55 (br. s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.27 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 8.9, 5.7 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.8, 9.2 Hz, 1H), 4.94 (dd, J = 10.8, 8.0 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.17 (app. p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 12.0, 9.2 Hz, 1H), 2.61 (dd, J = 12.0, 9.3 Hz, 1H), 2.44 - 2.32 (m, 1H), 2.25 - 2.17 (m, 1H), 2.16 - 2.09 (m, 1H), 1.92 - 1.82 (m, 1H), 1.65 - 1.38 (m, 4H), 1.30 - 1.16 (m, 2H), 1.08 - 0.97 (m, 1H).	424.4	B	
I-2197				C	
I-2198				A	B
I-2199				B	

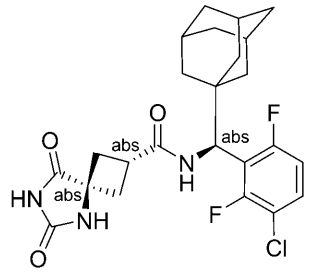
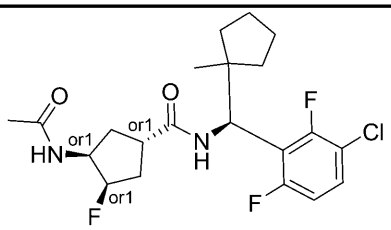
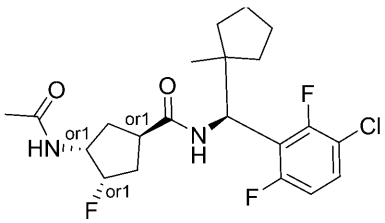
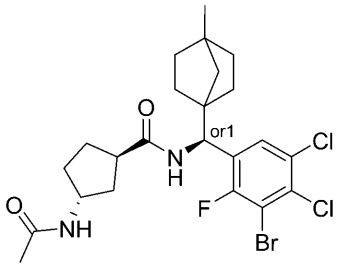
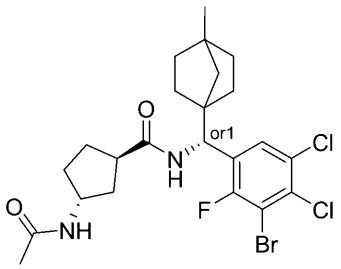
【表１－６６１】

I-2200				D	
I-2201				B	D
I-2202				D	
I-2203				B	
I-2204				B	D
I-2205				A	B

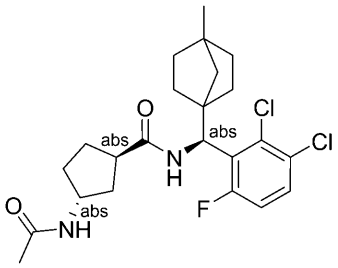
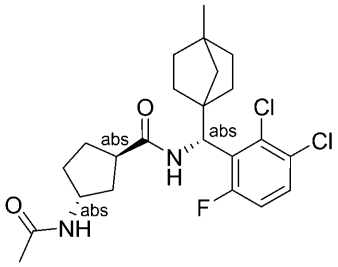
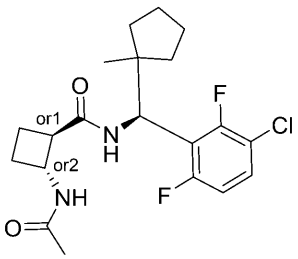
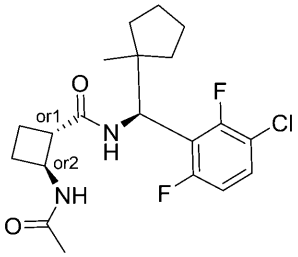
【表１－６６２】

I-2206				D	
I-2207				C	
I-2208				D	
I-2209				B	B
I-2210				D	
I-2211				D	

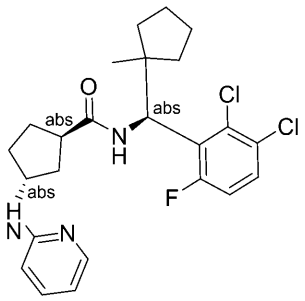
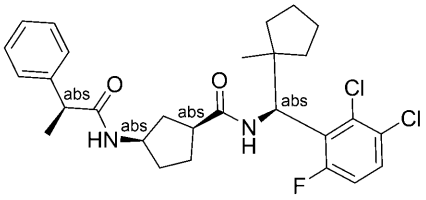
【表１－６６３】

I-2212				D	
I-2213				A	A
I-2214				A	A
I-2215				B	D
I-2216				C	

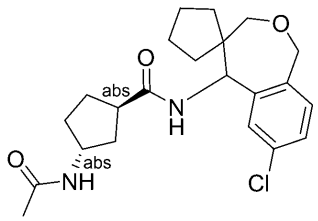
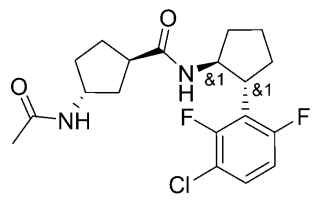
【表１－６６４】

I-2217				A	B
I-2218				C	
I-2219				D	
I-2220				E	

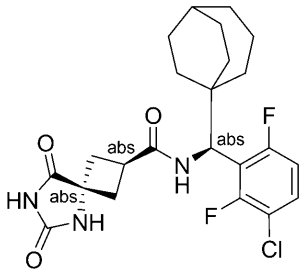
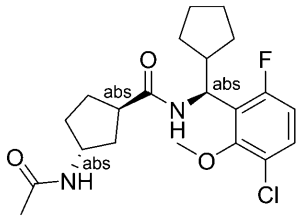
【表１－６６５】

I-2221		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.97 - 7.91 (m, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.38 - 7.30 (m, 1H), 7.26 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 6.41 (td, J = 10.9, 10.2, 6.1 Hz, 3H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.12 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 3.01 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 1.94 (dq, J = 13.4, 6.9 Hz, 2H), 1.83 (s, 1H), 1.73 (dq, J = 13.2, 7.7, 6.4 Hz, 1H), 1.60 (s, 6H), 1.57 - 1.40 (m, 2H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	464.1	B	B
I-2222		(400 MHz, DMSO-d6) 8.12 - 8.02 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.96 - 7.84 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.65 - 7.57 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.39 - 7.12 (m, 6H), 5.56 - 5.45 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.05 - 3.92 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.62 - 3.49 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.06 - 2.92 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.99 - 1.87 (dt, J = 13.8, 7.3 Hz, 1H), 1.82 - 1.70 (dq, J = 10.5, 5.2 Hz, 2H), 1.68 - 1.52 (m, 7H), 1.44 - 1.23 (m, 7H), 1.02 -	519.25	B	B

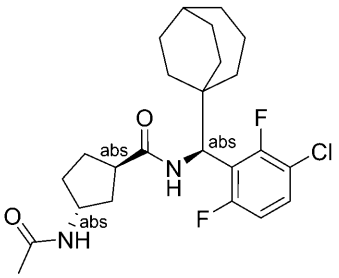
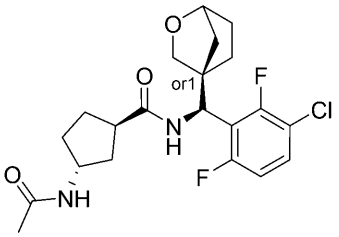
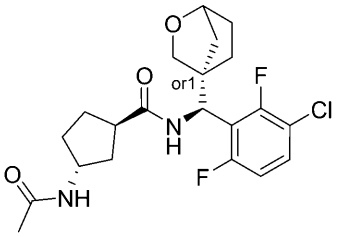
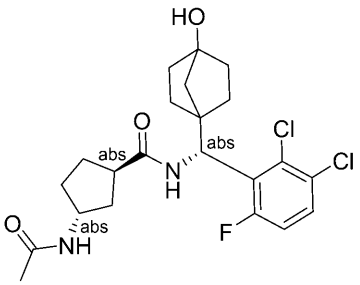
【表１－６６６】

I-2223		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 6.3 Hz, 0.5H), 7.79 (d, J = 6.1 Hz, 0.5H), 7.34 (t, J = 1.6 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.12 - 4.97 (m, 1H), 4.79 (AB の dA , JAB = 13.8 Hz, 1H), 4.57 (AB の ddB , JAB, = 13.8, 0.9 Hz, 1H), 4.08 - 3.99 (m, 1H), 3.81 (AB の ddA , JAB = 12.5, 4.3 Hz, 1H), 3.49 (AB の dB, JAB = 12.5 Hz, 1H), 3.03 - 2.91 (m, 1H), 2.00 - 1.79 (m, 3H), 1.77 (s, 1.5H), 1.76 (s, 1.5H), 1.73 - 1.48 (m, 5H), 1.48 - 1.35 (m, 2H), 1.35 - 1.13 (m, 3H), 1.11 - 1.03 (m, 1H). 2 つのジアステレオマーの 1:1 混合物。	405.2	E	
I-2224		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.88 (d, J = 4.5 Hz, 0.5H), 7.86 (d, J = 4.7 Hz, 0.5H), 7.74 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.50 - 7.42 (m, 1H), 7.12 - 7.03 (m, 1H), 4.38 (p, J = 8.6 Hz, 1H), 4.00 - 3.88 (m, 1H), 3.21 (dd, J = 8.8, 3.2 Hz, 0.5H), 3.17 (dd, J = 9.3, 3.4 Hz, 0.5H), 2.64 - 2.53 (m, 1H), 2.09 - 1.91 (m, 2H), 1.87 - 1.67 (重複する m, 5H), 1.74 (s, 1.5H), 1.74 (s, 1.5H), 1.64 - 1.41 (m, 3H), 1.37 - 1.22 (m, 2H). 1:1 のジアステレオマー比	385.4	E	

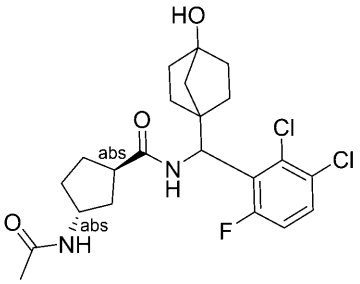
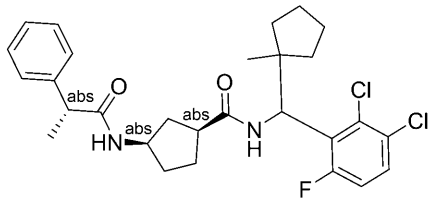
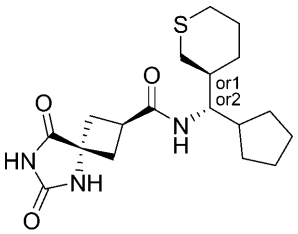
【表１－６６７】

I-2225		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 10.54 (br s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.21 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.54 (app td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.17 - 7.07 (m, 1H), 4.96 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.24 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.68 - 2.61 (m, 1H), 2.61 - 2.53 (m, 1H), 2.25 - 2.13 (m, 2H), 1.87 - 1.80 (m, 1H), 1.74 - 1.21 (m, 14H). 約5%のビシクロオクタン類似体を不純物として含有。このバッチはジアステレオマーの約 4:1 の混合物である。	466.3	A	B
I-2226		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの 19:1 混合物として, 8.15 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.9, 5.7 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.9, 9.1 Hz, 1H), 4.93 (dd, J = 10.8, 8.2 Hz, 1H), 4.05 - 3.96 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 2.83 (app. p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.43 - 2.31 (m, 1H), 1.92 - 1.72 (m, 4H), 1.76 (s, 3H), 1.66 - 1.16 (m, 9H), 1.08 - 0.97 (m, 1H). 約 3 重量%の DMF に加えて、脂肪族不純物を含有。	411.4	C	

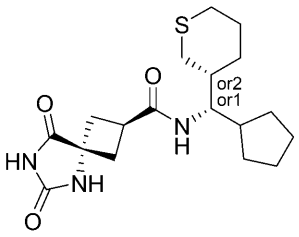
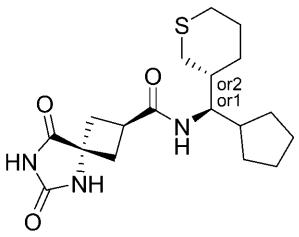
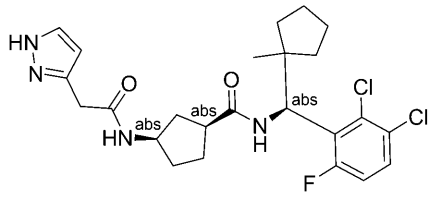
【表１－６６８】

I-2227		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 8.06 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.54 (app td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.11 (app t, J = 9.1 Hz, 1H), 4.95 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.03 - 3.93 (m, 1H), 3.00 - 2.89 (m, 1H), 1.88 - 1.73 (m, 5H), 1.76 (s, 3H), 1.71 - 1.19 (m, 16H). 約5%のビシロオクタン類似体を不純物として含有。このバッチはジアステレオマーの約 4:1 の混合物である。	455.3	B	B
I-2228				C	
I-2229				D	
I-2230				D	

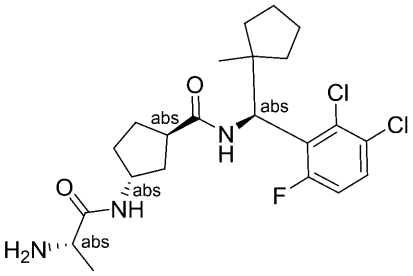
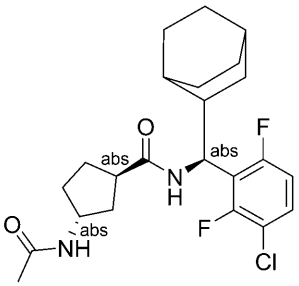
【表１－６６９】

I-2231		NMR (400 MHz, DMSO-d6) -- 主要なジアステレオマーを記載 8.08 (d,J= 8.3 Hz, 1H), 7.78 (d,J= 6.8 Hz, 1H), 7.60 (dd,J= 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (dd,J= 10.5, 9.1 Hz, 1H), 5.48 (d,J= 8.2 Hz, 1H), 4.05 - 3.92 (m, 1H), 3.14 - 3.00 (m, 1H), 2.99 - 2.85 (m, 1H), 1.88 - 1.68 (重複する m, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.66 - 1.53 (m, 2H), 1.53 - 1.42 (m, 8H), 1.42 - 1.26 (m, 3H). 8.34ppm にギ酸塩。約 85:15 のジアステレオマー比。約 10%の混合不純物。2.54ppm に残留 DMSO が存在。1ppm 前後に未知の脂肪族不純物。	457.4	B	C
I-2232		(400 MHz, DMSO-d6) 8.01 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.33-7.16 (m, 6H), 5.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.98 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.56 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 2.98-2.90 (m, 1H), 1.91-1.75 (m, 3H), 1.58 (s, 6H), 1.54-1.35 (m, 2H), 1.36 (s, 1H), 1.29 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.25 (s, 1H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	519.25	C	
I-2233		(400 MHz, メタノール-d4) 3.72 (dd, J = 8.7, 5.0 Hz, 1H), 3.25 (tt, J = 9.6, 8.3 Hz, 1H), 3.00-2.87 (m, 2H), 2.63-2.54 (m, 1H), 2.54 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 2.54-2.45 (m, 2H), 2.48-2.38 (m, 2H), 2.21-2.03 (m, 2H), 1.91-1.82 (m, 2H), 1.86-1.68 (m, 2H), 1.71-1.59 (m, 3H), 1.62-1.51 (m, 2H), 1.23 (dqd, J = 16.2, 8.2, 5.0 Hz, 3H).	366.2	E	

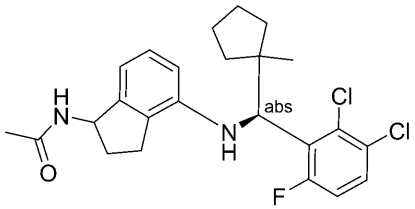
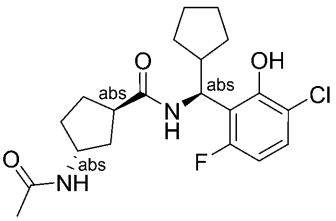
【表１－６７０】

I-2234		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.47 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.69 (td, J = 8.8, 5.2 Hz, 1H), 3.13 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70 (ddd, J = 17.6, 12.6, 8.8 Hz, 2H), 2.52-2.40 (m, 3H), 2.34 (dd, J = 13.3, 10.3 Hz, 1H), 2.26 -2.16 (m, 2H), 2.08-1.95 (m, 2H), 1.70 (td, J = 12.2, 11.3, 5.0 Hz, 1H), 1.69-1.53 (m, 3H).1.51 (tdt, J = 25.4, 21.3, 14.3, 6.8 Hz, 5H), 1.16 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 1.13 (dd, J = 8.5, 4.5 Hz, 1H), 1.10-1.00 (m, 1H).	366.05	D	
I-2235		(400 MHz, メタノール-d4) 3.72 (dd, J = 8.5, 4.9 Hz, 1H), 3.24 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.93 (tdd, J = 11.7, 8.1, 2.9 Hz, 2H), 2.62-2.38 (m, 5H), 2.19-2.11 (m, 1H), 2.09 (s, 1H), 2.06 (s, 1H), 1.85 (s, 2H), 1.76-1.68 (m, 4H), 1.68-1.53 (m, 3H), 1.29-1.19 (m, 3H).	366.1	E	
I-2236		(400 MHz, DMSO-d6) 12.51 (s, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.09 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 3.03-2.94 (m, 4H), 1.9-1.76 (m, 3H), 1.60 (s, 8H), 1.42-1.34 (m, 3H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	495.2	A	A

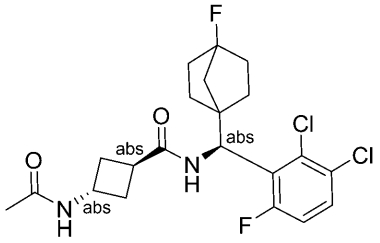
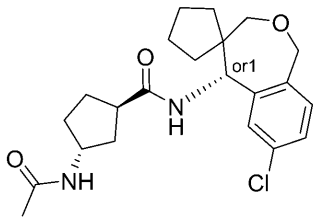
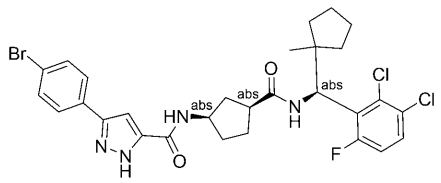
【表１－６７１】

I-2237		(400 MHz, クロロホルム-d) 7.48 - 7.29 (m, 2H), 7.03 - 6.90 (dd, J = 11.1, 8.9 Hz, 1H), 6.42 - 6.29 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 5.93 - 5.67 (m, 1H), 4.41 - 4.22 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.57- 3.43 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 2.90 - 2.72 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.30 - 2.08 (m, 2H), 2.07 - 1.79 (m, 3H), 1.68 - 1.59 (s, 5H), 1.59 - 1.49 (m, 2H), 1.48 - 1.40 (d, J = 12.1 Hz, 1H), 1.39 - 1.33 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 1.32 - 1.24 (m, 1H), 1.07 - 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	458.25	A	B
I-2238		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 8.30 (d, J = 8.3 Hz, 0.5H, 重複する), 8.28 (d, J = 8.5 Hz, 0.5H, 重複), 7.79 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.77 (app t, J = 6.5 Hz, 1H), 7.58 - 7.47 (m, 1H), 7.16 - 7.07 (m, 1H), 5.06 (dd, J = 11.6, 7.8 Hz, 0.5H), 5.01 (dd, J = 11.6, 7.7 Hz, 0.5H), 4.03 - 3.94 (m, 1H, 残留水と重複), 2.88 - 2.71 (m, 1H), 2.29 - 2.12 (m, 1H), 1.98 - 1.71 (m, 3H, 重複), 1.76 (s, 1.5H, 重複), 1.75 (s, 1.5H, 重複する), 1.70 - 1.50 (m, 5H), 1.70 - 1.50 (m, 5H), 1.49 - 1.23 (m, 9H), 1.06 (dd, J = 12.9, 6.6 Hz, 0.5H), 0.88 (d, J = 7.6 Hz, 0.5H, 重複), 0.86 (d, J = 7.6 Hz, 0.5H, 重複), 0.75 (dd, J = 12.5, 6.6 Hz, 0.5H).	439.3	A	B

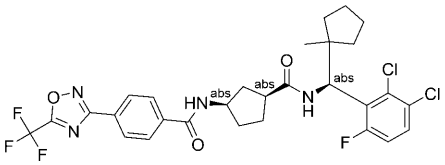
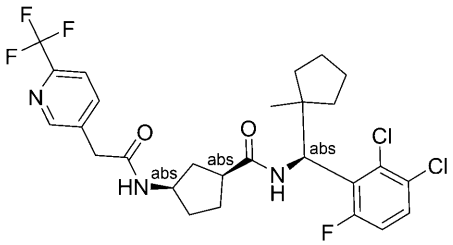
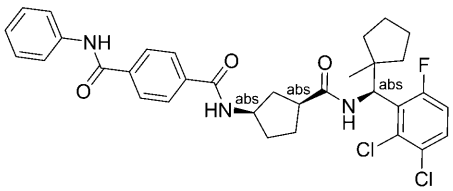
【表１－６７２】

I-2239		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.13 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.63 - 7.56 (m, 1H), 7.25 (重複する dd, J = 9.0, 4.3 Hz, 0.5H), 7.22 (重複する dd, J = 8.9, 4.3 Hz, 0.5H), 6.94 (app. t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.46 (dd, J = 7.4, 2.7 Hz, 1H), 6.28 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.25 - 5.14 (m, 1H), 5.08 (d, J = 10.4, 0.5H), 5.08 (d, J = 10.4, 0.5H), 4.56 (app. t, J = 9.9 Hz, 1H), 2.84 (d, J = 15.0, 8.9, 3.6 Hz, 0.5H), 2.78 - 2.51 (m, 1.5H), 2.44 - 2.32 (m, 1H), 1.82 (s, 1.5H), 1.80 (s, 1.5H), 1.79 - 1.56 (m, 7H), 1.53 - 1.46 (m, 1H), 1.39 - 1.30 (m, 1H), 1.07 - 1.04 (m, 3H). 2 つのジアステレオマーの 1:1 混合物。約 10%の副生成物。	449.1	E	
I-2240		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの 19:1 混合物として，10.02 (s, 1H), 8.15 (br. d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 8.9, 5.8 Hz, 1H), 6.69 (dd, J = 9.9, 9.1 Hz, 1H), 4.94 (dd, J = 10.9, 8.4 Hz, 1H), 4.07 - 3.97 (m, 1H), 2.86 - 2.76 (m, 1H), 2.61 - 2.52 (m, 1H), 1.89 - 1.72 (m, 4H), 1.76 (重複する s, 3H), 1.66 - 1.40 (m, 6H), 1.39 - 1.21 (m, 3H), 1.07 - 0.97 (m, 1H).	397.4	C	

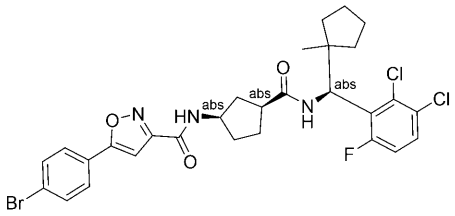
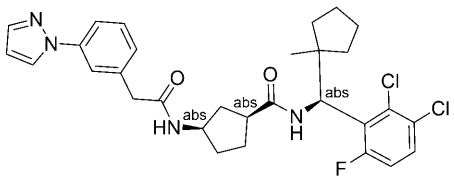
【表１－６７３】

I-2241		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d,J= 8.2 Hz, 1H), 8.06 (d,J= 7.5 Hz, 1H), 7.62 (dd,J= 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd,J= 10.5, 9.1 Hz, 1H), 5.53 (d,J= 8.1 Hz, 1H), 4.21 (app. sext,J= 7.5 Hz, 1H), 3.08 - 2.98 (m, 1H), 2.30 - 2.23 (m,1H), 2.16 - 1.96 (m, 3H), 1.92 - 1.63 (m, 6H), 1.74 (重複する s, 3H), 1.63 - 1.44 (m, 4H). 微量のギ酸塩付加物。約 9:1 のジアステレオマー比。(主要なものを記載)。残留 DMSO の存在及び未知の脂肪族不純物。	445.4	A	A
I-2242				E	
I-2243		(400 MHz, DMSO-d6) 13.65 (s, 1H), 8.32 - 7.88 (m, 2H), 7.80 - 7.58 (m, 5H), 7.33 - 7.09 (m, 2H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.27 (s, 1H), 3.11 - 3.01 (m, 1H), 1.89 (d, J = 37.4 Hz, 4H), 1.60 (s, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	637.1	B	D

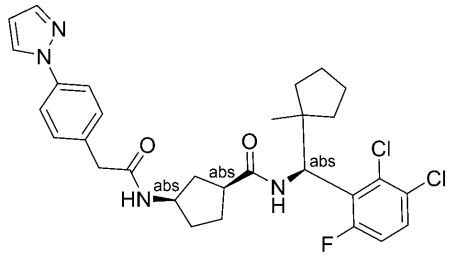
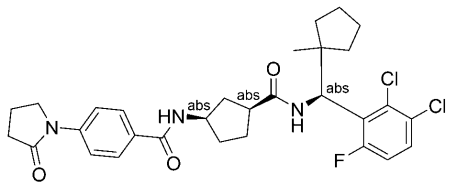
【表１－６７４】

I-2244		(400 MHz, DMSO-d6) 8.51 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.12 - 8.03 (m, 3H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.30 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.05 - 1.80 (m, 4H), 1.67 - 1.47 (m, 8H), 1.39 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 1.26 (dd, J = 14.5, 9.9 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	627.2	B	
I-2245		(400 MHz, DMSO-d6) 8.63 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 8.0, 2.1 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.57 (s, 2H), 3.00 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.97 - 1.76 (m, 3H), 1.70 - 1.52 (m, 7H), 1.49 - 1.34 (m, 3H), 1.27 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	574.1	A	B
I-2246		(400 MHz, DMSO-d6) 10.34 (s, 1H), 8.42 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.11 - 7.96 (m, 5H), 7.81 - 7.77 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.41 - 7.34 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.15 - 7.10 (m, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.29 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.04 - 1.80 (m, 4H), 1.69 - 1.48 (m, 8H), 1.39 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 1.32 - 1.23 (m, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	610.2	A	A

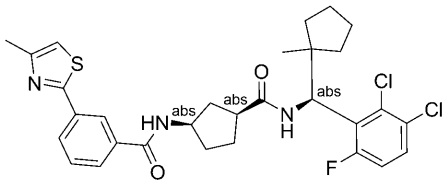
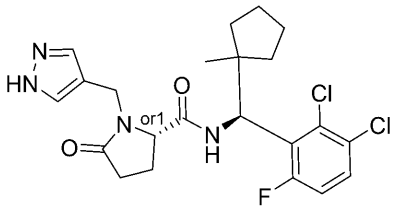
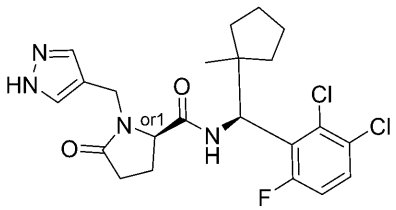
【表１－６７５】

I-2247		(400 MHz, DMSO-d6) 8.71 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.78 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.29 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.03 - 1.79 (m, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.38 (s, 1H), 1.33 - 1.21 (m, 2H), 0.98 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	638.1	B	
I-2248		(400 MHz, DMSO-d6) 8.47 - 8.44 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.11 - 8.01 (dd, J = 11.2, 7.8 Hz, 2H), 7.79 - 7.72 (m, 2H), 7.71 - 7.65 (ddd, J = 8.1, 2.3, 1.0 Hz, 1H), 7.63 - 7.57 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.45 - 7.37 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.30 - 7.22 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.20 - 7.15 (dt, J = 7.8, 1.3 Hz, 1H), 6.58 - 6.52 (dd, J = 2.5, 1.7 Hz, 1H), 5.52 - 5.42 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.07 - 3.95 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 3.53 - 3.41 (d, J = 1.5 Hz, 2H), 3.05 - 2.95 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.95 - 1.78 (m, 3H), 1.71 - 1.51 (m, 7H), 1.49 - 1.32 (m, 3H), 1.30 - 1.20 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 0.99 - 0.90 (d, J	571.25	A	A

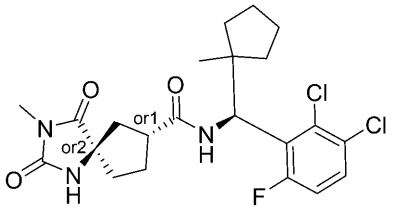
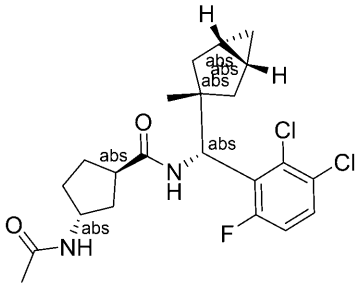
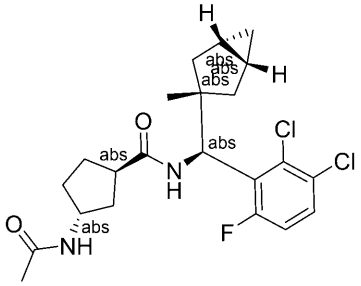
【表１－６７６】

I-2249		(400 MHz, DMSO-d6) 8.45 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.05 (dd, J = 7.8, 3.9 Hz, 2H), 7.80-7.70 (m, 3H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.39-7.31 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.53 (dd, J = 2.5, 1.8 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.42 (d, J = 1.5 Hz, 2H), 3.00 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 1.96-1.76 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.49-1.34 (m, 3H), 1.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	571.3	A	A
I-2250		(400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.91 - 7.83 (m, 2H), 7.78 - 7.70 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 3.87 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 3.05 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.55 (s, 2H), 2.14 - 1.93 (m, 2H), 1.96 - 1.70 (m, 4H), 1.64 - 1.42 (m, 8H), 1.39 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	574.25	A	A

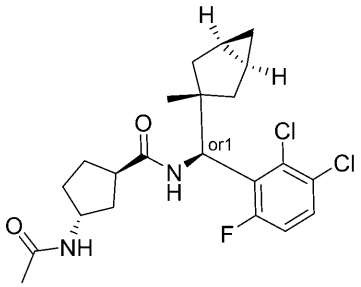
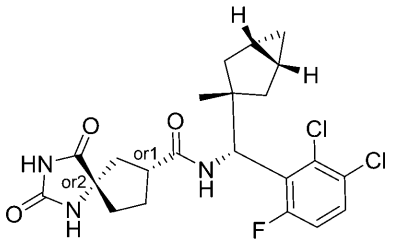
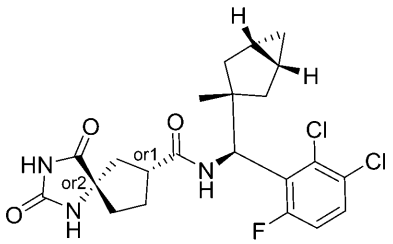
【表１－６７７】

I-2251		(400 MHz, DMSO-d6) 8.53 - 8.45 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.37 - 8.31 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 8.11 - 8.01 (m, 2H), 7.95 - 7.89 (dt, J = 8.0, 1.3 Hz, 1H), 7.66 - 7.53 (m, 2H), 7.40 - 7.36 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.31 - 7.22 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.57 - 5.45 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.38 - 4.23 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 3.15 - 2.97 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.49 - 2.40 (d, J = 1.0 Hz, 3H), 2.07 - 1.78 (m, 4H), 1.68 - 1.45 (s, 8H), 1.43 - 1.33 (s, 1H), 1.31 - 1.18 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 1.03 - 0.91 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	588.15	B	B
I-2252		(400 MHz, DMSO-d6) 12.74 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.66- 7.23 (m, 4H), 5.51 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.70 (d, J = 14.9 Hz, 1H), 4.29 (dd, J = 8.7, 3.6 Hz, 1H), 3.58 (d, J = 14.9 Hz, 1H), 2.22 - 2.03 (m, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.53 -1.37 (m, 2H), 1.27 (d, J = 19.6 Hz, 1H), 0.99 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	467.1	D	
I-2253		(400 MHz, DMSO-d6) 12.73 (s, 1H), 8.51 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 3H), 5.46 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.59 (d, J = 14.9 Hz, 1H), 4.22 (dd, J = 8.5, 3.5 Hz, 1H), 3.22 (d, J = 14.9 Hz, 1H), 2.35 - 2.07 (m, 3H), 1.76 (tt, J = 10.0, 3.1 Hz, 1H), 1.67 - 1.51 (m, 6H), 1.46 - 1.36 (m, 1H), 1.34 - 1.22 (m, 1H), 0.98 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	467.1	D	

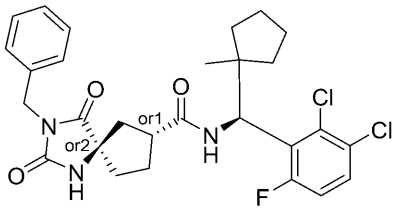
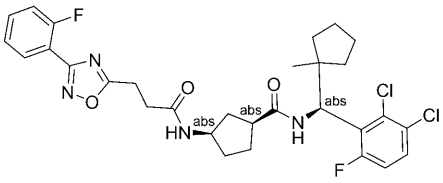
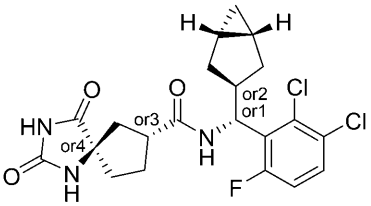
【表１－６７８】

I-2254		(400 MHz, DMSO-d6) 8.56 (s, 1H), 8.22 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.14 (dd, J = 13.1, 10.1 Hz, 1H), 1.95 (dtd, J = 23.9, 11.4, 8.2 Hz, 3H), 1.79 - 1.48 (m, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	470.1	A	A
I-2255		(400 MHz, DMSO-d6) 7.94 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.30 - 7.20 (m, 1H), 5.41 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 2.99 - 2.91 (m, 1H), 2.03 - 1.69 (m, 6H), 1.68 - 1.58 (m, 2H), 1.62 - 1.48 (m, 1H), 1.47 - 1.27 (m, 6H), 1.18 - 0.91 (m, 3H), 0.85 (td, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H), 0.09 (q, J = 3.8 Hz, 1H).	441.1	A	A
I-2256		(400 MHz, DMSO-d6) 7.94 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.74 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.96 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.95 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.96 - 1.75 (m, 2H), 1.75 (s, 3H), 1.74 - 1.45 (m, 5H), 1.35 (dt, J = 14.7, 8.6 Hz, 5H), 1.10 - 1.05 (m, 3H), 0.85 (td, J = 7.9, 4.1 Hz, 1H), 0.10 (q, J = 3.8 Hz, 1H).	441.1	B	

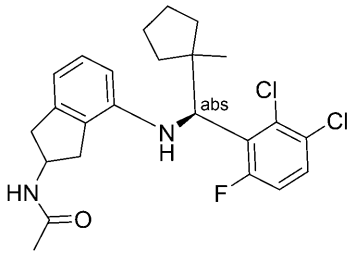
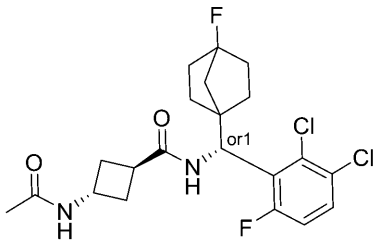
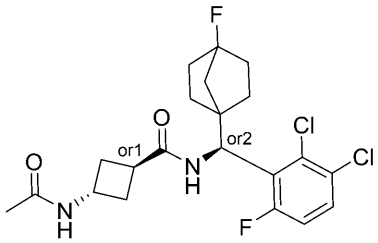
【表１－６７９】

I-2257		(400 MHz, DMSO-d6) 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.66 - 7.57 (m, 1H), 7.33 - 7.20 (m, 1H), 5.54 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.98 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 2.98 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.21 (dd, J = 13.8, 6.4 Hz, 1H), 2.00 (dd, J = 13.9, 6.3 Hz, 1H), 1.87 (qd, J = 12.1, 11.4, 4.7 Hz, 2H), 1.76 (d, J = 1.3 Hz, 3H), 1.73 - 1.59 (m, 2H), 1.59 - 1.47 (m, 1H), 1.43 - 1.35 (m, 2H), 1.23 (s, 1H), 1.14 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 1.08 - 0.96 (m, 4H), 0.72 (td, J = 8.0, 4.3 Hz, 1H), 0.19 (t, J = 4.2 Hz, 1H).	441.05	D	
I-2258		(400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.31 - 7.21 (m, 1H), 5.42 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.08 - 3.00 (m, 1H), 2.08 (dd, J = 13.0, 9.9 Hz, 1H), 2.01 - 1.83 (m, 3H), 1.65 (td, J = 12.8, 11.0, 6.7 Hz, 3H), 1.53 (dd, J = 13.1, 5.8 Hz, 2H), 1.45 - 1.29 (m, 3H), 1.10 - 1.05 (m, 3H), 1.05 - 0.93 (m, 1H), 0.85 (td, J = 8.1, 4.1 Hz, 1H), 0.09 (q, J = 3.9 Hz, 1H).	468	A	A
I-2259		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.42 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.04 (s, 1H), 2.06 - 1.94 (m, 3H), 1.84 - 1.70 (m, 2H), 1.66 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 1.54 (dd, J = 12.6, 5.8 Hz, 1H), 1.36 (dt, J = 16.4, 9.5 Hz, 4H), 1.08 (s, 3H), 0.86 (td, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H), 0.10 (d, J = 4.0 Hz, 1H).	468.1	B	

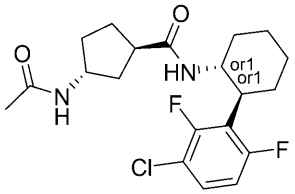
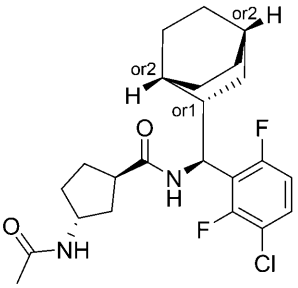
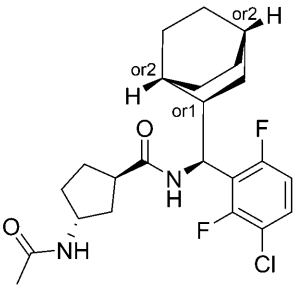
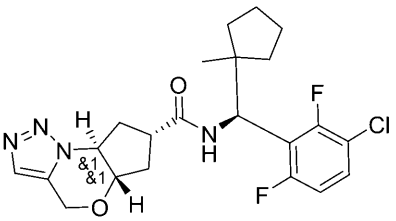
【表１－６８０】

I-2260		(400 MHz, DMSO-d6) 8.70 (s, 1H), 8.22 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.39 - 7.31 (m, 2H), 7.30 -7.16 (m, 4H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.54 (s, 2H), 3.11 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.17 (dd, J = 13.1, 10.0 Hz, 1H), 2.08 - 1.88 (m, 3H), 1.71 (dq, J = 13.3, 6.3 Hz, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.38 (s, 1H), 1.28 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	546.25	A	B
I-2261		(400 MHz, DMSO-d6) 8.07-7.93 (m, 3H), 7.71-7.57 (m, 2H), 7.49-7.37 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 3.20 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.98 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.66 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 1.94-1.74 (m, 3H), 1.64 (dd, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 1.59 (s, 7H), 1.48-1.34 (m, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	605.05	A	B
I-2262		(400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.41 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.04 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 2.90 (s, 1H), 2.25 (s, 1H), 2.17 - 2.05 (m, 2H), 2.01 - 1.82 (m, 3H), 1.62 (td, J = 10.9, 6.3 Hz, 2H), 1.50 - 1.39 (m, 2H), 1.24 (dtd, J = 23.7, 6.6, 6.0, 3.2 Hz, 3H), 0.28 (td, J = 7.9, 4.7 Hz, 1H), 0.13 (q, J = 4.1 Hz, 1H).	454.05	A	A

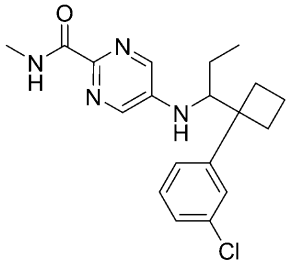
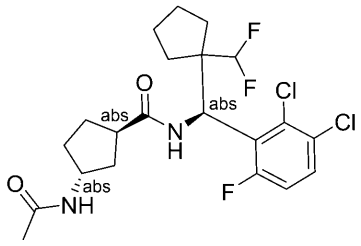
【表１－６８１】

I-2263		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.19 - 8.13 (m, 1H), 7.60 (重複する dd, J = 8.8, 5.2 Hz, 0.5H), 7.59 (重複する dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 0.5H), 7.23 (dd, J = 11.4, 9.0 Hz, 0.5H), 6.90 (重複する t, J = 7.8 Hz, 0.5H), 6.90 (重複する t, J = 7.8 Hz, 0.5H), 6.47 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.25 (重複する d, J = 8.0 Hz, 0.5H), 6.24 (重複する d, J = 8.0 Hz, 0.5H), 5.06 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 4.54 - 4.40 (m, 2H), 3.16 - 2.96 (m, 1H), 3.03 (重複する m, 1H), 2.72 - 2.62 (m, 1H), 2.59 (重複する dd, J = 15.8, 5.4 Hz, 0.5H), 2.46 (埋没した m, 0.5H), 1.80 (s, 1.5H), 1.79 (s, 1.5H), 1.78 - 1.70 (m, 1H), 1.70 - 1.60 (m, 5H), 1.54 - 1.43 (m, 1H), 1.39 - 1.29 (m, J = 9.5 Hz, 1H), 1.08 - 1.00 (m, 3H). 2 つのジアステレオマーの約 1:1 混合物。約 7%の副生成物。	449.1	E	
I-2264				B	
I-2265				E	

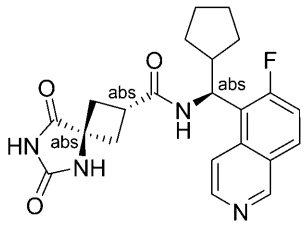
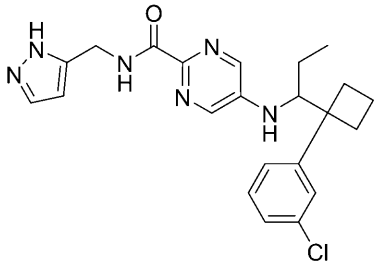
【表１－６８２】

I-2266				A	A
I-2267				C	
I-2268				D	
I-2269		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの約 1.4:1 混合物として, 8.41 - 8.35 (m, 2H), 7.62 - 7.53 (m, 4H), 7.22 - 7.12 (m, 2H), 5.25 - 5.20 (m, 2H), 5.20 (重複する d, J = 5.0 Hz, 1H), 5.16 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 4.96 - 4.93 (m, 2H), 4.92 - 4.90 (m, 1H), 4.02 - 3.91 (m, 1H), 3.85 - 3.76 (m, 2H), 3.31 - 3.23 (m, 2H), 2.46 (重複する ddd, J = 12.4, 7.2, 2.0 Hz, 1H), 2.36 - 2.18 (m, 3H), 2.08 - 1.92 (m, 2H), 1.80 (td, J = 11.6, 8.0 Hz, 1H), 1.69 - 1.46 (m, 13H), 1.44 - 1.35 (m, 2H), 1.27 - 1.18 (m, 2H), 1.00 - 0.95 (m, 6H).	451.4	A	B

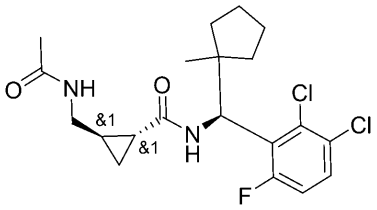
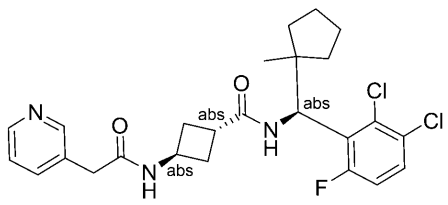
【表１－６８３】

I-2270		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (q,J= 4.6 Hz, 1H), 8.29 (s, 2H), 7.33 (d,J= 7.7 Hz, 1H), 7.27-7.23 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 1H), 6.21 (d,J= 10.0 Hz, 1H), 3.78 (td,J= 10.5, 1.8 Hz, 1H), 2.76 (d,J= 4.8 Hz, 3H), 2.36 - 2.28 (m, 2H), 2.28 - 2.15 (m, 2H), 2.09 - 1.96 (m, 1H), 1.79 - 1.67 (m, 1H), 1.64 - 1.52 (m, 1H), 1.04 - 0.93 (m, 1H), 0.77 (t,J= 7.2 Hz, 3H). 約20%の混合不純物。1.2ppm及び1.27ppmに未知の不純物	359.4	E	
I-2271		NMR (400 MHz, d-DMSO) 8.27 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.9, 9.0 Hz, 1H), 6.33 (t, J = 56.1 Hz, 1H, CH-F カップリング), 5.64 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.10 - 3.89 (m, 1H), 2.89 (app p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.89 - 1.71 (m, 5H, 重複), 1.76 (s, 3H, 重複), 1.70 - 1.58 (m, 3H), 1.57 - 1.28 (m, 6H).	465.3	A	B

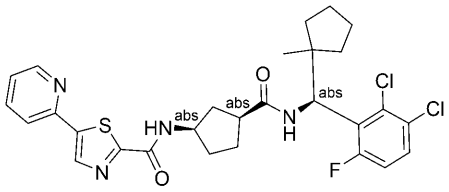
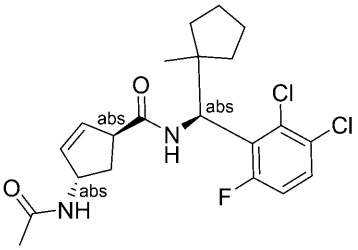
【表１－６８４】

I-2272		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.34 (br. s, 1H), 9.29 (s, 1H), 8.61 - 8.57 (m, 2H), 8.51 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 8.12 (dd, J = 9.0, 5.3 Hz, 1H), 7.54 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.28 (dd, J = 10.6, 7.5 Hz, 1H), 3.13 (app. p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.71 - 2.60 (m, 2H), 2.49 (埋没した m, 1H), 2.25 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 2.02 (m, 1H), 2.02 - 1.94 (m, 1H), 1.73 - 1.62 (m, 1H), 1.61 - 1.48 (m, 2H), 1.46 - 1.34 (m, 2H), 1.18 - 1.08 (m, 1H), 1.02 - 0.90 (m, 1H). 2つのジアステレオマーの＞17:1 混合物。	411.2	E	
I-2273		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.69-8.47 (m, 2H), 8.32 (s, 2H), 7.62 (br s, 1H), 7.37 - 7.32 (m, 1H), 7.27 - 7.23 (m, 2H), 7.21-7.18 (m, 1H), 6.27 (d,J= 10.0 Hz, 1H), 6.14 (s, 1H), 4.44 (d,J= 5.7 Hz, 2H), 3.79 (td,J= 10.7, 1.6 Hz, 1H), 2.37 - 2.28 (m, 2H), 2.26 - 2.16 (m, 2H), 2.08 - 1.97 (m, 1H), 1.79 - 1.66 (m, 1H), 1.62 - 1.51 (m, 1H), 1.03 - 0.91 (m, 1H), 0.77 (t,J= 7.2 Hz, 3H). 約 10%の混合不純物。1.2ppm 及び 1.27ppm に未知の不純物	425.4	E	

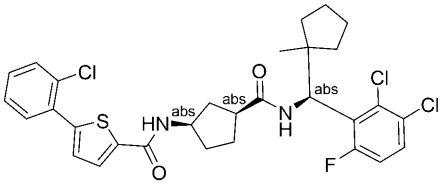
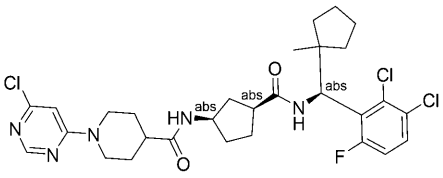
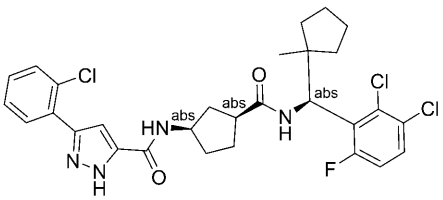
【表１－６８５】

I-2274		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.31 (部分的に重複する d,J= 9.3 Hz, 0.5H), 8.28 (部分的に重複する d,J= 9.2 Hz, 0.5H), 7.93 (t,J= 5.5 Hz, 0.5H), 7.89 (t,J= 5.5 Hz, 0.5H), 7.62 (部分的に重複する t,J= 4.6 Hz, 0.5H), 7.60 (部分的に重複する t,J= 4.6 Hz, 0.5H), 7.31 - 7.22 (m, 1H), 5.56 (d,J= 8.9 Hz, 0.5H), 5.51 (d,J= 8.7 Hz, 0.5H), 3.11 - 2.98 (m, 1H), 2.92 - 2.80 (m, 1H), 1.81 (重複する m, 1H), 1.80 (重複する s, 1.5H), 1.76 (重複する s, 1.5H),1.64 - 1.55 (m, 6H), 1.44 - 1.32 (m, 1H), 1.31 - 1.12 (m, 2H), 1.00 - 0.94 (m, 3H), 0.84 - 0.77 (m, 0.5H), 0.74 - 0.67 (m, 0.5H), 0.66 - 0.60 (m, 0.5H), 0.60 - 0.54 (m, 0.5H). 約 1:1 のジアステレオマー比。残留 DMSO。	415.4	B	
I-2275		(400 MHz, DMSO-d6) 8.46 - 8.35 (m, 3H), 8.04 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.67 - 7.57 (m, 2H), 7.32 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.23 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.41 (s, 2H), 3.10 (s, 1H), 2.31 (s, 1H), 2.08 (dt, J = 28.9, 9.2 Hz, 3H), 1.59 (s, 6H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (s, 1H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	492.2	A	A

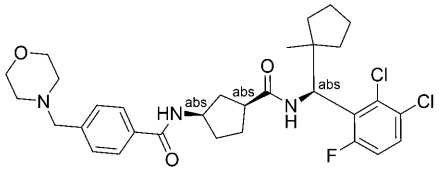
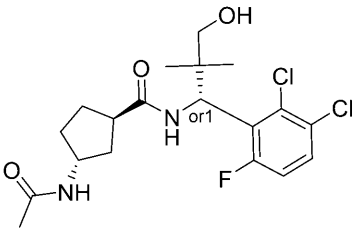
【表１－６８６】

I-2276		(400 MHz, DMSO-d6) 8.67 (dt, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 8.25 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.04 (td, J = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.56 (ddd, J = 7.5, 4.8, 1.2 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.32 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.94 (dddd, J = 34.6, 16.1, 12.8, 7.6 Hz, 3H), 1.73-1.57 (m, 1H), 1.61 (s, 6H), 1.56-1.45 (m, 1H), 1.26 (d, J = 14.6 Hz, 2H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	575.2	A	A
I-2277		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 - 8.17 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.89 - 7.76 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.66 - 7.55 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.35 - 7.22 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.85 - 5.74 (dt, J = 5.5, 2.0 Hz, 1H), 5.72 - 5.62 (m, 1H), 5.59 - 5.49 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.78 - 4.65 (m, 1H), 3.64 - 3.51 (m, 1H), 2.41 - 2.20 (dt, J = 12.8, 8.1 Hz, 1H), 1.83 - 1.71 (s, 3H), 1.69 - 1.47 (m, 7H), 1.45 - 1.36 (s, 1H), 1.34 - 1.21 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.17 - 0.78 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	427.05	A	A

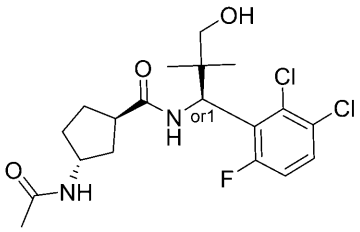
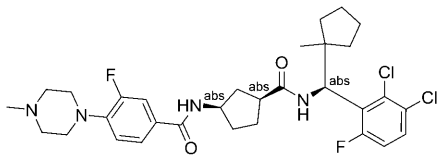
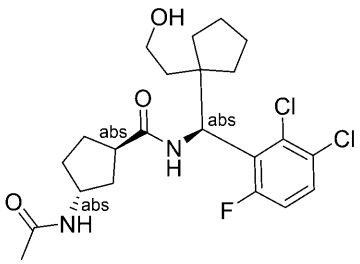
【表１－６８７】

I-2278		(400 MHz, DMSO-d6) 8.36 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 7.72-7.63 (m, 1H), 7.66-7.56 (m, 2H), 7.49-7.38 (m, 3H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.24 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.95 (ddd, J = 25.4, 11.7, 6.7 Hz, 2H), 1.90-1.76 (m, 2H), 1.65-1.53 (m, 7H), 1.50 (dt, J = 20.4, 7.2 Hz, 1H), 1.39 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	607.15	B	
I-2279		(400 MHz, メタノール-d4) 8.28 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 10.9, 8.9 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 5.72 (t, J = 4.6 Hz, 1H), 4.52 (s, 2H), 4.21 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 3.03 (q, J = 11.4, 8.6 Hz, 3H), 2.52 (tt, J = 11.4, 3.8 Hz, 1H), 2.17- 1.92 (m, 3H), 1.84 (d, J = 13.6 Hz, 2H), 1.80 - 1.58 (m, 10H), 1.51 (dq, J = 14.4, 8.1, 7.7 Hz, 2H), 1.33 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 1.06 (d, J = 3.0 Hz, 3H).	610.1	A	B
I-2280		(400 MHz, DMSO-d6)13.78-13.57 (s, 1H), 8.37 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.10 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 7.89 (dd, J = 41.8, 7.6 Hz, 1H), 7.71-7.51 (m, 2H),7.40-7.35 (m, 1H), 7.27 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 2H), 6.97 (s, 1H), 5.51 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.28 (s, 1H), 3.10-3.02 (m, 1H), 1.94-1.82 (m,4H), 1.60 (s, 7H), 1.52 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 14.2 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	591.2	A	B

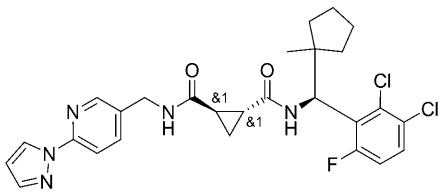
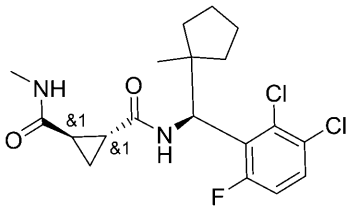
【表１－６８８】

I-2281		(400 MHz, DMSO-d6) 10.05 (s, 1H), 8.34 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.41 (s, 2H), 4.28 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.96 (s, 2H), 3.64 (d, J = 12.4 Hz, 2H), 3.24 (s, 1H), 3.07 (q, J = 8.0 Hz, 3H), 2.00 (dt, J = 13.8, 7.2 Hz, 1H), 1.91 (s, 2H), 1.84-1.73 (m, 1H), 1.60 (s, 8H), 1.39 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	590.15	A	B
I-2282		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.80 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.39 (dd, J = 10.5, 5.3 Hz, 1H), 3.30 (s, 2H), 3.16 (dd, J = 10.5, 5.0 Hz, 1H), 2.90 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.93-1.77 (m, 1H), 1.77 (s, 3H), 1.60 (ddd, J = 13.6, 8.8, 5.4 Hz, 2H), 1.47-1.30 (m, 1H), 0.92 (s, 3H), 0.86 (d, J = 3.0 Hz, 3H).	419.1	B	

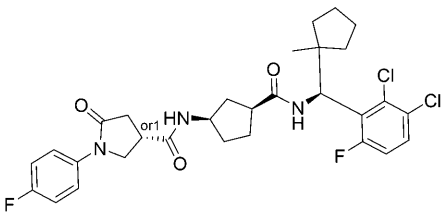
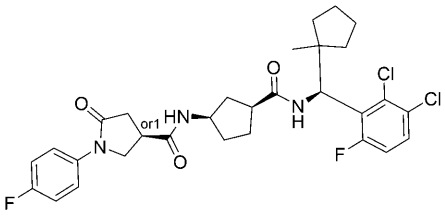
【表１－６８９】

I-2283		(400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.65-7.57 (m, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.79 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 3.97 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.39 (dd, J = 10.7, 5.2 Hz, 1H), 3.16 (dd, J = 10.5, 4.9 Hz, 1H), 2.90 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.93-1.74 (m, 1H), 1.76 (s, 2H), 1.73-1.48 (m, 2H), 1.36 (dd, J = 20.1, 6.5 Hz, 3H), 1.36 (s, 1H), 0.94-0.84 (m, 6H).	419.05	E	
I-2284		(400 MHz, DMSO-d6) 8.13 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.67-7.58 (m, 3H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 7.06 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.23 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 3.10 (s, 4H), 3.03 (q, J = 7.7 Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.01-1.72 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.58-1.41 (m, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	607.3	A	A
I-2285		(400 MHz, DMSO-d6) 8.15 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.40 (t, J = 4.7 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.43 (s, 2H), 2.99 - 2.91 (m, 1H), 1.94 -1.72 (m, 7H), 1.62 (dt, J = 14.0, 8.2 Hz, 3H), 1.56 - 1.30 (m, 8H), 1.15 (t, J = 10.6 Hz, 1H).	459.15	B	B

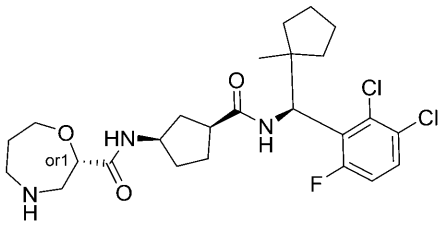
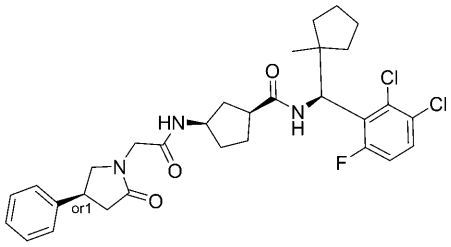
【表１－６９０】

I-2286		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 8.84 (app t, J = 5.8 Hz, 1H), 8.72 (app t, J = 5.7 Hz, 0.8H), 8.67 - 8.55 (m, 3.6H), 8.36 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 1.1 Hz, 0.8H), 7.89 (app t, J = 7.7 Hz, 1.8H), 7.87 - 7.79 (m, 3.6H), 7.64 - 7.58 (m, 1.8H), 7.31 - 7.23 (m, 1.8H), 6.58 - 6.55 (m, 1.8H), 5.53 (d, J = 8.7 Hz, 0.8H), 5.50 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.47 - 4.22 (m, 3.6H), 2.46 - 2.36 (m, 1.8H), 2.04 - 1.95 (m, 1H), 1.93 - 1.85 (m, 0.8H), 1.65 - 1.55 (m, 10.8H), 1.48 - 1.20 (m, 4.4H), 1.10 - 1.04 (m, 2.8H), 1.00 - 0.89 (m, 6.2H). 2つのトランスジアステレオマーの混合物(約5:4)。	544.4	D	
I-2287		NMR (400 MHz, d6-DMSO) 8.58 (app t, J = 8.7 Hz, 1H), 8.15 (app q, J = 4.4 Hz, 0.6 H), 8.03 (app q, J = 4.4 Hz, 0.4 H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.1 Hz, 0.6H), 7.26 (dd, J = 10.6, 9.1 Hz, 0.4H), 5.51 (app t, J = 8.3 Hz, 1H), 2.59 (d, J = 4.6 Hz, 1.6H), 2.55 (d, J = 4.6 Hz, 1.4H), 2.33 (app td, J = 8.7, 5.0 Hz, 1H), 1.92 - 1.86 (m, 0.6H), 1.82 - 1.75 (m, 0.4H), 1.67 - 1.51 (m, 6H, 重複), 1.36 (br. s, 1H), 1.29 - 1.22 (m, 1H), 1.06 - 0.94 (m, 1.4H, 重複), 0.96 (s, 3H, 重複), 0.91 - 0.85 (m, 0.6H).	401.3	D	

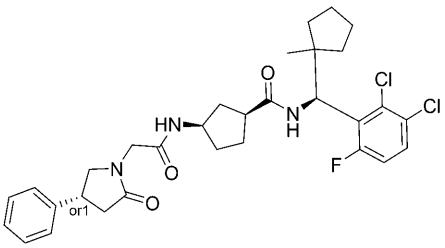
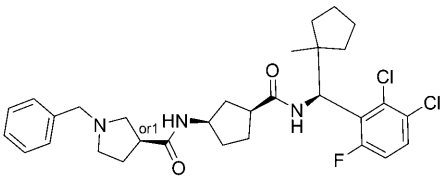
【表１－６９１】

I-2288		(400 MHz, DMSO-d6) 8.21 - 8.02 (dd, J = 7.7, 4.0 Hz, 2H), 7.74 - 7.57 (m, 3H), 7.32 - 7.14 (m, 3H), 5.54 - 5.39 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.14 - 4.01 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 4.00 - 3.91 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.87 - 3.75 (dd, J = 9.6, 6.1 Hz, 1H), 3.24 - 3.11 (h, J = 7.1, 6.3 Hz, 1H), 3.07 - 2.93 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.76 - 2.59 (m, 2H), 2.00 - 1.74 (ddt, J = 41.0, 15.3, 7.4 Hz, 3H), 1.72 - 1.51 (m, 7H), 1.49 - 1.34 (dt, J = 22.9, 7.5 Hz, 3H), 1.31 - 1.20 (s, 1H), 1.10 - 0.91 (m, 3H).	592.2	A	A
I-2289		(400 MHz, DMSO-d6) 8.21 - 7.95 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 7.78 - 7.48 (m, 3H), 7.41 - 7.05 (m, 3H), 5.54 - 5.27 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.13 - 4.02 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 3.99 - 3.92 (dd, J = 9.6, 8.6 Hz, 1H), 3.90 - 3.76 (dd, J = 9.6, 6.1 Hz, 1H), 3.28 - 3.10 (tt, J = 8.7, 7.0 Hz, 1H), 3.07 - 2.93 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 2.80 - 2.55 (m, 2H), 2.02 - 1.77 (m, 3H), 1.74 - 1.52 (m, 7H), 1.49 - 1.32 (ddd, J = 17.7, 12.9, 7.2 Hz, 3H), 1.29 - 1.17 (d, J = 34.6 Hz, 1H), 1.09 - 0.85 (m, 3H).	592.15	A	B

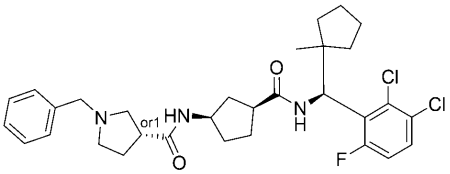
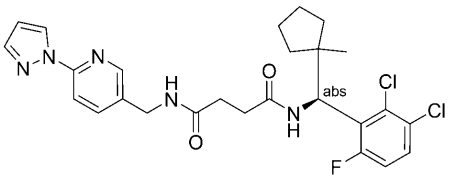
【表１－６９２】

I-2290		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.07 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 4.04-3.86 (m, 2H), 3.70 (ddd, J = 12.1, 7.7, 4.3 Hz, 1H), 3.20 (dd, J = 14.0, 3.5 Hz, 1H), 3.01 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 2.89 (ddd, J = 13.2, 6.4, 4.8 Hz, 1H), 2.78-2.67 (m, 2H), 1.87 (dt, J = 13.5, 7.2 Hz, 2H), 1.75 (s, 2H), 1.85-1.62 (m, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.43 (td, J = 13.5, 8.5 Hz, 2H), 1.31-1.19 (m, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	514.2	A	B
I-2291		(400 MHz, DMSO-d6) 8.21 - 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.00 - 7.86 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.66 - 7.52 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.44 - 6.87 (m, 6H), 5.58 - 5.23 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.15 - 3.99 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.97 - 3.68 (m, 3H), 3.65 - 3.53 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 3.42 - 3.41 (s, 1H), 3.08 - 2.89 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.77 - 2.64 (dd, J = 16.6, 9.1 Hz, 1H), 2.49 - 2.44 (s, 1H), 2.42 - 2.28 (dd, J = 16.6, 8.4 Hz, 1H), 1.98 - 1.71 (ddt, J = 29.1, 13.2, 7.3 Hz, 3H), 1.70 - 1.52 (m, 6H), 1.50 - 1.33 (m, 3H), 1.32 - 1.21 (s, 1H), 1.08 - 0.88 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	588.2	A	B

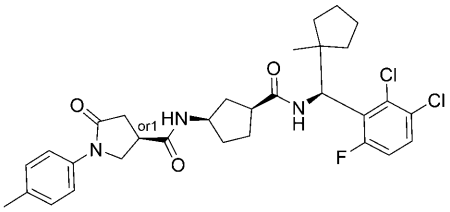
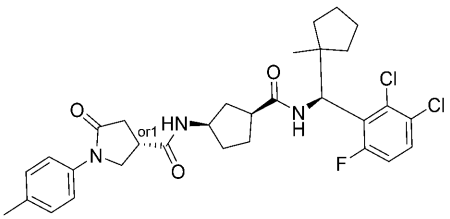
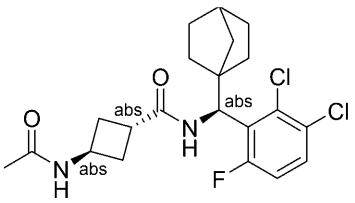
【表１－６９３】

I-2292		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 - 8.02 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.99 - 7.89 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.66 - 7.56 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.41 - 7.01 (m, 6H), 5.55 - 5.26 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.17 - 3.96 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.93 - 3.82 (d, J = 2.8 Hz, 2H), 3.81 - 3.72 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 3.66 - 3.54 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 3.47 - 3.37 (dd, J = 9.1, 7.1 Hz, 1H), 3.07 - 2.94 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.78 - 2.64 (dd, J = 16.6, 9.0 Hz, 1H), 2.44 - 2.31 (dd, J = 16.5, 8.4 Hz, 1H), 1.96 - 1.74 (m, 3H), 1.70 - 1.52 (m, 7H), 1.50 - 1.33 (m, 3H), 1.32 - 1.14 (dt, J = 39.4, 7.3 Hz, 1H), 1.04 - 0.91 (d, J = 2.8 Hz,	588.2	A	B
I-2293		(400 MHz, DMSO-d6) 8.16 - 7.98 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.78 - 7.64 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.64 - 7.54 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.37 - 7.11 (m, 6H), 5.55 - 5.28 (m, 1H), 4.06 - 3.93 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.65 - 3.48 (m, 2H), 3.05 - 2.90 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 2.86 - 2.70 (m, 2H), 2.69 - 2.58 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 2.44 - 2.26 (p, J = 7.4, 6.9 Hz, 2H), 2.07 - 1.72 (m, 5H), 1.70 - 1.50 (m, 6H), 1.49 - 1.25 (m, 5H), 1.02 - 0.78 (m, 3H).	574.25	A	C

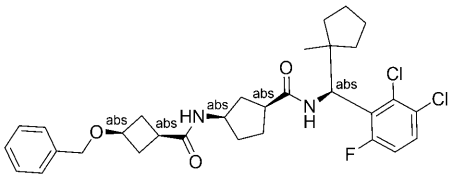
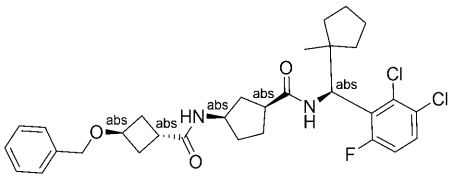
【表１－６９４】

I-2294		(400 MHz, DMSO-d6) 8.18 - 7.97 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.77 - 7.67 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.64 - 7.54 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.39 - 7.27 (m, 4H), 7.27 - 7.16 (m, 2H), 5.55 - 5.28 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.07 - 3.90 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.68 - 3.46 (m, 2H), 3.04 - 2.90 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.86 - 2.72 (dq, J = 10.3, 7.9, 7.3 Hz, 2H), 2.70 - 2.58 (dt, J = 8.2, 3.8 Hz, 1H), 2.44 - 2.23 (m, 2H), 2.01 - 1.71 (m, 5H), 1.69 - 1.50 (d, J = 7.0 Hz, 7H), 1.48 - 1.19 (m, 4H), 1.06 - 0.74 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	574.25	A	
I-2295		(400 MHz, DMSO-d6) 8.60 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 8.43 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.90 - 7.80 (m, 3H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 6.57 (dd, J = 2.6, 1.7 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.37 - 4.22 (m, 2H), 2.61 - 2.51 (m, 1H), 2.36 (tq, J = 15.0, 8.5, 7.6 Hz, 3H), 1.58 (s, 6 H), 1.35 (s, 1H), 1.24 (s, 1H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	532.15	D	D

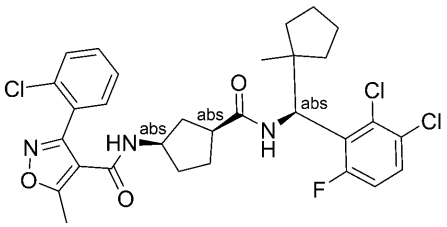
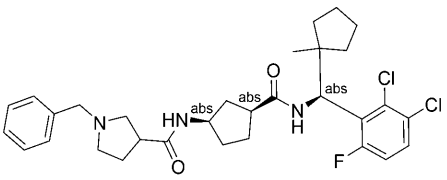
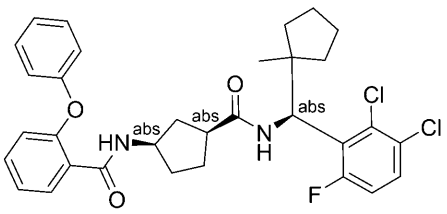
【表１－６９５】

I-2296		(400 MHz, DMSO-d6)8.06 (dd, J = 7.7, 3.1 Hz, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.56-7.49 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.05 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.94 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.82 (dd, J = 9.7, 6.2 Hz, 1H), 3.18 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.99 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 2.68 (dd, J = 16.9, 9.3 Hz, 1H), 2.63 (s, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.99-1.79 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.49-1.35 (m, 3H), 1.29-1.15 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	588.3	A	B
I-2297		(400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.60 (dt, J = 10.8, 5.7 Hz, 1H), 7.59-7.49 (m, 2H), 7.26 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.05 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 3.94 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.84-3.72 (m, 1H), 3.22-3.14 (m, 1H), 3.04-2.96 (m, 1H), 2.74-2.57 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.93 (dd, J = 13.2, 6.9 Hz, 1H), 1.91-1.78 (m, 2H), 1.66-1.60 (s, 7H), 1.51-1.39 (s, 3H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	588.3	A	A
I-2298		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.68 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.22 (h, J = 7.9 Hz, 1H), 3.10-3.01 (m, 1H), 2.26 (tt, J = 7.7, 3.9 Hz, 1H), 2.14 (s, 2H), 2.02 (dt, J = 19.3, 10.3 Hz, 2H), 1.75 (s, 3H), 1.54 (s, 2H), 1.50 (s, 1H), 1.35-1.17 (m, 4H).	427.05	A	A

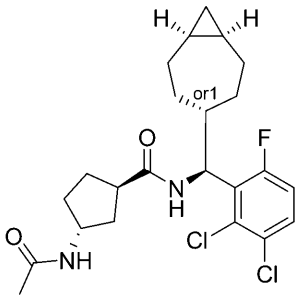
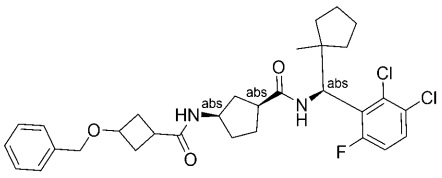
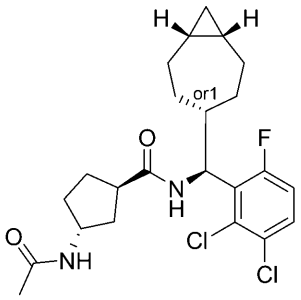
【表１－６９６】

I-2299		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.39 - 7.30 (m, 3H), 7.33 - 7.21 (m, 2H), 7.25 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.18 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 4.01 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 2.96 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.86 (tt, J = 9.3, 3.9 Hz, 1H), 2.34 - 2.21 (m, 2H), 2.07 (qd, J = 10.6, 8.6, 5.4 Hz, 2H), 1.92 - 1.73 (m, 3H), 1.59 (d, J = 6.8 Hz, 7H), 1.47 - 1.30 (m, 3H), 1.29 - 1.23 (m, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	575.25	B	B
I-2300		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.39 - 7.20 (m, 6H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.00 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.89 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 2.96 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.43 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.26 (dt, J = 10.9, 6.7 Hz, 2H), 1.98 (p, J = 10.0 Hz, 2H), 1.92 - 1.75 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.39 (ddt, J = 17.9, 11.8, 6.8 Hz, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	575.3	A	B

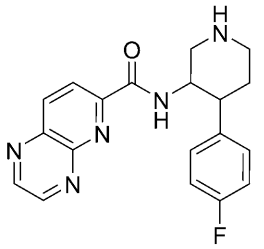
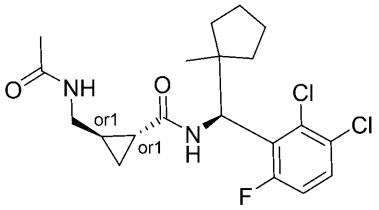
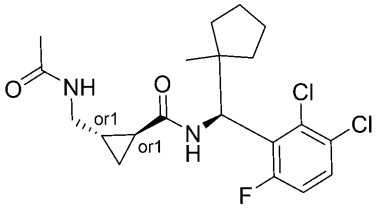
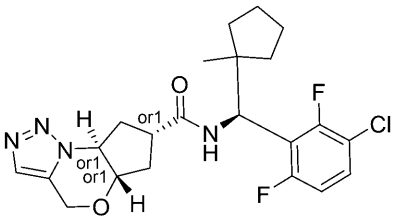
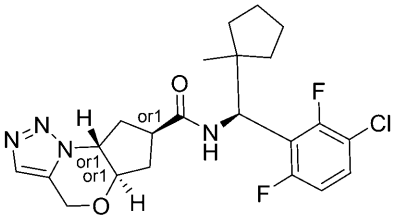
【表１－６９７】

I-2301		(400 MHz, DMSO-d6) 8.14 - 7.94 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.89 - 7.82 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.66 - 7.40 (m, 5H), 7.29 - 7.20 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.52 - 5.43 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.16 - 3.99 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 3.02 - 2.87 (dt, J = 15.3, 7.7 Hz, 1H), 2.61 - 2.56 (s, 3H), 2.00 - 1.88 (dt, J = 13.4, 7.0 Hz, 1H), 1.87 - 1.69 (m, 2H), 1.69 - 1.49 (s, 7H), 1.47 - 1.32 (m, 3H), 1.31 - 1.20 (s, 1H), 1.02 - 0.92 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	606.1	D	
I-2302		(400 MHz, DMSO-d6) 8.17 - 7.99 (dd, J = 8.5, 4.4 Hz, 1H), 7.76 - 7.54 (m, 2H), 7.41 - 7.08 (m, 6H), 5.53 - 5.41 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.07 - 3.90 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.62 - 3.48 (m, 2H), 3.02 - 2.89 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.85 - 2.72 (m, 2H), 2.69 - 2.57 (m, 1H), 2.43 - 2.25 (m, 2H), 1.98 - 1.70 (m, 5H), 1.68 - 1.52 (s, 7H), 1.48 - 1.20 (m, 4H), 1.01 - 0.91 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	574.15	A	B
I-2303		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.65-7.57 (m, 2H), 7.46 (ddd, J = 8.5, 7.4, 1.8 Hz, 1H), 7.42-7.32 (m, 2H), 7.31-7.20 (m, 2H), 7.12 (ddt, J = 8.4, 7.2, 1.1 Hz, 1H), 6.98 (ddd, J = 8.1, 7.2, 1.2 Hz, 3H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.14 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.00-2.91 (m, 1H), 1.93-1.77 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.40 (td, J = 13.3, 11.8, 7.3 Hz, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	583.3	D	

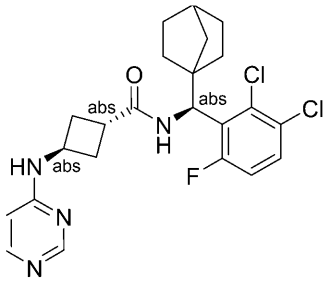
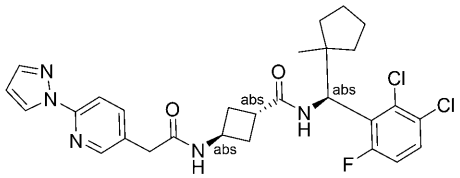
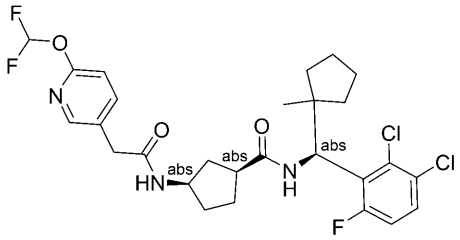
【表１－６９８】

I-2304		(400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.2, 8.9 Hz, 1H), 5.08 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.99 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.84 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.18 - 2.07 (m, 3H), 1.91 - 1.75 (m, 4H), 1.76 (s, 3H), 1.60 (ddd, J = 13.4, 8.7, 5.5 Hz, 1H), 1.49 - 1.29 (m, 2H), 1.22 - 1.01 (m, 4H), 0.92 - 0.75 (m, 4H), 0.61 (s, 1H).	455.2	D	
I-2305		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.39 - 7.20 (m, 6H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 4.00 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.95 - 3.83 (m, 1H), 2.96 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.44 (tt, J = 9.5, 7.4 Hz, 1H), 2.26 (dt, J = 10.9, 6.9 Hz, 2H), 2.10 - 1.86 (m, 2H), 1.81 (s, 2H), 1.89 - 1.73 (m, 1H), 1.59 (d, J = 6.4 Hz, 7H), 1.47 - 1.32 (m, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	575.3	A	B
I-2306		(400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.74 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 5.07 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.96 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.93 (s, 1H), 2.83 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.14 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 2.12 - 1.97 (m, 2H), 1.85 (s, 2H), 1.75 (s, 3H), 1.64 - 1.51 (td, J = 12.9, 5.6 Hz, 3H), 1.36 (dd, J = 13.4, 6.4 Hz, 1H), 1.17 (t, J = 7.3 Hz, 4H), 0.82 (s, 2H), 0.77 (s, 2H), 0.61 (s, 1H).	455.2	D	

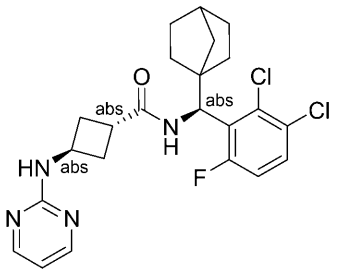
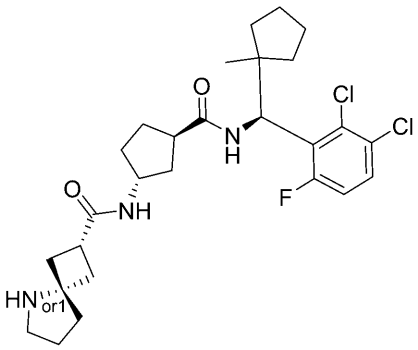
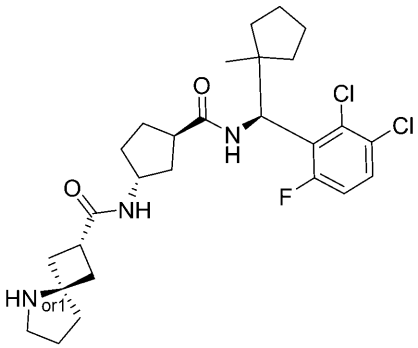
【表１－６９９】

I-2307				E	
I-2308				C	
I-2309				B	
I-2310				A	
I-2311				B	

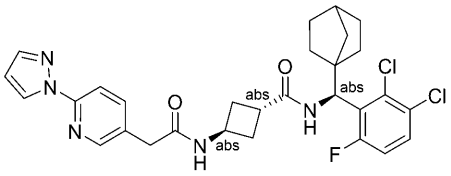
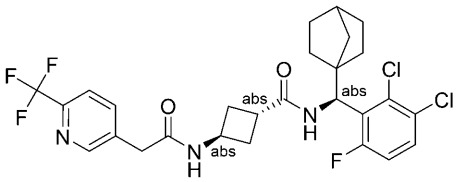
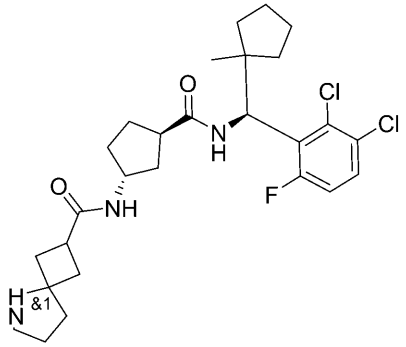
【表１－７００】

I-2312		(400 MHz, DMSO-d6) 8.35 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 9.1, 5.4 Hz, 2H), 7.25 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 6.36 (s, 1H), 5.70 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.46 (s, 1H), 3.13 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 2.46 - 2.36 (m, 1H), 2.23 (s, 1H), 2.18 - 2.03 (m, 3H), 1.52 (d, J = 18.2 Hz, 3H), 1.44 - 1.29 (m, 3H), 1.29 - 1.17 (m, 4H).	463.1	A	A
I-2313		(400 MHz, DMSO-d6) 8.59 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.40 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.91 - 7.79 (m, 3H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 6.57 (dd, J = 2.6, 1.7 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.25 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.46 (s, 2H), 3.10 (s, 1H), 2.37 - 2.20 (m, 1H), 2.09 (dt, J = 28.7, 8.9 Hz, 3H), 1.59 (s, 6H), 1.31 (d, J = 41.9 Hz, 2H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	558.2	A	A
I-2314		(400 MHz, DMSO-d6) 8.13 - 8.03 (m, 3H), 7.89 - 7.48 (m, 3H), 7.31 - 7.21 (m, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.01 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 3.42 (s, 2H), 3.00 (s, 1H), 1.95 - 1.77 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.38 (s, 3H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (s, 3H).	572.2	A	B

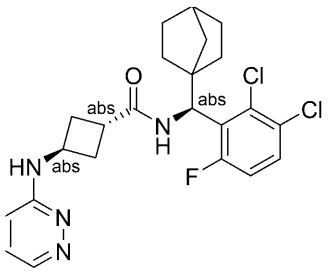
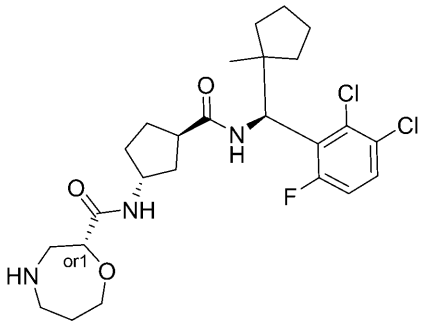
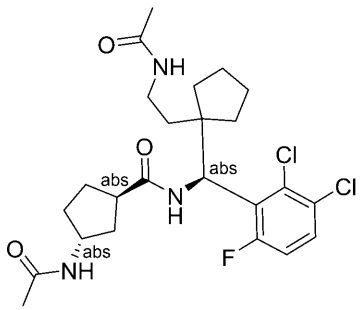
【表１－７０１】

I-2315		(400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 4.7 Hz, 2H), 8.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 6.53 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.44 (h, J = 7.9 Hz, 1H), 3.08 (td, J = 9.1, 4.5 Hz, 1H), 2.39 - 2.31 (m, 1H), 2.22 - 2.07 (m, 4H), 1.63 - 1.45 (m, 3H), 1.34 (dd, J = 15.8, 9.1 Hz, 3H), 1.23 (dd, J = 17.6, 8.1 Hz, 4H).	463.1	A	A
I-2316		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.69-7.57 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 2.96 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.77 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 2.59 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.13-2.02 (m, 2H), 1.98 (ddd, J = 10.9, 7.6, 3.8 Hz, 2H), 1.85 (dq, J = 14.6, 7.2 Hz, 1H), 1.82-1.73 (m, 1H), 1.67 (td, J = 6.2, 5.7, 3.0 Hz, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.57 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 1.37 (s, 4H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	524.35	A	B
I-2317		(400 MHz, DMSO-d6) 8.03 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.65-7.56 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.01 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 2.91 (dq, J = 32.5, 7.9 Hz, 2H), 2.76 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 2.16-2.05 (m, 1H), 2.00 (s, 1H), 1.92-1.75 (m, 3H), 1.60 (s, 12H), 1.38 (s, 4H), 1.26 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	524.25	A	

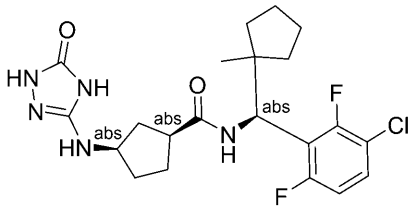
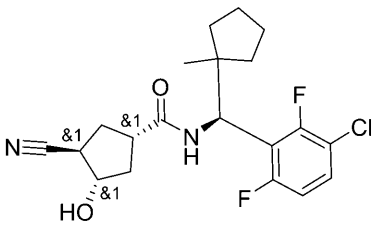
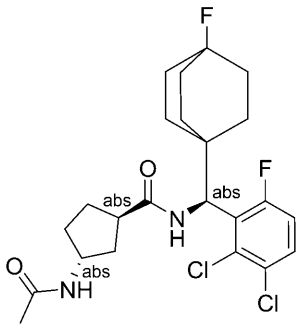
【表１－７０２】

I-2318		(400 MHz, DMSO-d6) 8.62-8.56 (m, 1H), 8.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.33-8.27 (m, 1H), 8.07 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.91-7.78 (m, 3H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.28-7.15 (m, 1H), 6.57 (dd, J = 2.6, 1.7 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.25 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 3.46 (s, 2H), 3.08 (dd, J = 10.2, 6.4 Hz, 1H), 2.30 (td, J = 8.0, 4.2 Hz, 1H), 2.19-2.00 (m, 4H), 1.54 (s, 2H), 1.49 (s, 1H), 1.38-1.17 (m, 7H	570.15	A	A
I-2319		(400 MHz, DMSO-d6) 8.61 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.24 (h, J = 7.8 Hz, 1H), 3.55 (s, 2H), 3.13-3.04 (m, 1H), 2.29 (td, J = 8.0, 4.1 Hz, 1H), 2.14 (s, 1H), 2.16-2.00 (m, 3H), 1.52 (d, J = 18.0 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 8.6 Hz, 3H), 1.34-1.16 (m, 4H).	572.2	A	A
I-2320		(400 MHz, DMSO-d6) 8.07-8.00 (m, 1H), 7.61 (s, 2H), 7.26 (s, 1H), 5.49 (s, 1H), 4.00 (s, 1H), 2.95 (s, 2H), 2.78 (s, 2H), 2.14-2.07 (m, 2H), 2.02 (s, 1H), 1.79 (s, 5H), 1.69 (s, 1H), 1.60 (s, 9H), 1.40-1.34 (m, 4H), 1.28-1.22 (m, 1H), 0.96 (s, 3H).	524.4	A	

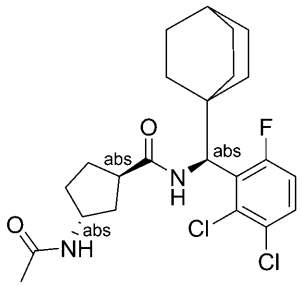
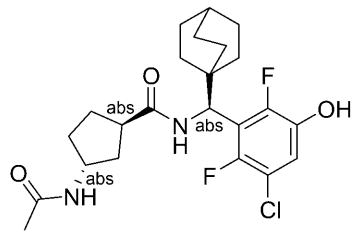
【表１－７０３】

I-2321		(400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (dd, J = 4.4, 1.4 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.33 -7.17 (m, 2H), 7.07 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 6.69 (dd, J = 9.0, 1.4 Hz, 1H), 5.75- 5.53 (m, 1H), 4.38 (h, J = 7.6 Hz, 1H), 3.17 (tt, J = 9.2, 4.2 Hz, 1H), 2.44 (tt, J = 7.8, 3.9 Hz, 1H), 2.29 (ddq, J = 11.5, 7.6, 4.0 Hz, 1H), 2.19 - 2.00 (m, 3H), 1.55 (q, J = 16.9, 15.9 Hz, 3H), 1.35 (dd, J = 16.5, 8.9 Hz, 3H), 1.26 (q, J = 8.4, 7.6 Hz, 3H).	463.1	A	A
I-2322		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.06 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.70 (ddd, J = 12.3, 8.0, 4.2 Hz, 1H), 3.15 (dd, J = 14.1, 3.6 Hz, 1H), 3.00 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 2.82 (dt, J = 13.2, 5.6 Hz, 1H), 2.72-2.61 (m, 2H), 2.55 (s, 2H), 1.92-1.63 (m, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.43 (tt, J = 17.1, 7.2 Hz, 3H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	514.2	A	B
I-2323		(400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.77 (t, J = 5.6 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.08 (tt, J = 11.3, 4.7 Hz, 1H), 2.95 (q, J = 6.3, 5.6 Hz, 2H), 1.91 (dt, J = 13.6, 7.1 Hz, 1H), 1.85 - 1.72 (m, 8H), 1.71 - 1.57 (m, 4H), 1.57 - 1.29 (m, 8H), 1.15 (dd, J = 12.7, 8.2 Hz, 1H).	500.1	B	

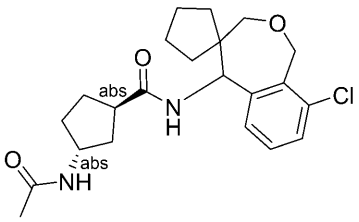
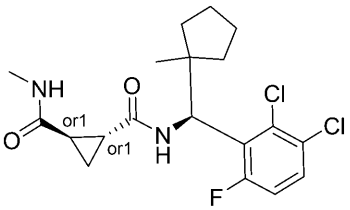
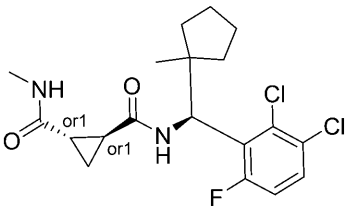
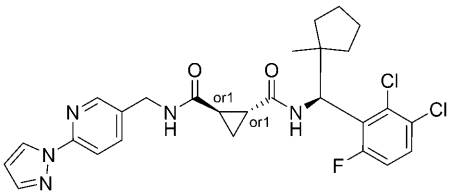
【表１－７０４】

I-2324		NMR (400 MHz,) 10.35 (br. s, 1H), 10.18 (s, 1H), 8.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.55 (app. td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (app. td, J = 9.5, 1.4 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 5.19 (d, J = 8.7 Hz, 1 H), 3.78 - 3.67 (m, 1H), 2.97 (app. p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.90 - 1.69 (m, 4H), 1.66 - 1.52 (m, 5H), 1.51 - 1.39 (m, 3H), 1.38 - 1.31 (m, 1H), 1.26 - 1.13 (m, 1H), 0.94 (s, 3H). 微量の不純物を含有。	454.2	A	A
I-2325		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの 1:1 混合物として, 8.25 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.59 - 7.52 (m, 2H), 7.18 - 7.11 (m, 2H), 5.57 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 5. 9 Hz, 1H), 5.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 5.16 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.22 - 4.12 (m, 2H), 3.06 - 2.96 (m, 2H), 2.80 - 2.72 (m, 2H), 2.24 - 1.85 (m, 6H), 1.66 - 1.31 (m, 16H), 1.21 (s, 2H), 0.94 (s, 6H).	397.3	B	
I-2326		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d,J= 8.6 Hz, 1H), 7.77 (d,J= 6.8 Hz, 1H), 7.61 (dd,J= 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (dd,J= 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.30 (d,J= 8.5 Hz, 1H), 4.04 - 3.90 (m, 1H), 2.97 - 2.86 (m, 1H), 1.87 - 1.78 (重複する m, 2H), 1.76 (重複する s, 3H), 1.74 - 1.67 (m, 12H), 1.66 - 1.55 (m, 2H), 1.48 - 1.28 (m, 2H). 8.47ppm に一部ギ酸塩。約 95:5 のジアステレオマー比。	473.3	A	

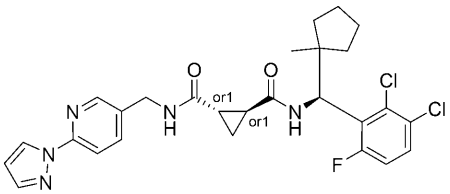
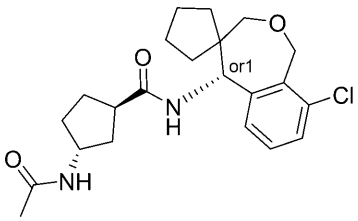
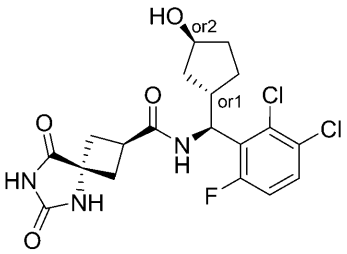
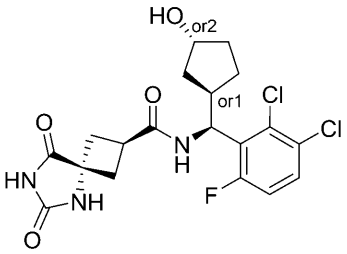
【表１－７０５】

I-2327		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.95 (d,J= 8.6 Hz, 1H), 7.76 (d,J= 6.8 Hz, 1H), 7.59 (dd,J= 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.22 (dd,J= 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.24 (d,J= 8.6 Hz, 1H), 4.06 - 3.92 (m, 1H), 3.02 - 2.86 (m, 1H), 1.88 - 1.77 (重複する m, 2H), 1.76 (重複する s, 3H), 1.65 - 1.56 (m, 1H), 1.54 - 1.41 (m, 14H), 1.42 - 1.29 (重複する m, 2H). 8.28ppm に微量のギ酸塩。約 95:5 のジアステレオマー比。	455.4	A	
I-2328		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーの 1:1 混合物として, 9.91 (br. s, 2H), 7.92 (br. d, J = 6.6 Hz, 2H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 6.98 (app. t, J = 7.9 Hz, 2H), 4.97 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.91 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.04 - 3.94 (m, 2H), 2.93 (app. p, J = 7.7 Hz, 2H), 1.87 - 1.72 (重複する m, 6H), 1.76 (重複する s, 6H), 1.66 - 1.57 (m, 2H), 1.56 - 1.30 (m, 30H).	455.4	A	A

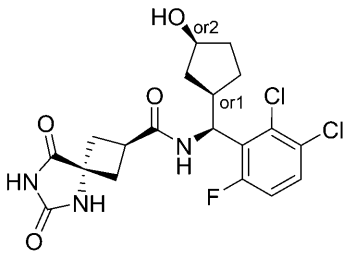
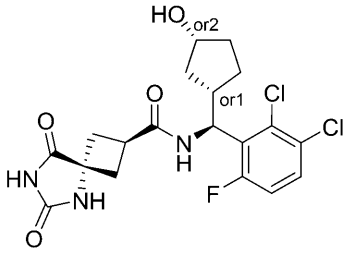
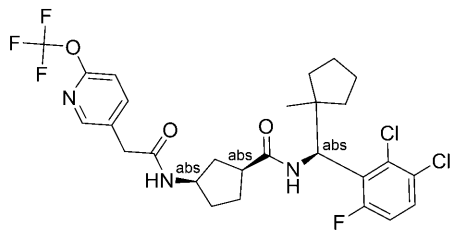
【表１－７０６】

I-2329		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 2 つのジアステレオマーの 1:1 混合物。8.12 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.80 (重複する d, J = 7.1 Hz, 0.5H), 7.78 (重複する d, J = 7.2 Hz, 0.5H), 7.33 - 7.28 (m, 2H), 7.26 - 7.21 (m, 1H), 5.16 - 5.06 (m, 1H), 5.02 (AB の dA, JAB = 14.6 Hz, 1H), 4.90 (AB の br. dB, JAB = 14.2 Hz, 1H), 4.08 - 3.97 (m, 1H), 3.82 (br. dd, J = 11.9, 4.0 Hz, 1H), 3.50 (d, J = 12.4 Hz, 1H), 3.02 - 2.90 (m, 1H), 2.00 - 1.78 (m, 3H), 1.77 (重複する s, 1.5H), 1.75 (s, 1.5H), 1.73 - 1.42 (m, 6H), 1.41 - 1.31 (m, 2H), 1.30 - 1.19 (m, 2H), 1.10 - 1.00 (m, 1H).	405.3	E	
I-2330				D	
I-2331				E	
I-2332				E	

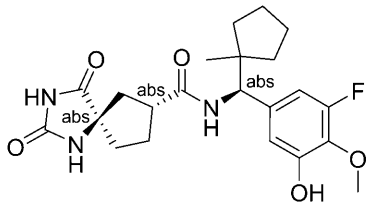
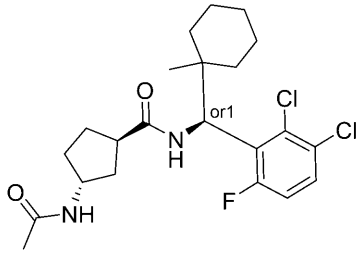
【表１－７０７】

I-2333				D	
I-2334				E	
I-2335		(400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.40 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 8.9, 4.9 Hz, 1H), 7.24 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 5.14 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 4.58 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.10 (q, J = 4.9 Hz, 1H), 3.15 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.62 (ddd, J = 32.6, 12.1, 9.2 Hz, 2H), 2.26 - 2.08 (m, 3H), 1.65 -1.45 (m, 2H), 1.36 (q, J = 9.6 Hz, 1H), 1.30 - 1.20 (m, 3H).	444.1	A	B
I-2336		(400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.63 - 7.55 (m, 1H), 7.26 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.09 - 5.00 (m, 1H), 4.48 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 3.16 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.76 (s, 1H), 2.65 (dd, J = 12.1, 9.0 Hz, 1H), 2.59 - 2.53 (m, 1H), 2.26 - 2.08 (m, 2H), 1.91 - 1.77 (m, 2H), 1.42 (dq, J = 13.6, 7.6, 5.8 Hz, 3H), 1.24 (s, 1H), 1.16 - 0.94 (m, 1H).	444.1	C	

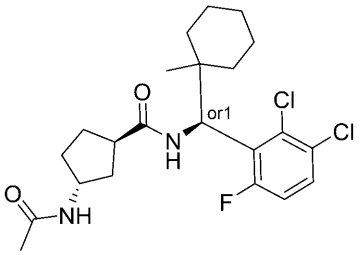
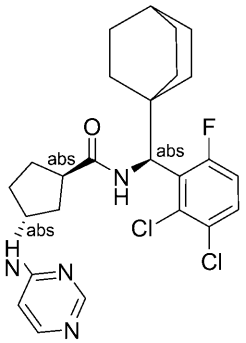
【表１－７０８】

I-2337		(400 MHz, DMSO-d6) 10.51 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.37 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 5.13 (s, 1H), 4.55 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.01 (s, 1H), 3.14 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.73 - 2.54 (m, 2H), 2.26 - 2.10 (m, 2H), 1.87 (s, 1H), 1.66 (dt, J = 15.2, 7.1 Hz, 1H), 1.58 - 1.38 (m, 3H), 1.24 (s, 1H), 1.06 (s, 1H), 0.98 - 0.83 (m, 1H).	444.1	D	
I-2338		(400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.31 - 7.20 (m, 1H), 5.08 - 4.99 (m, 1H), 4.38 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 4.16 - 4.09 (m, 1H), 3.15 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.79 (s, 1H), 2.61 (ddd, J = 32.7, 12.1, 9.0 Hz, 2H), 2.26 - 2.09 (m, 2H), 2.08 - 2.01 (m, 1H), 1.85 (ddt, J = 14.8, 10.6, 5.5 Hz, 1H), 1.46 (q, J = 11.3, 9.2 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.24 (s, 1H), 1.18 (q, J = 12.2, 10.3 Hz, 2H).	444.1	E	
I-2339		(400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (s, 1H), 8.14 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.88 (dd, J = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.8, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 8.5 Hz, 2H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.03 - 3.98 (m, 1H), 3.47 (s, 2H), 2.99 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 1.97 - 1.76 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.49 - 1.22 (m, 4H), 0.97 (s, 3H).	590.2	A	B

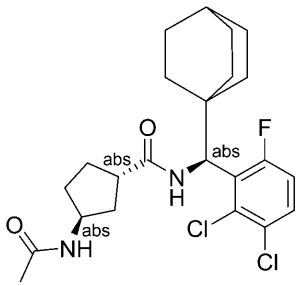
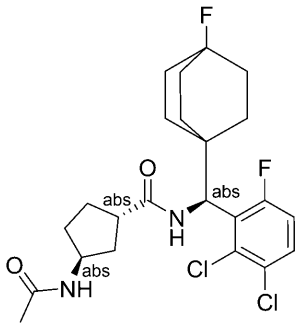
【表１－７０９】

I-2340		(400 MHz, DMSO-d6)10.62 (s, 1H), 9.59 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 8.14 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 6.67 (dd, J = 12.0, 2.0 Hz, 1H), 6.61 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 4.67 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.00 (dq, J = 10.2, 7.9 Hz, 1H), 2.11 (dd, J = 13.1, 10.4 Hz, 1H), 2.01 (ddd, J = 12.4, 8.8, 7.2 Hz, 1H), 1.92 (ddd, J = 15.5, 12.6, 7.6 Hz, 2H), 1.82-1.60 (m, 2H), 1.58-1.50 (m, 6H), 1.23 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 1.08 (s, 1H), 0.82 (s, 3H).	434.05	D	
I-2341		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーまたはアトロプ異性体の 1:1 混合物として，8.02 (d,J= 8.9 Hz, 2H), 7.75 (d,J= 6.8 Hz, 2H), 7.61 (dd,J= 8.9, 5.1 Hz, 2H), 7.25 (dd,J= 10.7, 9.1 Hz, 2H), 5.36 (d,J= 8.8 Hz, 2H), 4.00 - 3.90 (m, 2H), 3.01 - 2.91 (m, 2H), 1.93 - 1.79 (m, 4H), 1.75 (s, 6H), 1.71 - 1.41 (m, 14H), 1.40 - 1.22 (m, 12H), 1.10 - 1.01 (m, 2H), 0.97 (s, 3H), 0.96 (s, 3H). 示された構造は任意割り当てである。	443.3	D	

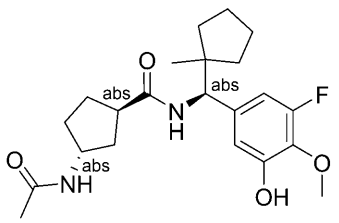
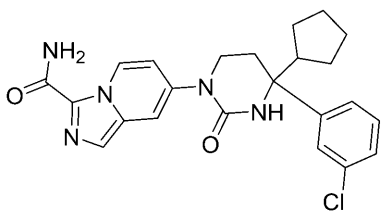
【表１－７１０】

I-2342		(400 MHz, DMSO-d6) ジアステレオマーまたはアトロプ異性体の 1:1 混合物として, 8.01 (d,J= 8.9 Hz, 2H), 7.76 (d,J= 6.8 Hz, 2H), 7.61 (dd,J= 8.9, 5.1 Hz, 2H), 7.25 (dd,J= 10.7, 9.1 Hz, 2H), 5.36 (d,J= 8.8 Hz, 2H), 4.04 - 3.94 (m, 2H), 3.01 - 2.90 (m, 2H), 1.76 (s, 6H), 1.88 - 1.72 (m, 4H), 1.65 - 1.51 (m, 4H), 1.50 - 1.22 (m, 22H), 1.13 - 1.01 (m, 2H), 0.97 (s, 3H), 0.96 (s, 3H). 示された構造は任意割り当てである。	443.3	A	B
I-2343		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 主要なジアステレオマーを記載。8.37 (s, 1H), 8.04 - 7.96 (埋没した m, 1H), 7.99 (重複する d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 9.1 Hz, 1H), 6.41 (dd, J = 6.0, 0.9 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.22 (br. s, 1H), 3.04 - 2.94 (m, 1H), 1.99 - 1.88 (m, 2H), 1.87 - 1.79 (m, 1H), 1.76 - 1.66 (m, 1H), 1.54 - 1.38 (m, 15H). 2 つのジアステレオマーの 9:1 混合物。8.32ppm に一部ギ酸塩。	491.1	A	A

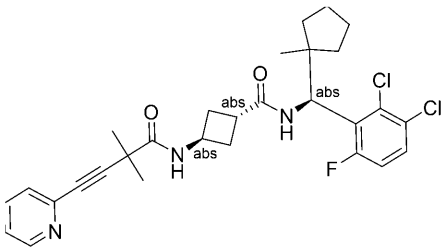
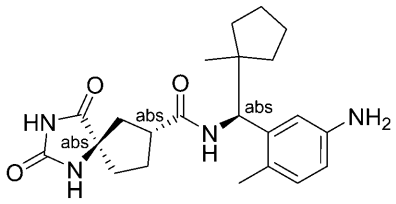
【表１－７１１】

I-2344		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.96 (d,J= 8.6 Hz, 1H), 7.75 (d,J= 6.9 Hz, 1H), 7.59 (dd,J= 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.22 (dd,J= 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.23 (d,J= 8.5 Hz, 1H), 4.09 - 3.73 (m, 1H), 3.01 - 2.83 (m, 1H), 1.93 - 1.78 (m, 2H), 1.75 (s, 3H), 1.68 - 1.55 (m, 2H), 1.55 - 1.41 (重複する m, 14H), 1.39 - 1.30 (重複する m, 1H). 微量のギ酸塩(3%w/w)及び脂肪族不純物。約 95:5 のジアステレオマー比。	455.4	A	A
I-2345		NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d,J= 8.6 Hz, 1H), 7.76 (d,J= 6.8 Hz, 1H), 7.61 (dd,J= 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (dd,J= 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.29 (d,J= 8.5 Hz, 1H), 4.02 - 3.90 (m, 1H), 2.98 - 2.86 (m, 1H), 1.93 - 1.79 (m, 2H), 1.75 (重複する s, 3H), 1.73 - 1.62 (重複する m, 13H), 1.60 - 1.47 (重複する m, 2H), 1.43 - 1.29 (m, 1H). 約 95:5 のジアステレオマー比。約 1 当量のギ酸塩の存在 -- 推定 18%w/w (DIPEA.ギ酸塩)	473.3	A	B

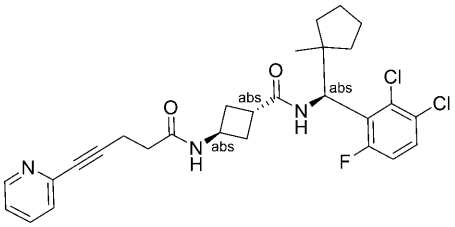
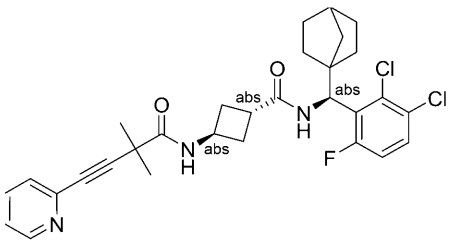
【表１－７１２】

I-2346		(400 MHz, DMSO-d6) 9.53 (s, 1H), 8.02 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.66 (dd, J = 12.1, 2.0 Hz, 1H), 6.60 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 4.67 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.75 (s, 3H), 2.89 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.92-1.73 (m, 3H), 1.78 (s, 3H), 1.67 (ddd, J = 13.3, 8.8, 5.4 Hz, 1H), 1.62-1.50 (m, 2H), 1.56 (s, 5H), 1.44-1.31 (m, 1H), 1.23 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 1.07 (s, 1H), 0.82 (s, 3H).	407.2	D	
I-2347		(400 MHz, DMSO-d6) 9.21 (dt, J = 7.7, 0.9 Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.53 (t, J = 1.4 Hz, 1H), 7.50 - 7.38 (m, 4H), 7.37 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 7.33 (dt, J = 8.6, 2.1 Hz, 2H), 7.21 - 7.06 (m, 1H), 3.55 - 3.46 (m, 1H), 3.17 (td, J = 12.1, 3.2 Hz, 1H), 2.48 -2.35 (m, 2H), 2.22 (td, J = 13.2, 4.6 Hz, 1H), 1.68 (dd, J = 11.2, 6.5 Hz, 1H), 1.63 - 1.45 (m, 4H), 1.39 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 1.18 - 1.05 (m, 1H).	438.15	E	

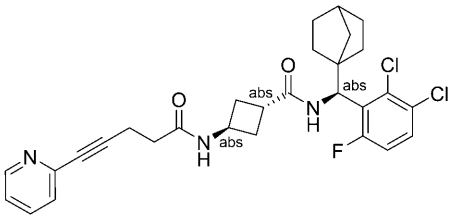
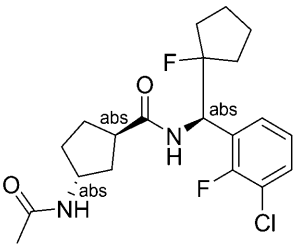
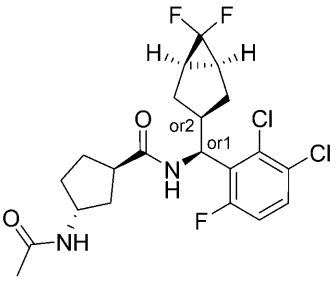
【表１－７１３】

I-2348		(400 MHz, DMSO-d6) 8.55 (dt, J = 4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.80 (td, J = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.52 (dt, J = 7.8, 1.2 Hz, 1H), 7.37 (ddd, J = 7.6, 4.8, 1.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.33 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 3.19 - 3.03 (m, 1H), 2.35 - 2.17 (m, 3H), 2.11 (ddt, J = 11.7, 8.8, 2.7 Hz, 1H), 1.59 (q, J = 10.9, 8.0 Hz, 6H), 1.44 (s, 6H), 1.40 - 1.33 (m, 1H), 1.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	544.15	B	
I-2349		(400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.02 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.57 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 6.36 (dd, J = 8.0, 2.3 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.66 (s, 2H), 2.97 (q, J = 8.6 Hz, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.08 (dd, J = 13.0, 10.2 Hz, 1H), 2.07 - 1.91 (m, 2H), 1.91 - 1.70 (m, 2H), 1.70 - 1.60 (m, 1H), 1.57 (s, 4H), 1.56 - 1.49 (m, 2H), 1.27 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 1.14 (s, 1H), 0.89 (s, 3H).	399.2	E	

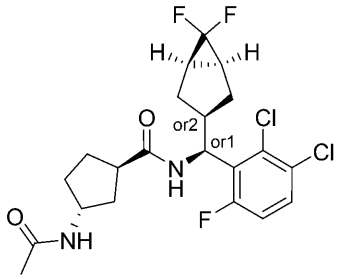
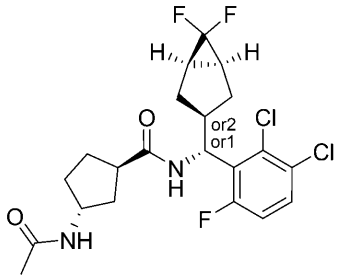
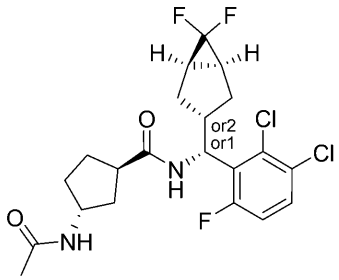
【表１－７１４】

I-2350		(400 MHz, DMSO-d6) 8.51 (dt, J = 4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.41 (dd, J = 7.8, 1.2 Hz, 1H), 7.34 (ddd, J = 7.6, 4.9, 1.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.28 (h, J = 7.9 Hz, 1H), 3.08 (tt, J = 9.1, 3.5 Hz, 1H), 2.63 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 2.39 - 2.23 (m, 3H), 2.21 - 1.98 (m, 3H), 1.59 (d, J = 5.8 Hz, 6H), 1.41 - 1.32 (m, 1H), 1.27 (q, J = 6.8, 4.3 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	530.1	A	B
I-2351		(400 MHz, DMSO-d6) 8.59 - 8.52 (m, 1H), 8.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.80 (td, J = 7.7, 1.9 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.37 (ddd, J = 7.6, 4.9, 1.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.32 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 3.15 - 3.01 (m, 1H), 2.36 - 2.17 (m, 3H), 2.17 - 2.07 (m, 2H), 1.64 - 1.48 (m, 3H), 1.44 (s, 6H), 1.40 - 1.15 (m, 7H).	556.1	B	

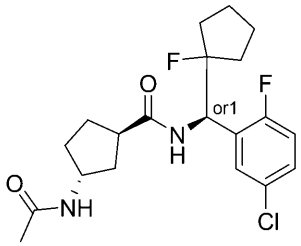
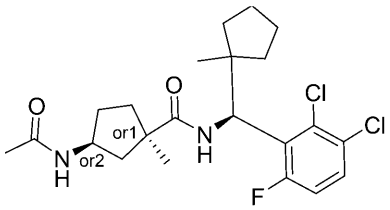
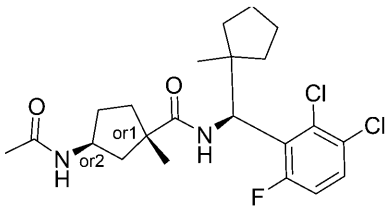
【表１－７１５】

I-2352		(400 MHz, DMSO-d6) 8.54 (dd, J = 5.0, 1.8 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.84 (td, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.44-7.36 (m, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.68 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.28 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 3.07 (td, J = 9.3, 4.4 Hz, 1H), 2.65 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 2.35 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 2.29 (td, J = 7.9, 3.9 Hz, 1H), 2.19-1.98 (m, 4H), 1.57-1.47 (m, 3H), 1.34 (s, 3H), 1.33-1.24 (m, 2H), 1.23 (d, J = 10.6 Hz, 2H).	542.1	A	A
I-2353		(400 MHz, DMSO-d6) 8.69 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.51 (td, J = 7.0, 6.5, 2.4 Hz, 2H), 7.24 (td, J = 7.9, 1.0 Hz, 1H), 5.41 (dd, J = 26.0, 9.1 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.92 - 1.62 (m, 14H), 1.59 - 1.31 (m, 3H).	399.15	B	B
I-2354		(400 MHz, DMSO-d6) 8.35 (dd, J = 27.2, 8.6 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.73 - 7.26 (m, 2H), 5.01 (dt, J = 125.4, 9.0 Hz, 1H), 4.02 (q, J = 6.3 Hz, 1H), 2.76 (dt, J = 23.9, 9.3 Hz, 2H), 2.39 - 1.99 (m, 3H), 1.97 - 1.71 (m, 7H), 1.65 (ddd, J = 13.4, 8.9, 5.3 Hz, 2H), 1.44 (ddt, J = 43.6, 19.4, 7.2 Hz, 3H).	463.1	C	

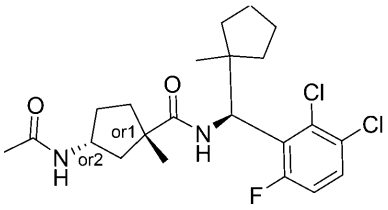
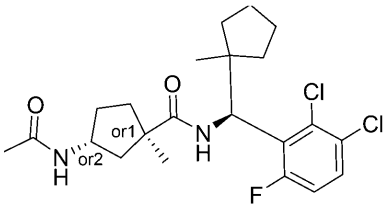
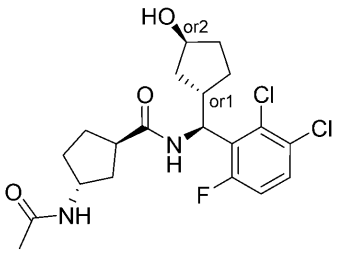
【表１－７１６】

I-2355		(400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 5.06 (dd, J = 11.1, 7.3 Hz, 1H), 3.99 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.11 (d, J = 10.6 Hz, 1H), 2.78 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.45 (s, 1H), 2.36 - 2.07 (m, 2H), 1.95 - 1.67 (m, 7H), 1.59 (ddd, J = 13.5, 8.9, 5.5 Hz, 1H), 1.50 - 1.17 (m, 4H).	463.1	C	
I-2356		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.71 - 7.56 (m, 2H), 4.84 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.4 Hz, 1H), 2.76 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.28 (s, 1H), 2.10 (ddd, J = 15.1, 9.6, 6.2 Hz, 3H), 1.95 - 1.74 (m, 7H), 1.64 (ddd, J = 13.9, 8.7, 5.7 Hz, 3H), 1.50 (tt, J = 12.4, 7.8 Hz, 1H), 1.43 - 1.29 (m, 1H).	463.1	D	
I-2357		(400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.07 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.80 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.62 (s, 1H), 2.34 (dd, J = 12.8, 7.8 Hz, 1H), 2.24 - 2.01 (m, 2H), 1.95 - 1.72 (m, 7H), 1.69 - 1.51 (m, 3H), 1.48 - 1.23 (m, 2H).	463.1	A	A

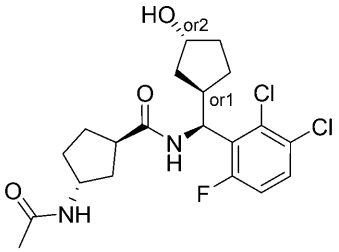
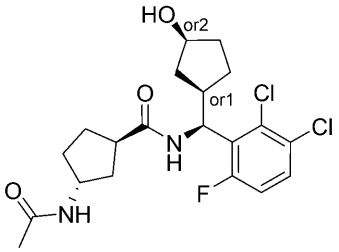
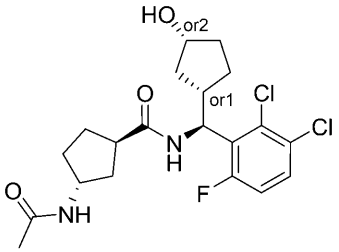
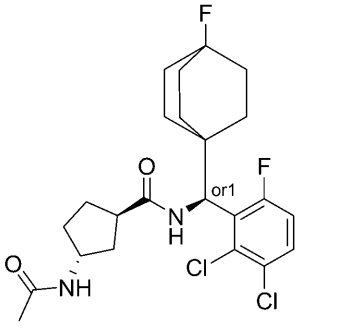
【表１－７１７】

I-2358		(400 MHz, DMSO-d6) 8.68 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.67 - 7.61 (m, 1H), 7.40 (ddd, J = 8.8, 4.4, 2.7 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.40 (dd, J = 26.6, 9.3 Hz, 1H), 4.03 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.91 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.94 - 1.81 (m, 4H), 1.78 (s, 4H), 1.75 - 1.61 (m, 6H), 1.55 (dt, J = 12.6, 7.9 Hz, 1H), 1.48 - 1.33 (m, 2H).	399.1	D	
I-2359		(400 MHz, DMSO-d6) 7.76 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 11.0, 9.0 Hz, 1H), 7.13 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 5.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.08 (h, J = 7.6 Hz, 1H), 2.11 (ddd, J = 12.6, 8.8, 6.0 Hz, 1H), 1.88 (ddd, J = 24.6, 12.7, 6.9 Hz, 2H), 1.73 (s, 3H), 1.76-1.64 (m, 1H), 1.61 (s, 6H), 1.39 (ddt, J = 36.1, 20.2, 7.5 Hz, 2H), 1.31 (s, 2H), 1.20 (s, 3H), 0.99 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	443.15	E	
I-2360		(400 MHz, DMSO-d6) 7.82 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.32-7.19 (m, 2H), 5.51 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.92 (h, J = 7.7 Hz, 1H), 2.34 (dd, J = 13.2, 8.1 Hz, 1H), 2.00 (dt, J = 12.6, 7.6 Hz, 1H), 1.84-1.71 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.60 (s, 6H), 1.61-1.49 (m, 1H), 1.42 (dq, J = 15.3, 7.4 Hz, 2H), 1.30 (s, 1H), 1.25 (s, 3H), 1.21 (dd, J = 13.1, 7.6 Hz, 1H), 0.99 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	443.1	D	

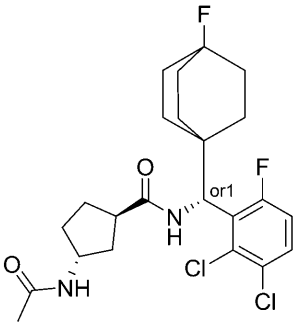
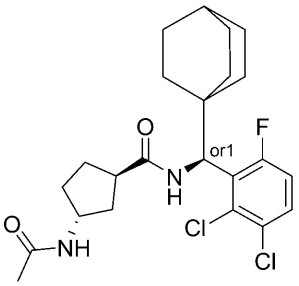
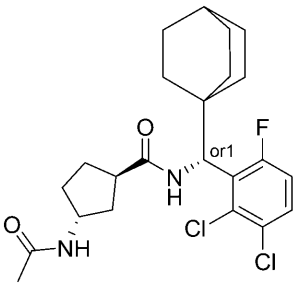
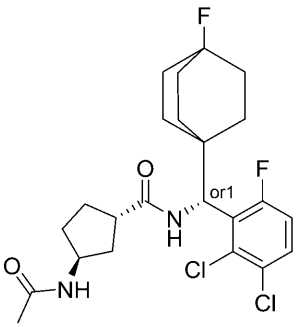
【表１－７１８】

I-2361		(400 MHz, DMSO-d6) 7.82 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.37-7.19 (m, 2H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.92 (p, J = 7.6, 7.0 Hz, 1H), 2.40 (dd, J = 13.2, 8.0 Hz, 1H), 1.96 (dt, J = 12.4, 7.4 Hz, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.78-1.67 (m, 1H), 1.61 (s, 6H), 1.56-1.34 (m, 3H), 1.25 (s, 3H), 1.33-1.18 (m, 2H), 0.99 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	443.1	B	
I-2362		(400 MHz, DMSO-d6) 7.77 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 11.0, 8.9 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.07 (h, J = 7.4 Hz, 1H), 2.11-2.00 (m, 1H), 1.89 (dt, J = 16.1, 7.1 Hz, 2H), 1.80 (dd, J = 13.1, 8.3 Hz, 1H), 1.73 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.61 -1.51 (m, 1H), 1.45-1.26 (m, 2H), 1.24 (s, 2H), 1.18 (s, 3H), 0.99 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	443.15	D	
I-2363		(400 MHz, メタノール-d4) 7.48 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.37 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 4.29 (q, J = 5.2 Hz, 1H), 4.28 - 4.15 (m, 1H), 2.91 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.69 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.27 (dt, J = 14.1, 6.9 Hz, 1H), 2.16 - 1.95 (m, 2H), 1.92 (s, 4H), 1.86 - 1.58 (m, 5H), 1.58 - 1.34 (m, 4H).	431.15	D	

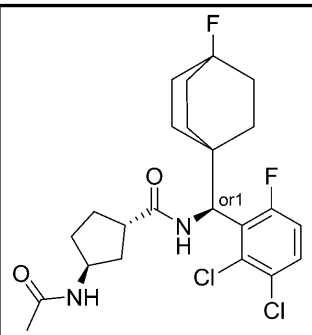
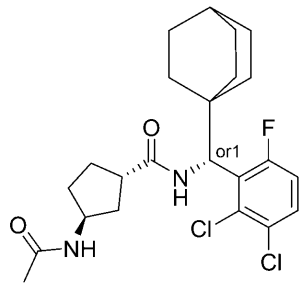
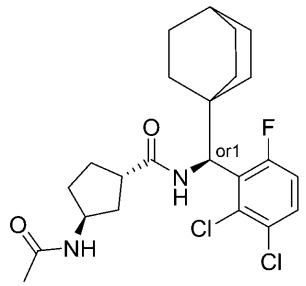
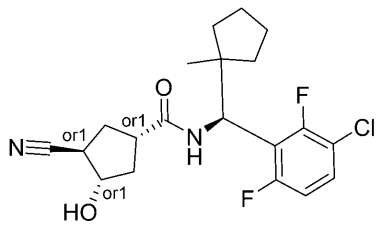
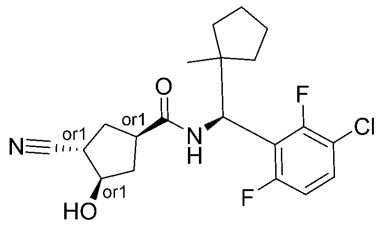
【表１－７１９】

I-2364		(400 MHz, メタノール-d4) 8.45 (s, 1H), 7.49 (dd, J = 9.1, 5.1 Hz, 1H), 7.16 -7.05 (m, 1H), 5.31 (dd, J = 41.0, 10.3 Hz, 1H), 4.36 (s, 1H), 4.31 - 4.13 (m, 1H), 2.93 (t, J = 8.1 Hz, 2H), 2.04 (ddd, J = 41.9, 15.7, 8.2 Hz, 4H), 1.94 - 1.74 (m, 3H), 1.72 - 1.42 (m, 8H), 1.24 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 1.03 (s, 1H).	431.05	E	
I-2365		(400 MHz, メタノール-d4) 8.39 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 10.4, 8.9 Hz, 1H), 5.35 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.26 - 4.13 (m, 2H), 2.91 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.67 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 2.16 -1.89 (m, 7H), 1.89 - 1.76 (m, 2H), 1.75 -1.56 (m, 5H), 1.50 (dq, J = 13.8, 7.2 Hz, 1H), 1.29 (d, J = 14.7 Hz, 1H).	431.15	E	
I-2366		(400 MHz, メタノール-d4) 8.63 - 8.35 (m, 1H), 7.49 (ddd, J = 9.1, 5.3, 1.8 Hz, 1H), 7.31 - 6.95 (m, 1H), 5.30 (dd, J = 43.4, 11.1 Hz, 1H), 4.30 (s, 1H), 4.26 - 4.14 (m, 1H), 3.19 - 2.78 (m, 2H), 2.25 - 1.98 (m, 4H), 1.91 (d, J = 5.7 Hz, 4H), 1.86 -1.58 (m, 4H), 1.56 - 1.23 (m, 4H).	431.15	E	
I-2367				A	B

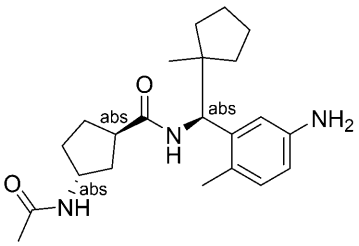
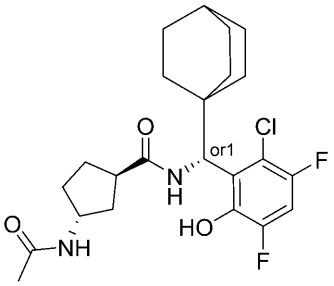
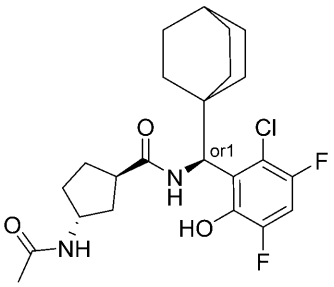
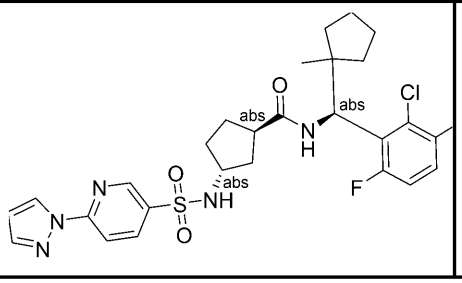
【表１－７２０】

I-2368				B	
I-2369				A	A
I-2370				C	
I-2371				E	

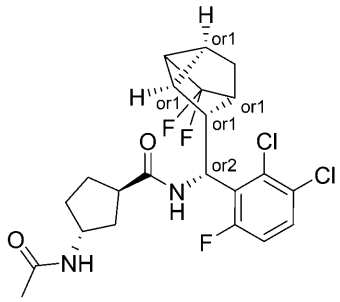
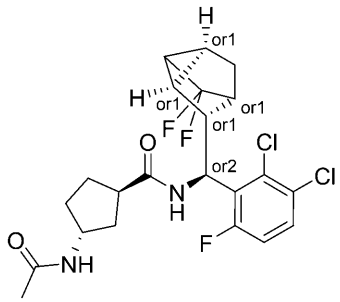
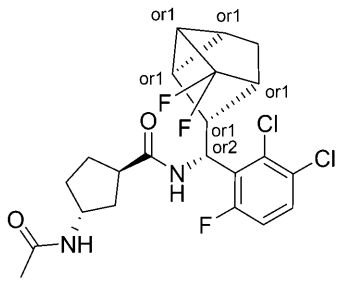
【表１－７２１】

I-2372				A	B
I-2373				C	
I-2374				A	A
I-2375				C	
I-2376				B	

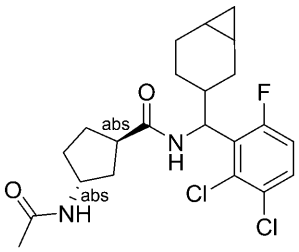
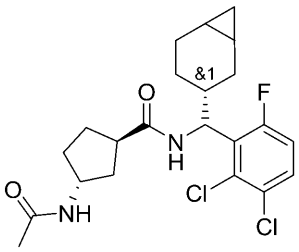
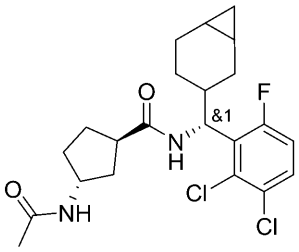
【表１－７２２】

I-2377		(400 MHz, DMSO-d6) 7.87 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.75 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.58 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 6.36 (dd, J = 8.1, 2.3 Hz, 1H), 5.07 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.63 (s, 2H), 4.03 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.88 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.84 (dt, J = 12.6, 5.8 Hz, 2H), 1.78 (s, 3H), 1.75 - 1.46 (m, 9H), 1.36 (dq, J = 14.6, 7.8 Hz, 1H), 1.30 - 1.24 (m, 1H), 1.14 (dd, J = 9.8, 4.9 Hz, 1H), 0.89 (s, 3H).	372.2	E	
I-2378				A	A
I-2379				D	
I-2380				C	

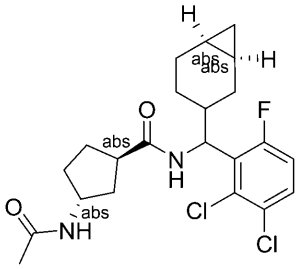
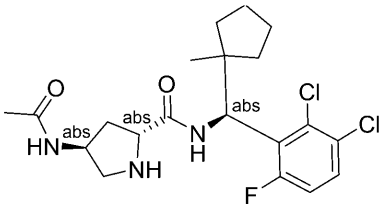
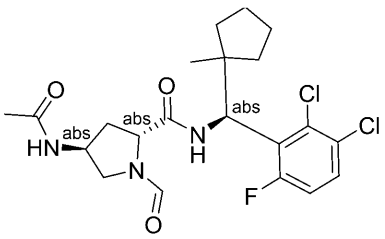
【表１－７２３】

I-2381		(400 MHz, DMSO-d6) 8.58 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.3 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 5.05 (s, 1H), 4.01 (h, J = 6.4 Hz, 1H), 2.84 (p, J = 7.9, 7.3 Hz, 2H), 1.99- 1.84 (m, 3H), 1.77 (d, J = 8.0 Hz, 8H), 1.62 (ddd, J = 13.0, 8.9, 5.6 Hz, 1H), 1.53 (s, 1H), 1.50-1.27 (m, 2H).	475.05	A	B
I-2382		(400 MHz, DMSO-d6) 8.58 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.3 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 10.4, 9.0 Hz, 1H), 5.06 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 3.97 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.84 (p, J = 8.1, 7.6 Hz, 2H), 1.97 - 1.76 (m, 6H), 1.76 (s, 4H), 1.69 -1.48 (m, 4H), 1.45- 1.32 (m, 1H).	475.05	E	
I-2383		(400 MHz, DMSO-d6) 8.45 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 5.17 (s, 1H), 3.99 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.82 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.70 (d, J = 11.8 Hz, 1H), 2.22 (s, 1H), 1.91 - 1.69 (m, 9H), 1.68 - 1.52 (m, 2H), 1.50 - 1.28 (m, 2H), 1.08 (t, J = 5.2 Hz, 1H).	475.05	A	A

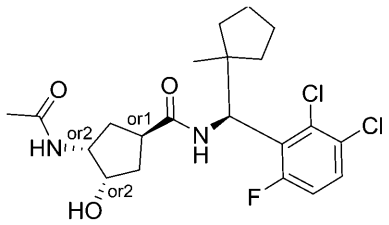
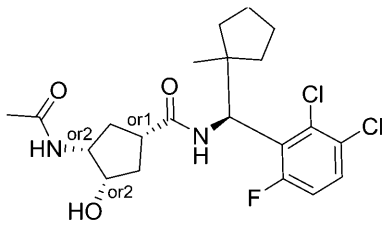
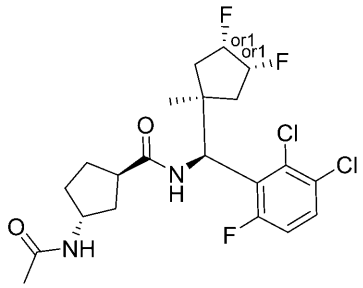
【表１－７２４】

I-2384		(400 MHz, DMSO-d6) 8.39-8.24 (m, 1H), 7.76 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.6, 5.2, 3.1 Hz, 1H), 7.36-7.24 (m, 1H), 5.60 (d, J = 16.1 Hz, 1H), 5.51 (q, J = 10.9, 10.4 Hz, 1H), 5.29-5.03 (m, 1H), 3.99 (dd, J = 13.9, 7.1 Hz, 1H), 3.32 (s, 4H), 2.85 (dt, J = 16.6, 8.2 Hz, 1H), 2.36 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 2.22 (s, 1H), 2.12-1.79 (m, 3H), 1.76 (dd, J = 5.5, 1.2 Hz, 3H), 1.67- 1.55 (m, 1H), 1.36 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 1.02- 0.89 (m, 2H).	441.15	B	
I-2385		(400 MHz, DMSO-d6) 8.26 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 6.9, 4.5 Hz, 1H), 7.59 (ddd, J = 8.7, 5.2, 3.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.2, 8.9 Hz, 1H), 4.95 (dt, J = 71.6, 9.0 Hz, 1H), 3.97 (dq, J = 12.2, 6.3 Hz, 1H), 2.97-2.62 (m, 1H), 1.83 (dd, J = 13.8, 6.5 Hz, 1H), 1.75 (d, J = 5.3 Hz, 4H), 1.72-1.29 (m, 4H), 1.24 (s, 2H), 1.13-0.96 (m, 1H), 0.85 (dq, J = 13.5, 5.4, 4.7 Hz, 2H), 0.81-0.68 (m, 1H), 0.60-0.43 (m, 1H), 0.08--0.02 (m, 2H), -0.13 (q, J = 5.0 Hz, 1H).	441.15	B	
I-2386		(400 MHz, DMSO-d6) 8.62-8.06 (m, 1H), 7.75 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 11.2, 8.9, 5.3 Hz, 1H), 7.26 (dddd, J = 13.5, 10.2, 7.9, 3.5 Hz, 1H), 5.8-5.43 (m, 1H), 5.21-4.78 (m, 1H), 3.97 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 3.33 (s, 7H), 3.02- 2.61 (m, 2H), 2.42-1.80 (m, 1H), 1.75 (d, J = 1.3 Hz, 3H), 1.68-0.28 (m, 7H).	441.15	D	

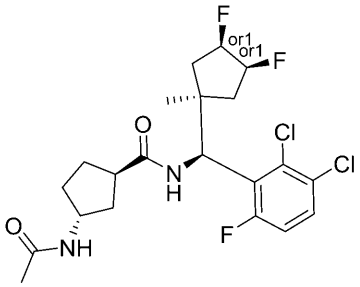
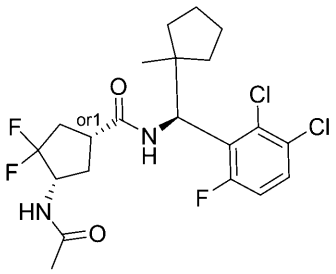
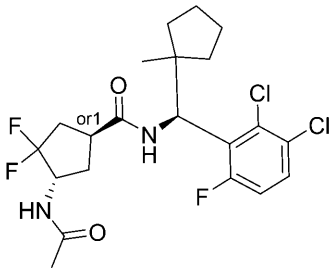
【表１－７２５】

I-2387		(400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 7.59 (ddt, J = 8.7, 5.9, 3.1 Hz, 1H), 7.24 (td, J = 9.3, 5.9 Hz, 1H), 5.11-4.75 (m, 1H), 3.96 (dt, J = 12.8, 7.2 Hz, 1H), 3.32 (s, 4H), 3.07-2.65 (m, 1H), 2.41-1.87 (m, 1H), 1.82 (s, 2H), 1.82-1.72 (m, 3H), 1.71-0.20 (m, 8H), 0.11 - -0.24 (m, 2H).	441.15	A	
I-2388		(400 MHz, DMSO-d6) 8.71 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 11.1, 9.0 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 3.97 (q, J = 5.7, 5.0 Hz, 1H), 3.85 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 2.88 (dd, J = 11.1, 5.6 Hz, 1H), 2.78 (dd, J = 11.1, 4.4 Hz, 1H), 1.91 (ddd, J = 13.3, 8.7, 4.8 Hz, 1H), 1.78 (s, 4H), 1.69 - 1.44 (m, 7H), 1.36 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 1.24 (q, J = 6.2, 4.8 Hz, 1H), 0.95 (d, J = 2.4 Hz, 3H).	430.15	B	
I-2389		(400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (dd, J = 102.1, 8.8 Hz, 1H), 8.20 - 7.84 (m, 2H), 7.64 (ddd, J = 8.9, 5.1, 3.8 Hz, 1H), 7.29 (ddd, J = 10.7, 8.9, 2.0 Hz, 1H), 5.50 (dd, J = 20.6, 8.7 Hz, 1H), 4.72 - 4.48 (m, 1H), 4.24 (dq, J = 41.2, 5.8, 5.4 Hz, 1H), 3.57 (dd, J = 10.8, 5.6 Hz, 1H), 3.51 - 3.39 (m, 1H), 2.08 (dtt, J = 30.5, 12.8, 5.9 Hz, 2H), 1.80 (d, J = 1.1 Hz, 3H), 1.71 - 1.49 (m, 6H), 1.36 (d, J = 13.3 Hz, 1H), 1.25 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 0.96 (dd, J = 10.4, 2.8 Hz, 3H).	458.15	B	

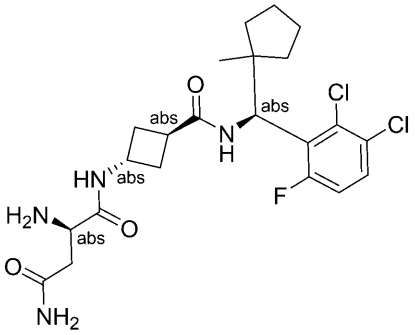
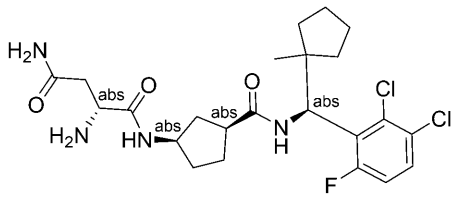
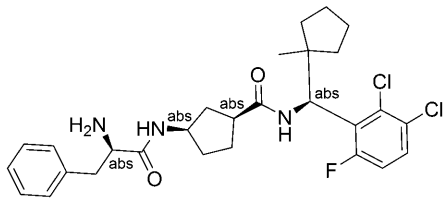
【表１－７２６】

I-2390		(400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.45 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.80 - 4.74 (m, 1H), 3.96 (p, J = 3.4 Hz, 1H), 3.92 - 3.82 (m, 1H), 3.12 (dd, J = 9.9, 4.4 Hz, 1H), 1.85 - 1.74 (m, 5H), 1.72 - 1.49 (m, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.25 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	445.1	B	B
I-2391		(400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.79 - 4.73 (m, 1H), 3.92 (q, J = 8.6, 7.8 Hz, 2H), 3.11 (dt, J = 13.1, 6.7 Hz, 1H), 1.81 (s, 5H), 1.70 - 1.51 (m, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	445.2	A	A
I-2392		(400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.30 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.57 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 5.19 - 5.10 (m, 1H), 5.00 (s, 1H), 3.98 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.96 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 2.24 - 1.98 (m, 2H), 1.98 - 1.78 (m, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.70 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 1.70 - 1.59 (m, 1H), 1.53 (s, 1H), 1.38 (dd, J = 13.4, 6.3 Hz, 1H), 1.07 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	465.05	D	

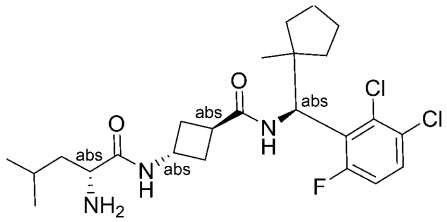
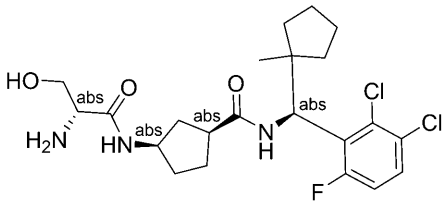
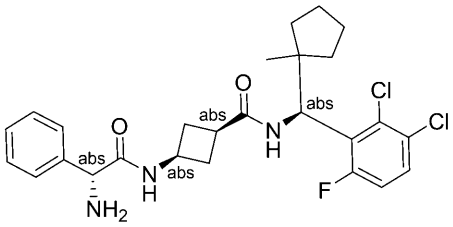
【表１－７２７】

I-2393		(400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 5.13 (dt, J = 9.2, 4.5 Hz, 1H), 5.02 (ddd, J = 18.6, 9.5, 5.6 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.4 Hz, 1H), 2.97 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.25 - 1.98 (m, 2H), 1.94 - 1.75 (m, 7H), 1.74 - 1.60 (m, 2H), 1.46 (dq, J = 12.0, 8.7, 7.5 Hz, 1H), 1.36 (dt, J = 13.0, 6.8 Hz, 1H), 1.07 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.05	B	B
I-2394		(400 MHz, DMSO-d6) 8.29 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.47 (dt, J = 18.2, 9.2 Hz, 1H), 3.14 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 2.29 - 2.11 (m, 2H), 2.06 - 1.92 (m, 1H), 1.86 (s, 4H), 1.61 (s, 6H), 1.39 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.05	A	A
I-2395		(400 MHz, DMSO-d6) 8.29 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.48 - 4.08 (m, 1H), 3.16 (dd, J = 9.8, 5.2 Hz, 1H), 2.32 (tt, J = 16.7, 7.4 Hz, 2H), 1.83 (s, 3H), 1.83 - 1.71 (m, 2H), 1.59 (d, J = 8.9 Hz, 6H), 1.38 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.05	A	B

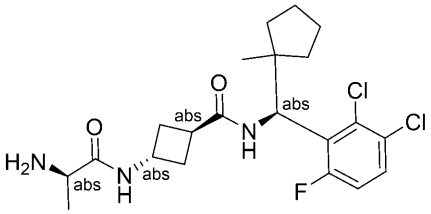
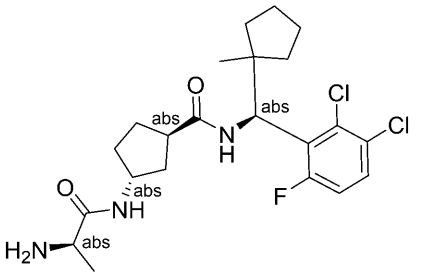
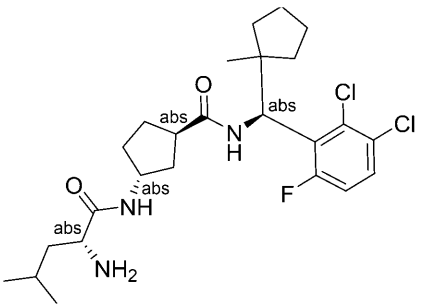
【表１－７２８】

I-2396		(400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (dd, J = 8.3, 5.3 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.82 (s, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (h, J = 7.9 Hz, 1H), 3.38 (dd, J = 9.1, 4.1 Hz, 1H), 3.07 (q, J = 8.6, 6.5 Hz, 1H), 2.36 (dd, J = 14.8, 4.0 Hz, 1H), 2.25 (tt, J = 8.1, 4.3 Hz, 1H), 2.20 - 2.03 (m, 4H), 1.94 (s, 2H), 1.59 (d, J = 6.7 Hz, 6H), 1.36 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 1.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	487.2	A	B
I-2397		(400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.83 (s, 1H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.03 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.42 (dd, J = 9.2, 4.0 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.37 (dd, J = 14.9, 4.0 Hz, 1H), 2.14 (dd, J = 14.9, 9.2 Hz, 1H), 2.03 - 1.70 (m, 5H), 1.60 (s, 7H), 1.50 - 1.34 (m, 3H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	501.2	A	B
I-2398		(400 MHz, DMSO-d6) 8.03 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.68 - 7.58 (m, 2H), 7.33 - 7.23 (m, 3H), 7.19 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.00 - 2.83 (m, 2H), 2.62 (dd, J = 13.3, 7.9 Hz, 2H), 1.92 - 1.70 (m, 5H), 1.66 - 1.46 (m, 7H), 1.35 (ddt, J = 38.9, 19.5, 6.1 Hz, 4H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	534.1	B	

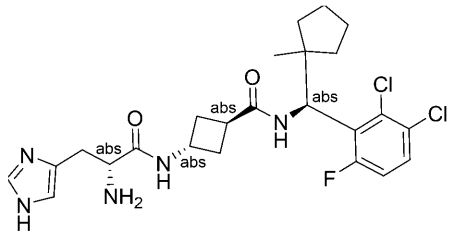
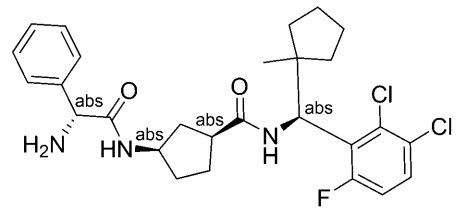
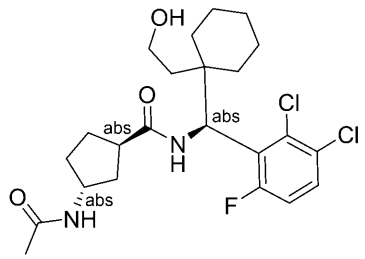
【表１－７２９】

I-2399		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (dd, J = 10.3, 8.3 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 3.08 (ddt, J = 14.2, 8.9, 4.4 Hz, 2H), 2.27 (ddt, J = 11.6, 7.4, 3.4 Hz, 1H), 2.18 - 2.02 (m, 3H), 1.74 (s, 2H), 1.70 - 1.50 (m, 7H), 1.32 (ddt, J = 27.8, 19.4, 4.4 Hz, 3H), 1.18 (ddd, J = 13.3, 8.9, 5.7 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 0.85 (dd, J = 13.7, 6.6 Hz, 6H).	486.1	B	C
I-2400		(400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.70 (t, J = 5.1 Hz, 1H), 4.04 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.49 (dt, J = 9.5, 4.3 Hz, 1H), 3.41- 3.34 (m, 1H), 3.14 (dd, J = 6.4, 4.7 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.00 - 1.72 (m, 5H), 1.69 - 1.52 (m, 7H), 1.51 - 1.34 (m, 3H), 1.31 - 1.23 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	474.15	A	B
I-2401		(400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.40-7.32 (m, 1H), 7.35- 7.18 (m, 4H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.32-4.17 (m, 2H), 3.08 (tt, J = 8.4, 4.2 Hz, 1H), 2.30 (s, 2H), 2.23 (ddt, J = 8.0, 6.0, 2.6 Hz, 1H), 2.18-2.03 (m, 3H), 1.61- 1.51 (m, 6H), 1.35 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 1.29-1.22 (m, 1H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	506.2	A	B

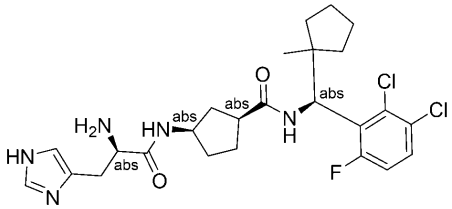
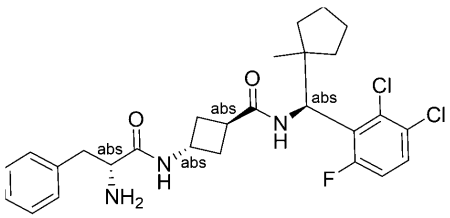
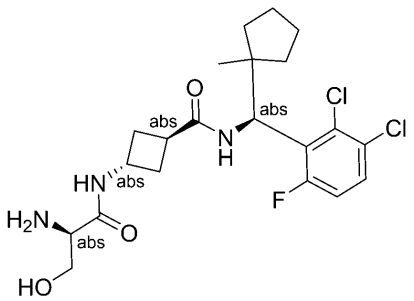
【表１－７３０】

I-2402		(400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.27 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 3.21 - 3.03 (m, 2H), 2.31 - 2.21 (m, 1H), 2.10 (tdd, J = 19.8, 14.4, 8.9 Hz, 3H), 1.88 (s, 2H), 1.59 (d, J = 5.9 Hz, 6H), 1.37 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.26 (s, 1H), 1.08 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	444.2	A	B
I-2403		(400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.03 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.20 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.00 (s, 2H), 1.89 (dt, J = 13.7, 7.2 Hz, 1H), 1.88-1.74 (m, 2H), 1.69-1.52 (m, 7H), 1.49-1.36 (m, 2H), 1.39-1.33 (m, 1H), 1.30-1.23 (m, 1H), 1.10 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	458.15	A	B
I-2404		(400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.08 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 2.00 - 1.75 (m, 5H), 1.75 - 1.50 (m, 8H), 1.38 (tdd, J = 13.6, 9.4, 6.4 Hz, 4H), 1.31 - 1.15 (m, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 0.86 (dd, J = 13.4, 6.6 Hz, 6H).	500.1	B	

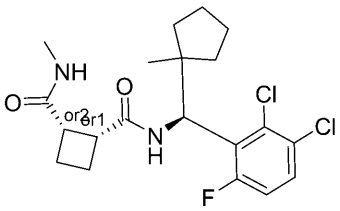
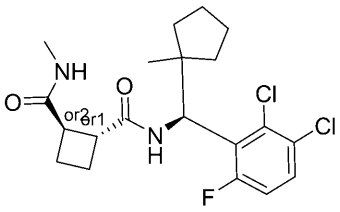
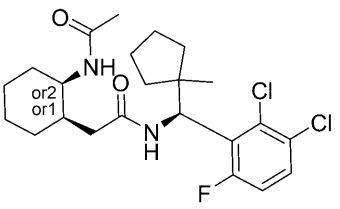
【表１－７３１】

I-2405		(400 MHz, クロロホルム-d) 7.81 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.37 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 1H), 7.02 - 6.93 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.39 (s, 1H), 5.85 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 4.44 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 3.64 (s, 1H), 3.17- 2.88 (m, 3H), 2.63 (s, 1H), 2.53 (s, 1H), 2.23 (q, J = 9.7 Hz, 1H), 2.11 (q, J = 9.7 Hz, 1H), 1.68 (s, 5H), 1.58 (s, 1H), 1.44 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 1.35- 1.23 (m, 1H), 1.00 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	510.3	A	C
I-2406		(400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 7.43 - 7.33 (m, 3H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.62 (s, 2H), 5.45 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.64 (s, 1H), 4.04 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 2.98 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 1.95 - 1.73 (m, 3H), 1.64 - 1.32 (m, 10H), 1.25 (s, 1H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	518.15	A	B
I-2407		(400 MHz, DMSO-d6)8.16 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.41 (t, J = 4.7 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.44 (ddd, J = 16.9, 10.9, 5.6 Hz, 2H) ,2.94 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.95-1.88 (m, 4H), 1.87 (s, 3H), 1.83 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 1.77 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 1.62 (ddd, J = 13.3, 8.8, 5.3 Hz, 2H), 1.59-1.50 (m, 4H), 1.46-1.29 (m, 3H), 1.06 (dt, J = 12.8, 7.2 Hz, 1H), 0.91 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 0.79 (q, J = 12.4, 10.1 Hz, 1H).	473.1	A	B

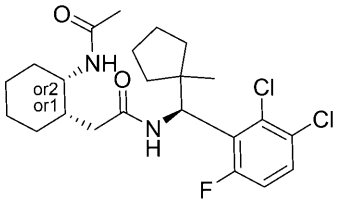
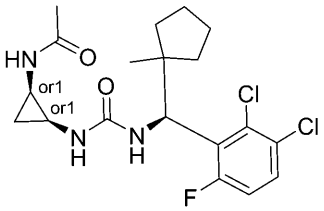
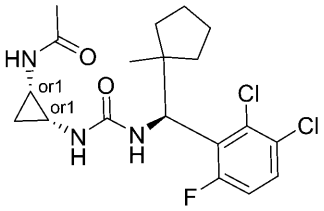
【表１－７３２】

I-2408		(400 MHz, クロロホルム-d) 7.55 (d, J = 28.8 Hz, 2H), 7.37 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 11.0, 8.9 Hz, 1H), 6.88 (s, 1H), 6.42 (s, 1H), 5.82 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 4.27 (s, 1H), 3.66 (s, 1H), 3.08 (s, 1H), 2.98 (d, J = 14.1 Hz, 1H), 2.83 - 2.67 (m, 1H), 2.28 - 2.14 (m, 1H), 2.07 (s, 1H), 1.97 - 1.75 (m, 3H), 1.68 (s, 5H), 1.62 - 1.51 (m, 1H), 1.50 - 1.36 (m, 2H), 1.28 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 1.01 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	524.25	A	D
I-2409		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.31 - 7.22 (m, 3H), 7.21 - 7.15 (m, 3H), 5.53 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.27 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 3.29 (dd, J = 8.0, 5.4 Hz, 1H), 3.04 (tt, J = 9.1, 3.5 Hz, 1H), 2.86 (dd, J = 13.2, 5.4 Hz, 1H), 2.59 (dd, J = 13.3, 7.9 Hz, 1H), 2.22 (ddt, J = 11.5, 7.6, 3.6 Hz, 1H), 2.15 - 1.96 (m, 3H), 1.79 (s, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.43 - 1.32 (m, 1H), 1.31 - 1.21 (m, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	520.1	A	C
I-2410		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.25 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.70 (s, 1H), 4.28 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 3.46 (dd, J = 10.5, 4.7 Hz, 1H), 3.40 - 3.31 (m, 1H), 3.15 - 3.05 (m, 2H), 2.25 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 2.16 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.09 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 1.99 (s, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.36 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 1.30 - 1.24 (m, 1H), 0.96 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	460.2	A	B

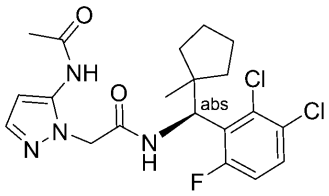
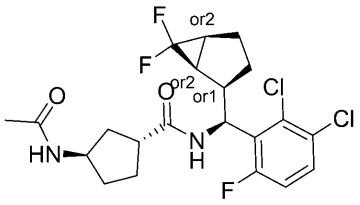
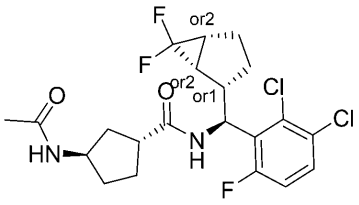
【表１－７３３】

I-2411		(400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.29 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.00 (q, J = 8.8, 8.2 Hz, 1H), 2.56 (d, J = 4.6 Hz, 3H), 1.99-1.85 (m, 4H), 1.60 (s, 6H), 1.36 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 1.25 (s, 1H), 0.95 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	415	E	
I-2412		(400 MHz, DMSO-d6)8.34 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.74 (q, J = 4.5 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.22 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 9.0 Hz, 1H), 2.59 (d, J = 4.6 Hz, 3H), 1.99-1.75 (m, 4H), 1.59 (d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.38-1.31 (m, 1H), 1.24 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	415.05	E	
I-2413		(400 MHz, DMSO-d6) 8.26 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.73 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.46 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.36 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 2.23 (dd, J = 14.0, 4.2 Hz, 1H), 2.05 (dd, J = 14.0, 9.5 Hz, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.60 (t, J = 5.0 Hz, 9H), 1.57-1.42 (m, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.29 (t, J = 10.8 Hz, 2H), 1.13 (q, J = 12.2, 11.5 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.6 Hz, 4H), 0.85- 0.71 (m, 1H).	457.1	D	

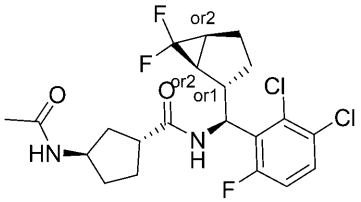
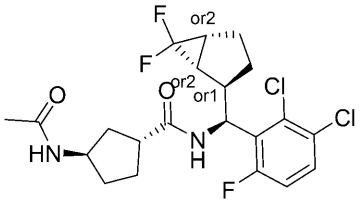
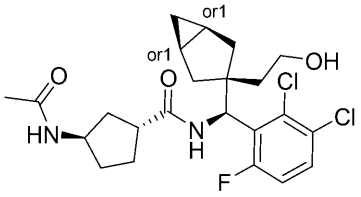
【表１－７３４】

I-2414		(400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.70-7.57 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.55 (s, 1H), 2.20-2.02 (m, 2H), 1.72 (s, 3H), 1.67 (s, 3H), 1.59 (s, 10H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 1.08 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	457.1	D	
I-2415		(400 MHz, DMSO-d6) 7.83 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.9, 9.0 Hz, 1H), 6.66 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.05 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 5.45 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 2.61 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 2.38 (tt, J = 7.9, 3.5 Hz, 1H), 1.83 (s, 3H), 1.61 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 1.60 (s, 5H), 1.30 (d, J = 11.8 Hz, 1H), 1.20 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 0.96 (td, J = 7.9, 6.1 Hz, 1H), 0.91 (d, J = 2.6 Hz, 3H), 0.43 (q, J = 5.3 Hz, 1H).	416.05	D	
I-2416		(400 MHz, DMSO-d6) 7.76 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.68 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 6.08 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 2.65 (s, 1H), 2.46-2.38 (m, 1H), 1.84 (s, 3H), 1.65-1.54 (m, 6H), 1.31 (s, 1H), 1.20 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 0.98-0.87 (m, 4H), 0.38 (q, J = 5.3 Hz, 1H).	416.05	C	

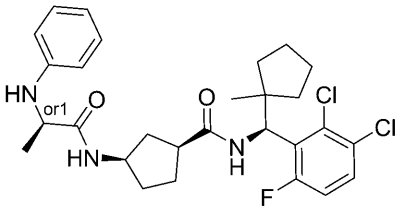
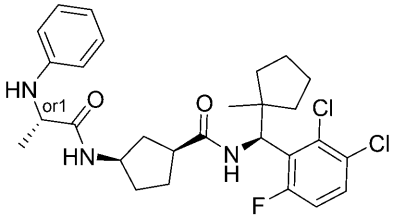
【表１－７３５】

I-2417		(400 MHz, DMSO-d6) 9.92 (s, 1H), 8.19 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.23 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 5.55 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.00 - 4.66 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.59 (d, J = 9.3 Hz, 6H), 1.42 - 1.31 (m, 1H), 1.24 (s, 1H), 0.94 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	441.15	D	
I-2418		(400 MHz, DMSO-d6) 8.43 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.31 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 5.11 (dd, J = 11.4, 7.4 Hz, 1H), 3.97 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.84 (dq, J = 23.9, 8.2 Hz, 2H), 2.19 (dt, J = 14.5, 7.3 Hz, 1H), 2.04 (s, 1H), 1.99 - 1.81 (m, 3H), 1.75 (m, 4H), 1.69 - 1.48 (m, 4H), 1.35 (tt, J = 16.5, 9.0 Hz, 2H).	463.15	D	
I-2419		(400 MHz, DMSO-d6) 8.62 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.10 (dd, J = 11.9, 7.2 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 2.87 (dt, J = 23.1, 9.7 Hz, 2H), 2.25 (td, J = 8.5, 4.2 Hz, 1H), 2.20 - 2.03 (m, 2H), 1.98 - 1.72 (m, 7H), 1.62 (ddd, J = 12.9, 8.8, 5.5 Hz, 1H), 1.53 - 1.29 (m, 3H), 1.12 (d, J = 11.5 Hz, 1H).	463.15	A	B

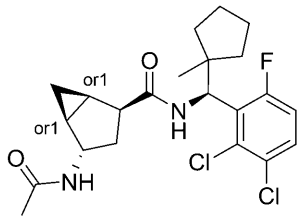
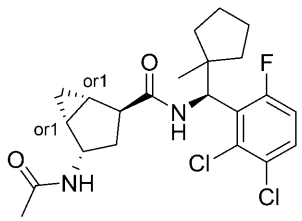
【表１－７３６】

I-2420		(400 MHz, DMSO-d6) 8.43 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.31 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 5.11 (dd, J = 11.5, 7.5 Hz, 1H), 4.00 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 2.85 (dt, J = 27.8, 8.7 Hz, 2H), 2.19 (ddd, J = 14.3, 8.3, 5.5 Hz, 1H), 2.09 - 1.99 (m, 1H), 1.97 - 1.80 (m, 2H), 1.76 (m, 6H), 1.67 - 1.55 (m, 2H), 1.51 - 1.27 (m, 3H).	463.15	C	
I-2421		(400 MHz, DMSO-d6) 8.49 (dd, J = 104.0, 8.1 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 15.0, 7.0 Hz, 1H), 7.72 - 7.59 (m, 1H), 7.29 (dd, J = 10.3, 9.0 Hz, 1H), 5.22 - 4.88 (m, 1H), 3.99 (dq, J = 26.3, 6.5 Hz, 1H), 2.83 (tq, J = 23.1, 8.8, 7.8 Hz, 2H), 2.25 (ddd, J = 14.4, 8.5, 5.6 Hz, 1H), 2.20 - 2.01 (m, 2H), 1.87 (dddd, J = 22.8, 12.7, 10.1, 6.9 Hz, 3H), 1.76 (d, J = 7.1 Hz, 3H), 1.65 (ddt, J = 15.2, 12.3, 7.5 Hz, 2H), 1.54 (ddd, J = 13.3, 8.8, 5.1 Hz, 1H), 1.49 - 1.31 (m, 2H), 1.11 (t, J = 11.6 Hz, 1H).	463.15	D	
I-2422		(400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.40 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.41 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.52 (dp, J = 13.5, 5.3 Hz, 2H), 2.95 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.01 - 1.73 (m, 8H), 1.71 - 1.57 (m, 3H), 1.50 - 1.30 (m, 3H), 1.25 (s, 2H), 1.10 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 0.76 (td, J = 8.0, 4.1 Hz, 1H), -0.26 (q, J = 3.9 Hz, 1H).	471.2	D	

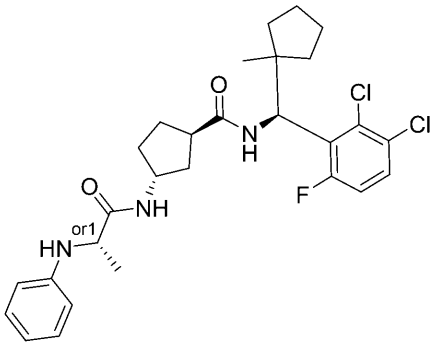
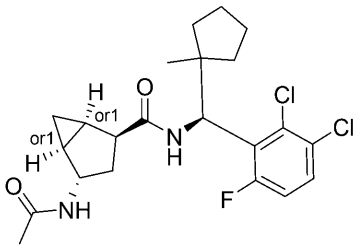
【表１－７３７】

I-2423		(400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 7.07 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 6.58 - 6.51 (m, 3H), 5.68 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.77 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 2.97 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 1.89 (dt, J = 13.7, 7.2 Hz, 1H), 1.77 (dddt, J = 15.4, 11.5, 6.9, 3.5 Hz, 2H), 1.60 (dt, J = 7.9, 4.4 Hz, 7H), 1.46 - 1.20 (m, 7H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	534.3	B	
I-2424		(400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.06 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 6.55 (dt, J = 6.9, 2.8 Hz, 3H), 5.68 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.83 - 3.41 (m, 1H), 2.95 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.89 (dt, J = 13.6, 7.1 Hz, 1H), 1.84 - 1.71 (m, 2H), 1.66 - 1.49 (m, 7H), 1.39 (tq, J = 13.0, 5.2, 4.2 Hz, 3H), 1.28 (d, J = 6.8 Hz, 4H), 1.09 - 0.82 (m, 3H).	534.25	B	

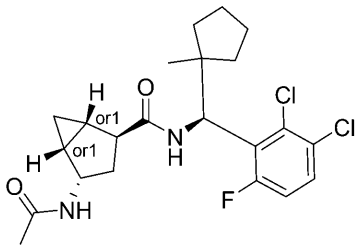
【表１－７３８】

I-2425		(400 MHz, DMSO-d6) 8.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.71-7.58 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.07 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 3.02 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.71-1.59 (m, 10H), 1.48-1.40 (m, 2H), 1.31 (dd, J = 13.5, 6.7 Hz, 2H), 1.24 (dt, J = 9.0, 4.6 Hz, 1H), 1.00 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 0.46 (td, J = 8.2, 5.2 Hz, 1H), 0.10 (q, J = 4.3 Hz, 1H).	441.05	A	B
I-2426		(400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.55 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.16-4.08 (m, 1H), 3.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.74 (s, 3H), 1.73-1.66 (m, 1H), 1.63-1.52 (m, 6H), 1.48 (d, J = 14.6 Hz, 1H), 1.42-1.35 (m, 1H), 1.32-1.25 (m, 1H), 1.20 (ddt, J = 12.4, 8.8, 4.9 Hz, 2H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 0.42 (td, J = 8.2, 5.2 Hz, 1H), 0.09 (q, J = 4.3 Hz, 1H).	441.05	C	

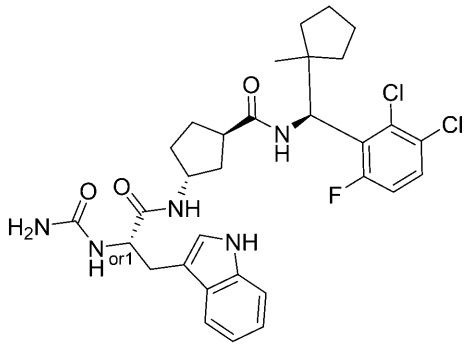
【表１－７３９】

I-2427		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.06 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 6.55 (dt, J = 6.9, 2.8 Hz, 3H), 5.68 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.83 - 3.41 (m, 1H), 2.95 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.89 (dt, J = 13.6, 7.1 Hz, 1H), 1.84 - 1.71 (m, 2H), 1.66 - 1.49 (m, 7H), 1.39 (tq, J = 13.0, 5.2, 4.2 Hz, 3H), 1.28 (d, J = 6.8 Hz, 4H), 1.09 - 0.82 (m, 3H).	534.25	B	
I-2428		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.71-7.58 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.07 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 3.02 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.71-1.59 (m, 10H), 1.48-1.40 (m, 2H), 1.31 (dd, J = 13.5, 6.7 Hz, 2H), 1.24 (dt, J = 9.0, 4.6 Hz, 1H), 1.00 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 0.46 (td, J = 8.2, 5.2 Hz, 1H), 0.10 (q, J = 4.3 Hz, 1H).	441.05	A	B

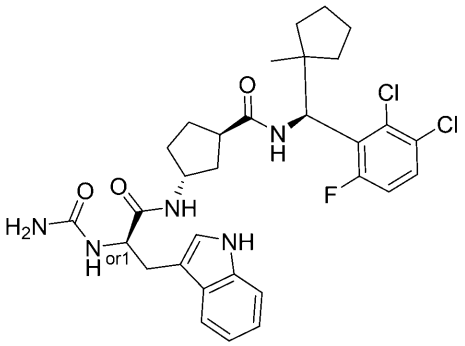
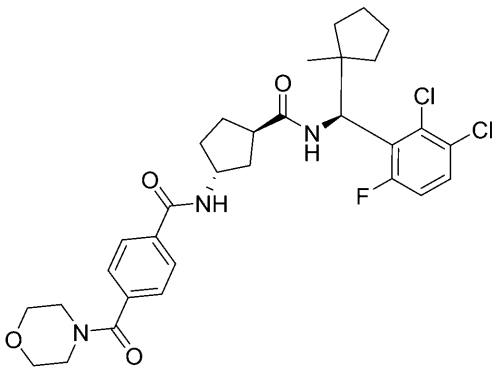
【表１－７４０】

I-2429		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.55 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.16-4.08 (m, 1H), 3.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.74 (s, 3H), 1.73-1.66 (m, 1H), 1.63-1.52 (m, 6H), 1.48 (d, J = 14.6 Hz, 1H), 1.42-1.35 (m, 1H), 1.32-1.25 (m, 1H), 1.20 (ddt, J = 12.4, 8.8, 4.9 Hz, 2H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 0.42 (td, J = 8.2, 5.2 Hz, 1H), 0.09 (q, J = 4.3 Hz, 1H).	441.05	C	

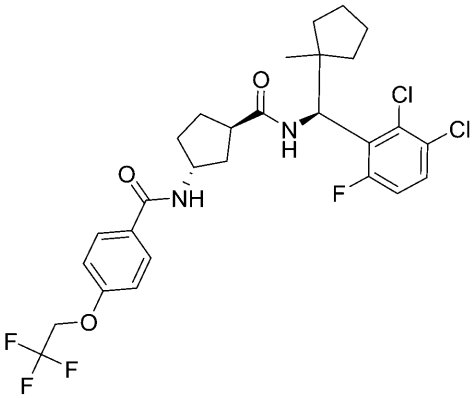
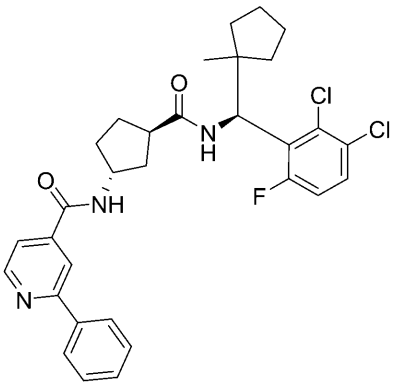
【表１－７４１】

I-2430		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.78 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.35 - 7.18 (m, 2H), 7.10 - 7.01 (m, 2H), 6.99 - 6.91 (m, 1H), 6.13 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 3H), 4.38 - 4.29 (m, 1H), 3.98 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 2.93 (qd, J = 14.4, 6.7 Hz, 3H), 1.86 (dt, J = 13.7, 7.2 Hz, 1H), 1.70 (dt, J = 10.1, 5.1 Hz, 2H), 1.59 (d, J = 7.1 Hz, 7H), 1.46 - 1.32 (m, 2H), 1.31 - 1.14 (m, 2H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	616.3	A	B

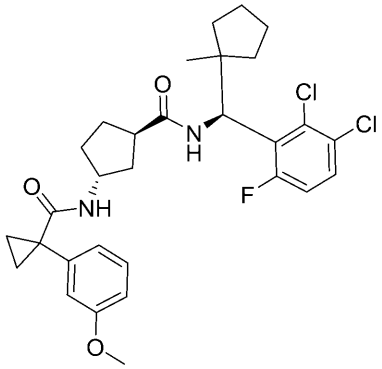
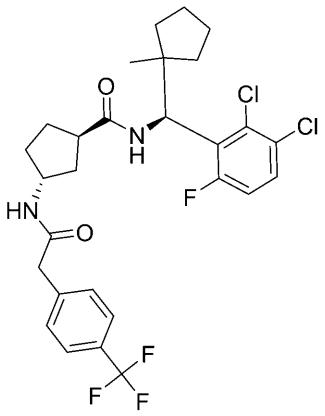
【表１－７４２】

I-2431		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.79 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.13 - 7.91 (m, 1H), 7.83 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.33 - 7.21 (m, 2H), 7.10 - 6.99 (m, 2H), 6.98 - 6.88 (m, 1H), 6.11 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.64 - 5.29 (m, 3H), 4.35 (q, J = 7.3 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 3.02 - 2.82 (m, 3H), 1.89 - 1.71 (m, 3H), 1.61 (t, J = 5.0 Hz, 6H), 1.50 - 1.32 (m, 4H), 1.27 (dd, J = 11.6, 7.0 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	616.3	A	D
I-2432		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.34 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.52 - 7.44 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.28 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 3.60 (d, J = 32.4 Hz, 6H), 3.32 - 3.21 (m, 2H), 3.06 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.03 - 1.75 (m, 4H), 1.67 - 1.44 (m, 8H), 1.43 - 1.22 (m, 2H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	604.3	A	B

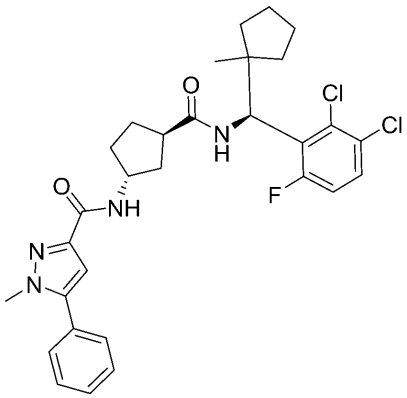
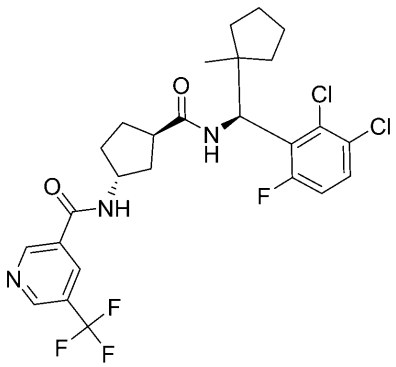
【表１－７４３】

I-2433		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.91 - 7.82 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.18 - 7.07 (m, 2H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.84 (q, J = 8.9 Hz, 2H), 4.25 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.07 - 1.75 (m, 4H), 1.69 - 1.44 (m, 8H), 1.39 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 1.27 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	589.15	A	C
I-2434		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.83- 8.77 (m, 1H), 8.65 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.19 -8.12 (m, 2H), 8.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 5.1, 1.5 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.58 - 7.46 (m, 3H), 7.27 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.31 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.15 - 1.78 (m, 4H), 1.61 (s, 8H), 1.39 (s, 1H), 1.26 (d, J = 14.3 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	568.3	B	

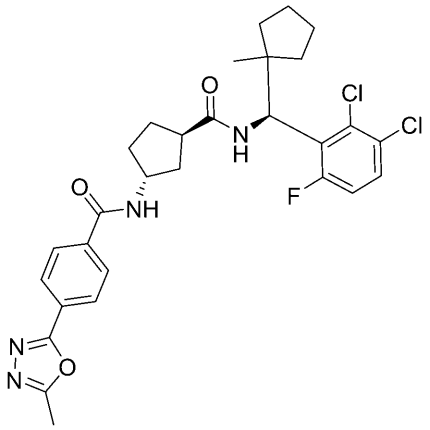
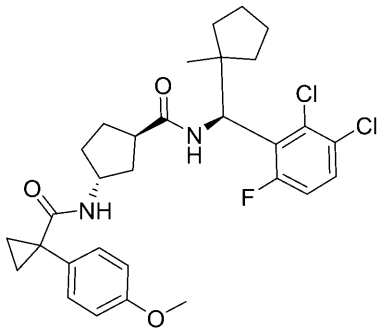
【表１－７４４】

I-2435		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.31 - 7.19 (m, 2H), 6.90 (dt, J = 7.6, 1.3 Hz, 1H), 6.85 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 2H), 6.47 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.05 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 2.90 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.85 (dt, J = 13.6, 7.1 Hz, 1H), 1.78 - 1.65 (m, 2H), 1.59 (s, 7H), 1.49 - 1.23 (m, 6H), 1.01 - 0.91 (m, 5H).	561.3	D	
I-2436		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.26 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.06-3.98 (m, 1H), 3.49 (s, 2H), 3.04- 2.95 (m, 1H), 1.90 (dt, J = 13.7, 7.3 Hz, 1H), 1.82 (s,23H), 1.60 (s, 7H), 1.41 (dd, J = 31.4, 7.9 Hz, 1H), 1.40 (s, 2H), 1.26 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	573.1	B	

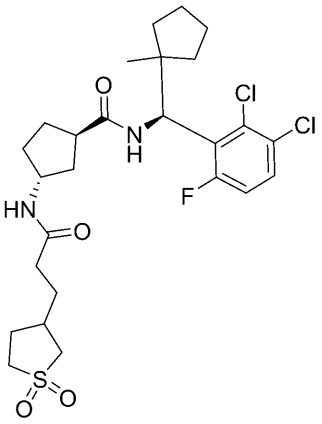
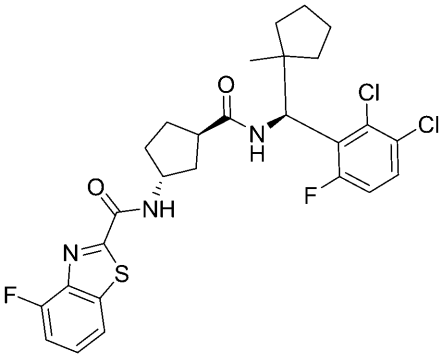
【表１－７４５】

I-2437		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.66-7.43 (m, 6H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.77 (s, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.27 (dt, J = 15.3, 7.5 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.06 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.92 (dq, J = 15.3, 7.5 Hz, 1H), 1.86 (s, 3H), 1.61 (s, 7H), 1.53-1.42 (m, 1H), 1.39 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	571.3	B	
I-2438		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.28 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 9.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.35 - 6.94 (m, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.30 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.08 - 1.75 (m, 4H), 1.70 - 1.45 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	560.2	A	B

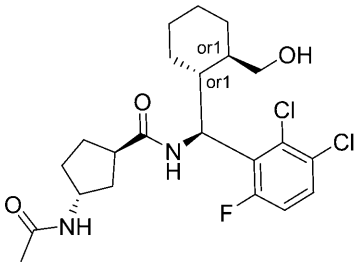
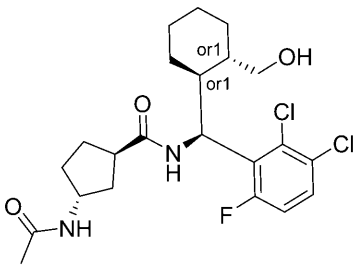
【表１－７４６】

I-2439		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.10 - 8.00 (m, 5H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.29 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.61 (s, 3H), 2.08 - 1.78 (m, 4H), 1.70- 1.45 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	573.3	A	B
I-2440		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.35 - 7.19 (m, 3H), 6.91 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 6.25 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 5.46 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.04 (q, J = 7.3 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 2.92 - 2.84 (m, 1H), 1.84 (dt, J = 13.6, 7.2 Hz, 1H), 1.78 - 1.63 (m, 1H), 1.62 - 1.47 (m, 7H), 1.36 (dd, J = 13.2, 5.6 Hz, 2H), 1.27 (dd, J = 13.0, 4.7 Hz, 5H), 0.95 (d, J = 2.7 Hz, 3H), 0.94 - 0.84 (m, 2H).	561.3	C	

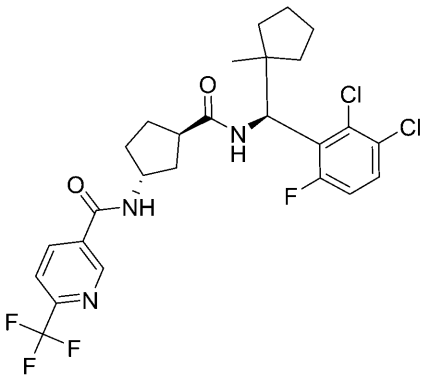
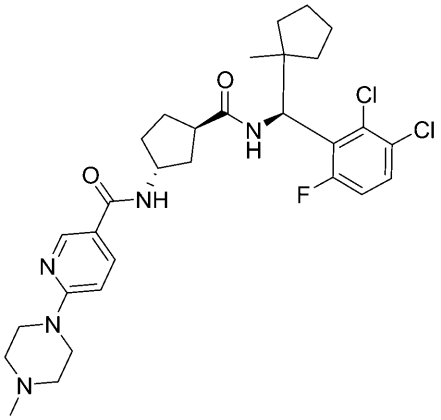
【表１－７４７】

I-2441		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.03 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.02 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.21 (ddd, J = 21.3, 11.8, 7.0 Hz, 2H), 3.09 - 2.93 (m, 2H), 2.68 (dd, J = 13.0, 10.3 Hz, 1H), 2.26 (qd, J = 12.3, 11.5, 6.5 Hz, 2H), 2.08 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 1.88 (dt, J = 19.4, 6.5 Hz, 2H), 1.80 (p, J = 4.8 Hz, 1H), 1.67 (s, 2H), 1.69 - 1.58 (m, 8H), 1.42 (s, 1H), 1.37 (dd, J = 12.1, 6.2 Hz, 2H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	561.25	A	
I-2442		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.05 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.14 - 8.02 (m, 2H), 7.61 (ddd, J = 10.8, 5.3, 3.3 Hz, 2H), 7.53 - 7.44 (m, 1H), 7.27 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.33 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.03 - 1.96 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.95 - 1.86 (m, 1H), 1.79 - 1.68 (m, 1H), 1.61 (s, 6H), 1.39 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	566.2	B	

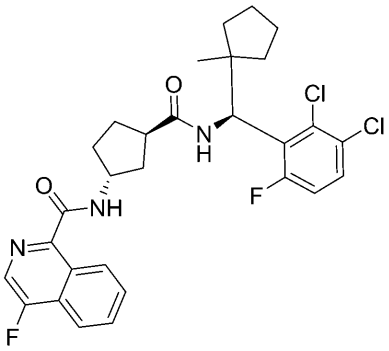
【表１－７４８】

I-2443		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.1, 8.9 Hz, 1H), 5.38 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 4.47 (t, J = 5.2 Hz, 1H), 4.01 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.48 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.78 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.11 - 2.06 (m, 1H), 1.91 - 1.71 (m, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.59 (ddt, J = 18.7, 10.0, 4.8 Hz, 1H), 1.53 (s, 4H), 1.51 - 1.42 (m, 1H), 1.31 (dd, J = 11.4, 6.4 Hz, 1H), 1.26 - 1.14 (m, 1H), 1.20 (s, 3H), 0.78 - 0.70 (m, 1H).	459.2	D	
I-2444		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.66 (dd, J = 8.4, 5.9 Hz, 1H), 4.36 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.44 (dt, J = 9.3, 4.4 Hz, 1H), 3.33 - 3.25 (m, 1H), 2.93 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.91 - 1.78 (m, 5H), 1.77 (s, 3H), 1.74 - 1.54 (m, 3H), 1.53 - 1.31 (m, 1H), 1.42 (s, 1H), 1.30 - 1.14 (m, 2H), 1.11 (d, J = 11.4 Hz, 4H).	459.2	D	

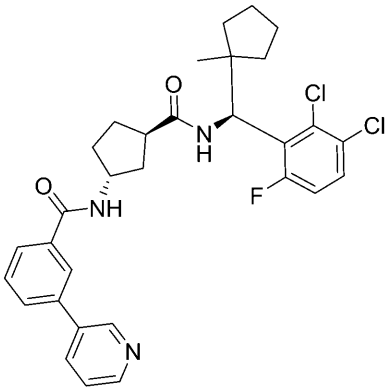
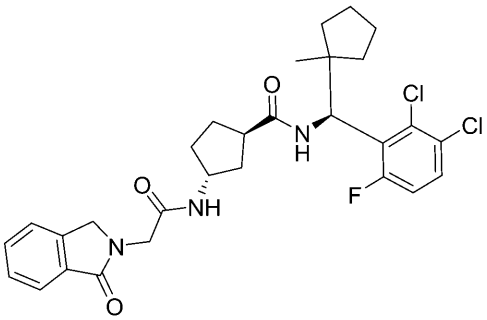
【表１－７４９】

I-2445		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.13 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.45 (dd, J = 8.2, 2.2 Hz, 1H), 8.06 (dd, J = 10.4, 8.3 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.29 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.08 - 1.73 (m, 4H), 1.70 - 1.44 (m, 8H), 1.39 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	560.2	A	A
I-2446		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.22 - 7.88 (m, 3H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.23 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 3.58 (t, J = 5.1 Hz, 4H), 3.04 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.38 (t, J = 5.1 Hz, 4H), 2.21 (s, 3H), 2.05 - 1.73 (m, 4H), 1.69 - 1.45 (m, 8H), 1.41 (d, J = 21.2 Hz, 1H), 1.26 (d, J = 12.8 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	590.25	A	B

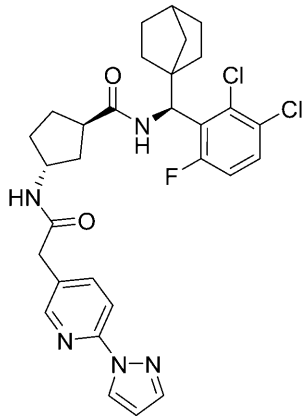
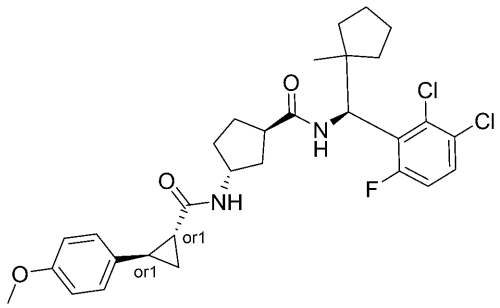
【表１－７５０】

I-2447		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.00 - 8.88 (m, 1H), 8.68 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.97 (ddd, J = 8.3, 6.9, 1.2 Hz, 1H), 7.86 (ddd, J = 8.4, 6.9, 1.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.38 (h, J = 6.9 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.13 - 1.93 (m, 2H), 1.94 - 1.81 (m, 2H), 1.71 - 1.46 (m, 8H), 1.40 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	560.25	D	

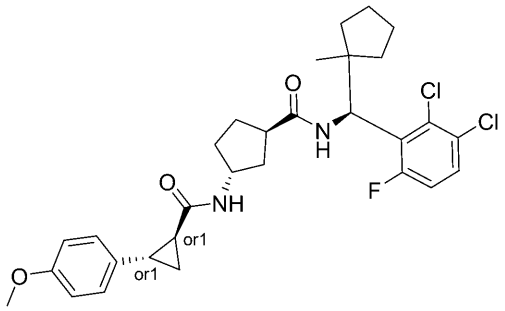
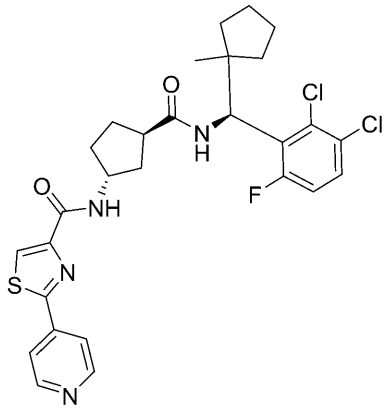
【表１－７５１】

I-2448		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.22 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.84 (dd, J = 5.4, 1.4 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.24 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.98 (tt, J = 5.5, 1.8 Hz, 3H), 7.71 - 7.58 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.31 (p, J = 7.0 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.10 - 1.75 (m, 4H), 1.61 (s, 6H), 1.58 - 1.45 (m, 2H), 1.39 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	568.3	A	B
I-2449		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.13 -7.94 (m, 2H), 7.73 - 7.67 (m, 1H), 7.67 - 7.55 (m, 3H), 7.50 (ddd, J = 8.2, 5.7, 2.8 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.52 (s, 2H), 4.07 (dt, J = 13.4, 6.4 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.86 (ddt, J = 33.3, 13.2, 6.4 Hz, 3H), 1.73 - 1.50 (m, 7H), 1.49 - 1.32 (m, 3H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	560.3	A	A

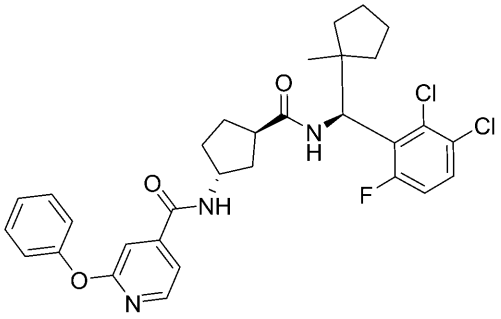
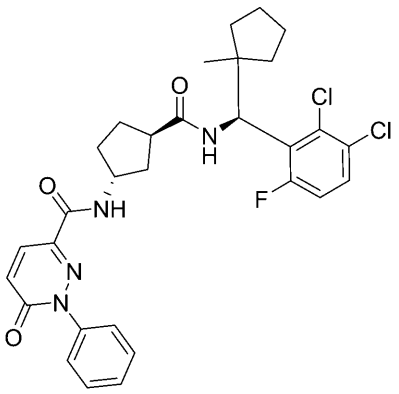
【表１－７５２】

I-2450		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.60 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.11 (d, J = 9.3 Hz, 2H), 7.92-7.83 (m, 2H), 7.82 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.1, 5.0 Hz, 1H), 7.30-7.20 (m, 1H), 6.60-6.55 (m, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.03 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 3.47 (s, 2H), 2.99 (s, 1H), 2.32 (s, 1H), 2.14 (s, 1H), 1.87- 1.80 (m, 2H), 1.55 (s, 1H), 1.37 (s, 9H), 1.33 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 1.24 (t, J = 9.9 Hz, 2H).	584.3	A	
I-2451		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 - 8.01 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 7.08 - 6.99 (m, 2H), 6.88 - 6.80 (m, 2H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.06 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.97 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.18 (ddd, J = 9.4, 6.1, 4.1 Hz, 1H), 1.92 - 1.72 (m, 4H), 1.71 - 1.48 (m, 7H), 1.50 - 1.33 (m, 3H), 1.31 - 1.22 (m, 2H), 1.08 (ddd, J = 8.2, 6.1, 3.9 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	561.15	A	

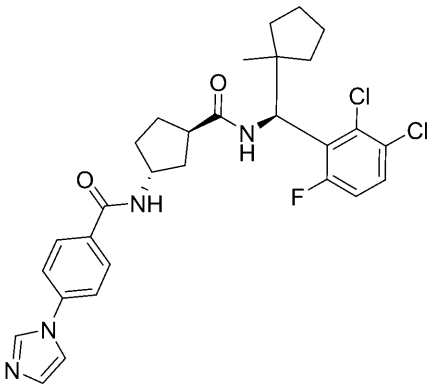
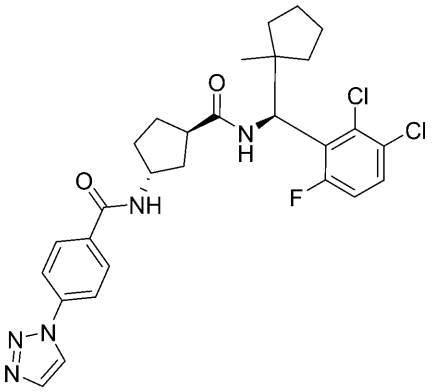
【表１－７５３】

I-2452		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (dd, J = 15.8, 7.8 Hz, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 7.07 - 7.00 (m, 2H), 6.88 - 6.79 (m, 2H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.06 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 3.71 (s, 3H), 2.97 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.16 (ddd, J = 9.6, 6.1, 4.1 Hz, 1H), 1.93 - 1.71 (m, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.41 (dt, J = 18.5, 7.2 Hz, 3H), 1.27 (tt, J = 10.3, 4.8 Hz, 2H), 1.09 (ddd, J = 8.2, 6.1, 3.9 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	561.15	B	
I-2453		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.80-8.74 (m, 2H), 8.45 (s, 1H), 8.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.14-8.02 (m,3H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.32 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.10 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.06-1.82 (m, 4H), 1.68 (q, J = 6.4, 4.8 Hz, 1H), 1.63-1.58 (m, 6H), 1.51 (dd, J = 12.7, 7.9 Hz, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 14.1 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	575.1	A	

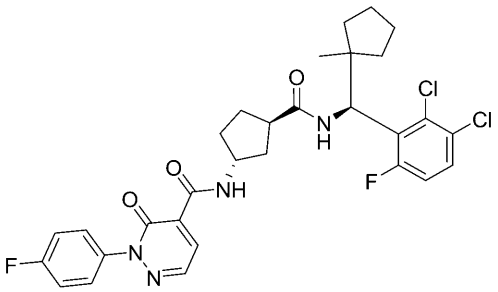
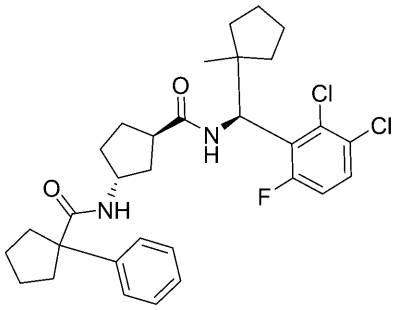
【表１－７５４】

I-2454		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.58 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 15.8, 8.0 Hz, 3H), 7.31-7.19 (m, 2H), 7.14 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.27 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.54-2.47 (m, 2H), 2.04-1.75 (m, 2H), 1.65-1.43 (m, 8H), 1.39 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 1.27 (t, J = 5.5 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	584.15	A	
I-2455		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.26 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.68-7.61 (m, 2H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.59-7.50 (m, 2H), 7.50-7.43 (m, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (h, J = 7.3 Hz, 1H), 3.08-2.96 (m, 1H), 2.01-1.73 (m, 4H), 1.59 (t, J = 5.7 Hz, 7H), 1.49-1.38 (m, 1H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	585.15	A	

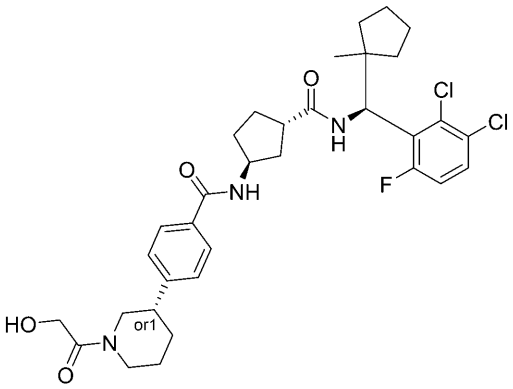
【表１－７５５】

I-2456		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.43 - 8.28 (m, 2H), 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.03 - 7.96 (m, 2H), 7.86 (t, J = 1.5 Hz, 1H), 7.82 - 7.74 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.29 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.05 - 1.77 (m, 4H), 1.73 - 1.44 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	557.15	A	B
I-2457		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.94 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.11 - 8.00 (m, 6H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.29 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 3.08 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 2.06 - 1.80 (m, 4H), 1.64 - 1.57 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 15.1 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	558.1	A	A

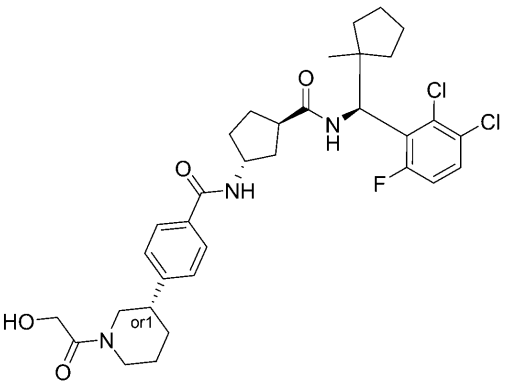
【表１－７５６】

I-2458		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.44 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.51 - 8.12 (m, 3H), 7.62 (ddt, J = 8.9, 6.5, 4.3 Hz, 3H), 7.54 - 7.34 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.31 (p, J = 6.2, 5.6 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.08 (s, 1H), 2.05 - 1.89 (m, 2H), 1.89 - 1.70 (m, 2H), 1.59 (s, 5H), 1.55 - 1.42 (m, 2H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	603.25	D	
I-2459		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.97 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.36 - 7.20 (m, 5H), 7.23 - 7.14 (m, 2H), 5.46 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.99 (p, J = 7.0 Hz, 1H), 2.99 - 2.88 (m, 1H), 1.73 (dtt, J = 15.6, 10.1, 6.0 Hz, 5H), 1.66 - 1.48 (m, 11H), 1.41 - 1.21 (m, 4H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	559.15	D	

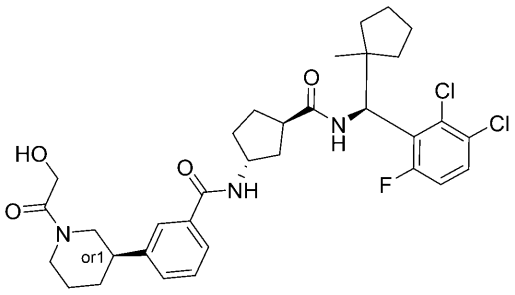
【表１－７５７】

I-2460		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.30 - 8.15 (m, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 11.4, 8.0 Hz, 2H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.54 (s, 1H), 4.47 - 4.34 (m, 1H), 4.26 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 4.20 - 4.02 (m, 2H), 3.70 (t, J = 13.6 Hz, 1H), 3.12 - 2.96 (m, 2H), 2.77 (td, J = 12.1, 7.2 Hz, 1H), 2.70 - 2.60 (m, 1H), 2.02 - 1.83 (m, 4H), 1.83 - 1.67 (m, 3H), 1.67 - 1.41 (m, 9H), 1.39 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 1.27 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	632.35	A	B

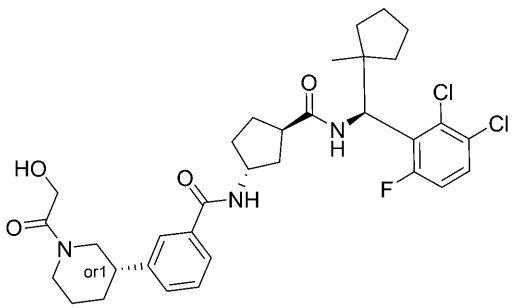
【表１－７５８】

I-2461		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.42 - 8.14 (m, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 11.3, 7.9 Hz, 2H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.54 (s, 1H), 4.40 (dd, J = 21.3, 12.3 Hz, 1H), 4.26 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 4.10 (dd, J = 21.6, 8.1 Hz, 2H), 3.70 (t, J = 13.7 Hz, 1H), 3.13 - 2.96 (m, 2H), 2.83 - 2.72 (m, 1H), 2.63 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 2.02 - 1.85 (m, 4H), 1.79 (dt, J = 21.7, 7.6 Hz, 3H), 1.64 - 1.36 (m, 10H), 1.28 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	632.35	A	B

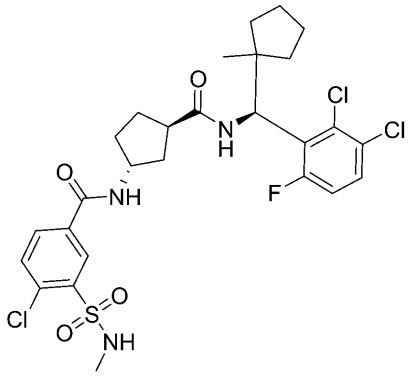
【表１－７５９】

I-2462		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.72 (t, J = 9.1 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.41 (q, J = 9.4, 7.6 Hz, 2H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.53 (dt, J = 10.4, 5.4 Hz, 1H), 4.43 (t, J = 12.1 Hz, 1H), 4.26 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 4.20-4.03 (m, 2H), 3.71 (t, J = 14.8 Hz, 1H), 3.08 (s, 1H), 3.06-2.96 (m, 1H), 2.74 (t, J = 12.1 Hz, 2H), 1.94 (s, 4H), 1.60 (s, 6H), 1.58-1.42 (m, 3H), 1.39 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	632.2	A	B

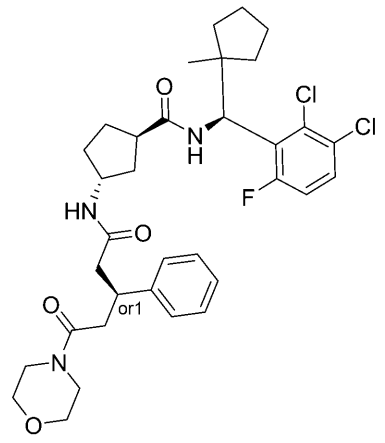
【表１－７６０】

I-2463		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.77-7.68 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.41 (q, J = 9.2, 7.6 Hz, 2H), 7.27 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.53 (dt, J = 10.4, 5.3 Hz, 1H), 4.43 (t, J = 12.7 Hz, 1H), 4.26 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 4.21-4.03 (m, 2H), 3.71 (t, J = 14.9 Hz, 1H), 3.14-2.96 (m, 2H), 2.74 (t, J = 12.1 Hz, 1H), 2.63 (d, J = 12.7 Hz, 1H), 1.94 (s, 4H), 1.93-1.82 (m, 3H), 1.82-1.75 (m, 3H), 1.60 (s, 6H), 1.38 (s, 1H), 1.28 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	632.3	A	B

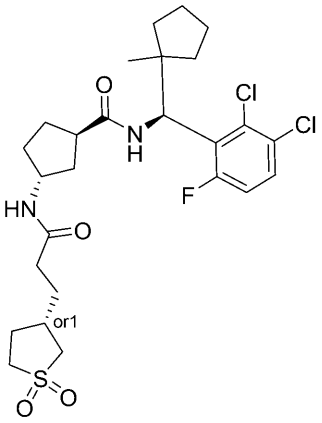
【表１－７６１】

I-2464		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.63 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.40 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.23 - 8.04 (m, 2H), 7.93 - 7.75 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.27 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.48 (s, 2H), 2.05 - 1.76 (m, 4H), 1.74 - 1.44 (m, 8H), 1.38 (dd, J = 8.9, 4.6 Hz, 1H), 1.27 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	620.2	A	A

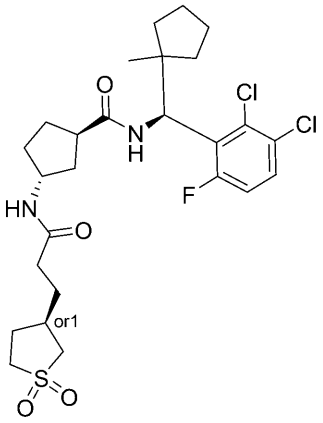
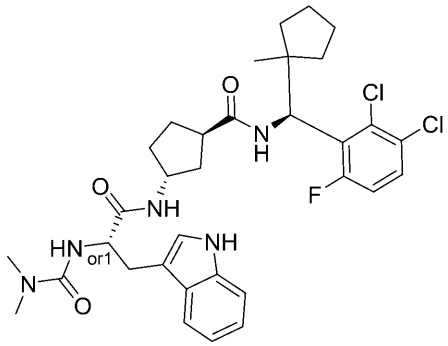
【表１－７６２】

I-2465		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.66 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.30 - 7.12 (m, 6H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.92 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.54 - 3.42 (m, 3H), 3.37 (dd, J = 10.5, 5.4 Hz, 3H), 3.29 (td, J = 7.6, 7.1, 3.2 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.71 - 2.55 (m, 2H), 2.43 (dd, J = 14.2, 7.2 Hz, 1H), 2.35 (dd, J = 14.2, 7.9 Hz, 1H), 1.82 (dt, J = 13.6, 7.1 Hz, 1H), 1.70 (s, 1H), 1.69 (dq, J = 11.0, 5.5 Hz, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.54 (s, 1H), 1.37 (p, J = 7.7, 7.2 Hz, 2H), 1.27 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 1.14 (dt, J = 13.6, 7.1 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.	646.4	A	A

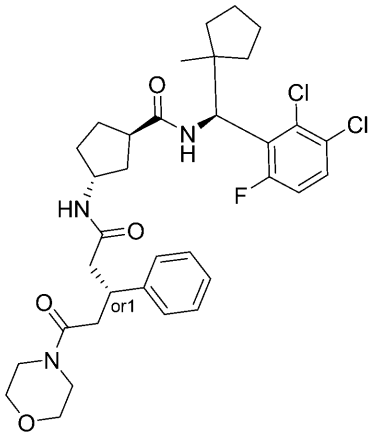
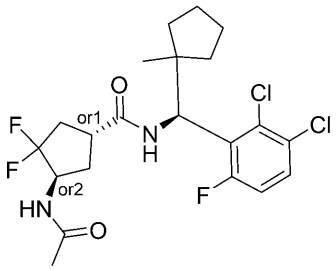
【表１－７６３】

I-2466		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.30 - 7.21 (m, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.01 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.28 - 3.13 (m, 2H), 3.10 - 2.86 (m, 2H), 2.68 (dd, J = 13.1, 10.4 Hz, 1H), 2.33 - 2.18 (m, 2H), 2.08 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 1.87 (ddd, J = 16.5, 11.3, 5.9 Hz, 2H), 1.83 - 1.74 (m, 1H), 1.70 (ddd, J = 10.8, 8.5, 2.7 Hz, 1H), 1.69 - 1.63 (m, 2H), 1.61 (d, J = 8.8 Hz, 7H), 1.46 - 1.32 (m, 3H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	561.25	A	B

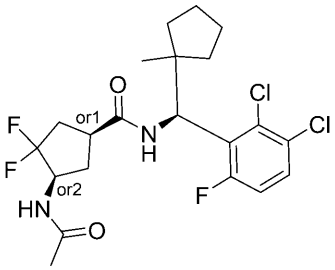
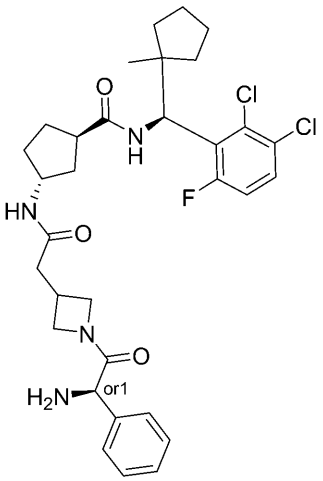
【表１－７６４】

I-2467		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.01 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.28 - 3.13 (m, 2H), 3.09 - 2.88 (m, 2H), 2.68 (dd, J = 13.0, 10.3 Hz, 1H), 2.34 - 2.18 (m, 2H), 2.08 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 1.94 - 1.62 (m, 4H), 1.62 (s, 3H), 1.60 (s, 4H), 1.60 - 1.54 (m, 2H), 1.40 (dq, J = 18.3, 6.7, 5.4 Hz, 3H), 1.28 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	561.3	A	B
I-2468		1H NMR (400 MHz, Methanol-d4) 7.97 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.17 - 7.07 (m, 3H), 7.03 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 5.70 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 4.43 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 4.16 - 4.06 (m, 1H), 3.24 - 3.10 (m, 2H), 2.87 (s, 6H), 1.99 (dq, J = 14.7, 7.7, 6.9 Hz, 1H), 1.72 (d, J = 13.3 Hz, 9H), 1.51 (dt, J = 21.5, 7.4 Hz, 2H), 1.31 (s, 2H), 1.21 (dt, J = 12.9, 7.0 Hz, 1H), 1.04 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	644.2	A	B

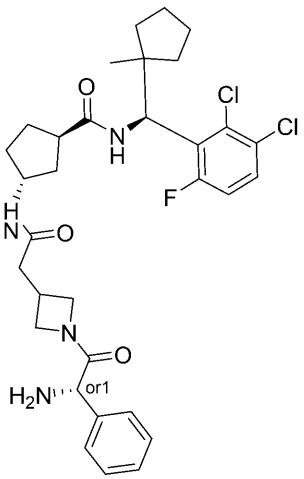
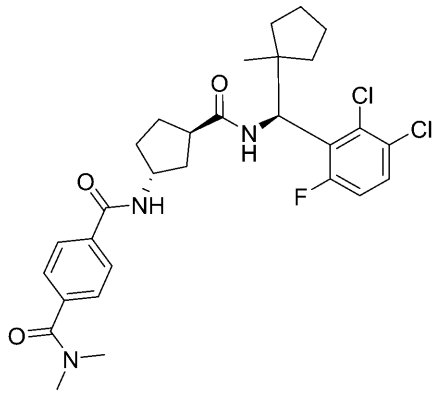
【表１－７６５】

I-2469		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.96 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.30 - 7.19 (m, 5H), 7.19 - 7.11 (m, 1H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.93 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.47 (q, J = 9.3, 8.2 Hz, 3H), 3.40 - 3.22 (m, 6H), 2.88 (h, J = 7.3, 6.8 Hz, 1H), 2.71 - 2.55 (m, 2H), 2.44 (dd, J = 14.2, 7.5 Hz, 1H), 2.34 (dd, J = 14.1, 7.7 Hz, 1H), 1.75 (h, J = 6.3 Hz, 3H), 1.60 (s, 6H), 1.38 (s, 3H), 1.25 (s, 2H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	646.4	A	B
I-2470		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.47 (dp, J = 18.0, 8.9 Hz, 1H), 3.14 (dtd, J = 12.5, 9.0, 8.1, 3.5 Hz, 1H), 2.25 (q, J = 3.9, 3.3 Hz, 1H), 2.24-2.12 (m, 1H), 1.97 (ddd, J = 12.5, 8.5, 3.6 Hz, 1H), 1.86 (s, 3H), 1.85-1.78 (m, 1H), 1.61 (s, 6H), 1.42-1.35 (m, 1H), 1.31-1.24 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	465.1	A	A

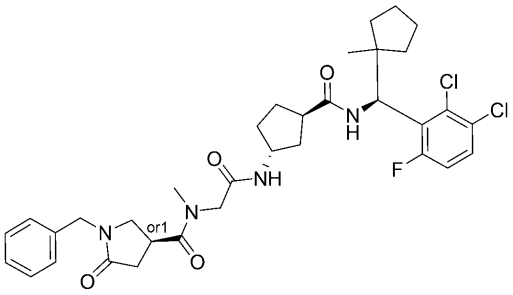
【表１－７６６】

I-2471		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.66-7.58 (m, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.38 (dq, J = 17.8, 8.9 Hz, 1H), 3.19-3.09 (m, 1H), 2.39-2.26 (m, 2H), 1.83 (s, 3H), 1.77 (dt, J = 13.2, 8.9 Hz, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.39 (s, 1H), 1.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	465.05	A	B
I-2472		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09- 8.01 (m, 1H), 7.82 (dd, J = 23.4, 6.9 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 4.7 Hz, 4H), 7.32-7.21 (m, 2H), 5.48 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.48-4.34 (m, 1H), 3.99 (q, J = 10.1, 8.8 Hz, 2H), 3.96-3.81 (m, 1H), 3.52 (ddd, J = 33.1, 9.8, 5.7 Hz, 1H), 2.96 (s, 1H), 2.76- 2.68 (m, 1H), 2.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 2.25 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 1.94-1.76 (m, 1H), 1.80 (s, 2H), 1.60 (s, 7H), 1.39 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.27 (s, 2H), 0.97 (t, J = 2.7 Hz, 3H).	617.15	A	B

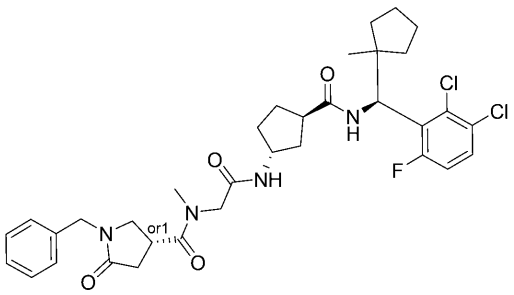
【表１－７６７】

I-2473		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (dd, J = 8.6, 5.0 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 22.5, 7.0 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 4.8 Hz, 4H), 7.32-7.21 (m, 2H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.40 (dd, J = 20.1, 9.3 Hz, 1H), 3.99 (s, 1H), 3.97-3.82 (m, 2H), 3.60-3.43 (m, 1H), 2.97 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.37 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 2.25 (dd, J = 7.7, 2.9 Hz, 1H), 1.86 (tt, J = 15.1, 7.6 Hz, 1H), 1.78 (s, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.42-1.34 (m, 2H), 1.28 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	617.2	A	B
I-2474		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.34 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.92 - 7.86 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.51 - 7.44 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.27 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 3.07 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 3.00 (s, 3H), 2.89 (s, 3H), 1.91 (s, 2H), 2.03 - 1.76 (m, 2H), 1.63 - 1.43 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	562.3	A	B

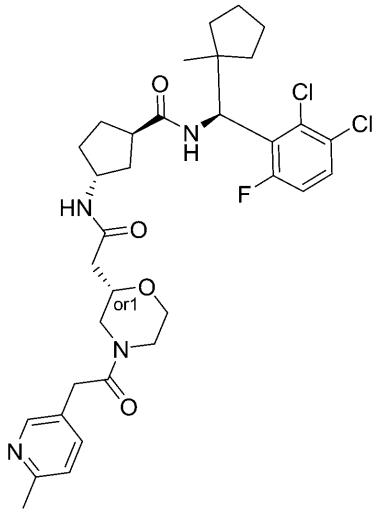
【表１－７６８】

I-2475		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 - 7.97 (m, 1H), 7.81 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 9.0, 5.1, 1.9 Hz, 1H), 7.39 - 7.19 (m, 6H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.45 - 4.31 (m, 2H), 4.05 - 3.79 (m, 3H), 3.63 (tt, J = 9.3, 6.1 Hz, 1H), 3.46 (q, J = 8.6, 7.8 Hz, 1H), 2.97 (s, 3H), 2.78 (s, 1H), 2.62 (dd, J = 16.8, 9.7 Hz, 2H), 2.49 (s, 1H), 1.98 - 1.76 (m, 3H), 1.60 (s, 6H), 1.58 (s, 1H), 1.39 (tt, J = 14.0, 7.8 Hz, 3H), 1.30 - 1.24 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	659.35	A	B

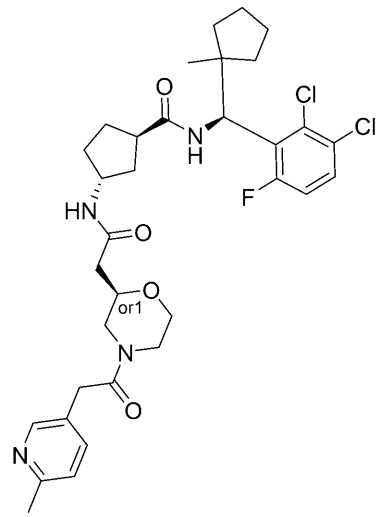
【表１－７６９】

I-2476		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 - 7.98 (m, 1H), 7.81 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 9.0, 5.1, 1.3 Hz, 1H), 7.34 (td, J = 7.1, 1.5 Hz, 2H), 7.31 - 7.18 (m, 4H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.45 - 4.29 (m, 2H), 4.08 - 3.98 (m, 1H), 4.01 - 3.84 (m, 1H), 3.63 (tt, J = 9.5, 6.1 Hz, 1H), 3.46 (td, J = 8.7, 8.2, 5.5 Hz, 1H), 3.40 - 3.29 (m, 1H), 3.39 - 3.35 (m, 1H), 2.99 (s, 1H), 2.97 (s, 2H), 2.77 (s, 1H), 2.68 - 2.48 (m, 2H), 1.99 - 1.74 (m, 3H), 1.60 (s, 6H), 1.67 - 1.52 (m, 1H), 1.48 - 1.31 (m, 3H), 1.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 1.00 - 0.94 (m, 3H).	659.35	A	B

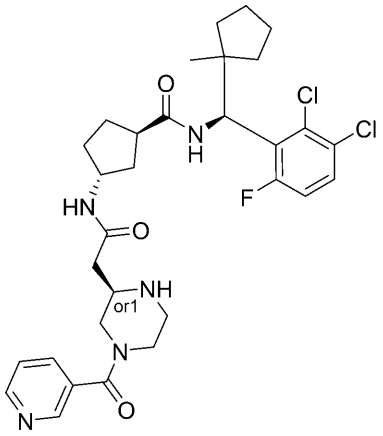
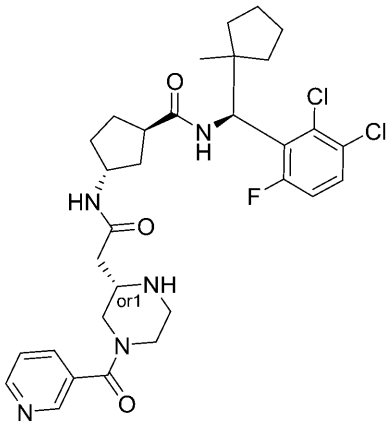
【表１－７７０】

I-2477		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.88-7.81 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.49 (dd, J = 7.9, 2.4 Hz, 1H), 7.25 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 8.1, 2.4 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.19 (dd, J = 62.2, 13.2 Hz, 1H), 3.95 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 15.2 Hz, 1H), 3.75 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 3.71-3.62 (m, 2H), 3.60 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.11 (t, J = 12.1 Hz, 1H), 2.96-2.87 (m, 1H), 2.73 (t, J = 11.7 Hz, 1H), 2.43 (s, 4H), 2.33-2.16 (m, 2H), 1.96-1.68 (m, 3H) , 1.60 (s, 7H), 1.38 (s, 2H), 1.26 (s, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	647.2	A	B

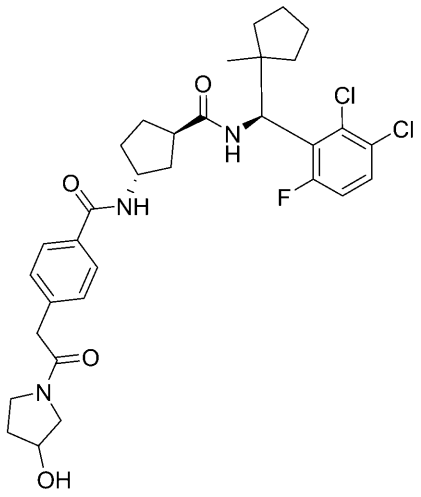
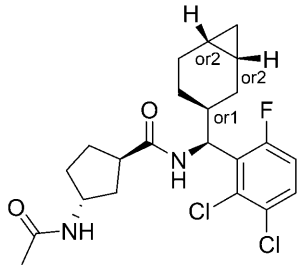
【表１－７７１】

I-2478		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.09-8.00 (m, 1H), 7.88-7.81 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz,1H), 7.49 (dd, J = 8.0, 2.3 Hz, 1H), 7.25 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 7.9, 2.4 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.19 (dd, J = 64.0, 13.1 Hz, 1H), 3.96 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 15.4 Hz, 1H), 3.79 (s, 1H), 3.75 (d, J = 15.7 Hz, 1H), 3.68 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.59 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 3.11 (t, J = 12.0 Hz, 1H), 2.97-2.87 (m, 1H), 2.73 (t, J = 12.4 Hz, 1H), 2.43 (s, 4H), 2.24 (h, J = 7.6, 7.0 Hz, 2H), 1.96-1.72 (m,3H), 1.59 (s, 7H), 1.42 (dt, J = 19.1, 6.6 Hz, 1H),	647.2	A	B

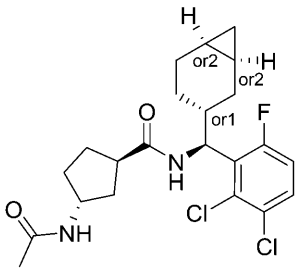
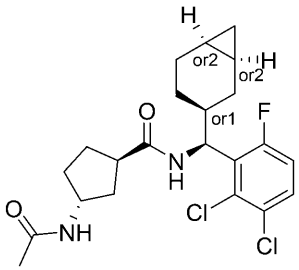
【表１－７７２】

I-2479		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.93 - 8.51 (m, 2H), 8.19 - 7.74 (m, 3H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.28 (d, J = 19.2 Hz, 1H), 4.05 (s, 1H), 3.89 (s, 1H), 2.88 (d, J = 49.4 Hz, 4H), 2.61 (d, J = 39.0 Hz, 2H), 2.21 (s, 1H), 2.08 (s, 1H), 1.84 (s, 2H), 1.59 (s, 9H), 1.37 (d, J = 9.2 Hz, 2H), 1.31 - 1.08 (m, 2H), 0.96 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	618.35	A	B
I-2480		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.62 (d, J = 13.0 Hz, 2H), 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 50.4 Hz, 2H), 7.61 (ddd, J = 9.0, 5.1, 1.6 Hz, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.25 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.29 (s, 1H), 4.05 (s, 1H), 3.91 (s, 1H), 3.12 - 2.80 (m, 4H), 2.66 (t, J = 11.6 Hz, 2H), 2.35 - 2.05 (m, 2H), 1.91 (d, J = 89.4 Hz, 4H), 1.48 (d, J = 81.9 Hz, 9H), 1.25 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 0.96 (s, 3H).	618.3	A	B

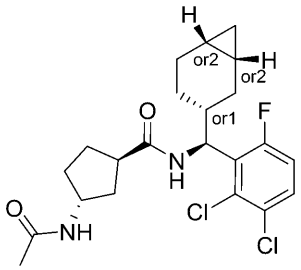
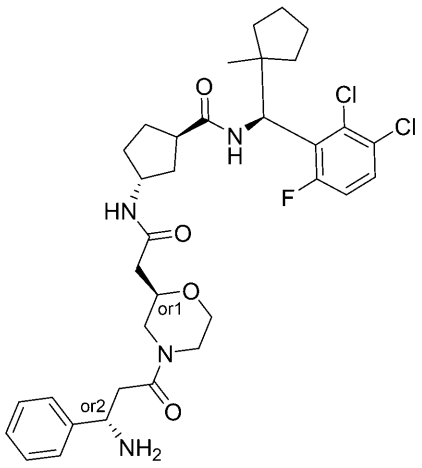
【表１－７７３】

I-2481		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.82 - 7.70 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.34 - 7.17 (m, 3H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.96 (dd, J = 41.8, 3.5 Hz, 1H), 4.26 (dq, J = 20.1, 7.0, 5.5 Hz, 2H), 3.67 (d, J = 16.2 Hz, 2H), 3.62 - 3.36 (m, 2H), 3.31 - 3.21 (m, 1H), 3.04 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.04 - 1.69 (m, 6H), 1.67 - 1.43 (m, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.25 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	618.35	A	B
I-2482		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (ddd, J = 10.4, 8.9, 1.5 Hz, 1H), 5.84-5.75 (m, 1H), 5.74-5.60 (m, 1H), 5.12-4.96 (m, 1H), 4.00 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.83 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.71 (s, 1H), 2.15 (s, 1H), 1.91-1.73 (m, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.67-1.52 (m, 1H), 1.47-1.33 (m, 1H), 1.33 (s, 4H), 1.24 (s, 1H), 0.94 (dd, J = 13.3, 7.1 Hz, 3H).	441.05	C	

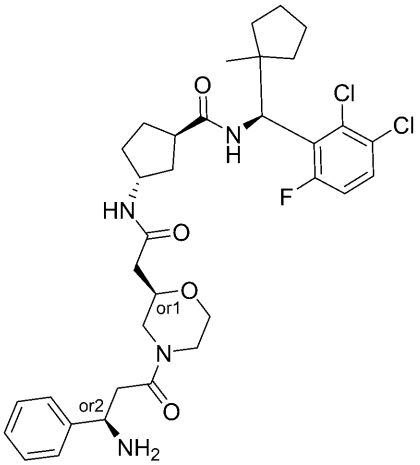
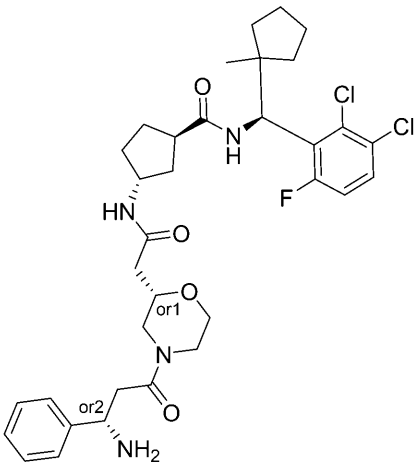
【表１－７７４】

I-2483		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.2, 8.9 Hz, 1H), 4.90 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 4.00 (p, J = 6.4 Hz, 1H), 2.83 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.47-2.38 (m, 1H), 1.81 (ddt, J = 19.8, 14.1, 8.2 Hz, 4H), 1.77 (s, 4H), 1.67-1.51 (m, 2H), 1.38 (ddt, J = 29.7, 12.4, 7.4 Hz, 2H), 1.09-0.97 (m, 1H), 0.86 (s, 3H), 0.91-0.74 (m, 1H), 0.53 (td, J = 8.8, 4.2 Hz, 1H).	441	B	
I-2484		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.31 (t, J = 12.6 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.61 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.28 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 5.57-5.48 (m, 1H), 5.09 (s, 1H), 4.93 (d, J = 10.2 Hz, 1H), 4.00 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 2.84 (s, 1H), 2.69 (s, 1H), 2.17 (s, 2H), 2.04 (s, 1H), 1.86 (s, 2H), 1.77 (s, 4H), 1.61 (s, 1H), 1.44 (s, 2H), 1.25 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 1.10 (d, J = 11.1 Hz, 1H), 0.94 (dd, J = 20.7, 7.0 Hz, 3H),	441.2	C	

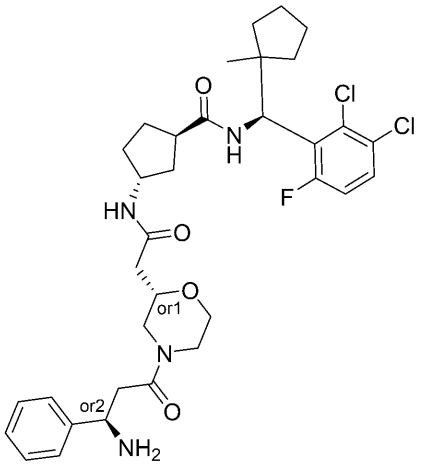
【表１－７７５】

I-2485		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.34 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.2, 8.9 Hz, 1H), 5.63-5.56 (m, 1H), 5.48 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 5.23 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.87 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.23 (s, 1H), 1.91-1.73 (m, 1H), 1.77 (s, 6H), 1.64 (dq, J = 18.2, 7.0, 6.2 Hz, 4H), 1.52-1.30 (m, 3H), 0.99 (d, J = 7.0 Hz, 3H).	441.15	A	B
I-2486		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.82 (dt, J = 13.0, 6.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.7 Hz, 4H), 7.37 - 7.18 (m, 2H), 5.49 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 4.28 (s, 1H), 4.02 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.79 (d, J = 14.1 Hz, 2H), 3.74 - 3.47 (m, 1H), 3.33 (s, 1H), 3.24 (t, J = 11.6 Hz, 2H), 2.97 (s, 1H), 2.90 - 2.73 (m, 2H), 2.73 - 2.63 (m, 3H), 2.40 - 1.74 (m, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.51 - 1.21 (m, 5H), 0.97 (d, J = 3.3 Hz, 3H).	661.4	A	B

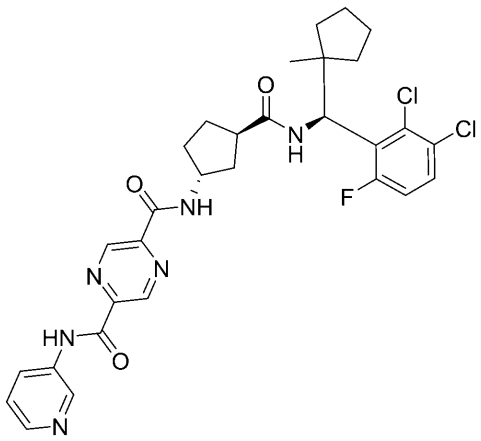
【表１－７７６】

I-2487		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.36 - 7.19 (m, 4H), 5.53 - 5.46 (m, 1H), 4.21 (dd, J = 56.8, 12.8 Hz, 2H), 4.01 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 3.80 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 3.70 - 3.43 (m, 2H), 3.30 (s, 2H), 3.15 - 2.90 (m, 2H), 2.67 - 2.55 (m, 1H), 2.45 - 2.32 (m, 1H), 2.20 (dt, J = 14.3, 6.8 Hz, 2H), 1.96 - 1.74 (m, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.48 - 1.24 (m, 5H), 0.97 (s, 3H).	661.4	A	B
I-2488		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.47 - 7.36 (m, 2H), 7.36 - 7.20 (m, 4H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.28 (d, J = 14.2 Hz, 2H), 4.17 - 3.96 (m, 1H), 3.79 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 3.65 (t, J = 15.0 Hz, 2H), 3.12 - 2.93 (m, 2H), 2.73 (d, J = 11.7 Hz, 1H), 2.66 - 2.54 (m, 2H), 2.37 (d, J = 11.8 Hz, 1H), 2.22 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 1.80 (s, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.49 - 1.22 (m, 5H), 0.97 (d, J = 2.2 Hz, 3H).	661.4	A	B

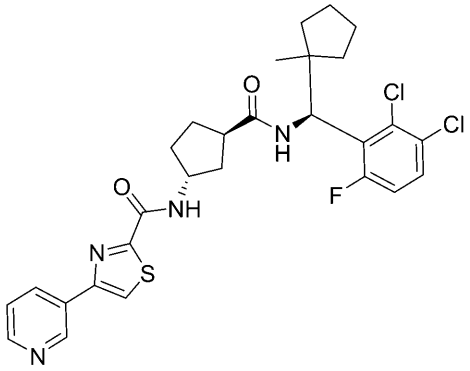
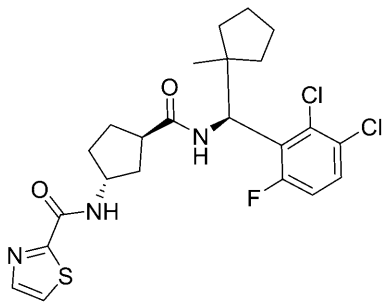
【表１－７７７】

I-2489		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.12 - 8.02 (m, 1H), 7.90 - 7.74 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.35 - 7.18 (m, 4H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.38 - 4.23 (m, 2H), 4.15 (d, J = 13.5 Hz, 1H), 4.02 (d, J = 6.7 Hz, 2H), 3.74 (dd, J = 32.5, 15.7 Hz, 1H), 3.31 - 3.18 (m, 1H), 3.09 - 2.77 (m, 3H), 2.75 - 2.56 (m, 1H), 2.31 - 2.17 (m, 2H), 1.96 - 1.74 (m, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.50 - 1.23 (m, 5H), 0.97 (s, 3H).	661.45	A	B

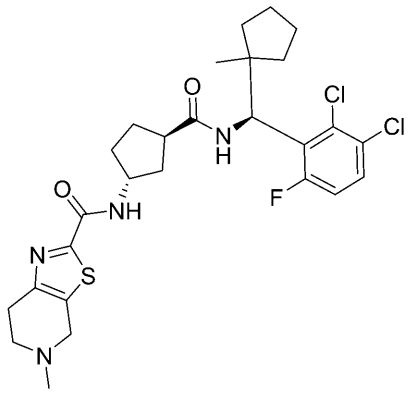
【表１－７７８】

I-2490		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 11.20 (s, 1H), 9.33 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 9.28 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 9.09 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.92 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.36 (dd, J = 4.7, 1.5 Hz, 1H), 8.31 (dt, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.3, 4.7 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.37 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.11 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.05 - 1.85 (m, 4H), 1.69 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.63 - 1.44 (m, 7H), 1.39 (s, 1H), 1.27 (t, J = 11.2 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	613.45	A	A

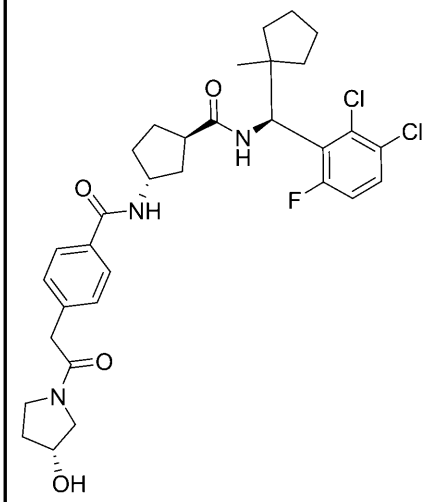
【表１－７７９】

I-2491		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.35 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.63 - 8.54 (m, 2H), 8.44 (dt, J = 8.0, 2.0 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.53 (dd, J = 8.0, 4.8 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.32 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.01 (dt, J = 13.7, 7.1 Hz, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.95 - 1.85 (m, 1H), 1.61 (s, 6H), 1.62 - 1.44 (m, 1H), 1.39 (s, 1H), 1.27 (t, J = 10.9 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	575.25	B	B
I-2492		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.66 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.11 - 7.98 (m, 3H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.28 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.89 (dddd, J = 24.2, 15.7, 12.6, 7.6 Hz, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.57 - 1.42 (m, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	498.2	B	B

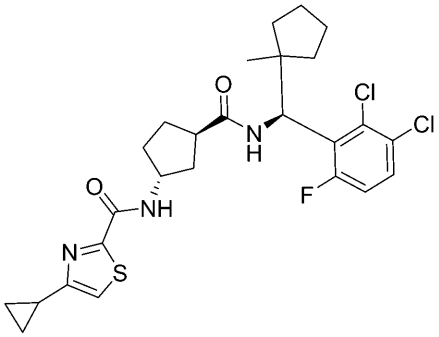
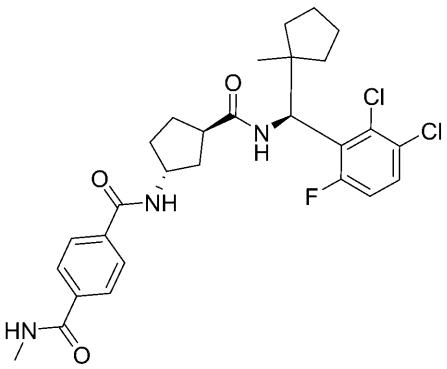
【表１－７８０】

I-2493		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.53 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.25 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.65 (d, J = 1.7 Hz, 2H), 3.05 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.88 - 2.80 (m, 2H), 2.74 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.87 (dddd, J = 19.6, 12.2, 10.3, 5.5 Hz, 4H), 1.62 (dd, J = 19.5, 9.8 Hz, 2H), 1.60 (s, 5H), 1.46 (dt, J = 12.2, 8.0 Hz, 1H), 1.38 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.27 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	567.3	A	B

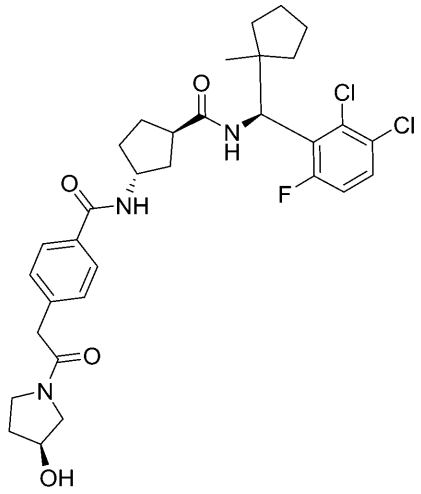
【表１－７８１】

I-2494		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 19.9, 8.9 Hz, 3H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 5.01 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.90 (d, J = 3.2 Hz, 2H), 4.32-4.22 (m, 2H), 3.67 (d, J = 16.1 Hz, 2H), 3.54 (dt, J = 11.4, 6.6 Hz, 1H), 3.32-3.22 (m, 1H), 3.08-3.00 (m,1H), 1.99- 1.93 (m, 1H), 1.91 (s, 5H), 1.90-1.81 (m, 1H), 1.82 (s, 6H), 1.60 (s, 1H), 1.38 (s,1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	618.4	A	B

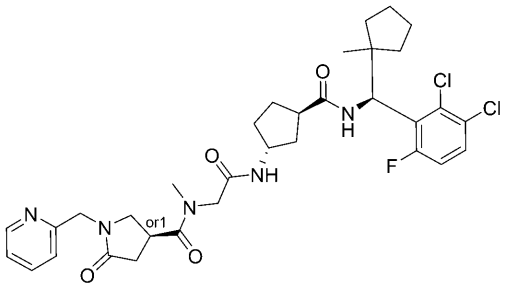
【表１－７８２】

I-2495		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.07 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.13 (tt, J = 8.3, 5.0 Hz, 1H), 1.95 (dd, J = 13.1, 6.9 Hz, 1H), 1.89 (s, 1H), 1.93-1.80 (m, 2H), 1.65 (s, 1H), 1.60 (s, 5H), 1.59 (s, 1H), 1.46 (dt, J = 12.2, 8.0 Hz, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.99-0.89 (m, 5H), 0.87 (tt, J = 4.6, 2.1 Hz, 2H).	538.2	B	
I-2496		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.55 (q, J = 4.5 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.90 (s, 4H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.31 - 7.22 (m, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.28 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.07 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.80 (d, J = 4.5 Hz, 3H), 1.91 (s, 1H), 2.04 - 1.76 (m, 3H), 1.64 - 1.57 (m, 7H), 1.59 - 1.43 (m, 1H), 1.39 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.27 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	548.3	A	A

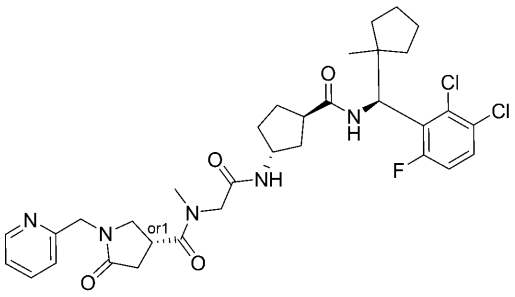
【表１－７８３】

I-2497		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.80 - 7.73 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.33 - 7.21 (m, 3H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.95 (dd, J = 41.6, 3.5 Hz, 1H), 4.32 - 4.21 (m, 2H), 3.67 (d, J = 16.1 Hz, 2H), 3.62 - 3.35 (m, 2H), 3.32 - 3.22 (m, 1H), 3.04 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.02 - 1.67 (m, 6H), 1.67 - 1.42 (m, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.25 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	618.2	A	A

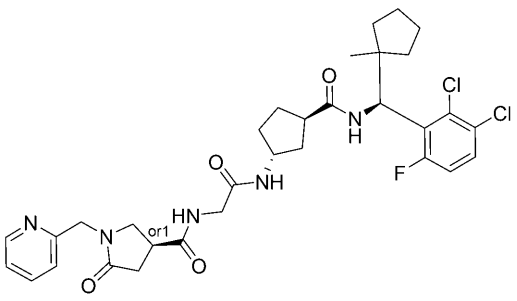
【表１－７８４】

I-2498		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.61 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 8.05 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.83 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.45 (s, 2H), 7.25 (ddd, J = 10.6, 8.9, 1.4 Hz, 1H), 5.48 (dd, J = 8.7, 2.4 Hz, 1H), 4.67 - 4.44 (m, 2H), 4.02 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.92 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.83 (d, J = 16.1 Hz, 1H), 3.70 - 3.65 (m, 1H), 3.62 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 3.53 - 3.41 (m, 2H), 2.99 (s, 3H), 2.79 (s, 1H), 2.71 - 2.52 (m, 1H), 1.97 篓 C 1.74 (m, 3H), 1.68 - 1.50 (m, 7H), 1.49 - 1.30 (m, 3H), 1.25 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	660.1	A	B

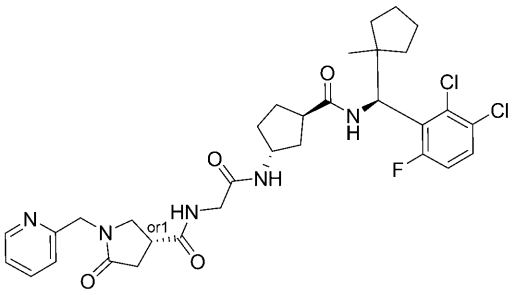
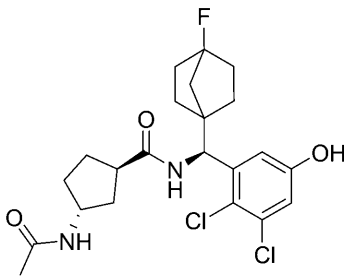
【表１－７８５】

I-2499		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.62 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.19 - 7.75 (m, 3H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.47 (s, 2H), 7.34 - 7.17 (m, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.65 - 4.45 (m, 2H), 4.09 - 3.97 (m, 2H), 3.96 - 3.90 (m, 1H), 3.84 (d, J = 16.1 Hz, 1H), 3.71 - 3.60 (m, 1H), 3.48 (ddd, J = 13.0, 9.2, 3.6 Hz, 2H), 2.99 (s, 3H), 2.79 (s, 1H), 2.70 - 2.53 (m, 1H), 1.99 -1.72 (m, 3H), 1.60 (q, J = 7.6, 6.5 Hz, 7H), 1.40 (td, J = 11.6, 10.5, 6.4 Hz, 3H), 1.25 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	660.35	A	B

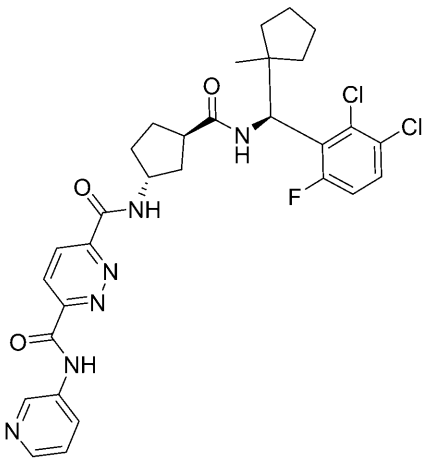
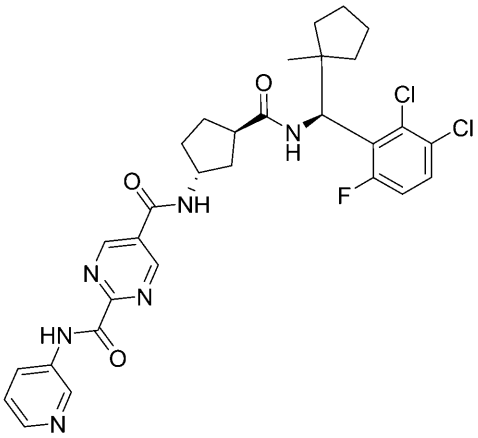
【表１－７８６】

I-2500		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.57 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.30 - 8.17 (m, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.93 - 7.78 (m, 2H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.61 - 4.40 (m, 2H), 4.02 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.67 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 3.55 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.39 (dd, J = 9.6, 5.8 Hz, 1H), 3.25 (tt, J = 8.8, 6.6 Hz, 1H), 3.01 - 2.87 (m, 1H), 2.56 (d, J = 16.8 Hz, 1H), 1.93 - 1.74 (m, 3H), 1.68 - 1.49 (m, 7H), 1.48 - 1.31 (m, 3H), 1.30 - 1.21 (m, 1H), 1.17 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	646.1	B	

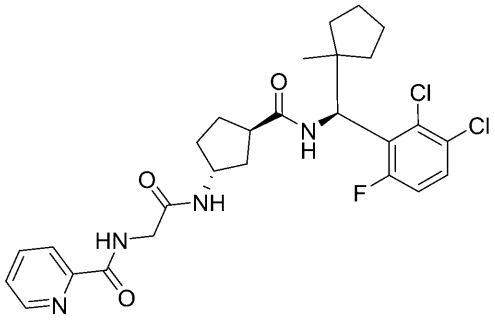
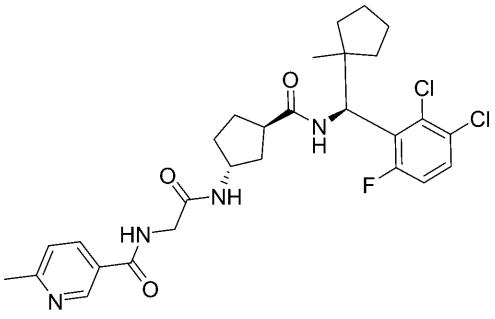
【表１－７８７】

I-2501		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.57 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.24 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.86 (dd, J = 17.1, 6.8 Hz, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.38 (s, 2H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.64 - 4.42 (m, 2H), 4.01 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 3.67 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 3.55 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 3.39 (dd, J = 9.6, 5.7 Hz, 1H), 3.24 (tt, J = 8.6, 6.7 Hz, 1H), 3.04 - 2.87 (m, 1H), 2.56 (d, J = 16.8 Hz, 1H), 1.88 (dt, J = 13.7, 7.2 Hz, 1H), 1.83 - 1.72 (m, 2H), 1.58 (d, J = 6.9 Hz, 7H), 1.49 - 1.30 (m, 3H), 1.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 1.17 (t, J = 7.2 Hz,	646.15	A	B
I-2502		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.07 (s, 1H), 8.18 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.4 Hz, 1H), 2.88 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.89 - 1.72 (m, 9H), 1.71 - 1.55 (m, 6H), 1.54 - 1.32 (m, 4H).	458.85	A	A

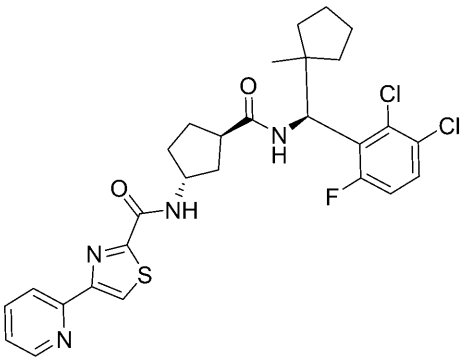
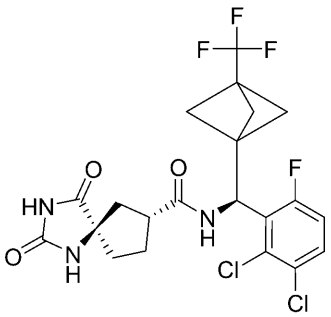
【表１－７８８】

I-2503		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 11.25 (s, 1H), 9.07 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.99 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.47 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.41 - 8.37 (m, 1H), 8.32 (ddd, J = 8.3, 2.6, 1.5 Hz, 1H), 8.06 (dd, J = 27.4, 8.7 Hz, 1H), 7.66 - 7.56 (m, 1H), 7.46 (dd, J = 8.3, 4.7 Hz, 1H), 7.26 (dt, J = 10.5, 8.2 Hz, 1H), 5.50 (dd, J = 17.1, 8.5 Hz, 1H), 4.40 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 3.17 - 3.00 (m, 1H), 2.16 - 1.69 (m, 5H), 1.66 - 1.48 (m, 7H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 15.1 Hz, 1H), 0.97 (dd, J = 6.5, 2.7 Hz, 3H).	613.15	A	B
I-2504		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 11.15 (s, 1H), 9.35 (s, 2H), 9.05 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.50-8.17 (m, 2H), 8.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 7.36-7.23 (m, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.31 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.17-3.02 (m, 1H), 2.13-1.79 (m, 5H), 1.61 (s, 7H), 1.39 (s, 1H), 1.26 (d, J = 15.5 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	613.1	A	A

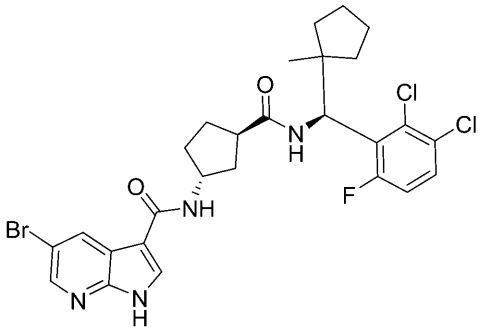
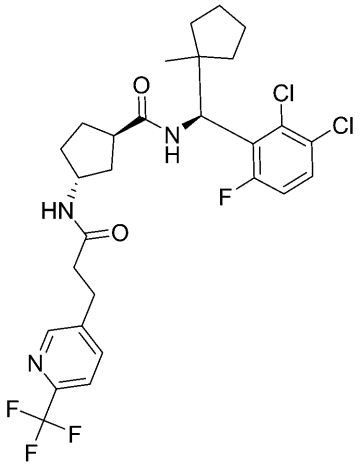
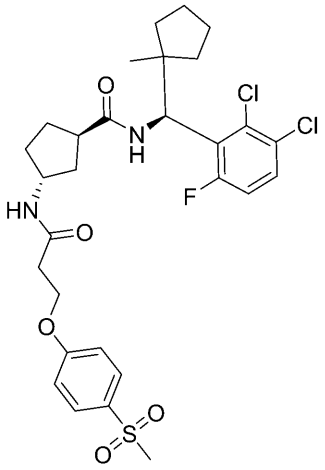
【表１－７８９】

I-2505		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.03 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.87 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.9, 1.7 Hz, 1H), 8.21 (dt, J = 8.0, 2.0 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.52 (dd, J = 8.0, 4.8 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.06 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 3.00 (p, J = 7.4 Hz, 1H), 1.86 (ddt, J = 39.5, 14.9, 7.3 Hz, 3H), 1.73 - 1.50 (m, 7H), 1.50 - 1.31 (m, 3H), 1.32 - 1.19 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	549.1	A	A
I-2506		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.91 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.78 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 8.20 - 8.01 (m, 2H), 7.89 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.06 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.84 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 2.99 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.52 (s, 3H), 1.98 - 1.74 (m, 3H), 1.72 - 1.51 (m, 7H), 1.50 - 1.33 (m, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	563.2	A	B

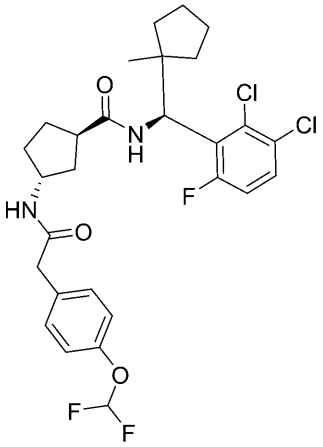
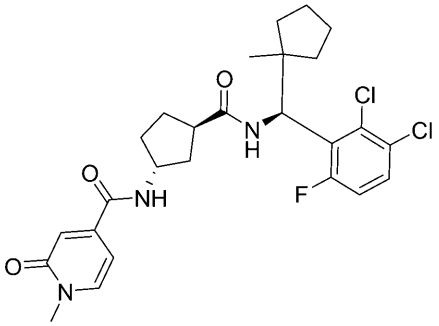
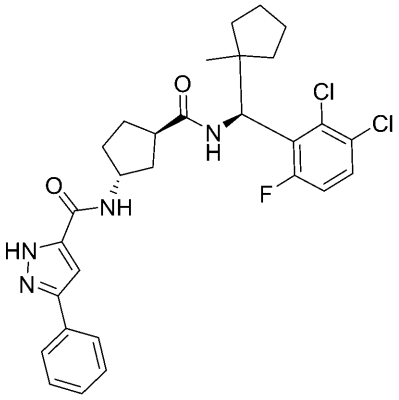
【表１－７９０】

I-2507		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.71 - 8.62 (m, 2H), 8.52 (s, 1H), 8.29 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.97 (td, J = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.45 - 7.38 (m, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.31 (p, J = 7.1 Hz, 1H), 3.11 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.10 - 1.86 (m, 1H), 1.93 (s, 3H), 1.71 (dd, J = 13.2, 7.5 Hz, 1H), 1.60 (s, 6H), 1.51 (dd, J = 12.9, 7.9 Hz, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	575.2	B	
I-2508		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.47 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.29 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.06-2.97 (m, 1H), 2.16 (dd, J = 13.2, 10.1 Hz, 1H), 1.94 (q, J = 9.3 Hz, 9H), 1.66 (tt, J = 12.5, 6.5 Hz, 2H).	508	C	

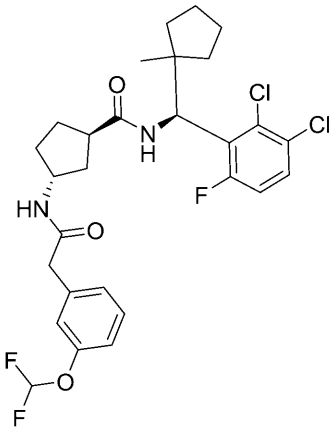
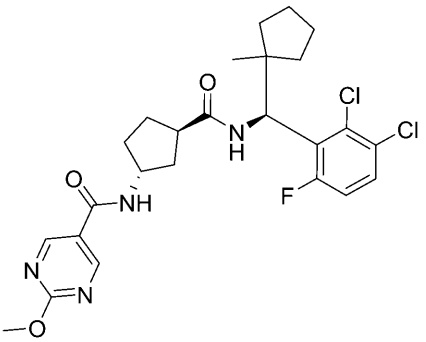
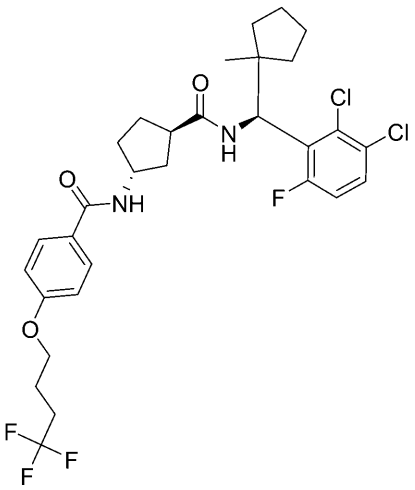
【表１－７９１】

I-2509			609.35	B	
I-2510			588.1	A	A
I-2511			613.1	A	A

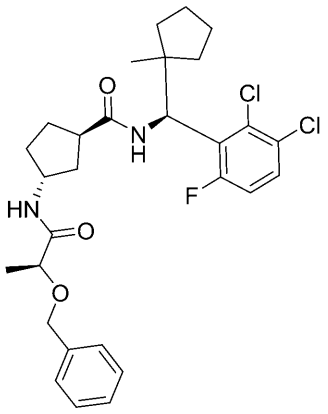
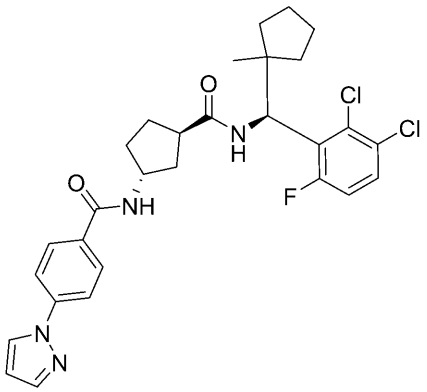
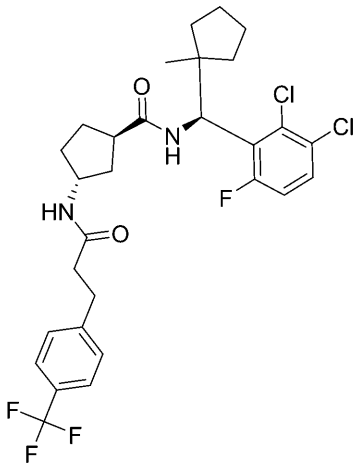
【表１－７９２】

I-2512			571.1	A	B
I-2513			522.15	A	A
I-2514			557.15	A	B

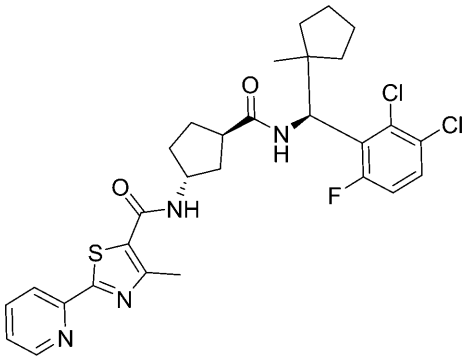
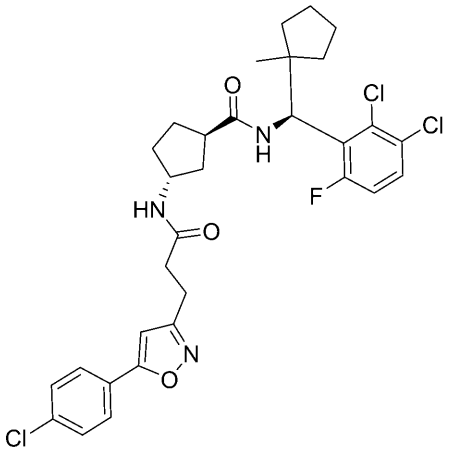
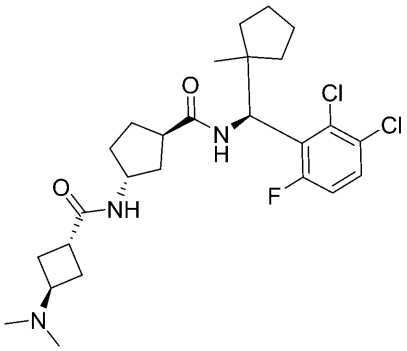
【表１－７９３】

I-2515			571.35	A	A
I-2516			523.1	A	A
I-2517			617.1	B	

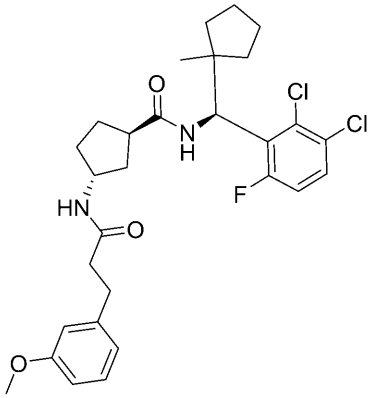
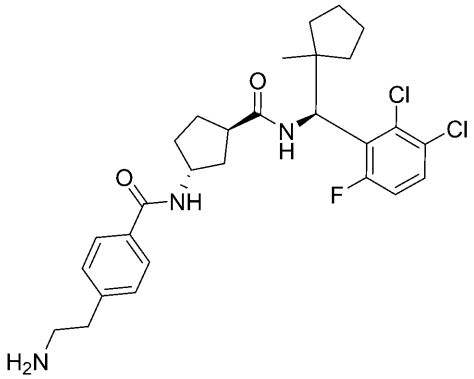
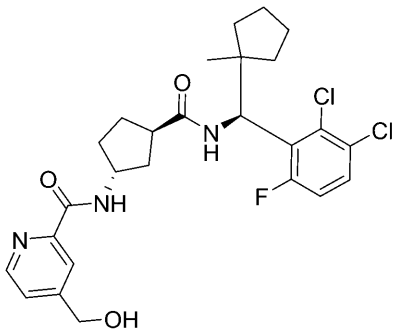
【表１－７９４】

I-2518			549.15	B	
I-2519			557.4	A	A
I-2520			587.1	A	

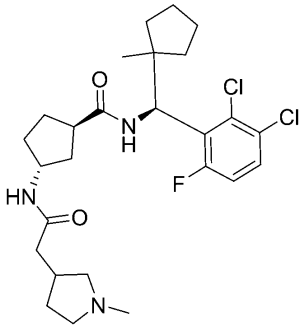
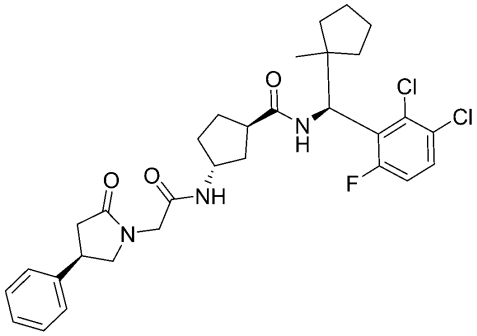
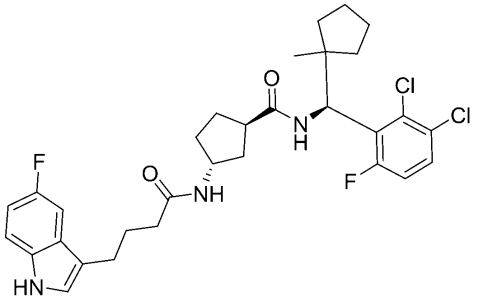
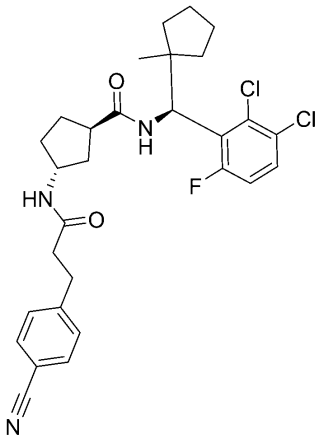
【表１－７９５】

I-2521			589.1	B	C
I-2522			620.05	B	
I-2523			512.2	A	B

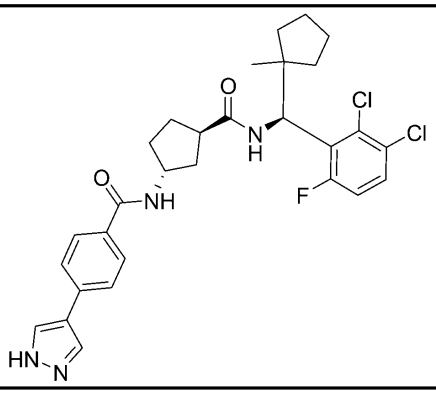
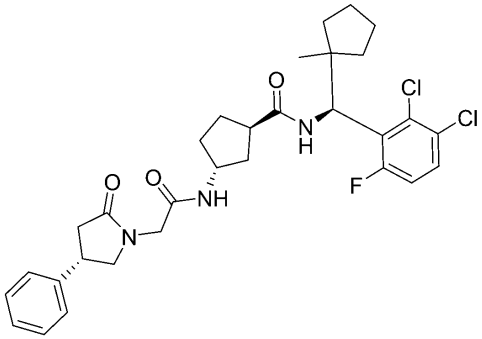
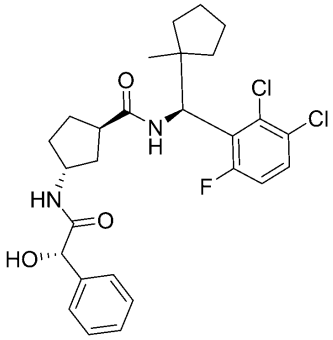
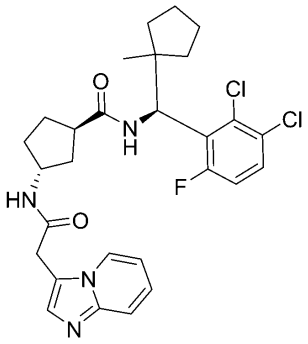
【表１－７９６】

I-2524			549.15	A	A
I-2525			534.4	A	B
I-2526		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.56 (dd, J = 4.9, 0.8 Hz, 1H), 8.47 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 1.8, 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.54 - 7.46 (m, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.58 - 5.48 (m, 2H), 4.62 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 4.31 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.00 - 1.80 (m, 1H), 1.88 (s, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 12.8 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	522.2	A	A

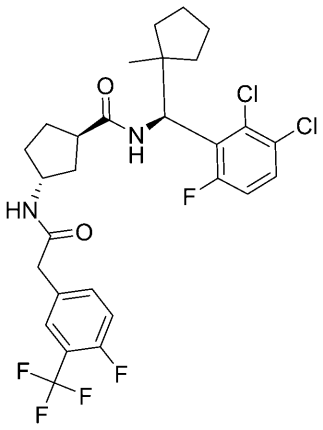
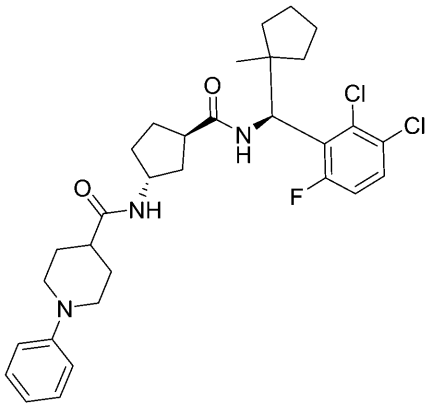
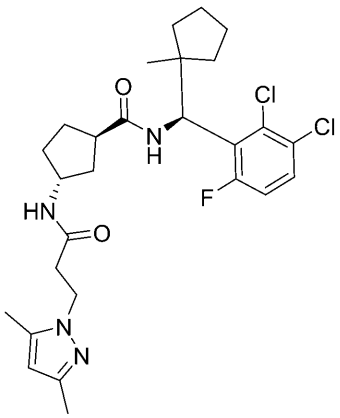
【表１－７９７】

I-2527			512.25	A	
I-2528			588.25	A	B
I-2529			590.15	A	B
I-2530			544.1	A	A

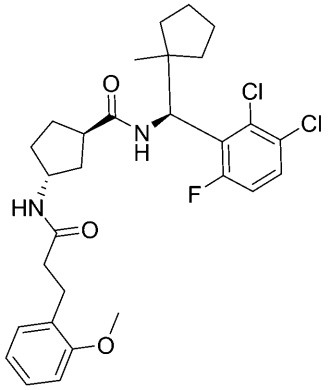
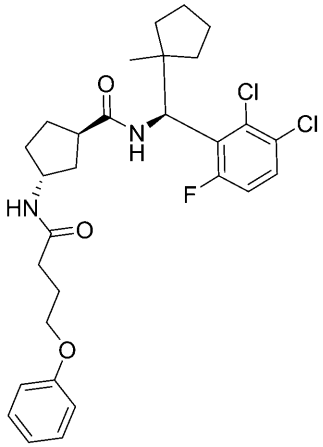
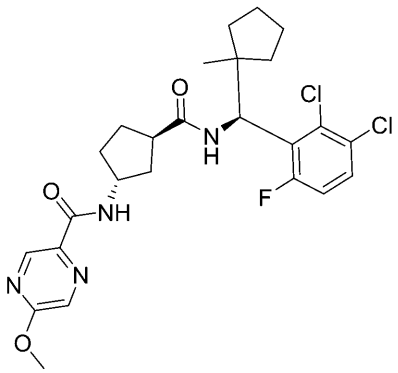
【表１－７９８】

I-2531			557.4	A	B
I-2532			588.25	A	B
I-2533			521.15	A	B
I-2534			545.15	A	B

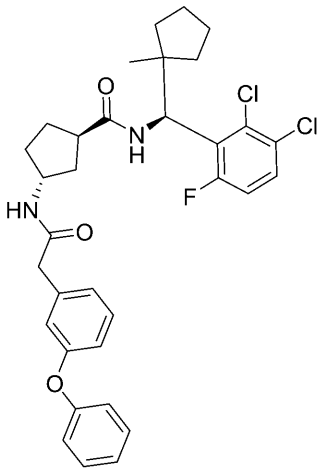
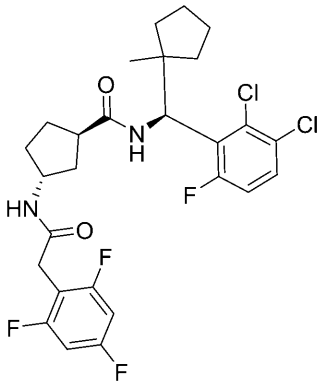
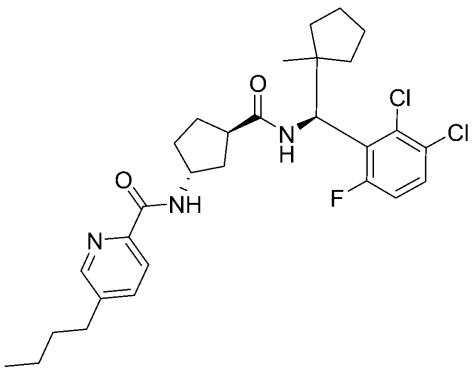
【表１－７９９】

I-2535			591.4	B	
I-2536			574.15	A	B
I-2537			537.2	A	B

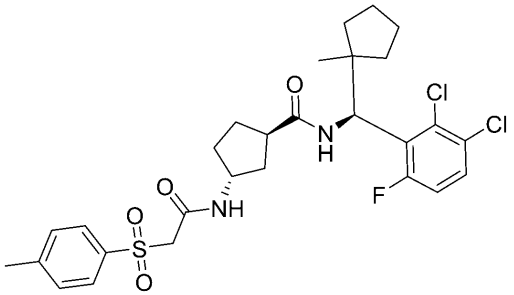
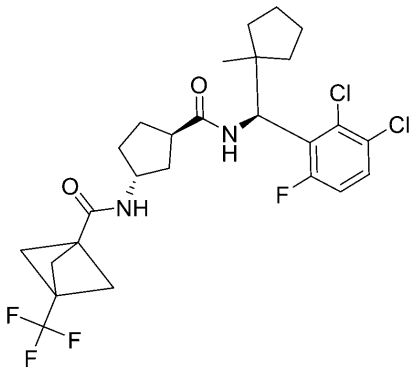
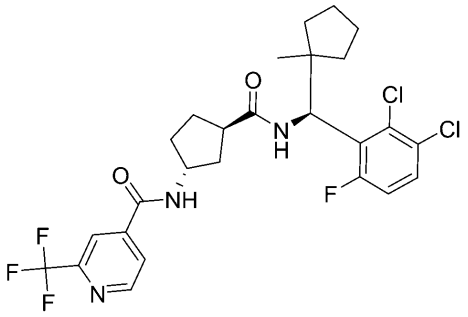
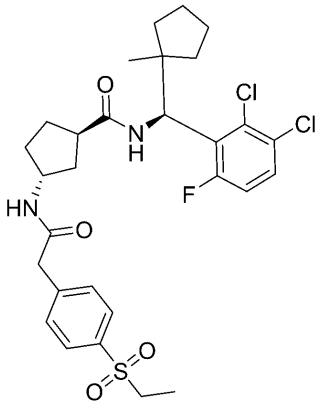
【表１－８００】

I-2538			549.2	B	A
I-2539			549.15	A	B
I-2540			523.2	B	

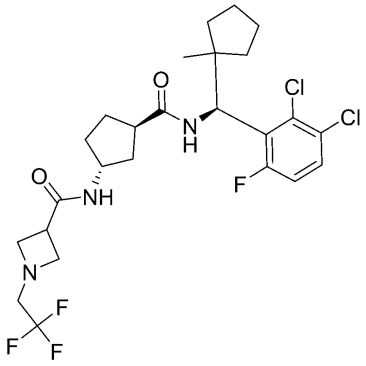
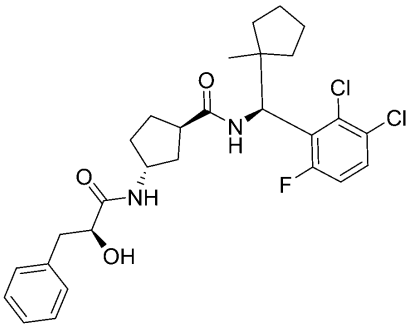
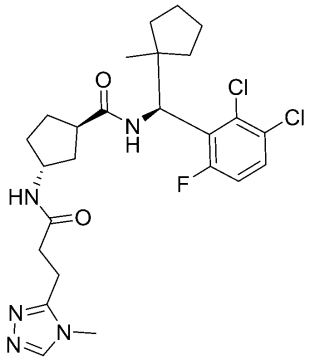
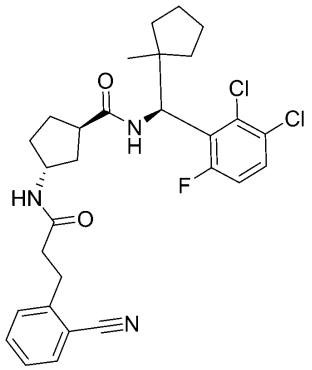
【表１－８０１】

I-2541			597.15	C	
I-2542			559.35	A	B
I-2543			548.15	D	

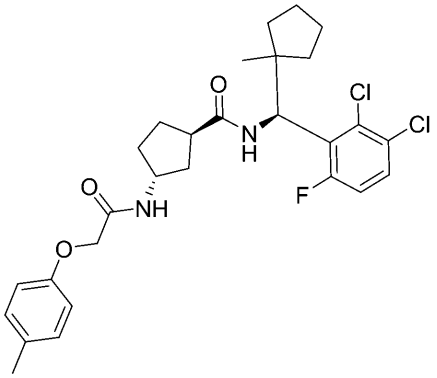
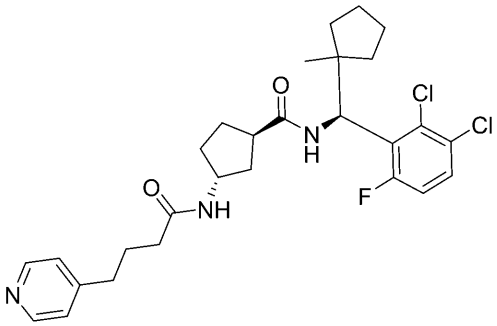
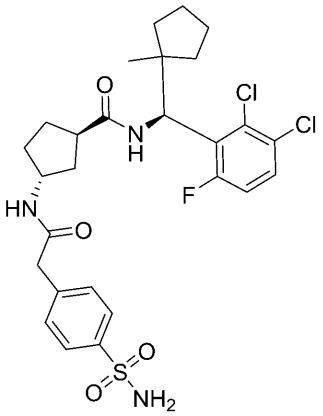
【表１－８０２】

I-2544			583.1	B	B
I-2545			549.1	B	A
I-2546			560.2	B	B
I-2547			597.4	B	B

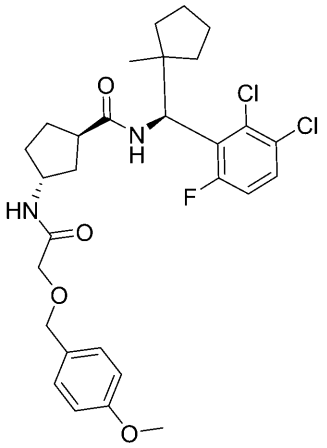
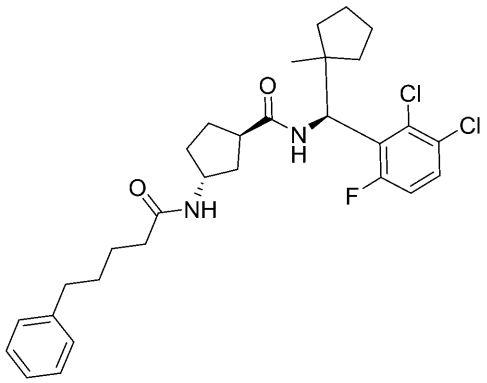
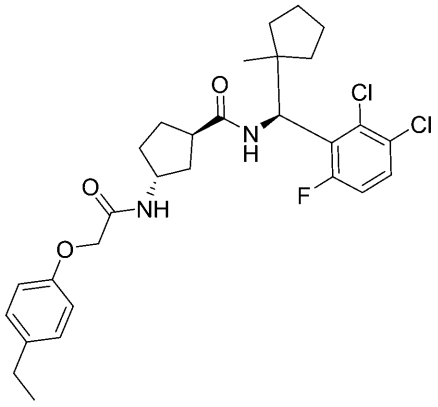
【表１－８０３】

I-2548			552.15	C	B
I-2549			535.15	D	
I-2550			524.25	B	B
I-2551			544.15	A	A

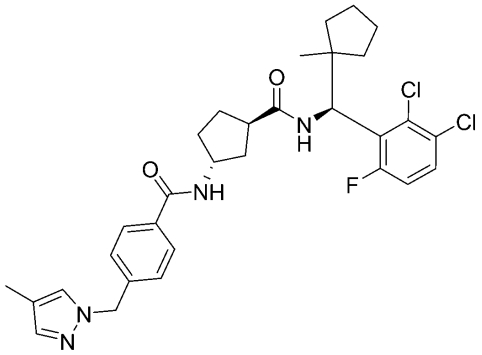
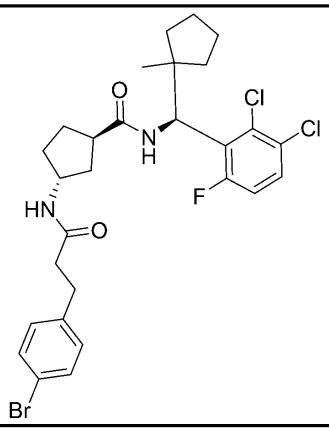
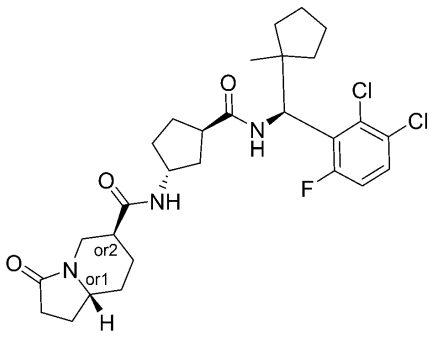
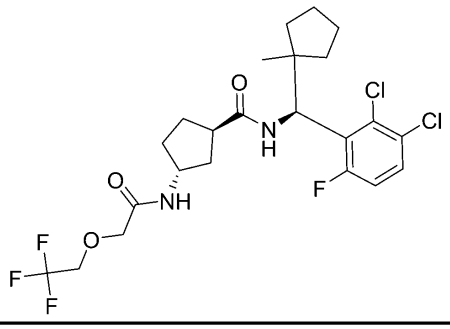
【表１－８０４】

I-2552			535.15	D	
I-2553			534.35	B	A
I-2554			584.1	A	B

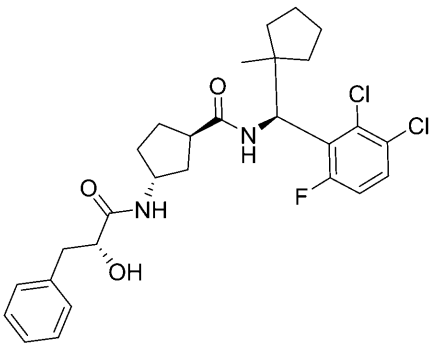
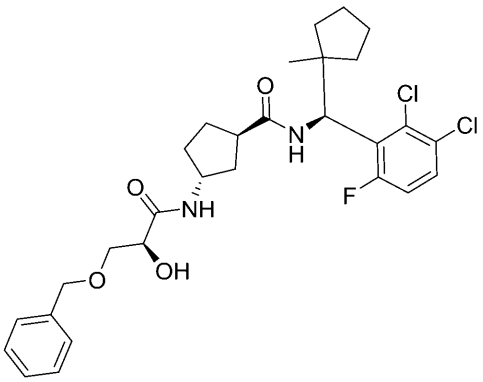
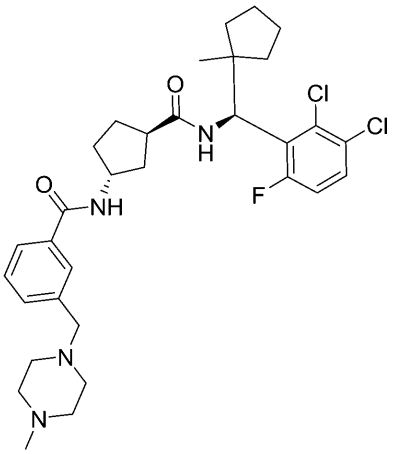
【表１－８０５】

I-2555			565.4	C	B
I-2556			547.15	D	
I-2557			549.15	D	D

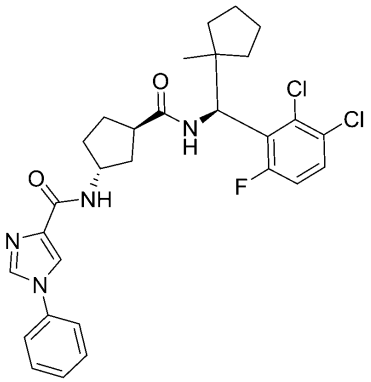
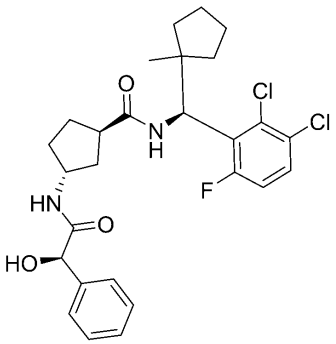
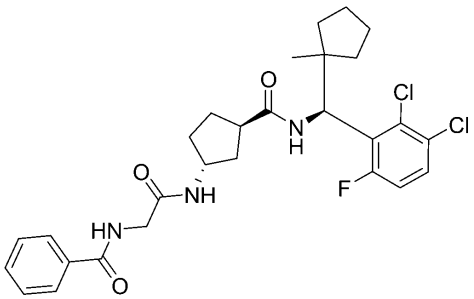
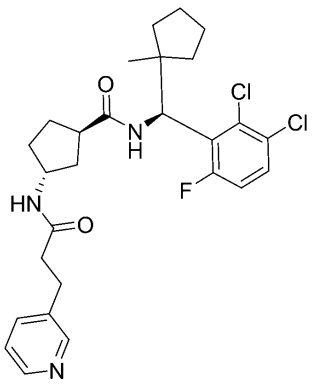
【表１－８０６】

I-2558			585.25	B	B
I-2559			597.3	D	
I-2560			552.15	B	C
I-2561			527.1	C	

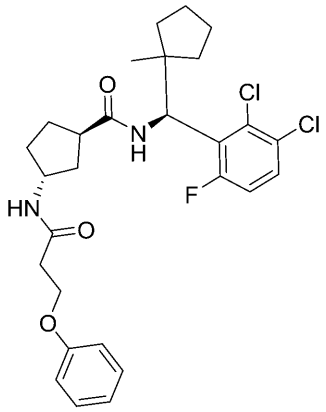
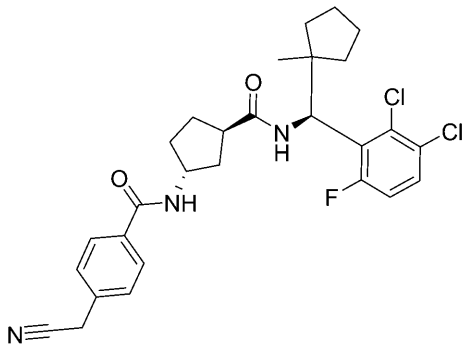
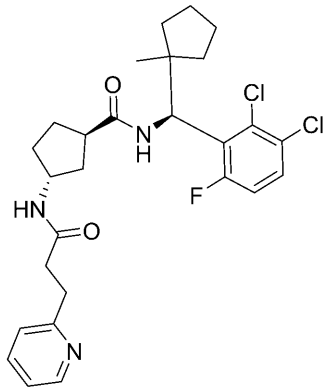
【表１－８０７】

I-2562			535.15	B	B
I-2563			565.25	B	C
I-2564			603.4	B	B

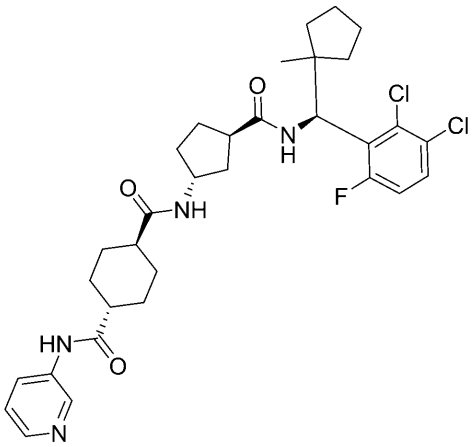
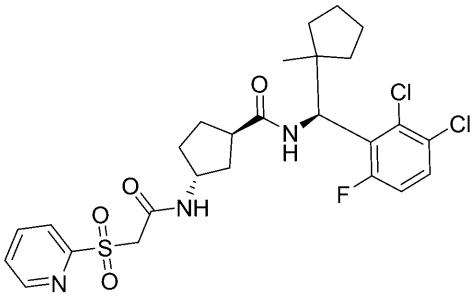
【表１－８０８】

I-2565			557.4	C	B
I-2566			521.15	B	B
I-2567			548.1	B	B
I-2568			520.1	B	B

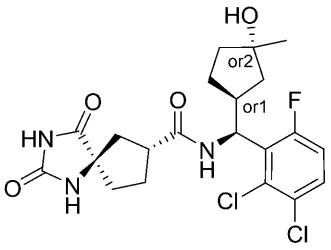
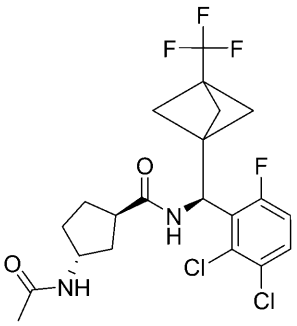
【表１－８０９】

I-2569			535.25	B	B
I-2570			530.2	A	A
I-2571			520.15	B	A

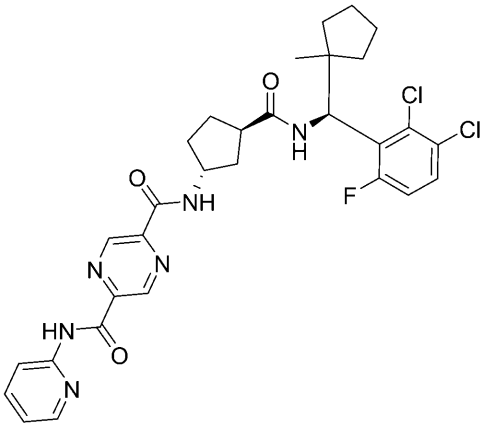
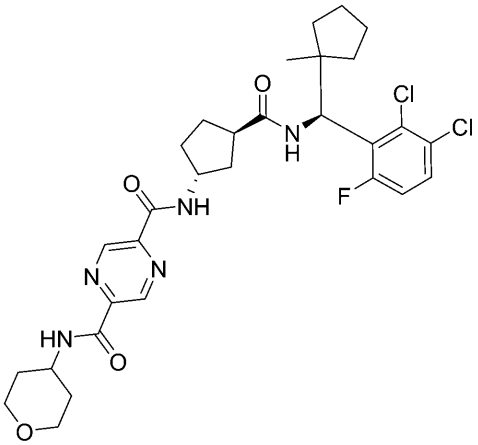
【表１－８１０】

I-2572		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.06 (s, 1H), 8.81 - 8.59 (m, 1H), 8.23 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.03 (ddd, J = 8.3, 2.6, 1.5 Hz, 2H), 7.75 - 7.51 (m, 2H), 7.37 - 7.12 (m, 2H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 2.97 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 2.33 (s, 1H), 2.08 (s, 1H), 1.88 (q, J = 5.8 Hz, 3H), 1.80 (d, J = 15.3 Hz, 4H), 1.59 (d, J = 6.4 Hz, 7H), 1.40 (d, J = 9.6 Hz, 7H), 1.26 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	617.4	B	A
I-2573		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.81 - 8.76 (m, 1H), 8.27 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.14 (td, J = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.77 - 7.71 (m, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.46 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.36 (s, 2H), 3.89 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.96 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.90 - 1.71 (m, 3H), 1.67 - 1.48 (m, 7H), 1.39 (ddt, J = 16.4, 8.2, 3.7 Hz, 2H), 1.28 (ddd, J = 13.1, 8.4, 3.6 Hz, 2H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	570.2	B	A

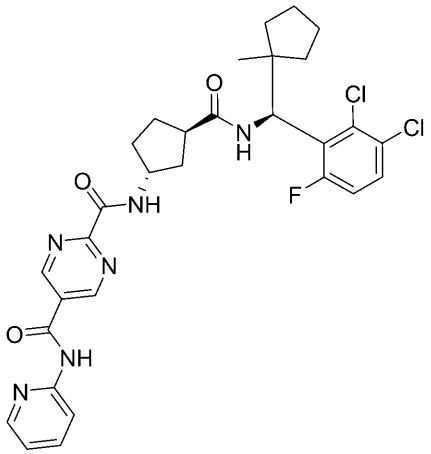
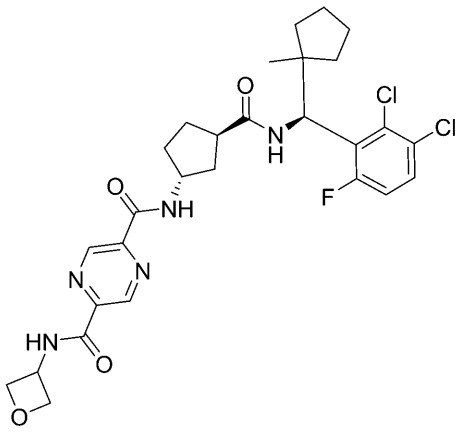
【表１－８１１】

I-2574		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.61 (s, 1H), 8.38 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.58 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.3, 8.9 Hz, 1H), 5.11 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 4.36 (s, 1H), 2.95 - 2.87 (m, 1H), 2.59 (s, 1H), 2.11 (dd, J = 13.1, 10.2 Hz, 1H), 2.05 - 1.78 (m, 4H), 1.65 (dq, J = 16.1, 6.5, 5.3 Hz, 3H), 1.57 - 1.37 (m, 2H), 1.36 - 1.21 (m, 2H), 1.12 (s, 3H).	472.05	E	
I-2575		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.34 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.62 (ddd, J = 8.9, 5.4, 3.4 Hz, 1H), 7.28 (ddt, J = 13.1, 9.6, 3.2 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 4.01 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 2.96-2.87 (m, 1H), 1.94 (d, J = 7.9 Hz, 5H), 1.90 (s, 2H), 1.85-1.78 (m, 3H), 1.77 (s,2H), 1.62 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 1.51-1.32 (m, 2H).	481.1	D	

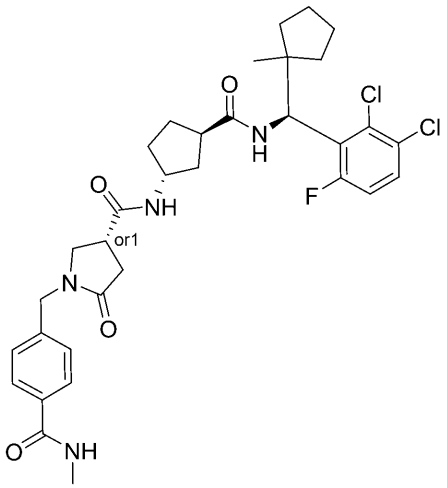
【表１－８１２】

I-2576		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.42 (s, 1H), 9.31 (d, J = 16.9 Hz, 2H), 8.93 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.94 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 10.5 Hz, 2H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.42 - 4.34 (m, 1H), 3.09 (s, 1H), 1.91 (s, 4H), 1.60 (s, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (s, 3H).	613.35	C	
I-2577		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.19 (s, 2H), 9.01 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.36 (h, J = 7.2 Hz, 1H), 4.14 - 4.01 (m, 1H), 3.93 - 3.83 (m, 2H), 3.40 (td, J = 11.4, 4.1 Hz, 2H), 3.13 - 3.04 (m, 1H), 2.02 - 1.83 (m, 4H), 1.77 - 1.47 (m, 12H), 1.38 (s, 1H), 1.26 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	620.15	B	A

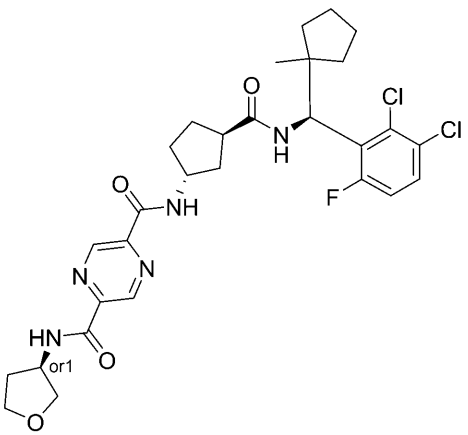
【表１－８１３】

I-2578		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 11.42 (s, 1H), 9.40 (s, 2H), 8.83 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.53 - 8.35 (m, 1H), 8.22 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.98 - 7.84 (m, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.44 - 7.08 (m, 2H), 5.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.33 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.08 - 1.80 (m, 4H), 1.71 - 1.47 (m, 8H), 1.39 (s, 1H), 1.26 (d, J = 16.4 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	613.3	A	A
I-2579		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.84 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 9.17 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.89 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.07 (h, J = 7.0 Hz, 1H), 4.82 - 4.60 (m, 4H), 4.36 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.05 - 1.74 (m, 4H), 1.72 - 1.44 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 13.3 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	592.1	B	A

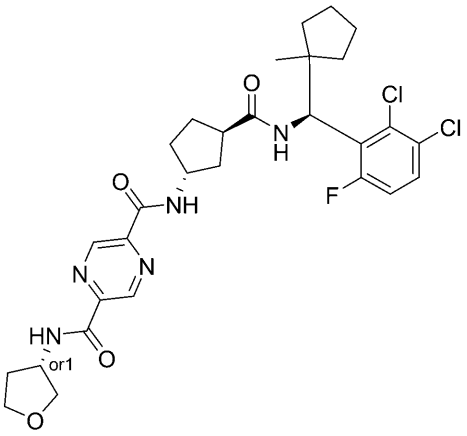
【表１－８１４】

I-2580		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.30 - 7.20 (m, 2H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.43 (d, J = 15.4 Hz, 1H), 4.37 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 3.99 (p, J = 6.4 Hz, 1H), 3.40 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.21 (dd, J = 9.6, 5.9 Hz, 1H), 3.12 - 2.99 (m, 1H), 2.96 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.77 (d, J = 4.5 Hz, 3H), 2.48 (s, 1H), 1.89 (dt, J = 13.6, 7.1 Hz, 1H), 1.78 (s, 2H), 1.59 (s, 8H), 1.38 (ddd, J = 26.8, 12.4, 6.5 Hz, 2H), 1.26 (s, 2H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	645.35	B	B

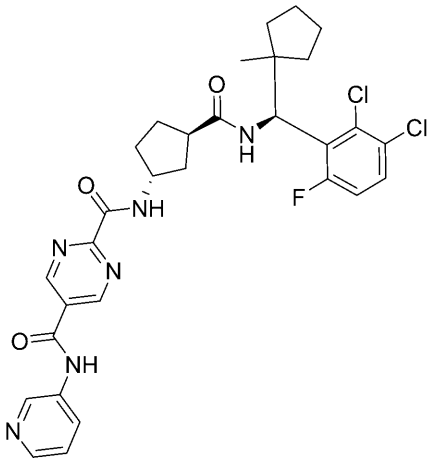
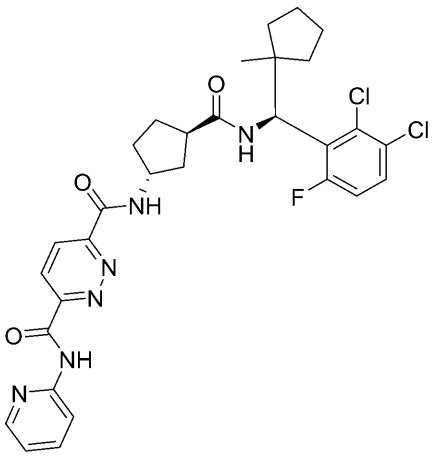
【表１－８１５】

I-2581		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.21-9.16 (m, 2H), 9.13 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.51 (ddt, J = 15.0, 7.0, 3.5 Hz, 1H), 4.34 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.87 (dt, J = 9.0, 6.6 Hz, 2H), 3.73 (td, J = 8.1, 5.9 Hz, 1H), 3.63 (dd, J = 8.8, 4.8 Hz, 1H), 3.14-3.02 (m, 1H), 2.16 (dtd, J = 12.6, 7.9, 6.5 Hz, 1H), 2.10- 2.00 (m, 1H), 2.04- 1.86 (m, 2H), 1.90-1.81 (m, 2H), 1.73-1.43 (m, 8H), 1.38 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	606.3	B	A

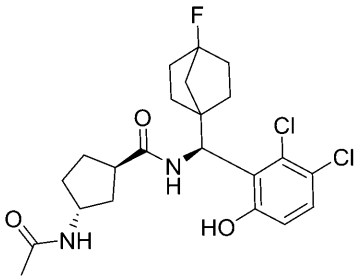
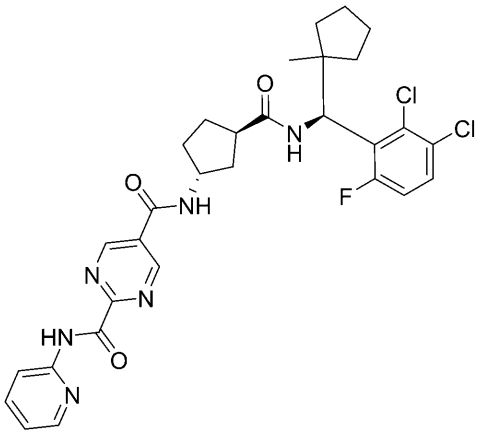
【表１－８１６】

I-2582		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.21-9.16 (m, 2H), 9.13 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.31-7.21 (m, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.52 (s, 1H), 4.35 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 3.87 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 3.73 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.63 (dd, J = 8.7, 4.8 Hz, 1H), 3.12-3.04 (m, 1H), 2.16 (dd, J = 12.6, 7.0 Hz, 1H), 2.09-1.97 (m, 1H), 1.93 (dt, J = 24.9, 7.2 Hz, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.50 (s, 1H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (s, 2H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	606.3	B	B

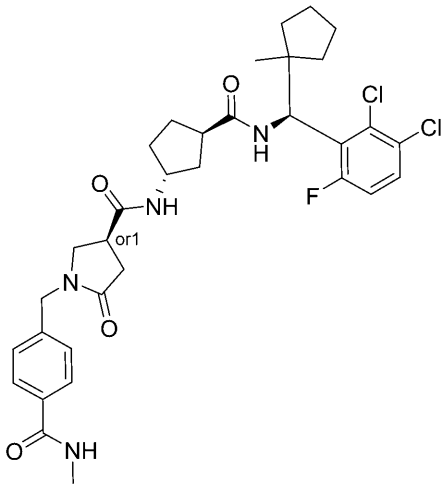
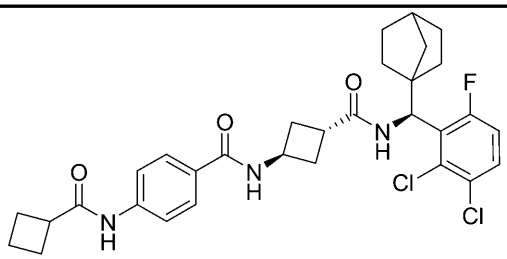
【表１－８１７】

I-2583		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.91 (s, 1H), 9.40 (s, 2H), 8.93 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 8.83 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.38 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 8.3, 4.7 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.32 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.12 - 3.04 (m, 1H), 2.05 - 1.86 (m, 4H), 1.60 (s, 8H), 1.51 (s, 1H), 1.38 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	613.35	B	B
I-2584		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 9.19 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.48 - 8.41 (m, 2H), 8.28 (dt, J = 8.4, 1.0 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.95 (ddd, J = 8.3, 7.3, 1.9 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.31 - 7.22 (m, 2H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.41 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.15 - 3.07 (m, 1H), 2.07 - 1.84 (m, 4H), 1.79 - 1.68 (m, 1H), 1.60 (s, 7H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	613.1	C	

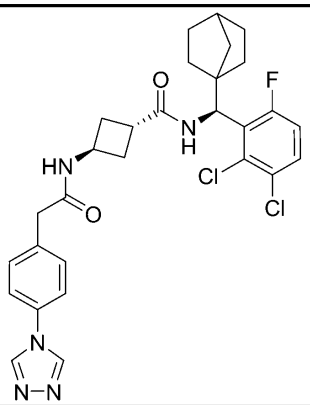
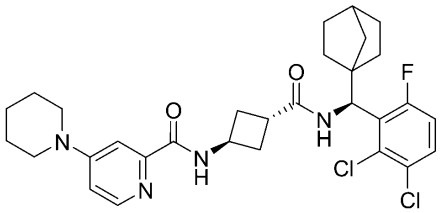
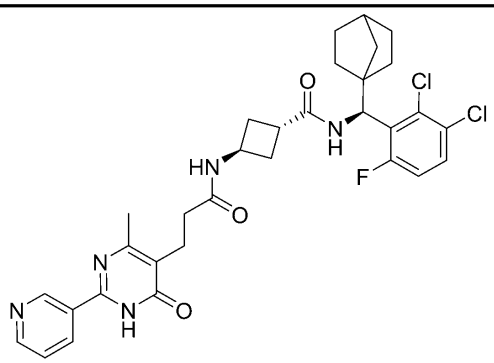
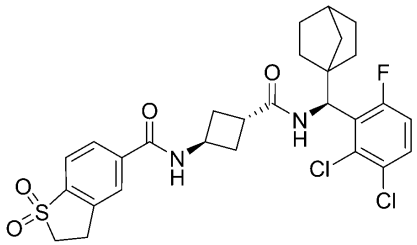
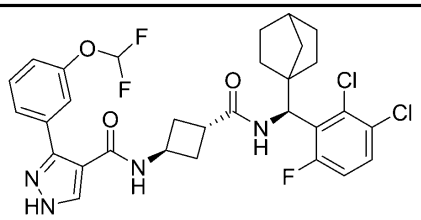
【表１－８１８】

I-2585		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.47 (s, 1H), 7.90 (d, J = 14.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 8.8, 2.7 Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 9.0, 5.3 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.04 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 2.98 - 2.78 (m, 1H), 1.87 (dq, J = 15.3, 7.4 Hz, 4H), 1.77 (s, 4H), 1.75 - 1.56 (m, 7H), 1.51 (dt, J = 15.5, 7.7 Hz, 2H), 1.39 (dd, J = 13.9, 7.8 Hz, 2H).	457.15	E	
I-2586		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 9.36 (s, 2H), 8.83 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.98-7.89 (m, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.32-7.24 (m, 1H), 7.24 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.32 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.09 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 2.10-1.79 (m, 4H), 1.61 (s, 8H), 1.39 (s, 2H), 0.98 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	613.25	B	A

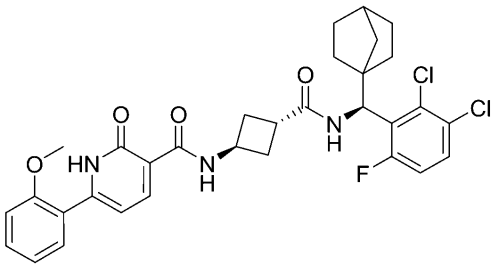
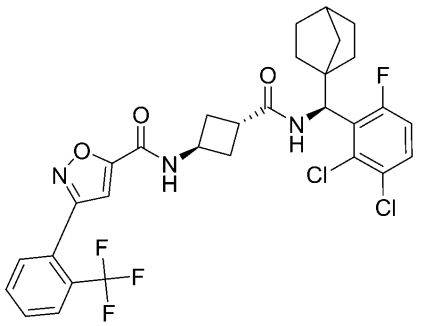
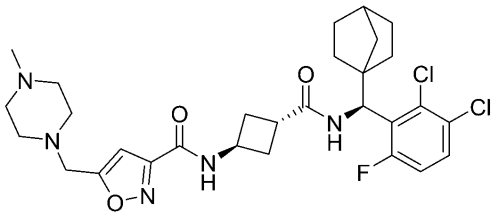
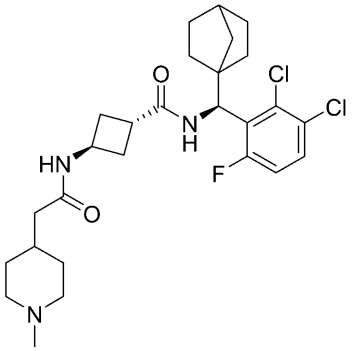
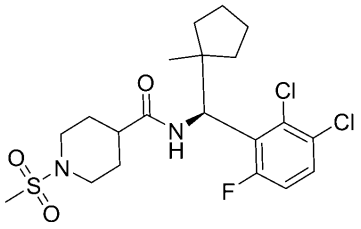
【表１－８１９】

I-2587		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.84 - 7.77 (m, 2H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.33 - 7.20 (m, 3H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.41 (s, 2H), 4.00 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.39 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 3.24 (dd, J = 9.6, 6.0 Hz, 1H), 3.10 - 3.01 (m, 1H), 2.96 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.78 (d, J = 4.5 Hz, 3H), 2.47 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 1.84 (ddt, J = 38.0, 15.4, 7.6 Hz, 1H), 1.81 (s, 2H), 1.62 - 1.50 (m, 7H), 1.37 (s, 3H), 1.25 (s, 1H), 0.95 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	645.35	B	C
I-2588				D	D

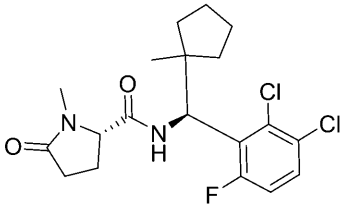
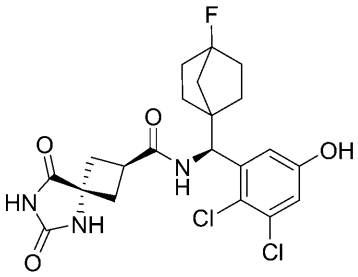
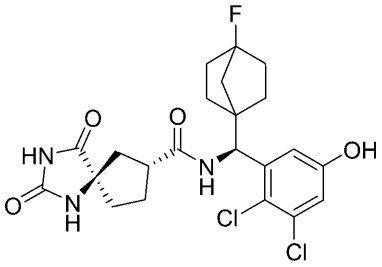
【表１－８２０】

I-2589				A	A
I-2590				D	
I-2591				B	A
I-2592				A	A
I-2593				B	B

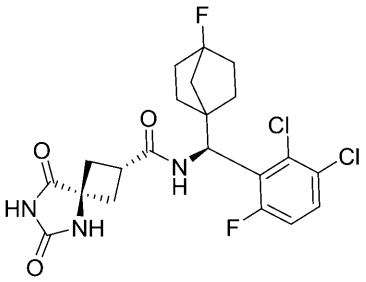
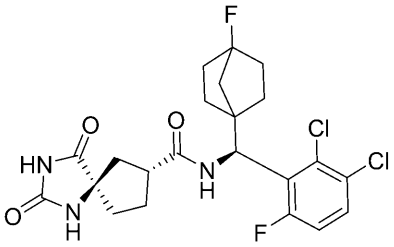
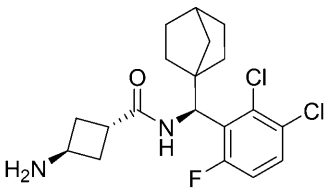
【表１－８２１】

I-2594				B	B
I-2595				D	
I-2596				B	B
I-2597				B	B
I-2598			465.1	B	B

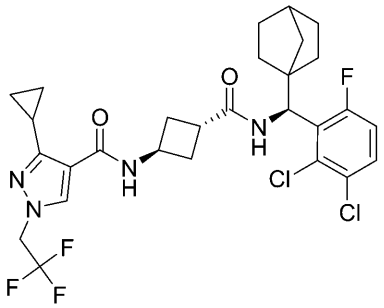
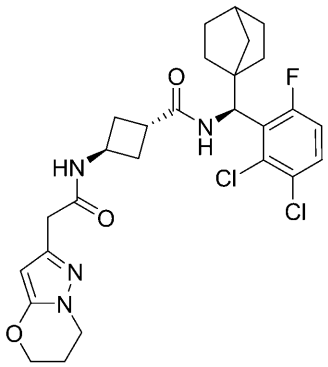
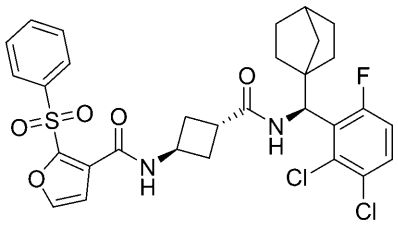
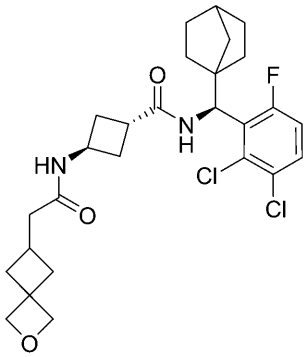
【表１－８２２】

I-2599			401.05	C	
I-2600		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.58 (s, 1H), 10.07 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 5.44 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.20 (p, J = 9.2 Hz, 1H), 2.79 - 2.59 (m, 2H), 2.36 - 2.11 (m, 2H), 1.87 - 1.72 (m, 3H), 1.67 (d, J = 10.4 Hz, 3H), 1.63 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 1.54 - 1.33 (m, 2H).	470.05	A	A
I-2601		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.35 (d, J = 209.4 Hz, 2H), 8.43 - 8.19 (m, 2H), 6.86 (dd, J = 41.7, 2.8 Hz, 2H), 5.43 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.12 (dd, J = 13.1, 10.2 Hz, 1H), 1.95 (qd, J = 13.3, 12.8, 8.0 Hz, 3H), 1.78 (s, 2H), 1.74 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 1.68 (td, J = 10.5, 9.5, 5.7 Hz, 4H), 1.64 (s, 1H), 1.59 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 1.52 - 1.16 (m, 2H).	484	A	B

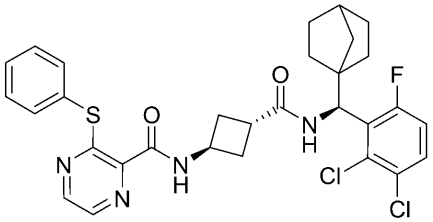
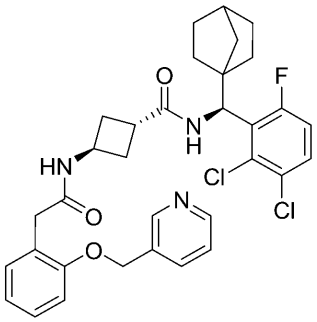
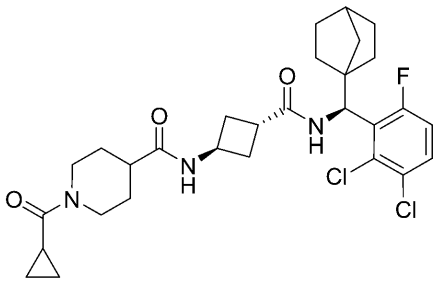
【表１－８２３】

I-2602		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.22 (p, J = 9.1, 9.1, 9.0, 9.0 Hz, 1H), 2.61 (m, 2H), 2.21 (m, 2H), 1.69 (m, 10H).	472.1	A	A
I-2603		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.02 (t, J = 8.6, 8.6 Hz, 1H), 2.10 (m, 1H), 1.77 (m, 15H).	486.15	A	A
I-2604		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.3 Hz, 4H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.5, 8.9 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.64 (s, 2H), 3.24 (dt, J = 9.3, 4.2 Hz, 1H), 2.46 - 2.22 (m, 3H), 2.13 (q, J = 3.8, 3.4 Hz, 2H), 1.51 (d, J = 20.9 Hz, 3H), 1.29 (ddq, J = 27.7, 18.8, 9.4, 7.6 Hz, 7H).	385.15		

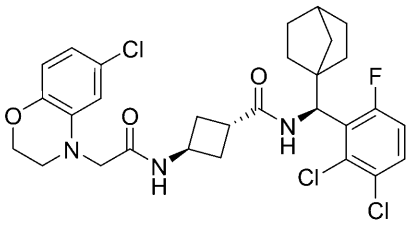
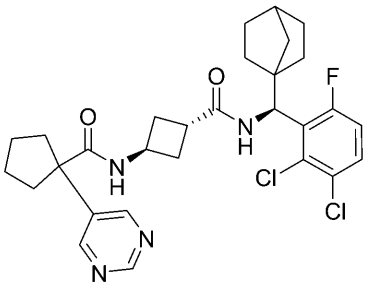
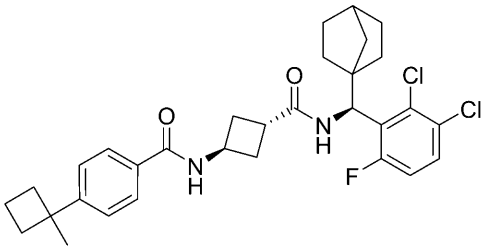
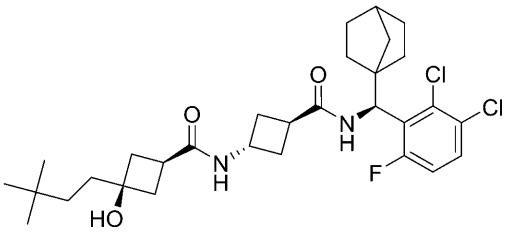
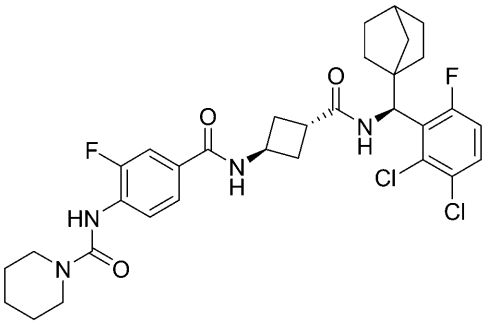
【表１－８２４】

I-2605			601	B	B
I-2606			551	A	A
I-2607			619	B	A
I-2608			525.2	B	A

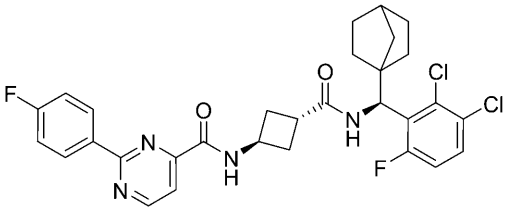
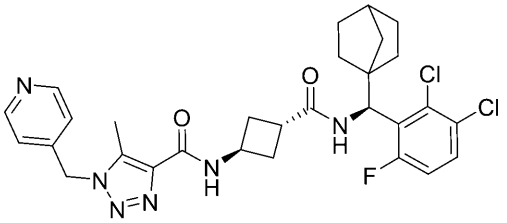
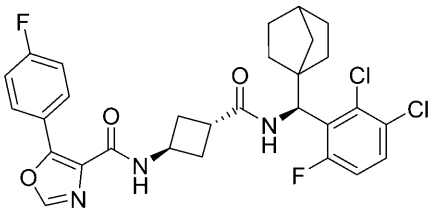
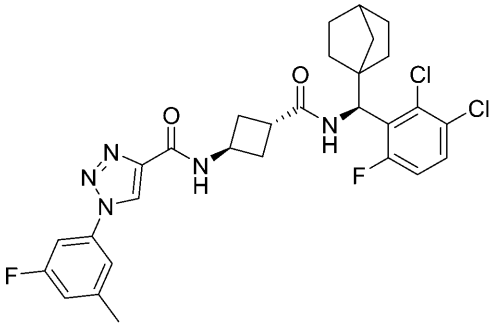
【表１－８２５】

I-2609		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 9.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 6.7, 3.0 Hz, 2H), 7.42 (q, J = 3.7 Hz, 3H), 7.29 - 7.19 (m, 1H), 5.69 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.52 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 3.11 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 2.39 (d, J = 9.3 Hz, 3H), 2.20 - 2.10 (m, 2H), 1.51 (d, J = 14.9 Hz, 3H), 1.33 (dd, J = 25.5, 12.8 Hz, 3H), 1.28 - 1.17 (m, 4H).	600.1	C	
I-2610			612.2	B	A
I-2611			564.2	B	A

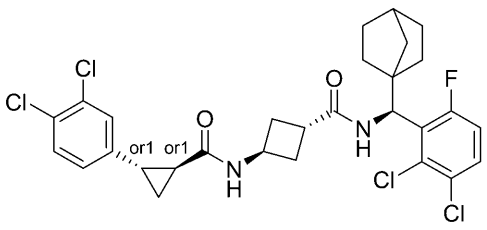
【表１－８２６】

I-2612			596	B	B
I-2613			561.2	B	A
I-2614			557.2	D	
I-2615			567.2	B	B
I-2616			633.2	B	A

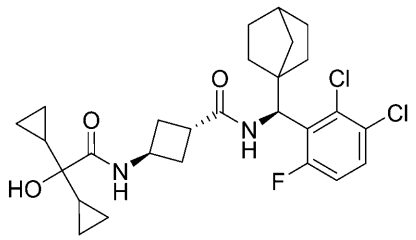
【表１－８２７】

I-2617			587	D	
I-2618			585.2	B	A
I-2619			576	D	
I-2620			588	B	B

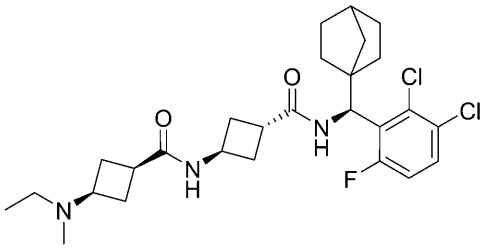
【表１－８２８】

I-2621		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.36 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 7.12 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.25 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 3.04 (s, 1H), 2.24 (ddd, J = 14.0, 10.2, 4.6 Hz, 3H), 2.11 (s, 2H), 2.07 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 2.01 (dd, J = 21.5, 11.7 Hz, 2H), 1.78 (dt, J = 9.4, 4.7 Hz, 1H), 1.49 (d, J = 21.2 Hz, 3H), 1.31 (dd, J = 10.2, 5.4 Hz, 3H), 1.25 - 1.21 (m, 3H), 1.18 (d, J = 10.3 Hz, 1H).	599.6	D	

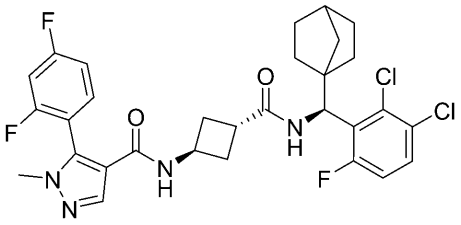
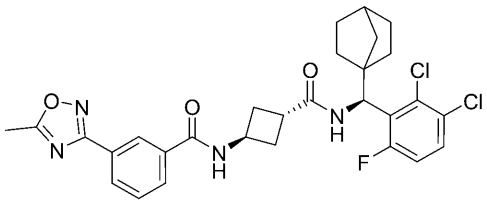
【表１－８２９】

I-2622		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.05 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.1, 4.7 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.42 - 4.04 (m, 2H), 3.15 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 3.04 (s, 1H), 2.24 (s, 1H), 2.18 - 2.14 (m, 1H), 2.11 (s, 2H), 1.50 (d, J = 22.2 Hz, 3H), 1.36 - 1.27 (m, 3H), 1.26 - 1.17 (m, 4H), 1.13 (t, J = 6.5 Hz, 2H), 0.41 - 0.32 (m, 2H), 0.27 (t, J = 6.5 Hz, 4H), 0.15 - 0.10 (m, 2H).	524.4	B	A

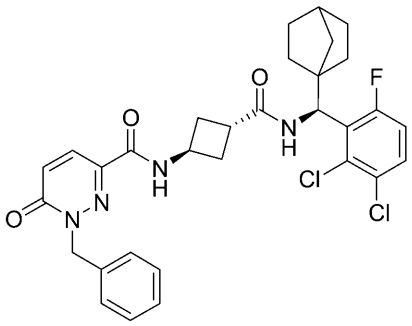
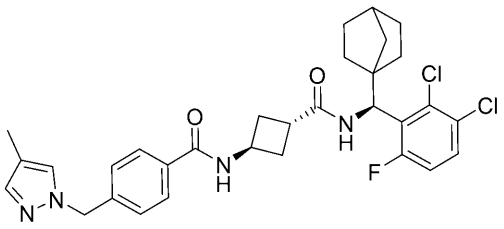
【表１－８３０】

I-2623		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.04 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.21 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 3.07 - 2.97 (m, 1H), 2.56 (s, 2H), 2.27 - 2.21 (m, 1H), 2.17 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 2.11 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 2.07 - 2.00 (m, 4H), 1.97 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 1.93 (s, 3H), 1.83 (dd, J = 17.8, 8.8 Hz, 2H), 1.49 (d, J = 21.4 Hz, 3H), 1.30 (dd, J = 20.5, 8.1 Hz, 3H), 1.20 (dd, J = 24.7, 9.0 Hz, 4H), 0.91 (t, J = 7.1 Hz, 3H).	526.2	B	B

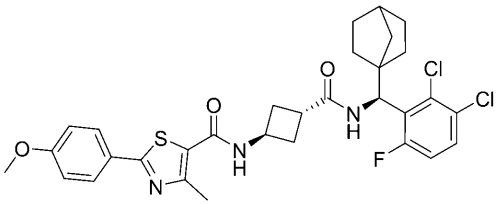
【表１－８３１】

I-2624		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.12 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.07 - 7.92 (m, 2H), 7.57 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.46 (td, J = 8.5, 6.5 Hz, 1H), 7.36 (td, J = 9.7, 2.5 Hz, 1H), 7.26 - 7.13 (m, 2H), 5.65 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.29 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 3.59 (s, 3H), 3.10 - 3.02 (m, 1H), 2.25 (s, 1H), 2.16 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 2.10 (d, J = 8.2 Hz, 3H), 1.49 (d, J = 21.9 Hz, 3H), 1.30 (dd, J = 21.1, 8.2 Hz, 3H), 1.20 (dd, J = 24.0, 9.3 Hz, 4H).	607.2	B	B
I-2625		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.72 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 21.6, 7.8 Hz, 2H), 7.57 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 6.45 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.11 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.01 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.28 (t, J = 8.2 Hz, 4H), 2.24 - 2.20 (m, 1H), 2.11 (s, 1H), 2.08 - 2.01 (m, 1H), 2.00 - 1.90 (m, 3H), 1.88 - 1.81 (m, 1H), 1.49 (d, J = 21.4 Hz, 3H), 1.30 (dd, J = 21.3, 8.3 Hz, 3H), 1.25 - 1.15 (m, 4H).	548.2	B	A

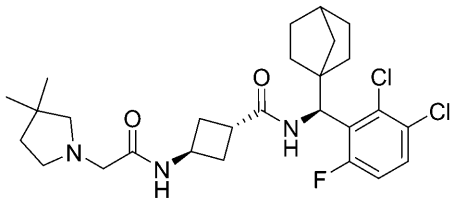
【表１－８３２】

I-2626		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.68 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 5.6 Hz, 4H), 7.31 - 7.25 (m, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.50 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 3.14 - 3.02 (m, 1H), 2.40 - 2.37 (m, 1H), 2.30 (dd, J = 12.9, 6.9 Hz, 2H), 2.12 (d, J = 4.5 Hz, 2H), 1.57 - 1.47 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 20.7, 8.2 Hz, 3H), 1.21 (dd, J = 22.4, 9.7 Hz, 4H).	597	B	A
I-2627		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.53 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.80 - 7.70 (m, 2H), 7.61 - 7.52 (m, 2H), 7.29 - 7.14 (m, 4H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 4.46 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 3.07 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 2.26 (s, 2H), 2.22 (s, 1H), 2.19 - 2.15 (m, 1H), 2.12 (s, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.57 - 1.47 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 20.7, 8.5 Hz, 3H), 1.27 - 1.18 (m, 4H).	583.2	B	B

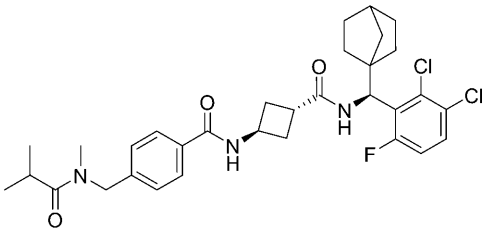
【表１－８３３】

I-2628		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.52 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.88 (t, J = 5.2 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.29 - 7.19 (m, 2H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.41 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 3.22 - 3.15 (m, 2H), 3.06 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 2.98 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.30 - 2.25 (m, 2H), 2.22 - 2.17 (m, 1H), 2.12 (h, J = 4.9, 4.4 Hz, 2H), 1.93 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.50 (d, J = 24.3 Hz, 3H), 1.32 (dd, J = 24.6, 12.1 Hz, 3H), 1.21 (dd, J = 23.0, 9.5 Hz, 4H).	562	C	

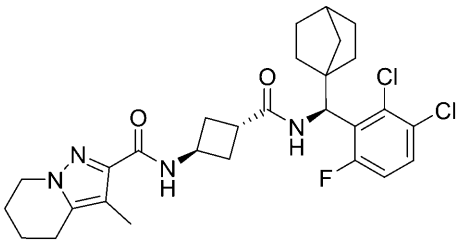
【表１－８３４】

I-2629		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.06 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.29 (h, J = 8.2 Hz, 1H), 3.07 - 2.99 (m, 1H), 2.92 (s, 2H), 2.58 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 2.27 (s, 2H), 2.23 (dd, J = 7.6, 3.7 Hz, 1H), 2.17 - 2.13 (m, 1H), 2.11 (s, 1H), 2.10 - 2.07 (m, 1H), 1.84 (s, 1H), 1.50 (p, J = 6.8, 5.1 Hz, 5H), 1.31 (dd, J = 21.1, 8.0 Hz, 3H), 1.20 (dd, J = 23.6, 9.5 Hz, 4H), 1.03 (s, 6H).	524.2	B	B

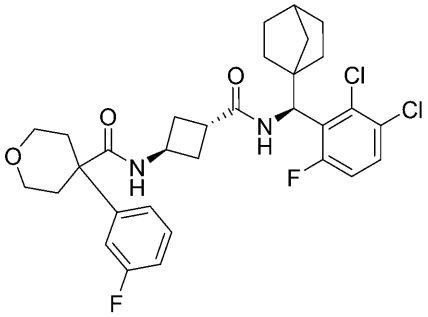
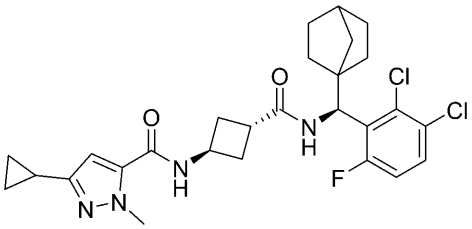
【表１－８３５】

I-2630		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.02 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.36 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 7.12 (dd, J = 13.5, 8.4 Hz, 2H), 7.05 (td, J = 8.5, 2.6 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.22 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 3.71 (dt, J = 12.0, 3.7 Hz, 2H), 3.38 (t, J = 11.2 Hz, 2H), 3.03 - 2.97 (m, 1H), 2.39 (d, J = 13.6 Hz, 3H), 2.23 - 2.18 (m, 1H), 2.10 (s, 1H), 2.05 - 2.01 (m, 2H), 1.82 - 1.77 (m, 2H), 1.49 (d, J = 20.9 Hz, 3H), 1.29 (dd, J = 21.6, 8.3 Hz, 3H), 1.24 - 1.15 (m, 4H).	591	B	A

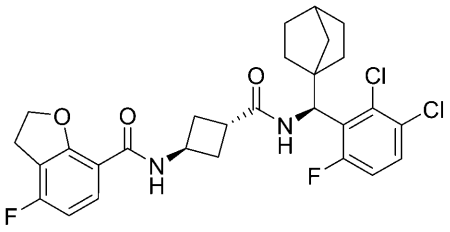
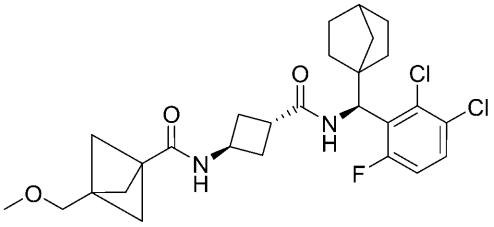
【表１－８３６】

I-2631		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.73 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.57 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.65 - 7.51 (m, 2H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.68 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.81 (p, J = 7.1 Hz, 1H), 4.48 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 3.15 - 3.07 (m, 1H), 2.44 - 2.39 (m, 3H), 2.28 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 2.23 (d, J = 10.6 Hz, 1H), 2.21 - 2.15 (m, 1H), 2.12 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 2.08 - 2.01 (m, 2H), 1.79 (q, J = 10.1 Hz, 1H), 1.70 - 1.61 (m, 1H), 1.57 - 1.46 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 25.5, 12.4 Hz, 3H), 1.22 (dd, J = 22.0, 9.5 Hz, 4H).	560.2	D	

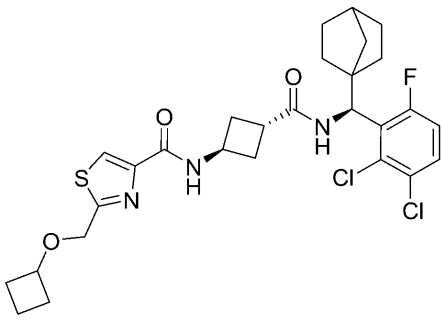
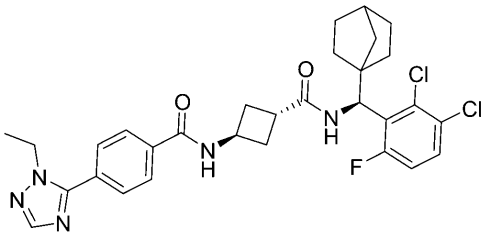
【表１－８３７】

I-2632		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.85 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.10 (dd, J = 8.2, 4.6 Hz, 2H), 8.02 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.70 - 7.55 (m, 2H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.52 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 3.16 - 3.10 (m, 1H), 2.67 (s, 3H), 2.33 - 2.28 (m, 2H), 2.25 (t, J = 10.2 Hz, 1H), 2.21 - 2.17 (m, 1H), 2.12 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 1.58 - 1.47 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 20.9, 8.2 Hz, 3H), 1.22 (dd, J = 21.7, 10.0 Hz, 4H).	571.2	B	A
I-2633		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.72 (s, 1H), 8.61 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.62 - 7.53 (m, 4H), 7.21 (dd, J = 10.5, 9.0 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.36 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 3.04 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 2.33 - 2.23 (m, 3H), 2.09 (d, J = 13.4 Hz, 2H), 1.49 (d, J = 22.6 Hz, 3H), 1.36 - 1.27 (m, 3H), 1.20 (dd, J = 24.2, 9.2 Hz, 4H).	628	B	B

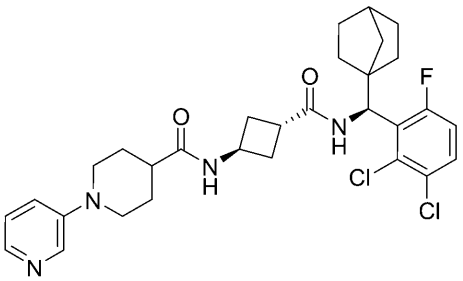
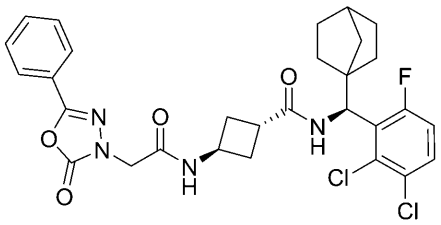
【表１－８３８】

I-2634		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.54 (dd, J = 17.7, 7.6 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.89 - 7.77 (m, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.23 (t, J = 9.2 Hz, 3H), 5.68 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.65 (s, 1H), 4.52 (s, 1H), 4.47 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 3.09 (s, 1H), 2.97 - 2.86 (m, 3H), 2.80 (s, 1H), 2.32 (s, 1H), 2.24 (dd, J = 21.7, 10.0 Hz, 2H), 2.16 (dd, J = 7.7, 3.6 Hz, 1H), 2.12 (s, 1H), 1.57 - 1.46 (m, 3H), 1.37 - 1.28 (m, 3H), 1.21 (dd, J = 22.1, 9.9 Hz, 4H), 0.99 (dd, J = 33.2, 6.7 Hz, 6H).	602.2	C	
I-2635		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.06 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 10.5, 8.9 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.25 (h, J = 8.2 Hz, 1H), 3.21 (s, 3H), 3.02 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 2.23 - 2.00 (m, 6H), 1.77 (s, 7H), 1.49 (d, J = 22.2 Hz, 3H), 1.30 (dd, J = 18.7, 8.3 Hz, 3H), 1.20 (dd, J = 25.0, 8.9 Hz, 4H).	525.2	B	A

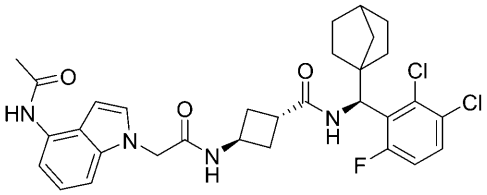
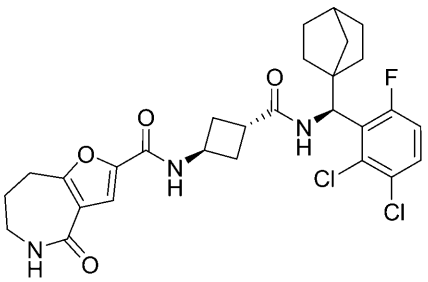
【表１－８３９】

I-2636		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.89 - 7.79 (m, 2H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 7.08 - 6.97 (m, 2H), 5.67 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.42 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.13 - 3.05 (m, 1H), 2.55 (s, 3H), 2.31 (dd, J = 11.8, 3.8 Hz, 1H), 2.25 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 2.20 - 2.15 (m, 1H), 2.12 (d, J = 4.4 Hz, 2H), 1.59 - 1.47 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 25.6, 11.6 Hz, 3H), 1.21 (dd, J = 22.4, 10.0 Hz, 4H).	616.2	C	
I-2637		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.05 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 - 7.56 (m, 2H), 7.22 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.29 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.99 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.24 - 2.18 (m, 1H), 2.12 - 2.07 (m, 2H), 2.05 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 2.01 (s, 3H), 1.49 (d, J = 20.7 Hz, 3H), 1.33 (s, 9H), 1.20 (dd, J = 24.0, 8.8 Hz, 4H).	550.2	A	A

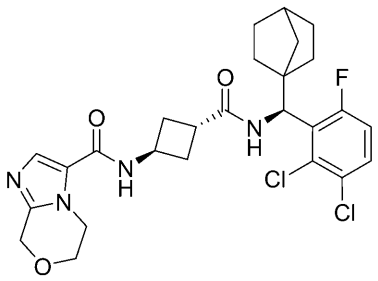
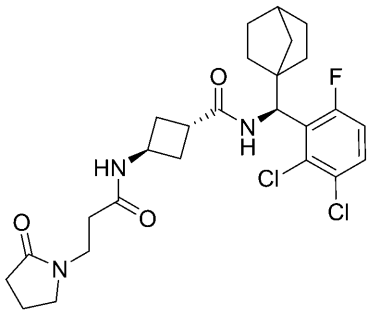
【表１－８４０】

I-2638		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.26 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 8.03 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 7.98 - 7.89 (m, 1H), 7.58 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 8.5, 3.0 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.21 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 3.75 (dd, J = 9.9, 6.2 Hz, 2H), 3.04 (dd, J = 8.9, 4.8 Hz, 1H), 2.68 (td, J = 12.4, 2.7 Hz, 2H), 2.25 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 2.20 (t, J = 3.8 Hz, 1H), 2.12 - 2.02 (m, 4H), 1.73 - 1.68 (m, 2H), 1.60 (td, J = 12.2, 11.7, 3.8 Hz, 2H), 1.50 (t, J = 11.7 Hz, 3H), 1.31 (dd, J = 20.8, 8.3 Hz, 3H), 1.20 (dd, J = 24.1, 9.2 Hz, 4H).	573.2	A	A
I-2639		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.11 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.59 (ddd, J = 9.0, 5.5, 3.4 Hz, 2H), 7.23 (dd, J = 10.5, 8.9 Hz, 1H), 6.76 (t, J = 8.5 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.78 (t, J = 8.7 Hz, 2H), 4.46 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.25 (t, J = 8.7 Hz, 3H), 3.10 (s, 1H), 2.18 (dd, J = 15.7, 8.6 Hz, 2H), 2.12 (s, 1H), 1.57 - 1.46 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 20.6, 7.9 Hz, 3H), 1.21 (dd, J = 22.7, 9.6 Hz, 4H).	549	B	B

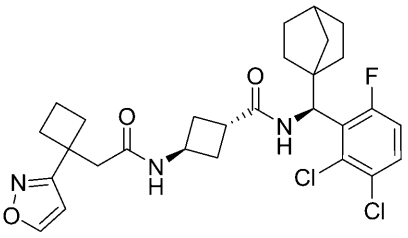
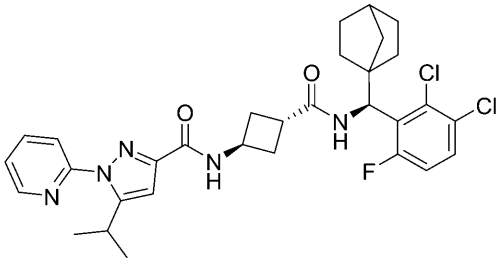
【表１－８４１】

I-2640		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.58 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.68 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.69 (s, 2H), 4.48 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 4.10 (q, J = 9.4 Hz, 2H), 3.14 - 3.07 (m, 1H), 2.27 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 2.23 (d, J = 10.8 Hz, 1H), 2.20 - 2.15 (m, 1H), 2.12 (s, 1H), 1.51 (t, J = 14.1 Hz, 3H), 1.33 (dd, J = 25.6, 11.6 Hz, 3H), 1.21 (dd, J = 22.5, 9.8 Hz, 4H).	601	A	A
I-2641		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.43 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 6.50 (s, 1H), 5.67 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.39 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.07 (td, J = 9.4, 8.8, 4.6 Hz, 1H), 2.29 (dd, J = 7.6, 3.8 Hz, 1H), 2.25 - 2.21 (m, 1H), 2.20 - 2.16 (m, 1H), 2.16 - 2.10 (m, 2H), 1.83 (td, J = 8.5, 4.2 Hz, 1H), 1.57 - 1.46 (m, 3H), 1.31 (dd, J = 21.2, 8.3 Hz, 3H), 1.21 (dd, J = 23.0, 9.5 Hz, 4H), 0.88 - 0.81 (m, 2H), 0.61 - 0.54 (m, 2H).	533.2	A	A

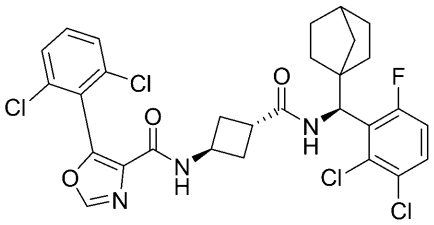
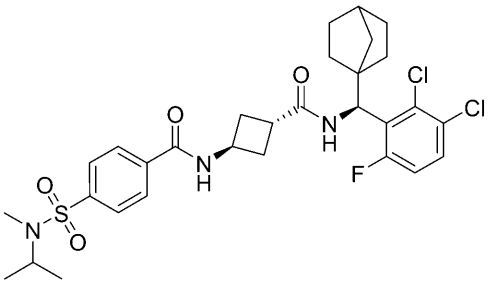
【表１－８４２】

I-2642		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.33 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.65 - 7.54 (m, 2H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.71 (s, 2H), 4.42 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 4.19 (t, J = 5.2 Hz, 2H), 3.93 (t, J = 5.2 Hz, 2H), 3.12 - 3.05 (m, 1H), 2.33 - 2.27 (m, 1H), 2.26 - 2.20 (m, 1H), 2.14 (dt, J = 19.7, 6.4 Hz, 3H), 1.57 - 1.46 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 20.8, 8.3 Hz, 3H), 1.23 (q, J = 13.5, 10.9 Hz, 4H).	535	A	A
I-2643		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.83 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.92 - 7.79 (m, 2H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.68 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.48 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 4.06 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 3.10 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 2.63 (s, 3H), 2.52 (s, 1H), 2.35 - 2.16 (m, 4H), 1.50 (d, J = 16.4 Hz, 3H), 1.38 - 1.28 (m, 3H), 1.21 (dd, J = 22.0, 9.9 Hz, 4H), 0.86 (d, J = 6.7 Hz, 6H).	525.7	A	A

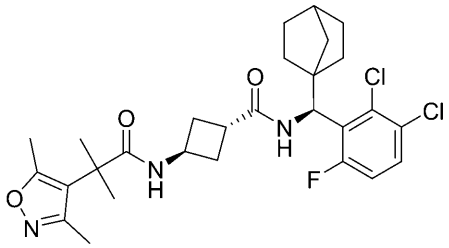
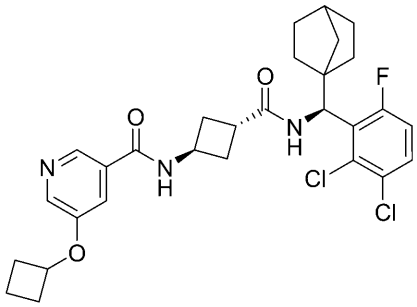
【表１－８４３】

I-2644		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.04 (dd, J = 17.4, 8.3 Hz, 2H), 7.58 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.45 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 4.02 (t, J = 6.1 Hz, 2H), 3.07 - 3.00 (m, 1H), 2.59 (t, J = 6.5 Hz, 3H), 2.25 (ddd, J = 11.8, 7.5, 3.1 Hz, 3H), 2.11 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.93 (qd, J = 7.4, 6.0, 4.1 Hz, 2H), 1.76 (ddt, J = 10.2, 7.3, 4.5 Hz, 2H), 1.57 - 1.46 (m, 3H), 1.31 (dd, J = 19.5, 8.0 Hz, 3H), 1.26 - 1.17 (m, 4H).	547.2	B	A
I-2645			587	D	

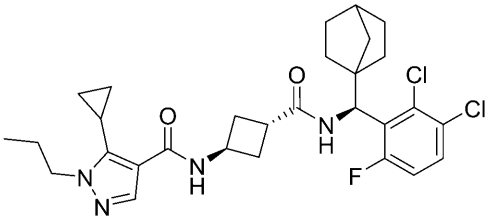
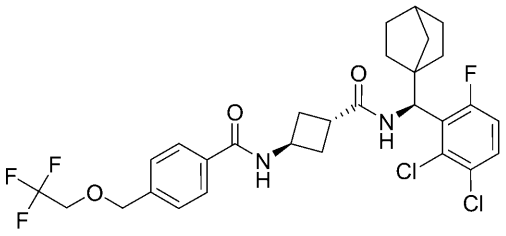
【表１－８４４】

I-2646		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.06 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.63 - 7.54 (m, 2H), 7.23 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.39 (dt, J = 15.6, 7.8 Hz, 1H), 4.08 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 3.06 (s, 1H), 2.29 (s, 1H), 2.23 - 2.17 (m, 1H), 2.17 - 2.11 (m, 3H), 1.83 (ddd, J = 8.4, 5.3, 3.0 Hz, 1H), 1.76 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.57 - 1.47 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 21.2, 8.0 Hz, 3H), 1.26 - 1.18 (m, 4H), 0.99 - 0.92 (m, 2H), 0.83 (t, J = 7.4 Hz, 3H), 0.73 - 0.65 (m, 2H).	563.2	D	
I-2647		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.52 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.08 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.66 (s, 2H), 4.51 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 4.09 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.04 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 2.41 - 2.23 (m, 4H), 2.14 (dtd, J = 24.4, 8.5, 5.0 Hz, 4H), 1.95 - 1.84 (m, 2H), 1.64 (q, J = 10.0 Hz, 1H), 1.55 - 1.44 (m, 3H), 1.39 - 1.27 (m, 3H), 1.27 - 1.15 (m, 4H).	625.8	B	A

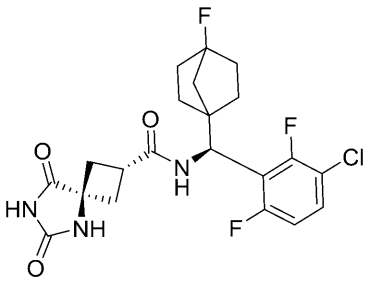
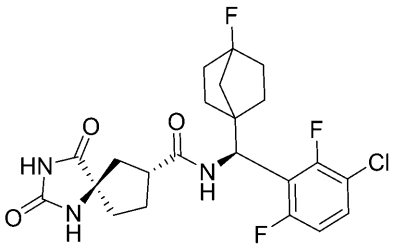
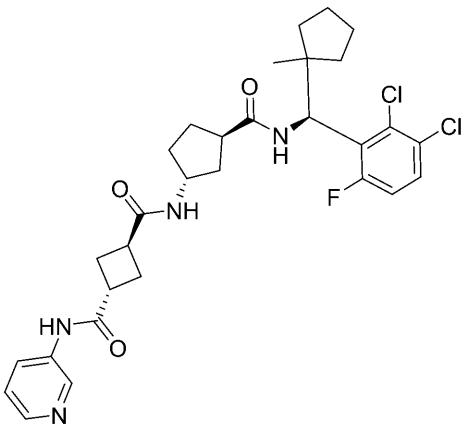
【表１－８４５】

I-2648		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 9.56 (s, 1H), 8.44 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.67 - 7.52 (m, 2H), 7.25 - 7.14 (m, 2H), 7.06 - 6.94 (m, 2H), 6.69 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.71 (s, 2H), 4.24 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 3.06 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 2.31 - 2.23 (m, 1H), 2.11 (d, J = 5.8 Hz, 6H), 2.09 - 2.04 (m, 1H), 1.49 (d, J = 22.2 Hz, 3H), 1.30 (dd, J = 20.6, 8.0 Hz, 3H), 1.20 (dd, J = 24.6, 9.1 Hz, 4H).	599	B	A
I-2649		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.75 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.98 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.77 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.50 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 4.25 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.12 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.33 - 2.28 (m, 2H), 2.25 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 2.23 - 2.18 (m, 1H), 2.12 (s, 1H), 2.07 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 1.51 (t, J = 14.5 Hz, 3H), 1.36 (t, J = 7.3 Hz, 4H), 1.33 - 1.28 (m, 2H), 1.23 (dt, J = 21.7, 9.7 Hz, 4H).	586	B	B

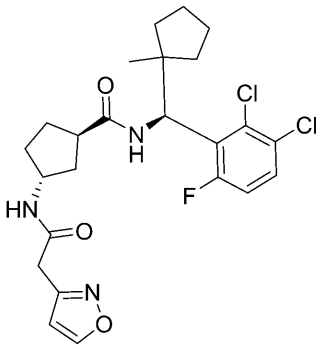
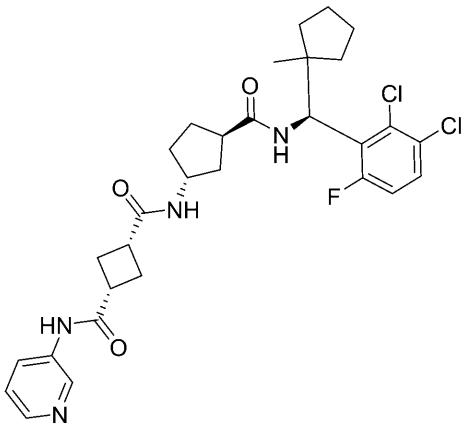
【表１－８４６】

I-2650		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.53 (dd, J = 5.0, 1.7 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.13 - 8.01 (m, 2H), 7.91 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 7.5, 4.9 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 6.67 (s, 1H), 5.68 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.51 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 3.79 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 3.06 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 2.32 - 2.25 (m, 3H), 2.12 (q, J = 5.5, 4.0 Hz, 2H), 1.57 - 1.47 (m, 3H), 1.32 (dd, J = 20.4, 7.9 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 9.1 Hz, 4H), 1.17 (d, J = 6.8 Hz, 6H).	598	A	A
I-2651		1H NMR (500 MHz, DMSO-d6) ? 8.14 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.31 - 7.19 (m, 1H), 5.65 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.20 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 3.29 - 3.22 (m, 4H), 3.04 (s, 1H), 2.25 (s, 1H), 2.20 - 2.16 (m, 2H), 2.15 - 2.10 (m, 2H), 2.06 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 1.99 (dd, J = 20.6, 10.9 Hz, 2H), 1.85 (p, J = 7.5 Hz, 2H), 1.50 (d, J = 22.8 Hz, 3H), 1.36 - 1.15 (m, 7H).	524.2	B	B

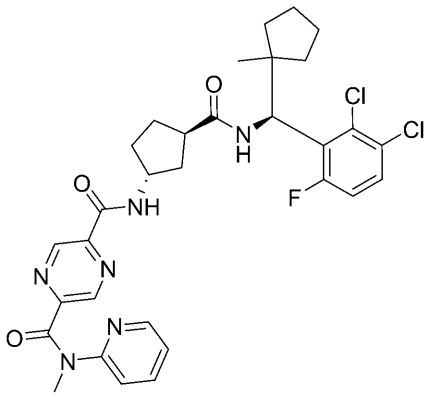
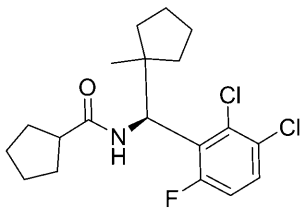
【表１－８４７】

I-2652		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.8, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.24 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.64 (dt, J = 34.6, 10.7 Hz, 2H), 2.31 - 2.14 (m, 2H), 1.76 (dt, J = 19.8, 11.1 Hz, 7H), 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.47 (d, J = 9.7 Hz, 2H).	455	A	A
I-2653		(400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.58 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.03 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 2.21 - 2.05 (m, 1H), 1.94 (tt, J = 14.3, 7.0 Hz, 3H), 1.88 - 1.57 (m, 10H), 1.47 (d, J = 10.0 Hz, 2H).	470.05	A	A
I-2654		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.05 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.24 (dd, J = 4.7, 1.5 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.80 - 7.54 (m, 2H), 7.38 - 7.15 (m, 2H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.05 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 2.99 (q, J = 8.2 Hz, 2H), 2.31 (q, J = 9.2, 8.4 Hz, 4H), 1.85 (ddt, J = 27.9, 13.2, 7.5 Hz, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.41 (d, J = 23.2 Hz, 3H), 1.26 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	588	B	B

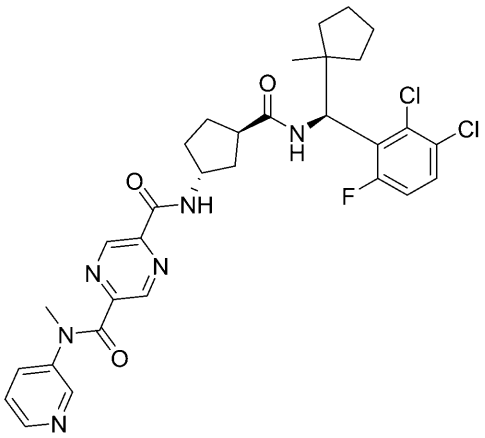
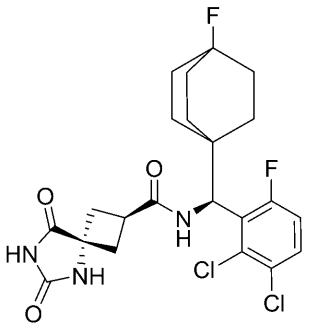
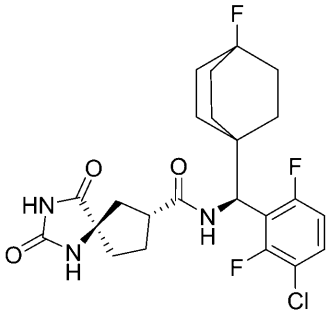
【表１－８４８】

I-2655		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.80 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.10 (dd, J = 35.3, 7.7 Hz, 2H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 6.48 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.16 - 3.92 (m, 1H), 3.52 (s, 2H), 2.99 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.02 - 1.73 (m, 3H), 1.72 - 1.51 (m, 7H), 1.50 - 1.33 (m, 3H), 1.31 - 1.17 (m, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	496.05	B	A
I-2656		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.05 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.24 (dd, J = 4.7, 1.5 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.80 - 7.54 (m, 2H), 7.38 - 7.15 (m, 2H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.05 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.27 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 2.99 (q, J = 8.2 Hz, 2H), 2.31 (q, J = 9.2, 8.4 Hz, 4H), 1.85 (ddt, J = 27.9, 13.2, 7.5 Hz, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.41 (d, J = 23.2 Hz, 3H), 1.26 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	588	B	B

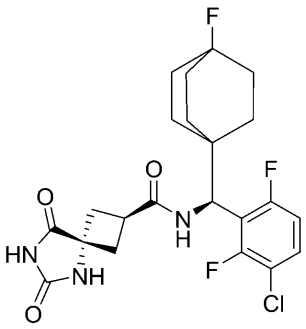
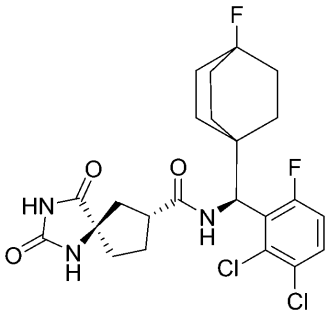
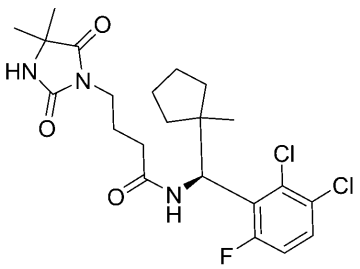
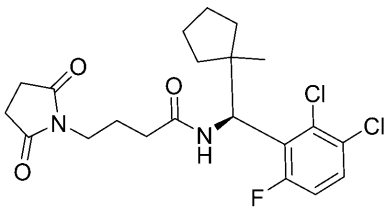
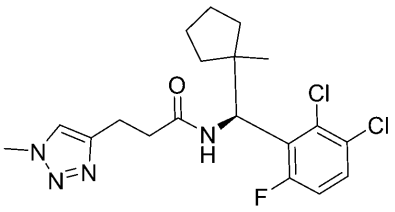
【表１－８４９】

I-2657		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.90 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.80 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.12 (dd, J = 5.1, 1.9 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.78 (td, J = 7.8, 2.0 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 7.16 (ddd, J = 7.4, 4.9, 1.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.31 (p, J = 7.1 Hz, 1H), 3.52 (s, 3H), 3.06 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.89 (ddt, J = 28.3, 12.6, 7.2 Hz, 3H), 1.60 (s, 8H), 1.53 - 1.42 (m, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	627.3	B	B
I-2658		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.98 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.89 - 2.73 (m, 1H), 1.82 - 1.66 (m, 1H), 1.65 - 1.50 (m, 10H), 1.47 - 1.30 (m, 4H), 1.27 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	372.05	D	

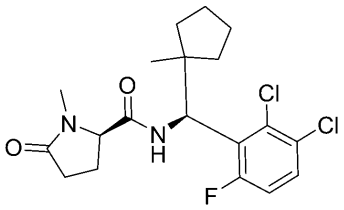
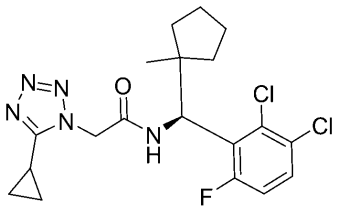
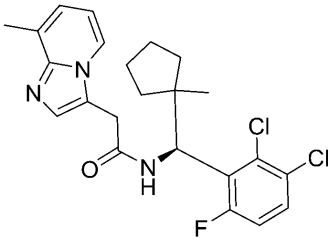
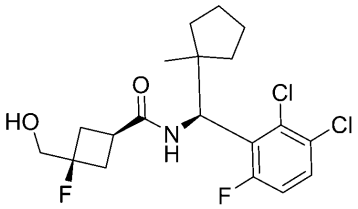
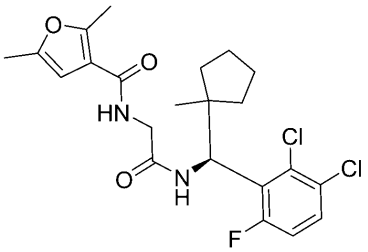
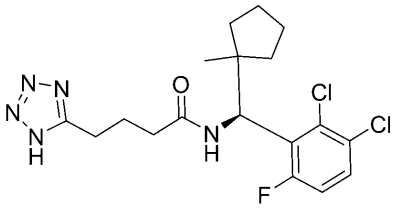
【表１－８５０】

I-2659		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.90 (s, 1H), 8.81 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.38 (s, 2H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.37 - 7.31 (m, 1H), 7.25 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.28 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 3.47 (s, 3H), 3.08 - 3.00 (m, 1H), 1.86 (s, 4H), 1.59 (s, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	627.3	B	A
I-2660		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.67-7.59 (m, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.33 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.23 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.66 (dd, J = 12.1, 8.9 Hz, 1H), 2.57 (dd, J = 12.1, 8.9 Hz, 1H), 2.28-2.18 (m, 1H), 2.21-2.07 (m, 1H), 1.71 (q, J = 6.0, 5.1 Hz, 12H).	486.15	A	B
I-2661		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.31 (s, 1H), 8.22 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 5.02 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.09 (dd, J = 13.2, 10.0 Hz, 1H), 2.01 - 1.85 (m, 3H), 1.68 (td, J = 14.2, 12.6, 7.0 Hz, 14H).	484.2	B	B

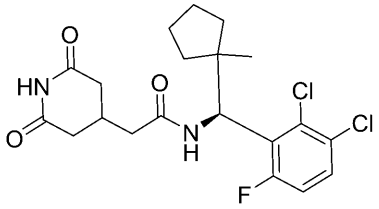
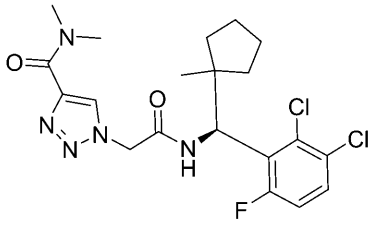
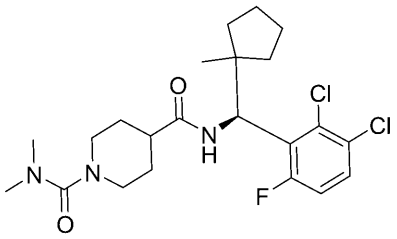
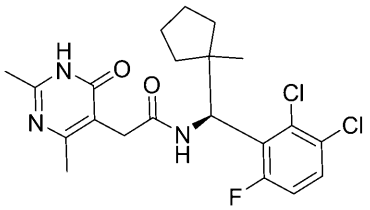
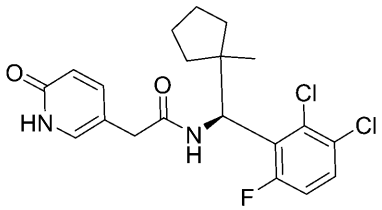
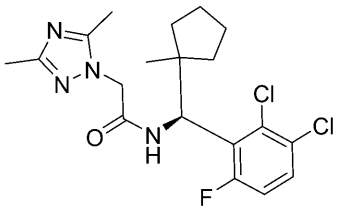
【表１－８５１】

I-2662		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.21 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (s, 1H), 5.04 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.23 (p, J = 9.1 Hz, 1H), 2.70 - 2.54 (m, 2H), 2.28 - 2.12 (m, 2H), 1.69 (dt, J = 16.6, 9.8 Hz, 12H).	470.15	B	A
I-2663		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.45 (s, 1H), 8.37-8.15 (m, 2H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.31 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.03 (q, J = 8.7, 8.2 Hz, 1H), 2.10 (dd, J = 13.2, 10.0 Hz, 1H), 2.05-1.81 (m, 2H), 1.82-1.51 (m, 15H).	500.2	B	A
I-2664			472.2	D	
I-2665			443.05	D	
I-2666			413.1	D	

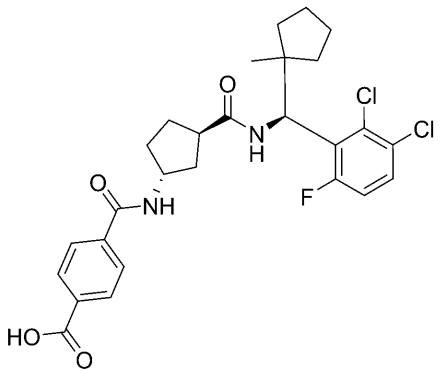
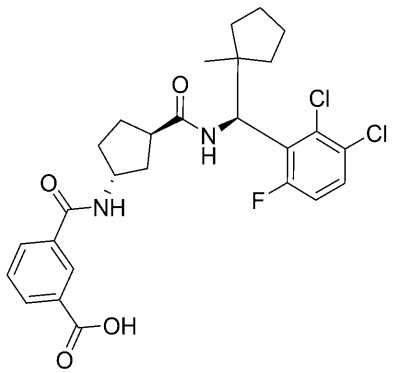
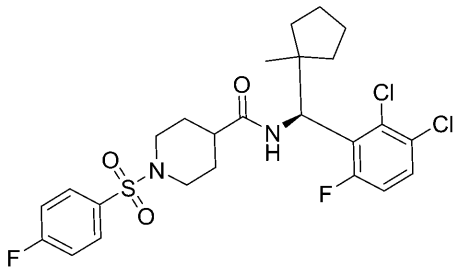
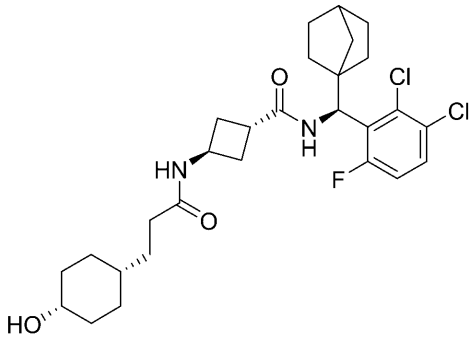
【表１－８５２】

I-2667			401.15	D	
I-2668			426.05	B	B
I-2669			448.05	D	
I-2670			406.05	C	
I-2671			455.1	D	
I-2672			414.1	D	

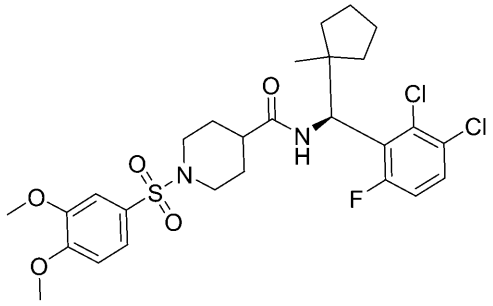
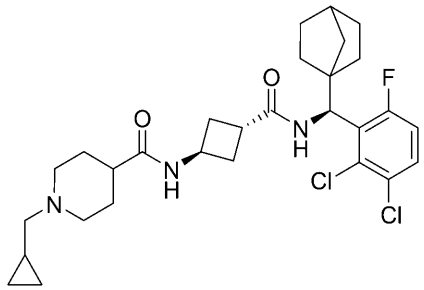
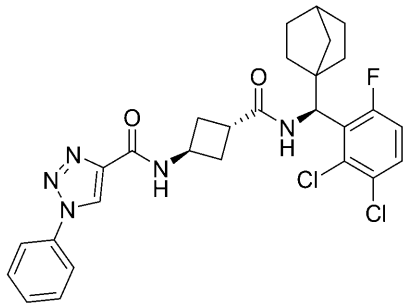
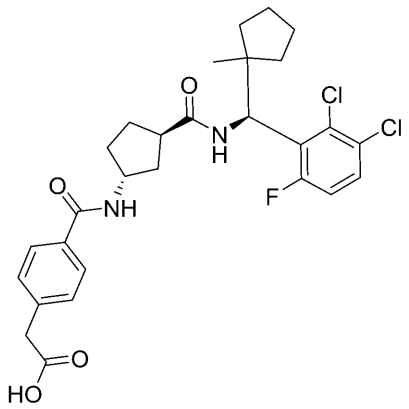
【表１－８５３】

I-2673			429.05	C	
I-2674			456.05	C	
I-2675			458.1	C	
I-2676			440.05	D	
I-2677			411.05	B	
I-2678			413.05	C	

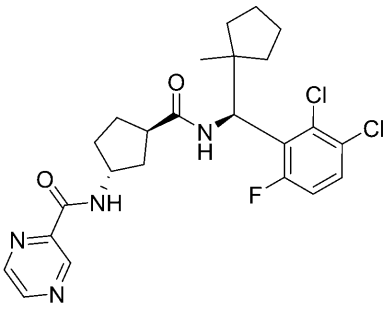
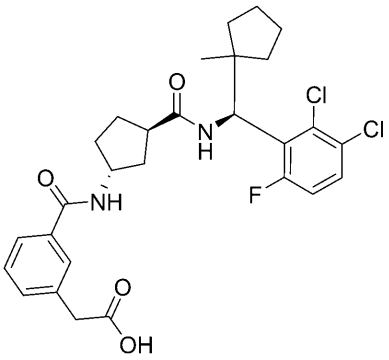
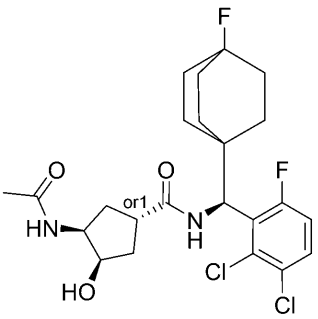
【表１－８５４】

I-2679		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 13.16 (s, 1H), 8.43 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.00 (td, J = 27.7, 8.3 Hz, 5H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.34 - 7.11 (m, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.27 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 3.14 - 2.94 (m, 1H), 2.07 - 1.70 (m, 4H), 1.60 (s, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 13.0 Hz, 1H), 0.97 (s, 3H).	535.1	B	B
I-2680		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 13.16 (s, 1H), 8.60 - 8.32 (m, 2H), 8.08 (d, J = 7.6 Hz, 3H), 7.74 - 7.53 (m, 2H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.28 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 3.07 (s, 1H), 1.93 (d, J = 21.3 Hz, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.50 (s, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (s, 3H).	535.15	B	D
I-2681			545.3	D	
I-2682			539.2	B	B

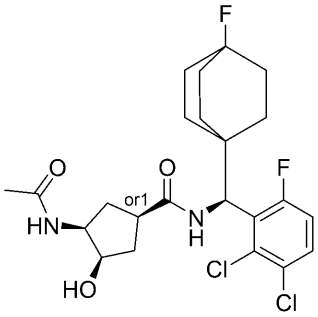
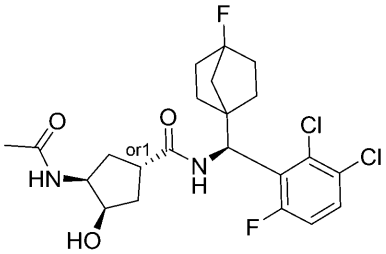
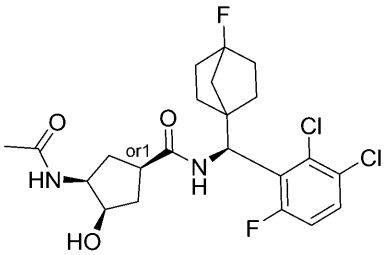
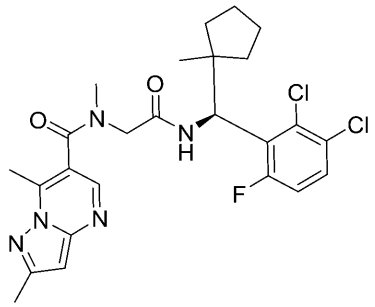
【表１－８５５】

I-2683			587.4	D	
I-2684			551.2	B	B
I-2685				B	A
I-2686		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 12.39 (s, 1H), 8.16 (dd, J = 64.5, 7.7 Hz, 2H), 7.80 - 7.54 (m, 3H), 7.45 - 7.16 (m, 3H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.25 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 3.62 (s, 2H), 3.04 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.88 (dddd, J = 48.0, 19.1, 13.5, 8.0 Hz, 4H), 1.70 - 1.10 (m, 10H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	549.15	B	B

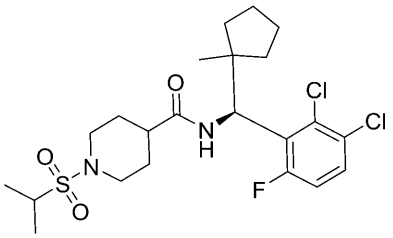
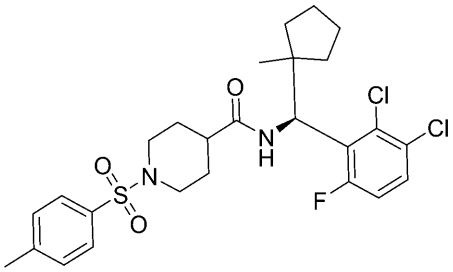
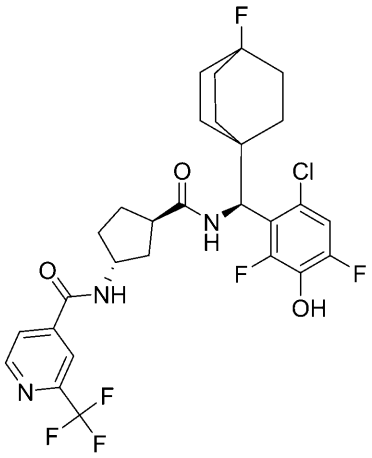
【表１－８５６】

I-2687		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.17 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.76 - 8.61 (m, 2H), 8.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.33 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.14 - 2.97 (m, 1H), 2.07 - 1.77 (m, 4H), 1.71 - 1.45 (m, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	493.1	B	A
I-2688		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 12.39 (s, 1H), 8.21 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.84 - 7.69 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.40 - 7.17 (m, 3H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.25 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 3.63 (s, 2H), 3.04 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.06 - 1.74 (m, 4H), 1.71 - 1.20 (m, 10H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	549.15	B	C
I-2689		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.77 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.98 - 3.92 (m, 1H), 3.86 (dd, J = 10.8, 7.2 Hz, 1H), 3.12 - 3.03 (m, 1H), 1.84 - 1.75 (m, 6H), 1.74 - 1.56 (m, 12H), 1.56 - 1.51 (m, 1H).	489.15	D	

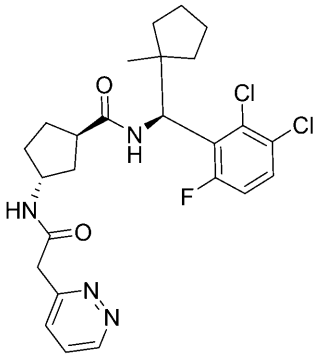
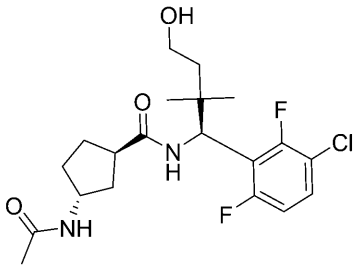
【表１－８５７】

I-2690		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.20 - 8.04 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.31 - 7.20 (m, 1H), 5.33 - 5.11 (m, 1H), 4.76 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.95 - 3.85 (m, 2H), 3.12 - 2.89 (m, 1H), 2.03 - 1.39 (m, 19H).	489.1	B	B
I-2691		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.52 - 5.31 (m, 1H), 4.79 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.00 - 3.81 (m, 2H), 3.13 - 3.03 (m, 1H), 1.96 - 1.38 (m, 17H).	475.15	C	
I-2692		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.77 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.98 - 3.85 (m, 2H), 3.13 - 2.89 (m, 1H), 2.03 - 1.83 (m, 2H), 1.80 (s, 6H), 1.74 - 1.64 (m, 4H), 1.64 - 1.44 (m, 5H).	475.05	B	A
I-2693			520.1	D	

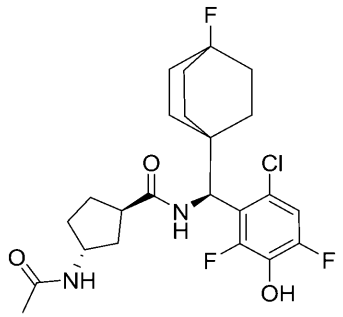
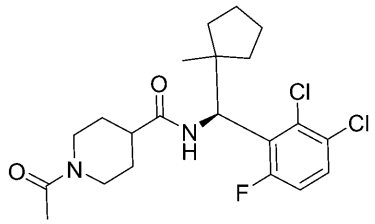
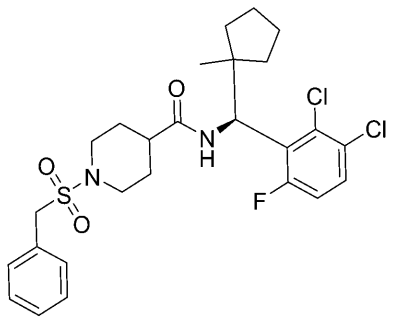
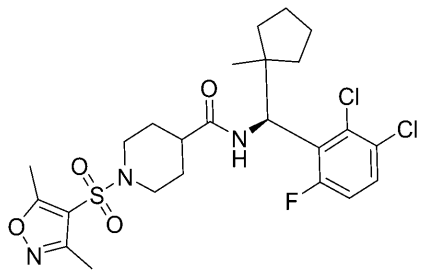
【表１－８５８】

I-2694			493.1	C	B
I-2695			541.2	D	
I-2696		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.41 (s, 1H), 8.93 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.80 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 8.09 (dd, J = 5.0, 1.5 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 5.22 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 4.29 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.00 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.07 - 1.78 (m, 4H), 1.78 - 1.37 (m, 14H).	604.05	E	

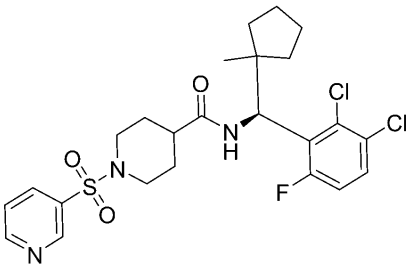
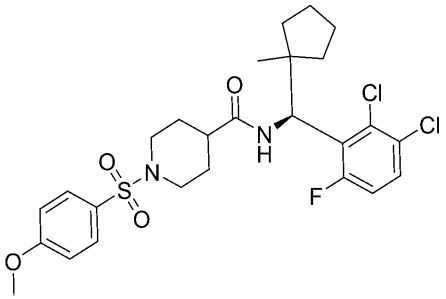
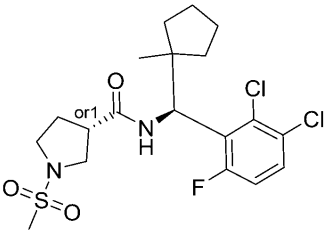
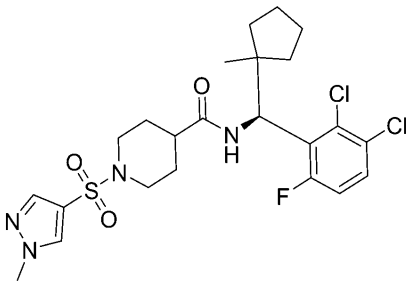
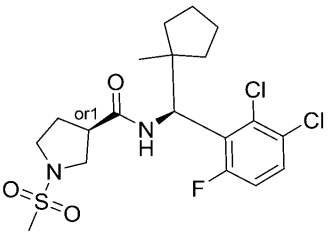
【表１－８５９】

I-2697		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.10 (dd, J = 3.9, 2.7 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.63 (m, 3H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.03 (q, J = 6.5, 6.5, 6.5 Hz, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.00 (m, 1H), 1.90 (dt, J = 13.9, 7.3, 7.3 Hz, 1H), 1.83 (q, J = 7.1, 6.5, 6.5 Hz, 1H), 1.67 (dt, J = 9.9, 5.3, 5.3 Hz, 1H), 1.59 (m, 7H), 1.44 (m, 1H), 1.38 (s, 2H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	507.15	B	A
I-2698		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.37 (s, 1H), 4.01 (p, J = 6.4 Hz, 1H), 3.45 (s, 2H), 2.96 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.95 - 1.70 (m, 6H), 1.60 (ddd, J = 14.7, 9.0, 6.0 Hz, 2H), 1.37 (tq, J = 15.6, 8.0, 7.3 Hz, 3H), 0.90 (d, J = 23.2 Hz, 6H).	417.15	E	

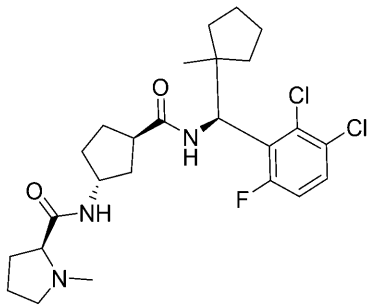
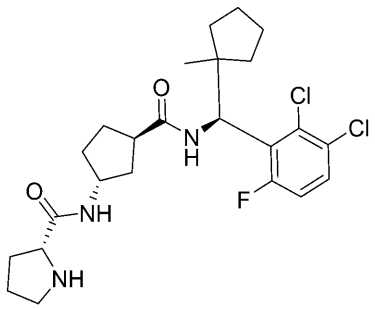
【表１－８６０】

I-2699		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.38 (s, 1H), 8.08 - 7.88 (m, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.42 - 7.05 (m, 1H), 5.20 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.99 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 2.92 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 2.03 - 1.75 (m, 7H), 1.75 - 1.55 (m, 12H), 1.46 (dq, J = 12.4, 8.7, 7.8 Hz, 1H), 1.35 (dq, J = 16.1, 9.3, 8.1 Hz, 1H).	473.05	E	
I-2700			429.5	D	
I-2701				D	
I-2702				D	

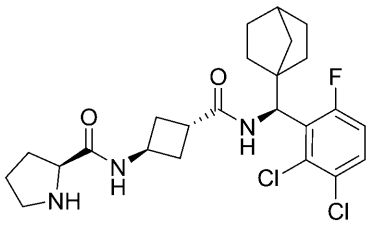
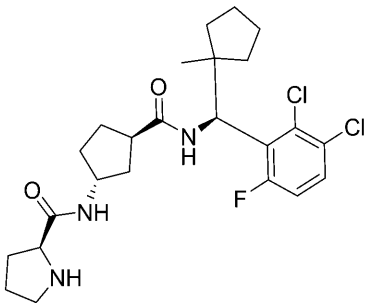
【表１－８６１】

I-2703				C	
I-2704				D	
I-2705			451.1	A	A
I-2706			531.1	B	B
I-2707			451.1	C	

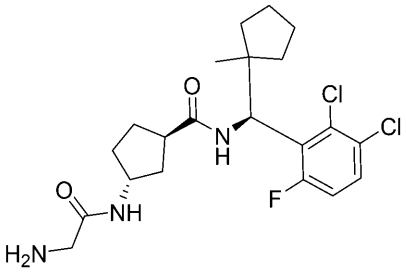
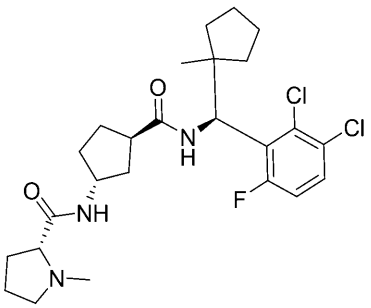
【表１－８６２】

I-2708		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.07 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.13 - 2.84 (m, 2H), 2.64 (dd, J = 9.4, 6.1 Hz, 1H), 2.23 (s, 4H), 2.10 - 1.97 (m, 1H), 1.94 - 1.74 (m, 3H), 1.73 - 1.50 (m, 10H), 1.43 (qd, J = 11.1, 9.4, 5.1 Hz, 3H), 1.27 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	498.25	B	B
I-2709		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.26 - 8.16 (m, 1H), 8.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.04 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 3.62 - 3.53 (m, 1H), 3.00 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.87 (hept, J = 4.4, 4.0 Hz, 2H), 2.04 - 1.72 (m, 4H), 1.72 - 1.45 (m, 10H), 1.45 -1.32 (m, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	484.2	B	B

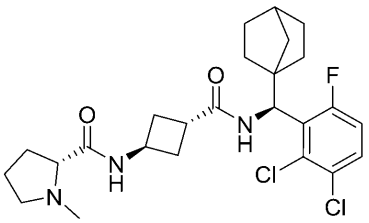
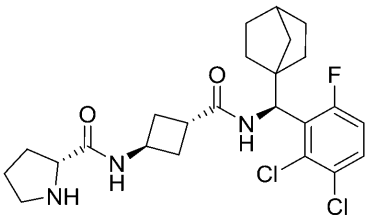
【表１－８６３】

I-2710		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.07 (t, J = 8.5 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.28 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 3.50 (dd, J = 8.5, 5.1 Hz, 1H), 3.08 - 3.02 (m, 1H), 2.84 (td, J = 6.5, 2.0 Hz, 2H), 2.26 (t, J = 10.3 Hz, 1H), 2.19 - 2.05 (m, 4H), 2.00 - 1.89 (m, 1H), 1.68 - 1.47 (m, 6H), 1.27 (ddt, J = 27.0, 20.8, 9.6 Hz, 7H).	482.2	B	B
I-2711		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.03 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.44 (dd, J = 8.6, 5.2 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 2.79 (td, J = 6.5, 2.1 Hz, 2H), 1.95 - 1.76 (m, 4H), 1.68 - 1.52 (m, 10H), 1.41 (ddd, J = 22.9, 11.8, 7.1 Hz, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	484.05	B	B

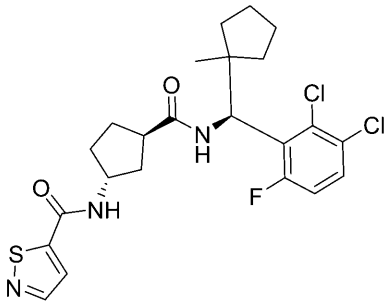
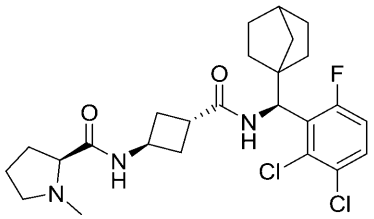
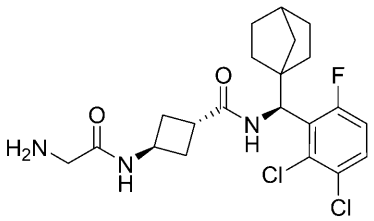
【表１－８６４】

I-2712		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.75-7.48 (m, 2H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.06 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.08-2.91 (m, 3H), 1.85 (ddd, J = 27.2, 14.1, 7.8 Hz, 3H), 1.59 (s, 7H), 1.49-1.33 (m, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	444.15	B	B
I-2713		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.60 (dt, J = 9.0, 2.2 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.05 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.04-2.95 (m, 2H), 2.65 (dd, J = 9.5, 5.7 Hz, 1H), 2.25 (s, 3H), 2.28-2.17 (m, 2H), 2.07-1.96 (m, 1H), 1.95-1.74 (m, 2H), 1.67 (ddt, J = 12.8, 9.7, 4.9 Hz, 4H), 1.59 (s, 6H), 1.42 (td, J = 13.4, 12.9, 7.9 Hz, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	498.15	C	

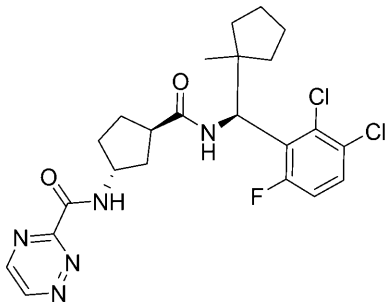
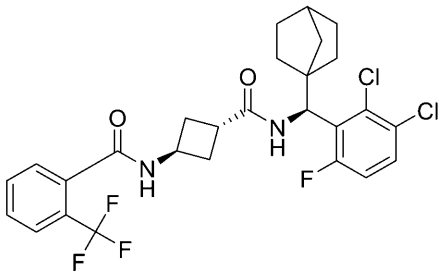
【表１－８６５】

I-2714		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)8.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.28 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 3.09-2.96 (m, 2H), 2.63 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 2.26-1.95 (m, 10H), 1.74-1.56 (m, 2H), 1.53 (s, 4H), 1.33 (dd, J = 16.7, 9.4 Hz, 2H), 1.23 (d, J = 16.0 Hz, 5H).	496.1	B	B
I-2715		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (dd, J = 8.3, 4.5 Hz, 2H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.71 - 5.50 (m, 1H), 4.27 (h, J = 8.2 Hz, 1H), 3.42 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 2H), 3.11 - 3.01 (m, 1H), 2.85 - 2.66 (m, 2H), 2.34 - 2.21 (m, 1H), 2.12 (ddt, J = 15.3, 12.9, 7.6 Hz, 4H), 1.96 - 1.67 (m, 1H), 1.55 (ddt, J = 18.5, 14.0, 8.3 Hz, 6H), 1.27 (ddt, J = 28.0, 21.2, 9.6 Hz, 7H).	482.2	B	B

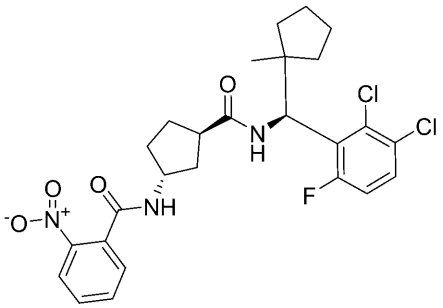
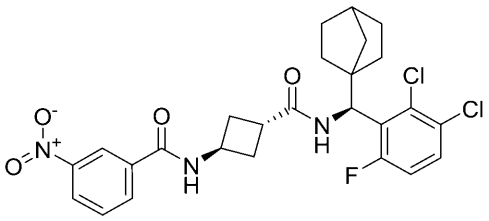
【表１－８６６】

I-2716		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.72-8.62 (m, 2H), 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.22 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.04-1.84 (m, 2H), 1.80 (ddd, J = 13.7, 8.7, 6.1 Hz, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.58-1.42 (m, 1H), 1.48 (s, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	498.05	A	A
I-2717		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.29 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 3.13 - 2.91 (m, 2H), 2.62 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 2.39 - 1.93 (m, 10H), 1.76 - 1.44 (m, 6H), 1.42 - 1.12 (m, 7H).	496.15	B	B
I-2718		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.31 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.00 (s, 3H), 2.21-1.97 (m, 5H), 1.51 (d, J = 18.8 Hz, 3H), 1.42-1.09 (m, 8H).	442.15	A	B

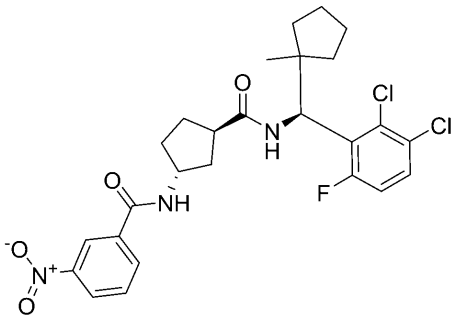
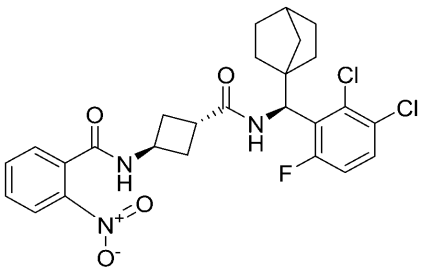
【表１－８６７】

I-2719		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.58 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 9.12-8.91 (m, 2H), 8.11 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.33 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.14-3.04 (m, 1H), 2.04-1.81 (m, 4H), 1.80-1.40 (m, 8H), 1.36 (d, J = 19.0 Hz, 2H), 1.24 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	494.1	B	A
I-2720		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.72 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.71 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 7.67-7.56 (m, 2H), 7.50 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.70 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.43-4.34 (m, 1H), 3.12 (s, 1H), 2.37 (s, 1H), 2.26-2.15 (m, 3H), 2.14 (s, 1H), 1.55 (s, 2H), 1.49 (s, 1H), 1.37 (s, 2H), 1.32 (s, 1H), 1.37-1.30 (m, 1H), 1.23 (dd, J = 16.8, 8.9 Hz, 3H).	557.05	B	B

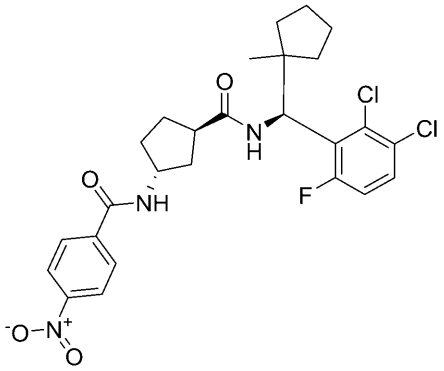
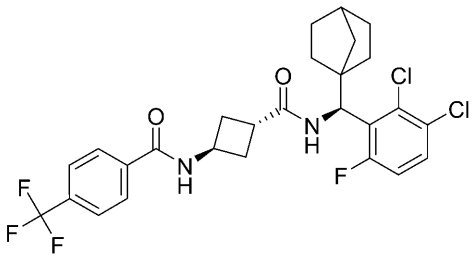
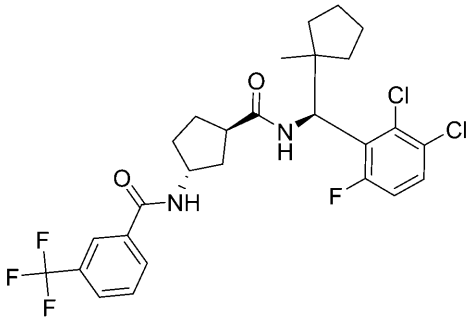
【表１－８６８】

I-2721		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.56 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.04 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 2H), 7.78 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 7.68 (td, J = 7.8, 1.5 Hz, 1H), 7.64 - 7.54 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.17 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 2.00 (dt, J = 13.7, 7.2 Hz, 1H), 1.94 - 1.70 (m, 3H), 1.69 - 1.33 (m, 9H), 1.26 (d, J = 16.0 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	536	B	B
I-2722		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.01 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.69 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 8.45-8.33 (m, 1H), 8.21 (dd, J = 60.4, 8.1 Hz, 2H), 7.77 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.32-7.18 (m, 1H), 5.70 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.53 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.14 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 2.40-2.18 (m, 4H), 2.14 (s, 1H), 1.53 (d, J = 19.3 Hz, 3H), 1.46-0.92 (m, 8H)	534.15	A	A

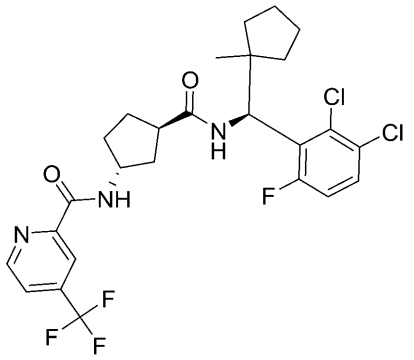
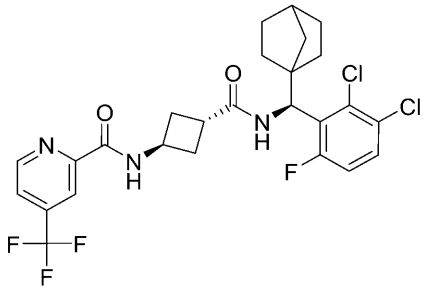
【表１－８６９】

I-2723		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.78 - 8.58 (m, 2H), 8.38 (ddd, J = 8.2, 2.4, 1.0 Hz, 1H), 8.30 (dt, J = 7.8, 1.3 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.77 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (dq, J = 26.4, 6.6 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.10 - 1.74 (m, 4H), 1.73 - 1.44 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 14.8 Hz, 1H), 1.07 - 0.77 (m, 3H).	536.2	A	A
I-2724		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.87 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.04 (dd, J = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 7.83-7.72 (m, 1H), 7.68 (td, J = 7.8, 1.5 Hz, 1H), 7.64-7.50 (m, 2H), 7.26 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.35 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 2.42-2.32 (m, 1H), 2.28-2.16 (m, 2H), 2.14 (s, 1H), 1.53 (d, J = 18.7 Hz, 3H), 1.46-1.04 (m, 8H)	534.15	A	A

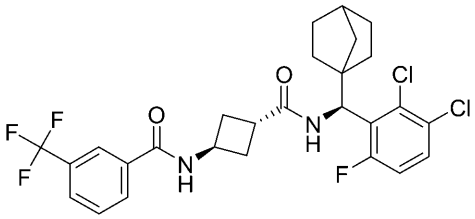
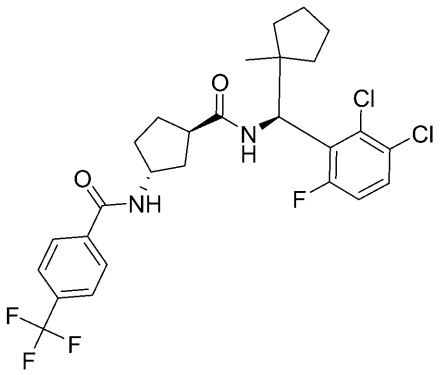
【表１－８７０】

I-2725		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.61 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.45 - 8.24 (m, 2H), 8.07 (dd, J = 9.5, 3.0 Hz, 3H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.28 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.08 - 1.73 (m, 4H), 1.70 - 1.45 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	536.1	B	B
I-2726		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.84 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.08 (dd, J = 36.7, 8.2 Hz, 3H), 7.85 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.34-7.16 (m, 1H), 5.70 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.51 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 3.13 (s, 1H), 2.28 (ddd, J = 38.4, 18.1, 9.0 Hz, 4H), 2.14 (s, 1H), 1.65-1.08 (m, 11H)	557.15	B	B
I-2727		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.52 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.21 - 8.12 (m, 2H), 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.71 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.27 (dq, J = 15.0, 7.1 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.08 - 1.74 (m, 4H), 1.69 - 1.46 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	559	D	D

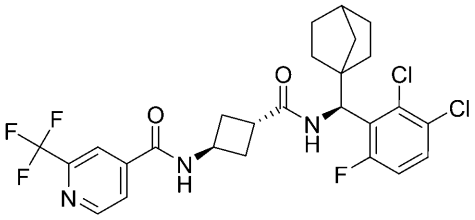
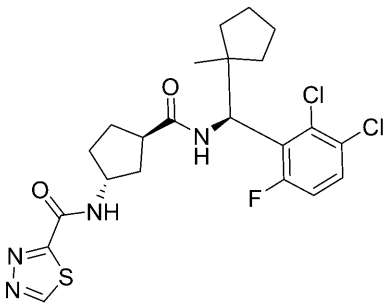
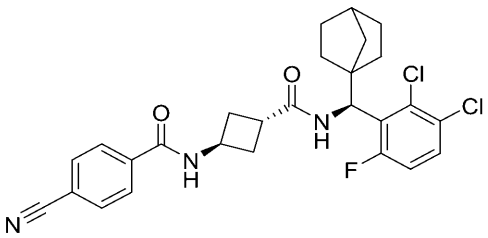
【表１－８７１】

I-2728		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.94 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.23 (s, 1H), 8.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.06 - 8.00 (m, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.31 - 7.22 (m, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.34 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.96 (ddd, J = 16.1, 11.1, 6.4 Hz, 2H), 1.87 (ddd, J = 19.4, 9.6, 5.7 Hz, 2H), 1.72 - 1.44 (m, 8H), 1.38 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	560.15	D	B
I-2729		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.19 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.94 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.05 - 7.99 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.30 - 7.20 (m, 1H), 5.69 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.59 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 3.11 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 2.47 - 2.27 (m, 3H), 1.55 (s, 2H), 1.50 (s, 3H), 1.39 - 1.20 (m, 7H).	558.15	C	B

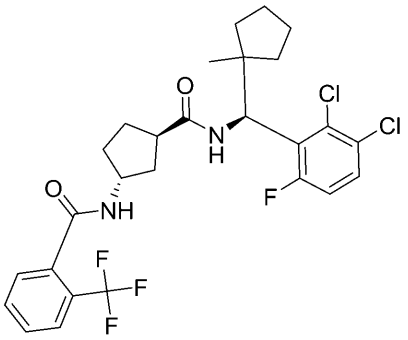
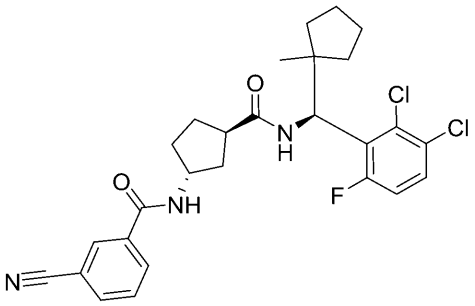
【表１－８７２】

I-2730		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.87 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.15 (dd, J = 17.6, 10.4 Hz, 3H), 7.90 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.72 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.70 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.52 (h, J = 7.8 Hz, 1H), 3.15 (s, 1H), 2.42-2.16 (m, 4H), 2.14 (s, 1H), 1.55 (s, 2H), 1.50 (s, 1H), 1.40-1.32 (m, 2H), 1.29 (d, J = 17.6 Hz, 2H), 1.23 (s, 3H).	557.15	B	B
I-2731		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.50 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.09 - 8.00 (m, 3H), 7.84 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.27 (p, J = 6.8 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.14 - 1.74 (m, 4H), 1.72 - 1.47 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	559	D	B

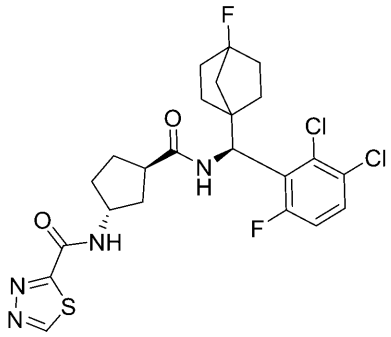
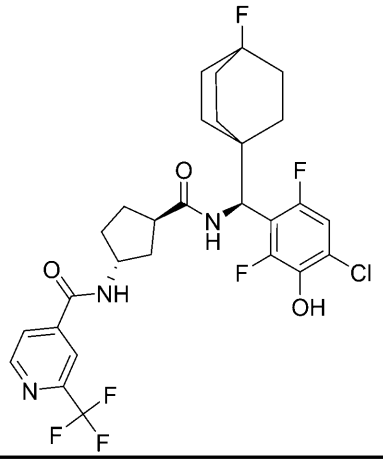
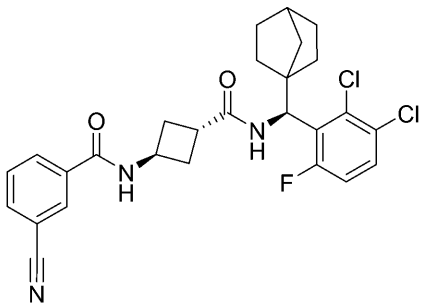
【表１－８７３】

I-2732		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.12 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.93 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.25 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.07 (dd, J = 4.9, 1.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.70 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.52 (h, J = 7.8 Hz, 1H), 3.20 - 3.11 (m, 1H), 2.43 - 2.17 (m, 4H), 2.14 (s, 1H), 1.55 (s, 3H), 1.34 (dd, J = 17.3, 9.3 Hz, 3H), 1.29 - 1.20 (m, 4H).	558.15	B	B
I-2733		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.78 (s, 1H), 9.19 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.29 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.01 -1.82 (m, 4H), 1.72 - 1.43 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 12.7 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	499.1	A	A
I-2734		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.86 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.97 (q, J = 8.5 Hz, 4H), 7.61 (dd, J = 9.1, 4.8 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.71 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.50 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.18-3.09 (m, 1H), 2.42-2.33 (m, 2H), 2.33-2.18 (m, 2H), 2.14 (s, 1H), 1.58-1.48 (m, 4H), 1.40-1.21 (m, 6H).	514.1	A	A

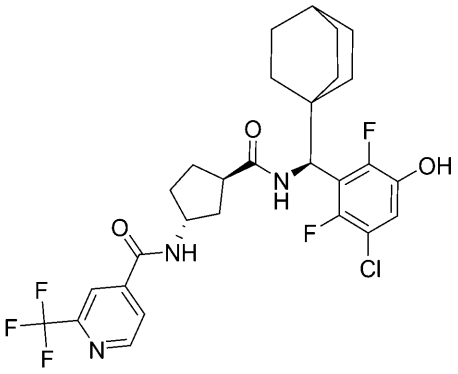
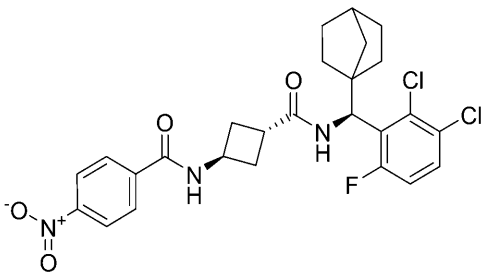
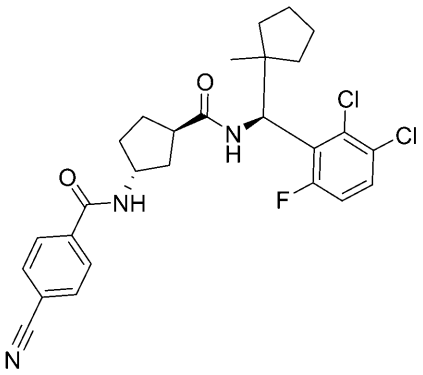
【表１－８７４】

I-2735		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.41 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.71 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.67 - 7.57 (m, 2H), 7.48 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.20 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.03 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.00 (dt, J = 13.6, 7.1 Hz, 1H), 1.87 (s, 2H), 1.72 (ddd, J = 13.9, 9.0, 5.7 Hz, 1H), 1.60 (s, 6H), 1.49 (dd, J = 13.4, 6.2 Hz, 3H), 1.40 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	559	B	B
I-2736		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.46 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.29 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 8.15 (dt, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.00 (dt, J = 7.7, 1.4 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.27 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.08 - 1.74 (m, 4H), 1.71 - 1.44 (m, 8H), 1.38 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 1.32 - 1.19 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	516.15	A	A

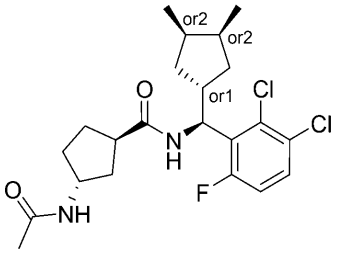
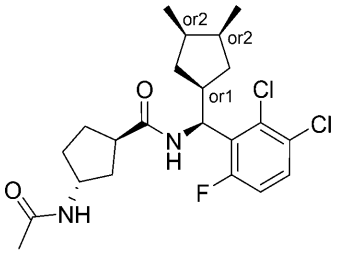
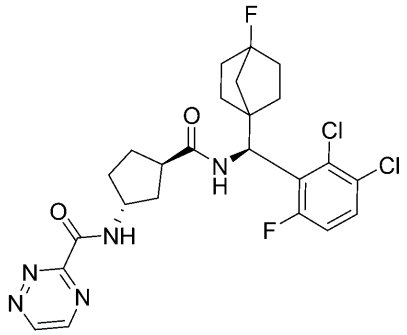
【表１－８７５】

I-2737		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.78 (s, 1H), 9.21 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.69 - 7.59 (m, 1H), 7.27 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.28 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 8.3, 7.7 Hz, 1H), 2.13 - 1.78 (m, 8H), 1.79 - 1.64 (m, 4H), 1.64 - 1.41 (m, 4H).	529.3	A	A
I-2738		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.25 (s, 1H), 8.93 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.80 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.09 (dd, J = 4.9, 1.6 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.20 (s, 1H), 4.99 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.28 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 3.01 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.05 - 1.76 (m, 4H), 1.76 - 1.42 (m, 14H).	604.05	D	D
I-2739		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.82 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.27 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 8.14 (ddd, J = 7.3, 4.1, 2.7 Hz, 2H), 8.00 (dt, J = 7.7, 1.4 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.70 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.50 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.14 (dt, J = 9.2, 5.4 Hz, 1H), 2.41-2.16 (m, 4H), 2.14 (s, 1H), 1.55 (s, 2H), 1.50 (s, 1H), 1.40-1.29 (m, 2H), 1.27 (s, 1H), 1.23 (d, J = 9.2 Hz, 4H).	514.1	A	A

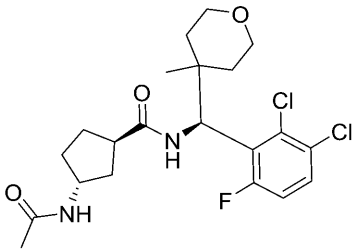
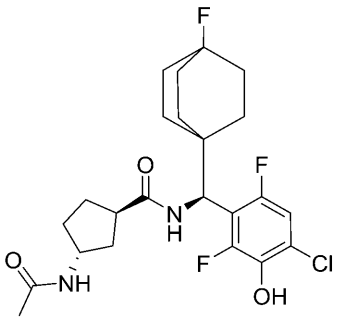
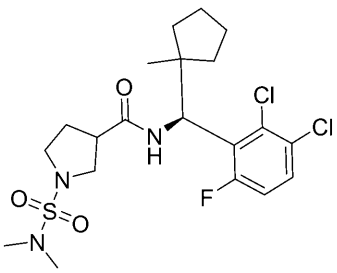
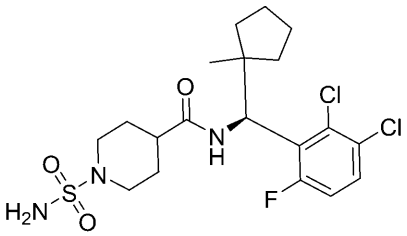
【表１－８７６】

I-2740		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.95 (s, 1H), 8.93 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.79 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.33 - 8.20 (m, 1H), 8.09 (dd, J = 5.0, 1.6 Hz, 1H), 8.01 - 7.87 (m, 1H), 6.98 (dd, J = 8.5, 7.2 Hz, 1H), 4.97 (dd, J = 20.5, 8.7 Hz, 1H), 4.29 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 3.04 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.15 - 1.75 (m, 4H), 1.70 - 1.29 (m, 15H).	586.25	B	B
I-2741		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.96 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.44-8.23 (m, 2H), 8.13 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.11-7.99 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.70 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.50 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 3.15 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 2.39-2.20 (m, 3H), 2.14 (s, 1H), 1.53 (d, J = 20.1 Hz, 3H), 1.46-1.06 (m, 7H)	534.15	A	A
I-2742		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.51 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.18 - 7.89 (m, 5H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.26 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.09 - 1.72 (m, 4H), 1.68 - 1.44 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	516.15	A	A

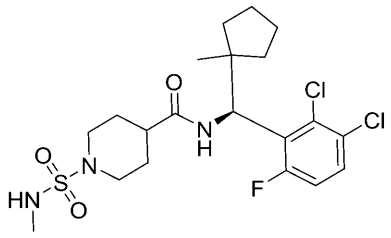
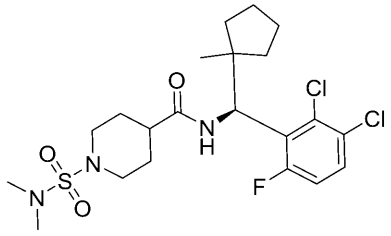
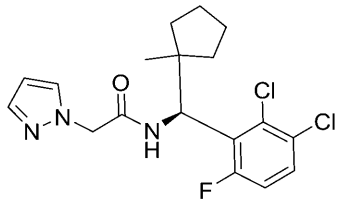
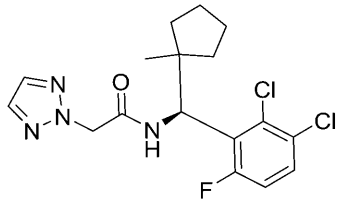
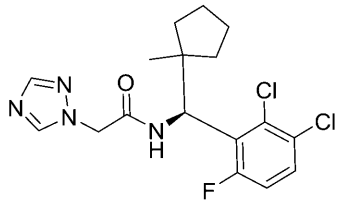
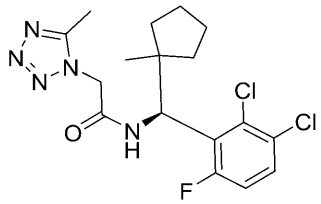
【表１－８７７】

I-2743		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.33 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 9.5, 9.5 Hz, 1H), 6.10 (s, 1H), 5.47 (d, J = 43.0 Hz, 2H), 4.29 (s, 1H), 2.71 (s, 1H), 2.10 (dt, J = 20.8, 6.4, 6.4 Hz, 4H), 1.67 (m, 6H), 1.47 (m, 4H), 1.14 (dq, J = 13.8, 7.2, 6.5, 6.5 Hz, 1H), 0.84 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.78 (d, J = 6.7 Hz, 3H).	443.15	C	
I-2744		1H NMR (400 MHz, Chloroform-d) 7.33 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 9.5, 9.5 Hz, 1H), 6.10 (s, 1H), 5.43 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 4.27 (dt, J = 12.5, 6.3, 6.3 Hz, 1H), 2.71 (p, J = 8.4, 8.4, 8.3, 8.3 Hz, 1H), 2.48 (s, 1H), 2.16 (m, 2H), 2.05 (s, 1H), 1.71 (d, J = 52.9 Hz, 6H), 1.47 (m, 4H), 1.17 (m, 1H), 0.87 (dt, J = 16.2, 4.5, 4.5 Hz, 3H), 0.78 (d, J = 6.7 Hz, 3H).	443.15	D	
I-2745		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.58 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 9.07 - 9.00 (m, 2H), 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.34 (h, J = 7.0 Hz, 1H), 3.04 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.04 - 1.77 (m, 7H), 1.77 - 1.44 (m, 9H).	524.15	B	A

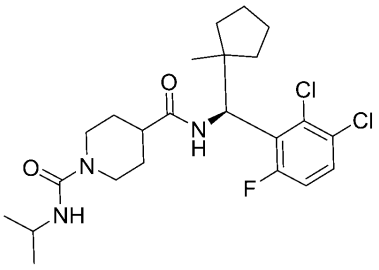
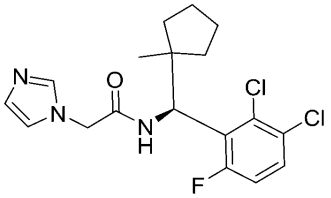
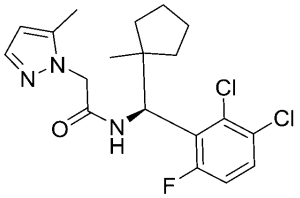
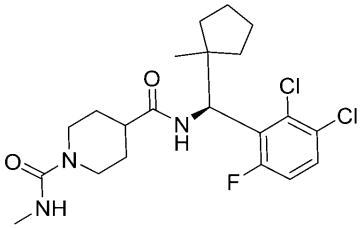
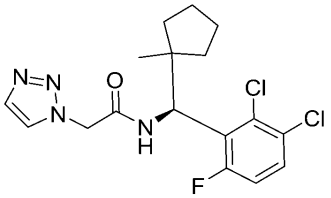
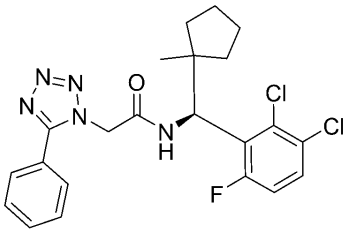
【表１－８７８】

I-2746		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.25 - 8.08 (m, 1H), 7.77 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.68 - 7.61 (m, 1H), 7.28 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.66 (d, J = 11.9 Hz, 2H), 3.54 - 3.39 (m, 2H), 2.97 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.94 - 1.70 (m, 6H), 1.70 - 1.53 (m, 3H), 1.49 - 1.27 (m, 3H), 1.20 (d, J = 13.3 Hz, 1H), 1.08 (d, J = 2.3 Hz, 3H).	445.15	D	
I-2747		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.18 (d, J = 31.4 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 4.96 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.99 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.91 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.89 - 1.74 (m, 6H), 1.74 - 1.52 (m, 13H), 1.52 - 1.27 (m, 2H).	473.05	D	D
I-2748				B	
I-2749				B	

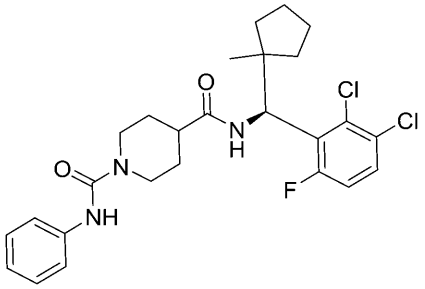
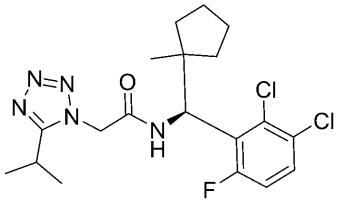
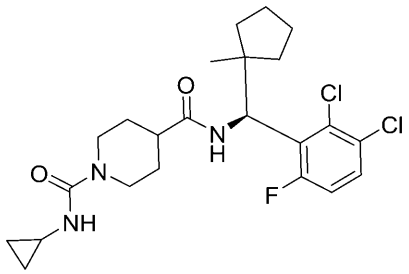
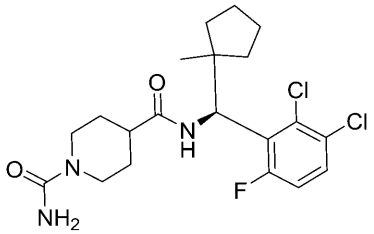
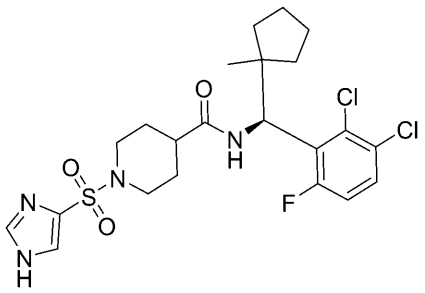
【表１－８７９】

I-2750				B	B
I-2751				B	B
I-2752				D	
I-2753				D	
I-2754				D	
I-2755				B	B

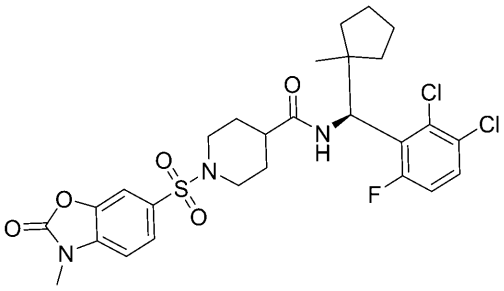
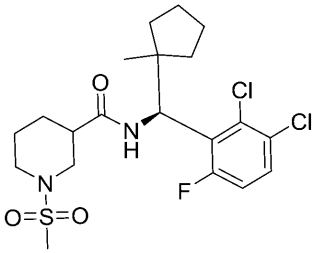
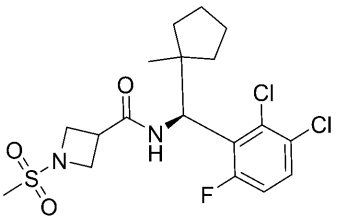
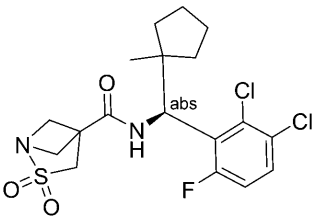
【表１－８８０】

I-2756				D	
I-2757				C	
I-2758				E	
I-2759				D	
I-2760				D	
I-2761				C	

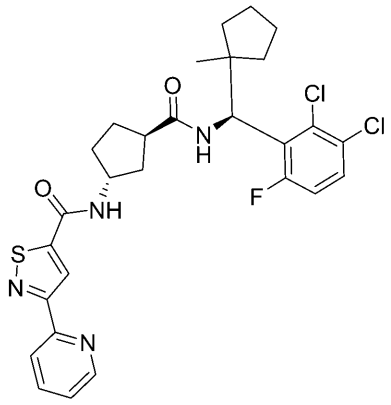
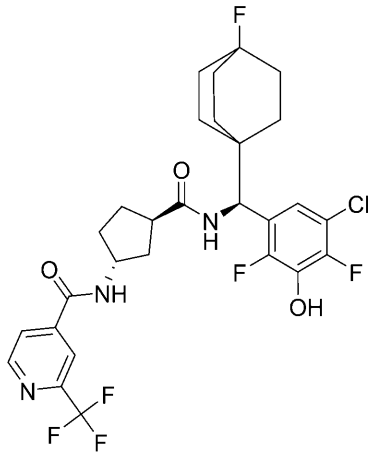
【表１－８８１】

I-2762				C	
I-2763				B	B
I-2764				D	
I-2765				C	
I-2766			517.1	B	

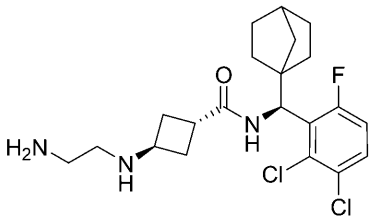
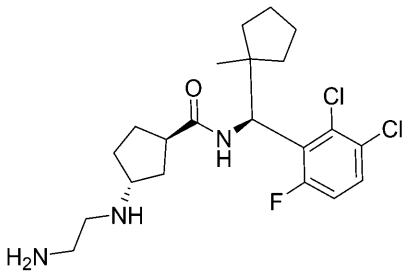
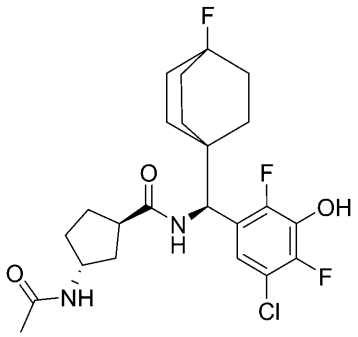
【表１－８８２】

I-2767			598.1	C	
I-2768				D	
I-2769				B	B
I-2770				D	

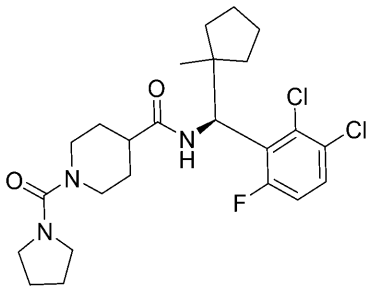
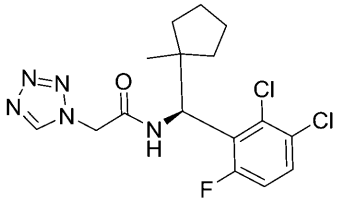
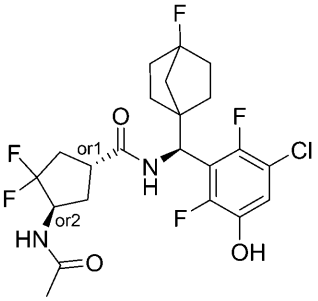
【表１－８８３】

I-2771		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.88 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.20 (dd, J = 7.9, 1.3 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.98 (tt, J = 7.7, 1.9 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.9, 5.1, 2.4 Hz, 1H), 7.50 (ddt, J = 7.6, 4.9, 1.6 Hz, 1H), 7.26 (ddd, J = 10.7, 8.8, 1.7 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.08 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.06-1.80 (m, 4H), 1.60 (s, 8H), 1.39 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 1.27 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	575.15	D	B
I-2772		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.93 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.37 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.10 (s, 3H), 6.71 (s, 2H), 5.01 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 4.31 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 3.08 (s, 1H), 2.94 (s, 4H), 1.66 (s, 6H), 1.55 (d, J = 9.2 Hz, 8H), 1.23 (s, 1H).	604.15	D	

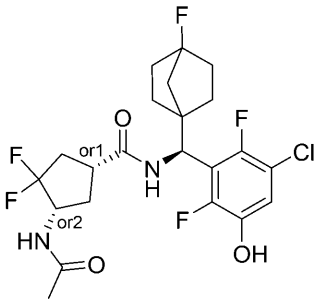
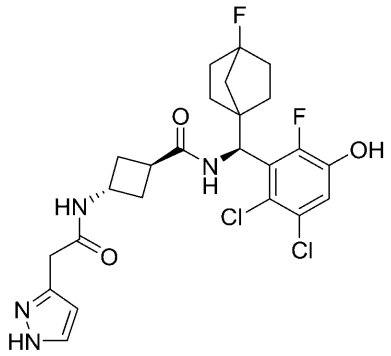
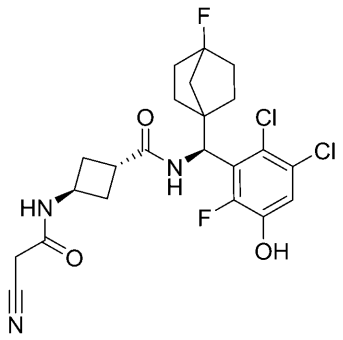
【表１－８８４】

I-2773		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.42 (s, 1H), 8.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (q, J = 9.7, 9.1 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.26 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.06 (tt, J = 9.1, 4.0 Hz, 1H), 2.73 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.55 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.50 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 2.30 - 1.97 (m, 3H), 1.94 - 1.78 (m, 2H), 1.70 - 1.09 (m, 10H).	428	B	B
I-2774		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.41 (s, 1H), 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.30 - 7.20 (m, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.10 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 3.04 - 2.96 (m, 1H), 2.80 (t, J = 6.0 Hz, 2H), 2.68 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 1.79 (td, J = 10.2, 7.8, 4.9 Hz, 3H), 1.59 (s, 7H), 1.46 - 1.21 (m, 4H), 0.96 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	430	C	
I-2775		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 6.86 (s, 1H), 4.99 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.01 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 2.87-2.79 (m, 1H), 1.88-1.74 (m, 2H), 1.77 (s, 3H), 1.67 (q, J = 7.1 Hz, 8H), 1.55 (s, 2H), 1.53 (s, 6H), 1.38 (dt, J = 13.2, 7.2 Hz, 1H).	473.1	D	

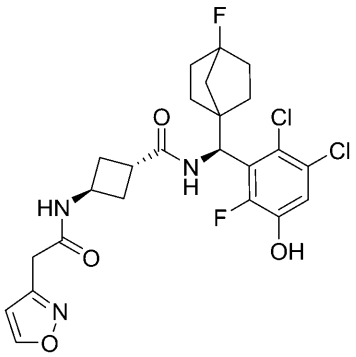
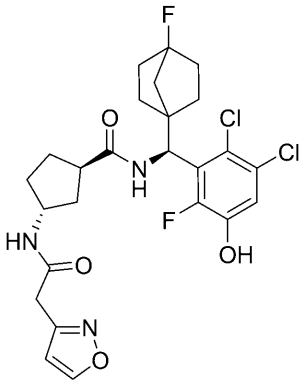
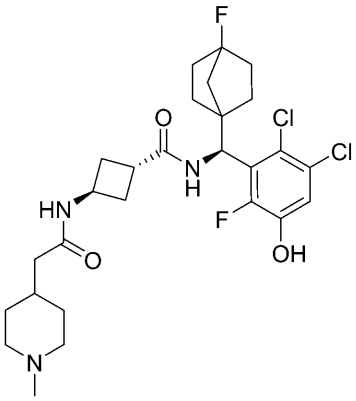
【表１－８８５】

I-2776				C	
I-2777				C	
I-2778		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.32 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.47 (dt, J = 18.1, 9.1 Hz, 1H), 3.11 (ddt, J = 12.8, 9.0, 4.8 Hz, 1H), 2.28 (dd, J = 8.9, 4.5 Hz, 1H), 2.22 (td, J = 11.3, 9.8, 5.8 Hz, 1H), 1.98 (ddt, J = 12.5, 8.3, 3.9 Hz, 1H), 1.92-1.87 (m, 4H), 1.86-1.76 (m, 3H), 1.72 (d, J = 9.4 Hz, 4H), 1.59 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 1.37 (s, 1H)	495.3	B	A

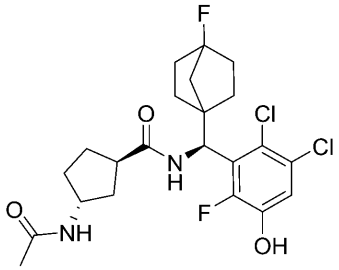
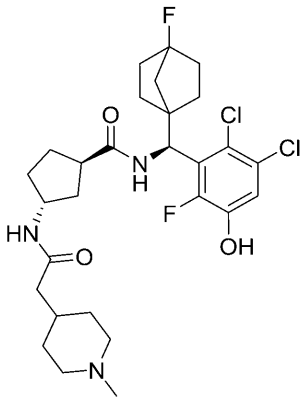
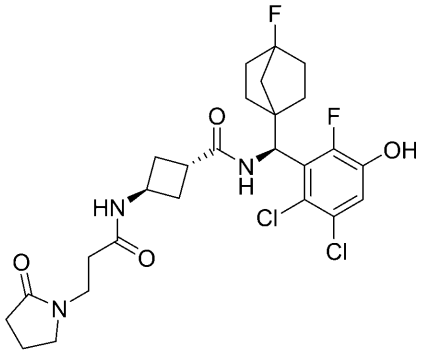
【表１－８８６】

I-2779		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.32 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.00 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.41 (dt, J = 17.4, 8.6 Hz, 1H), 3.12 (dt, J = 13.7, 8.5 Hz, 1H), 2.39-2.30 (m, 1H), 2.27 (dd, J = 17.8, 6.6 Hz, 1H), 1.84 (s, 3H), 1.87-1.66 (m, 9H), 1.59 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.54-1.42 (m, 2H).	495.25	B	A
I-2780		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 12.95 - 12.13 (m, 1H), 11.13 - 10.32 (m, 1H), 8.32 - 8.17 (m, 1H), 8.08 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.10 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.08 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.23 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 3.36 - 3.33 (m,2H), 3.06 (td, J = 9.2, 4.4 Hz, 1H), 2.28 (td, J = 8.7, 8.2, 4.7 Hz, 1H), 2.22 - 1.96 (m, 3H), 1.92 - 1.64 (m, 6H), 1.64 - 1.43 (m, 4H).	527.25	B	B
I-2781		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.49 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.23 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.57 (s, 2H), 3.12 - 3.02 (m, 1H), 2.29 (dt, J = 8.0, 4.0 Hz, 1H), 2.10 (dp, J = 30.2, 10.0, 9.0 Hz, 3H), 1.94 - 1.61 (m, 6H), 1.61 - 1.41 (m, 4H).	486.1	B	B

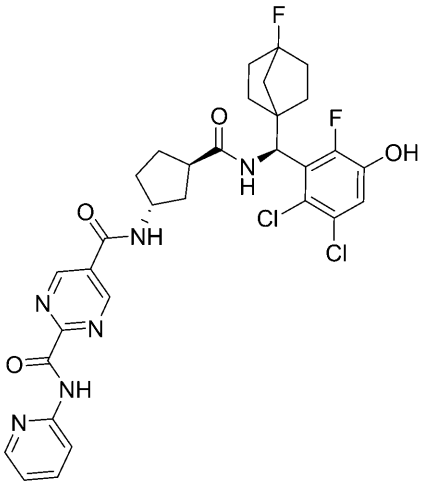
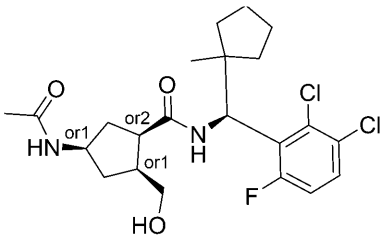
【表１－８８７】

I-2782		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.80 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.24 (h, J = 7.9 Hz, 1H), 3.50 (s, 2H), 3.12 - 3.00 (m, 1H), 2.29 (td, J = 8.1, 4.1 Hz, 1H), 2.24 - 1.95 (m, 3H), 1.92 - 1.63 (m, 6H), 1.63 - 1.40 (m, 4H).	528.2	B	A
I-2783		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.81 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.13 (dd, J = 28.0, 7.6 Hz, 2H), 7.07 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.49 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 5.50 - 5.34 (m, 1H), 4.03 (h, J = 6.3 Hz, 1H), 3.52 (s, 2H), 2.95 (p, J = 7.6 Hz, 1H), 1.93- 1.60 (m, 11H), 1.59 - 1.37 (m, 5H).	542.15	B	A
I-2784		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.04 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 7.08 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.62 - 5.36 (m, 1H), 4.21 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 3.10 - 2.93 (m, 1H), 2.69 (d, J = 11.4 Hz, 2H), 2.27 (td, J = 8.2, 4.4 Hz, 1H), 2.15 - 1.98 (m, 4H), 1.92 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.87 - 1.63 (m, 10H), 1.63 - 1.39 (m, 7H), 1.19 - 1.05 (m, 2H).	558.05	B	D

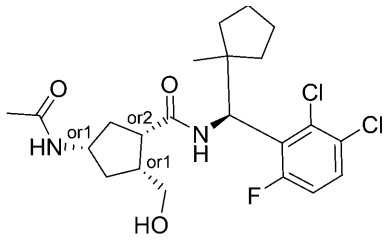
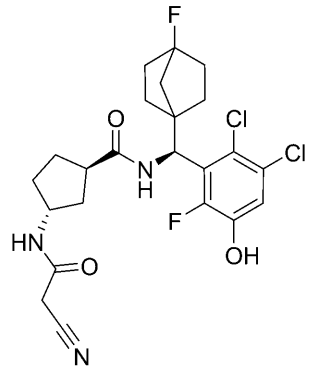
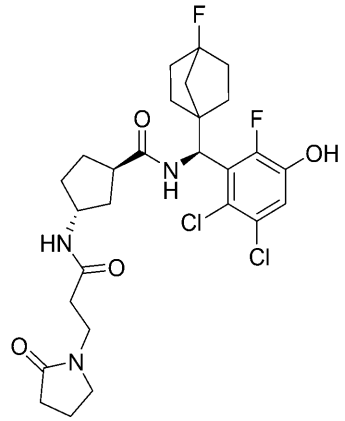
【表１－８８８】

I-2785		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.10 (s,1H), 8.07 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.60 - 5.30 (m, 1H), 4.00 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.98 - 1.29 (m, 19H).	475.1	B	A
I-2786		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.74 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.49 - 5.34 (m, 1H), 4.01 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.93 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.72 (d, J = 10.5 Hz, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.94 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.90 - 1.66 (m, 10H), 1.66 - 1.28 (m, 11H), 1.14 (qd, J = 11.5, 6.3 Hz, 2H).	572.25	B	D
I-2787		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.23 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 3.32 - 3.21 (m, 4H), 3.11 - 2.97 (m, 1H), 2.28 (tt, J = 8.1, 3.9 Hz, 1H), 2.19 (dt, J = 15.9, 7.6 Hz, 3H), 2.14 - 1.95 (m, 3H), 1.95 - 1.35 (m, 13H).	558.2	B	B

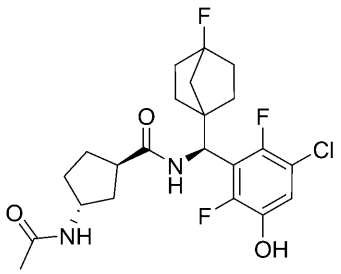
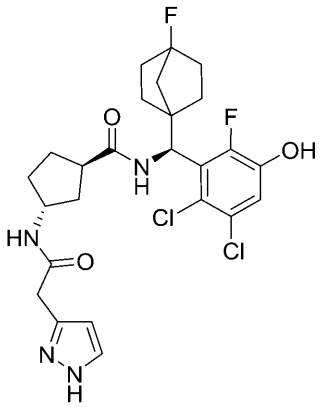
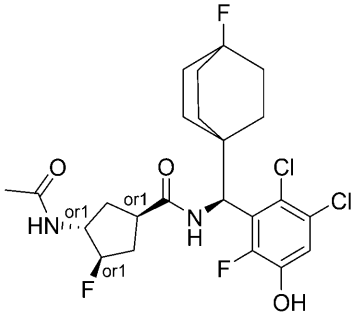
【表１－８８９】

I-2788		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 9.36 (s, 2H), 8.84 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.45 - 8.39 (m, 1H), 8.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.93 (td, J = 7.8, 1.9 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 7.5, 4.9 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.52 - 5.37 (m, 1H), 4.32 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.11 - 1.77 (m, 7H), 1.77 - 1.38 (m, 9H).	659.2	B	A
I-2789		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.46 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.50 (t, J = 5.2 Hz, 1H), 4.14 (s, 1H), 3.44 - 3.36 (m, 1H), 3.21 (td, J = 9.6, 5.6 Hz, 1H), 3.03 (q, J = 8.0, 7.5 Hz, 1H), 2.42 - 2.32 (m, 1H), 1.93 (dd, J = 13.1, 6.9 Hz, 1H), 1.74 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.53 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 1.24 (s, 1H), 1.00 - 0.91 (m, 3H).	459.15	D	

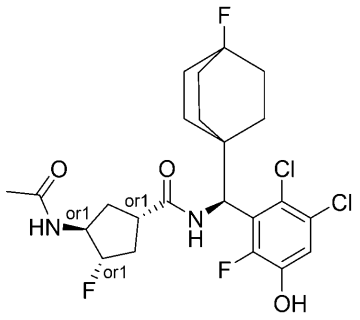
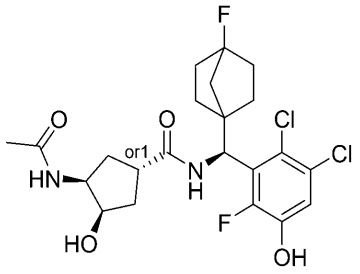
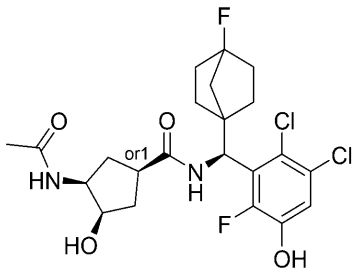
【表１－８９０】

I-2790		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.24 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.22 (t, J = 5.1 Hz, 1H), 4.17 (s, 1H), 3.10 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 3.06 - 2.99 (m, 1H), 2.77 (q, J = 6.7, 4.7 Hz, 1H), 2.29 (q, J = 9.5, 8.7 Hz, 1H), 2.07 (dt, J = 13.8, 6.7 Hz, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.71 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 1.59 (s, 6H), 1.54 - 1.44 (m, 2H), 1.36 (s, 1H), 1.25 (s, 1H), 0.95 (s, 3H).	459	D	
I-2791		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (dd, J = 53.5, 7.6 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 3.56 (d, J = 3.3 Hz, 2H), 2.94 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.02 - 1.32 (m, 16H).	500.15	B	A
I-2792		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.20 - 8.06 (m, 1H), 7.88 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.3 Hz, 1H), 3.35 - 3.26 (m, 4H), 2.92 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.21 (dt, J = 18.7, 7.6 Hz, 4H), 1.94 - 1.76 (m, 8H), 1.75 - 1.65 (m, 3H), 1.64 - 1.51 (m, 4H), 1.51 - 1.41 (m, 2H), 1.36 (dq, J = 16.3, 9.7, 8.2 Hz, 1H).	572.2	B	B

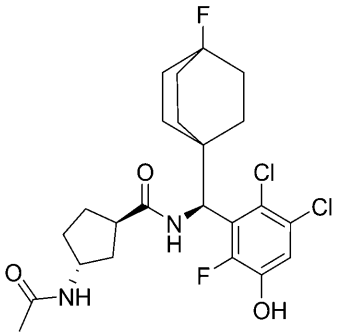
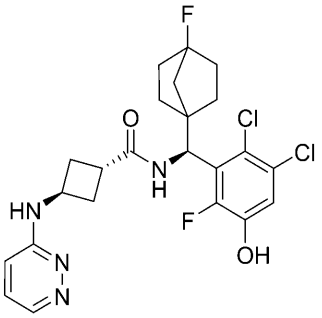
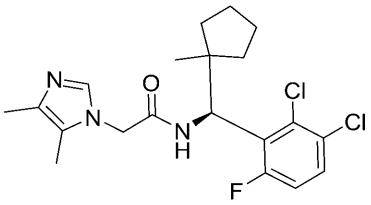
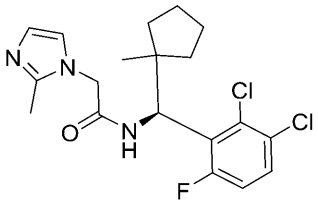
【表１－８９１】

I-2793		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.37 (s, 1H), 8.11 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.82 (dtd, J = 16.1, 7.6, 5.1 Hz, 4H), 1.77 (s, 3H), 1.74 (s, 5H), 1.74 - 1.56 (m, 2H), 1.57 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 1.53 - 1.29 (m, 3H), 1.41 (s, 1H).	459.15	B	A
I-2794		1H NMR (400 MHz, メタノール-d4) 7.58 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.26 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 5.71 (s, 1H), 4.22 (p, J = 6.3 Hz, 1H), 3.56 (s, 2H), 3.03 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.36 - 1.42 (m, 16H).	541.15	B	B
I-2795		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.03 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.92 - 4.78 (q, 1H), 4.03 (dd, J = 14.7, 8.0 Hz, 1H), 3.01 (h, J = 8.5 Hz, 1H), 2.40 - 2.23 (m, 1H), 1.86 (dt, J = 22.8, 8.6 Hz, 2H), 1.80 (s, 3H), 1.71 - 1.56 (m, 13H).	487.1	B	A

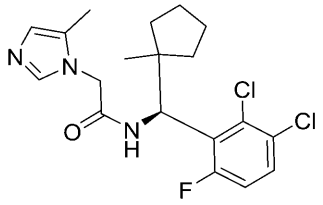
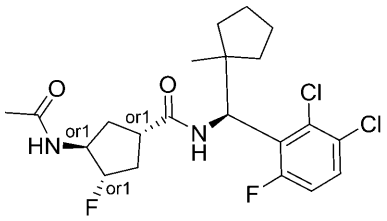
【表１－８９２】

I-2796		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.89 - 4.76 (q, 1H), 4.06 (dd, J = 14.7, 8.0 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.29 - 2.12 (m, 1H), 1.97 (dt, J = 14.2, 7.6 Hz, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.77 - 1.66 (m, 14H).	487.1	B	A
I-2797		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.15 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.47 - 5.30 (m, 1H), 4.80 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.01 - 3.82 (m, 2H), 3.08 (qd, J = 8.7, 4.4 Hz, 1H), 1.80 (d, J = 3.3 Hz, 8H), 1.75 - 1.64 (m, 4H), 1.64 - 1.45 (m, 5H).	491.1	C	
I-2798		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.15 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.51 - 5.32 (m, 1H), 4.79 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.01 - 3.85 (m, 2H), 3.15 - 3.02 (m, 1H), 1.81 (s, 8H), 1.75 - 1.66 (m, 4H), 1.66 - 1.60 (m, 2H), 1.60 - 1.46 (m, 3H).	471.1	B	B

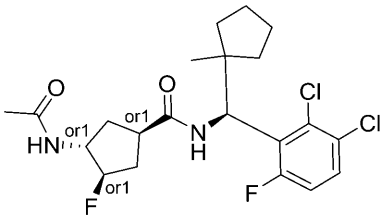
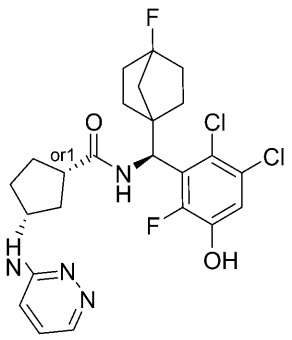
【表１－８９３】

I-2799		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.74 (s, 1H), 7.96 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.99 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.82 - 1.57 (m, 19H), 1.40 (ddt, J = 32.0, 13.3, 7.3 Hz, 2H).	489.15	B	B
I-2800		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.40 (dd, J = 4.4, 1.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.27 - 7.17 (m, 1H), 7.14 - 7.04 (m, 2H),6.69 (dd, J = 9.1, 1.4 Hz, 1H), 5.66 - 5.37 (m, 1H), 4.39 (dp, J = 14.5, 7.2, 6.7 Hz, 1H), 3.16 (dt, J = 9.5, 5.1 Hz, 1H), 2.45 (td, J = 7.8, 3.9 Hz, 1H), 2.30 (dt, J = 8.0, 4.1 Hz, 1H), 2.09 (dq, J = 19.9, 10.2 Hz, 2H), 1.97 - 1.37 (m, 10H).	497.15	B	A
I-2801				D	
I-2802				B	

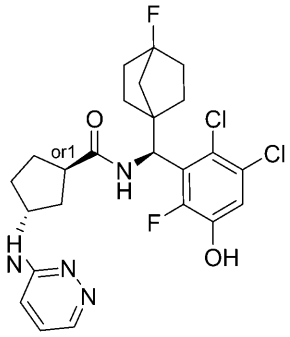
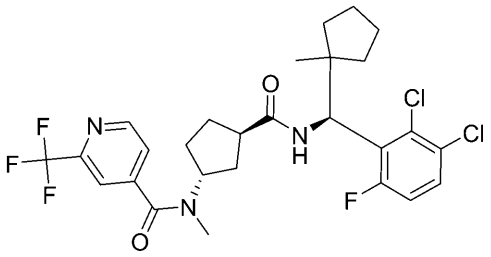
【表１－８９４】

I-2803				C	
I-2804		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.35 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 11.0, 8.9 Hz, 1H), 6.56 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 5.98 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 5.77 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 5.16-5.03 (q, J = 4.2, 4.1, 4.1 Hz, 1H), 4.25 (ddt, J = 14.4, 6.8, 3.6, 3.6 Hz, 1H), 2.97 (m, 1H), 2.32 (ttd, J = 18.0, 18.0, 9.5, 9.4, 5.6 Hz, 2H), 2.16 (m, 1H), 2.09 (m, 1H), 2.01 (m, 2H), 1.97 (s,2H), 1.67 (d, J = 5.5 Hz, 3H), 1.54 (d, J = 13.0 Hz, 1H), 1.43 (dd, J = 11.4, 5.7 Hz,1H), 1.27 (m, 2H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz,3H).	447.1	A	A

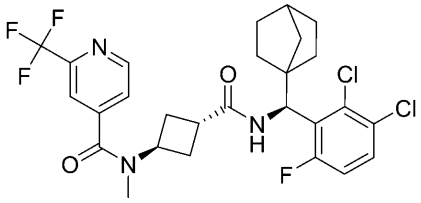
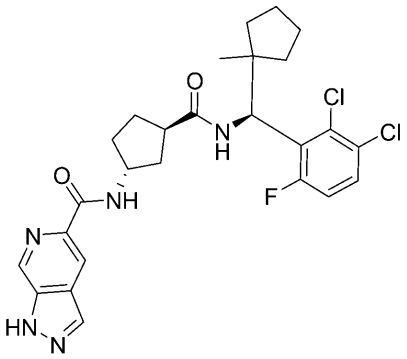
【表１－８９５】

I-2805		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.36 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 11.0, 8.9 Hz, 1H), 6.57 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 5.78 (d, J = 9.9 Hz, 2H), 5.22 (m, 1H), 5.09 (m, 1H), 3.00 (dt, J = 16.2, 8.4, 8.4 Hz, 1H), 2.36 (ddt, J = 29.3, 14.4, 6.7, 6.7 Hz, 2H), 2.18 (dd, J = 7.1, 3.4 Hz, 1H), 2.03 (m, 1H), 1.98 (s, 2H), 1.67 (d, J = 5.7 Hz, 3H), 1.53 (m, 1H), 1.41 (dd, J = 13.3, 6.2 Hz, 1H), 1.27 (m, 2H), 0.98 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	447.1	A	A
I-2806		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.40 (dd, J = 4.4, 1.4 Hz, 1H), 8.26 - 8.07 (m, 1H), 7.25 (dd, J = 9.1, 4.4 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.81 (dd, J = 9.1, 1.4 Hz, 1H), 5.53 - 5.29 (m, 1H), 4.23 (h, J = 5.9 Hz, 1H), 2.96 (dp, J = 21.4, 7.4, 6.7 Hz, 1H), 2.08 - 1.93 (m, 2H), 1.93 - 1.61 (m, 8H), 1.61 - 1.38 (m, 6H).	511.15	A	A

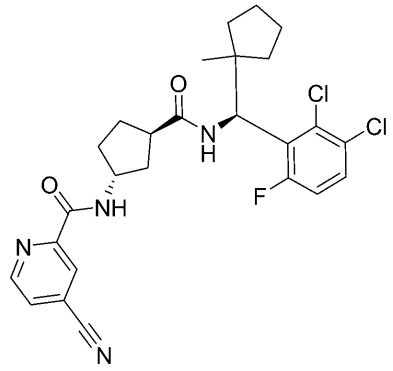
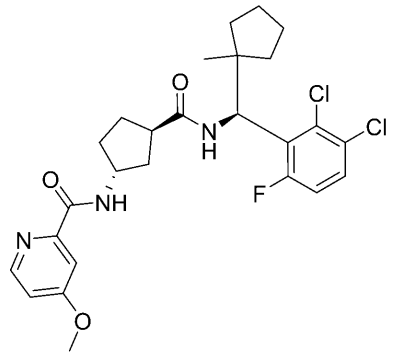
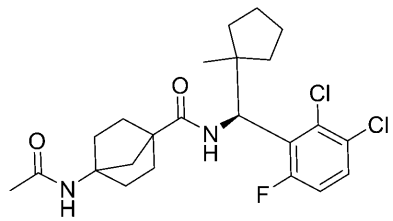
【表１－８９６】

I-2807		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.66 - 10.49 (m, 1H), 8.39 (dd, J = 4.3, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 9.0, 4.4 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 6.75 (dd, J = 9.1, 1.4 Hz, 1H), 5.51 - 5.34 (m, 1H), 4.20 (h, J = 6.1 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.08 - 1.90 (m, 2H), 1.90 - 1.77 (m, 4H), 1.76 - 1.59 (m, 6H), 1.59 - 1.40 (m, 4H).	511.15	B	A
I-2808		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.79 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.61 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 7.51 (ddd, J = 9.0, 5.2, 1.4 Hz, 1H), 7.16 (ddd, J = 10.6, 8.9, 1.4 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.30 (s, 1H), 3.03 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 2.82 (s, 3H), 1.89 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 1.78 (dt, J = 23.6, 12.4 Hz, 2H), 1.71 - 1.62 (m, 1H), 1.65 - 1.52 (m, 5H), 1.42 - 1.36 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 1.24 (d, J = 13.1 Hz, 1H), 1.23 (s, 1H), 0.95 (d, J = 2.4 Hz, 3H).	574.2	C	B

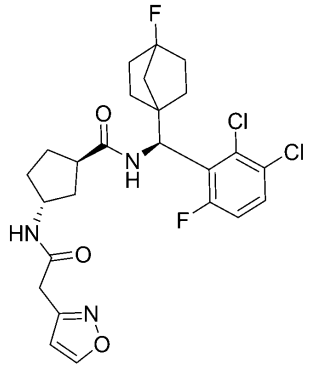
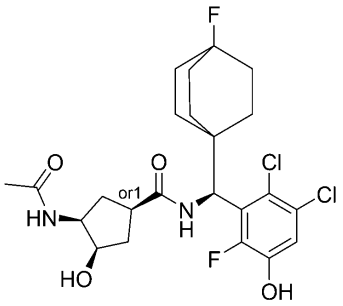
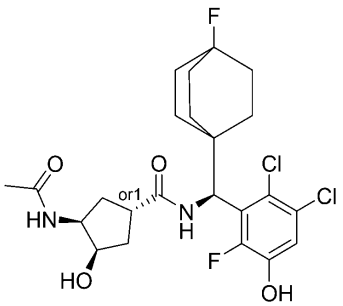
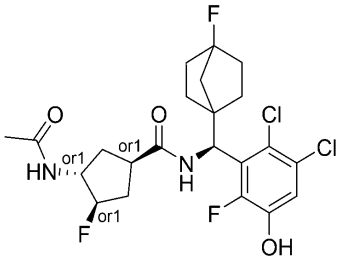
【表１－８９７】

I-2809		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.78 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.65 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.9, 5.2 Hz, 1H), 7.13 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.47 (s, 1H), 3.05 (s, 1H), 2.93 (d, J = 2.4 Hz, 3H), 2.46 - 2.36 (m, 2H), 2.20 (s, 1H), 2.12 (q, J = 5.3, 4.2 Hz, 2H), 1.55 - 1.43 (m, 3H), 1.35 (dd, J = 29.5, 11.6 Hz, 2H), 1.23 (t, J = 7.7 Hz, 5H).	572.2	D	
I-2810		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 13.83 (s, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.49 - 8.35 (m, 3H), 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.36 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.98 - 1.83 (m, 4H), 1.60 (s, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.25 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	532.15	B	B

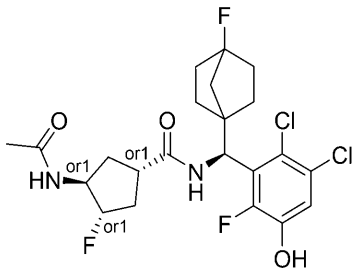
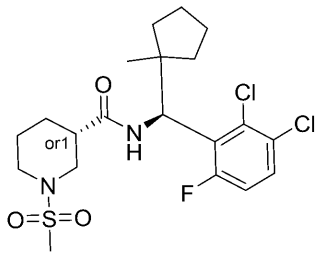
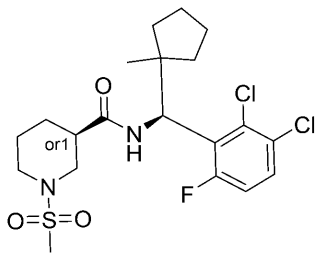
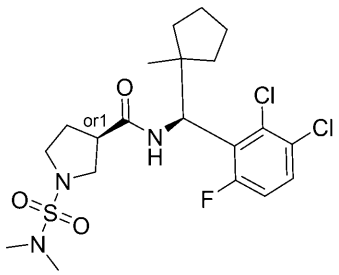
【表１－８９８】

I-2811		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.90 (dd, J = 5.0, 0.9 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.34 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 8.21 - 8.07 (m, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.33 (h, J = 7.0 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.01 - 1.80 (m, 4H), 1.69 - 1.46 (m, 8H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	517.1	B	A
I-2812		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.46 (dd, J = 17.1, 6.7 Hz, 2H), 8.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.31 - 7.22 (m, 1H), 7.16 (dd, J = 5.7, 2.7 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.30 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.07 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.00 - 1.80 (m, 4H), 1.60 (s, 8H), 1.61 - 1.43 (m, 1H), 1.25 (d, J = 12.7 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	522.2	C	B
I-2813		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.98 (s, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 11.0, 9.0 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 1.80 (d, J = 28.8 Hz, 9H), 1.72 - 1.48 (m, 10H), 1.33 (dd, J = 35.2, 8.3 Hz, 2H), 0.97 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	455.15	E	

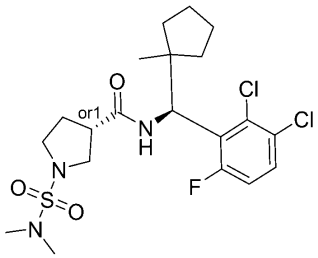
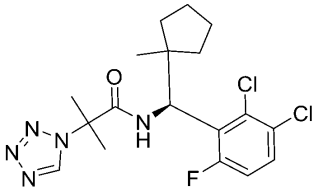
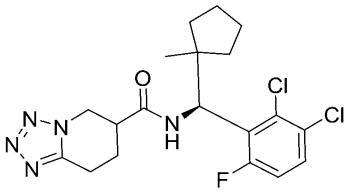
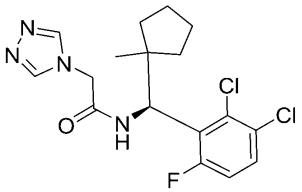
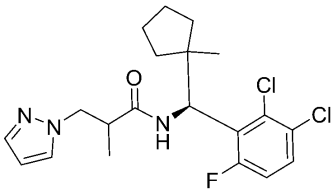
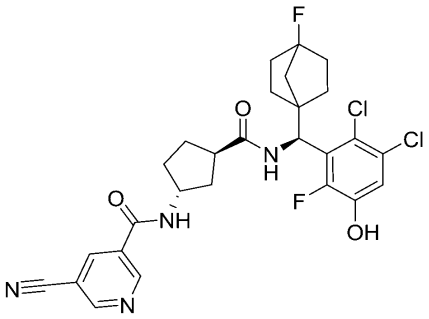
【表１－８９９】

I-2814		1H NMR (400 MHz, メタノール-d4) 8.58 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 6.47 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 5.73 (s, 1H), 4.33 - 4.09 (m, 1H), 3.60 (s, 2H), 3.01 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.17 - 1.89 (m, 4H), 1.89 - 1.44 (m, 12H).	526.15	B	A
I-2815		1H NMR (400 MHz, メタノール-d4) 6.97 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 5.49 (s, 1H), 4.68 - 4.52 (m, 1H), 4.14 (dd, J = 14.4, 5.2 Hz, 2H), 3.23 - 3.07 (m, 1H), 2.07 (ddt, J = 13.3, 8.9, 5.4 Hz, 1H), 1.95 (s, 3H), 1.93 - 1.65 (m, 15H).	505.15	D	C
I-2816		1H NMR (400 MHz, メタノール-d4) 7.08 - 6.92 (m, 1H), 5.48 (s, 1H), 4.58 (s, 1H), 4.21 (q, J = 3.6 Hz, 1H), 4.11 (td, J = 9.0, 4.0 Hz, 1H), 3.23 - 3.08 (m, 1H), 2.08 - 1.91 (m, 5H), 1.91 - 1.66 (m, 14H).	505.15	D	
I-2817		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.60 (s, 1H), 8.36 - 8.11 (m, 1H), 7.93 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.51 - 5.29 (m, 1H), 4.86 (dq, J = 53.2, 4.6 Hz, 1H), 4.28 - 3.97 (m, 1H), 3.08 - 2.89 (m, 1H), 2.39 - 2.24 (m, 1H), 2.04 - 1.83 (m, 4H), 1.80 (s, 5H), 1.74 - 1.60 (m, 4H), 1.54 (dq, J = 21.6, 10.1, 9.0 Hz, 3H).	493.1	B	A

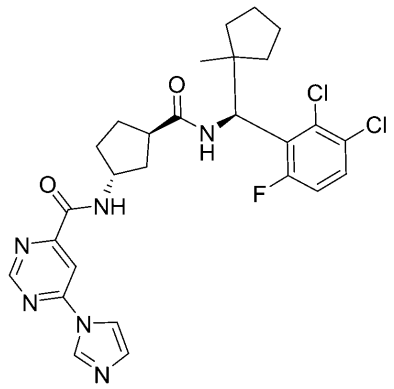
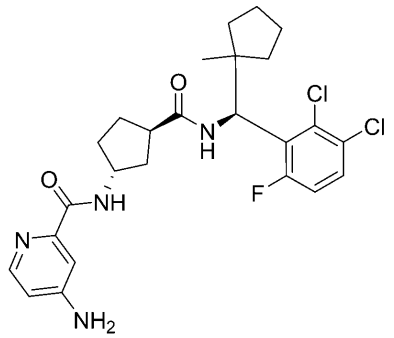
【表１－９００】

I-2818		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.51 - 5.35 (m, 1H), 4.83 (dq, J = 53.3, 5.0 Hz, 1H), 4.07 (d, J = 11.8 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.34 - 2.15 (m, 1H), 1.99 (dt, J = 14.0, 7.7 Hz, 1H), 1.80 (d, J = 4.6 Hz, 6H), 1.75 - 1.61 (m, 5H), 1.60 - 1.35 (m, 4H).	493.05	B	A
I-2819				D	
I-2820				D	
I-2821				B	B

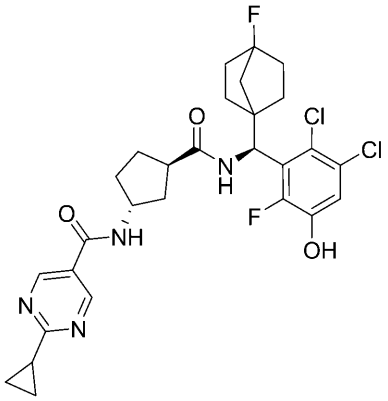
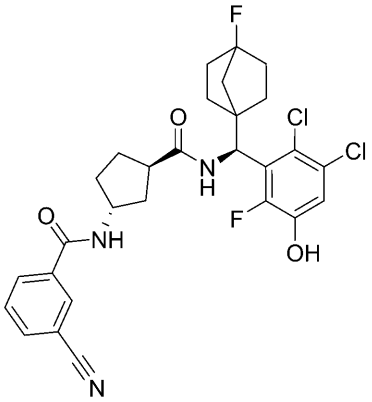
【表１－９０１】

I-2822				C	
I-2823				D	
I-2824				B	B
I-2825				C	
I-2826				E	
I-2827		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.18 (dd, J = 20.3, 2.1 Hz, 2H), 8.72 - 8.51 (m, 2H), 8.09 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.28 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.03 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.12 - 1.42 (m, 16H).	563.15	B	A

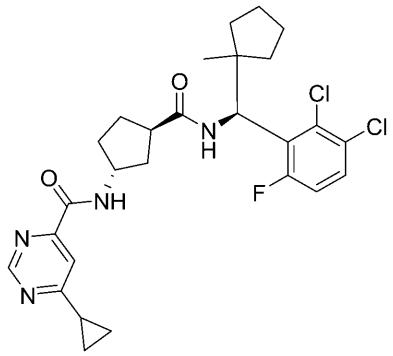
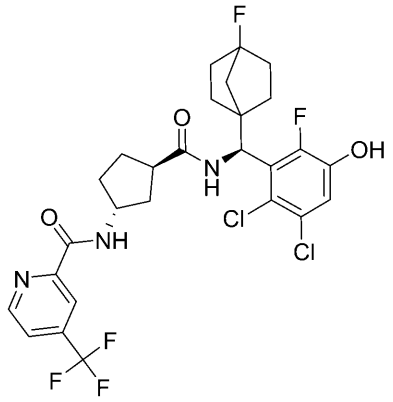
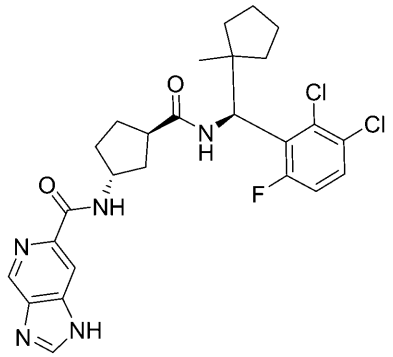
【表１－９０２】

I-2828		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.19 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.92 - 8.79 (m, 2H), 8.39 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.20 (t, J = 1.5 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.43 - 7.13 (m, 2H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.34 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 3.16 - 2.99 (m, 1H), 2.05 - 1.81 (m, 4H), 1.78 - 1.45 (m, 8H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	559.2	B	A
I-2829		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.29 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 6.58 (dd, J = 5.6, 2.4 Hz, 1H), 6.34 (s, 2H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.26 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.07 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 1.96 - 1.76 (m, 4H), 1.60 (t, J = 4.4 Hz, 7H), 1.51 (dd, J = 18.5, 7.3 Hz, 1H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	507.2	B	A

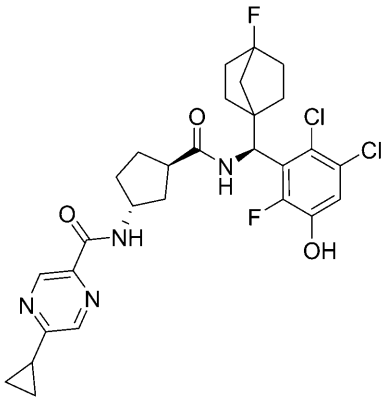
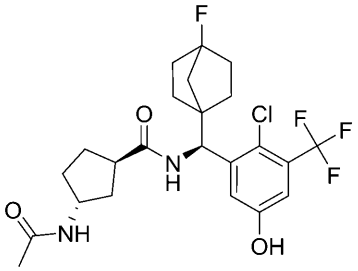
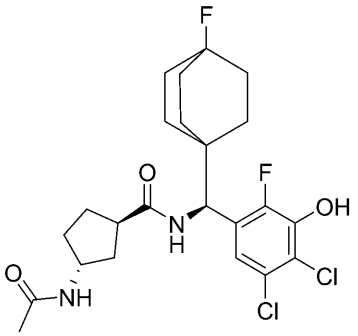
【表１－９０３】

I-2830		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.96 (s, 2H), 8.49 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.26 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.01 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 2.31 - 2.22 (m, 1H), 2.03 - 1.65 (m, 10H), 1.54 (dd, J = 19.3, 11.3 Hz, 6H), 1.11 (dt, J = 8.0, 2.9 Hz, 2H), 1.05 (dt, J = 5.1, 2.8 Hz, 2H).	579.2	B	A
I-2831		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.47 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.29 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 8.21 - 8.05 (m, 2H), 8.00 (dt, J = 7.7, 1.5 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.54 - 5.35 (m, 1H), 4.26 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.06 - 1.65 (m, 10H), 1.64 - 1.45 (m, 6H).	562.15	B	A

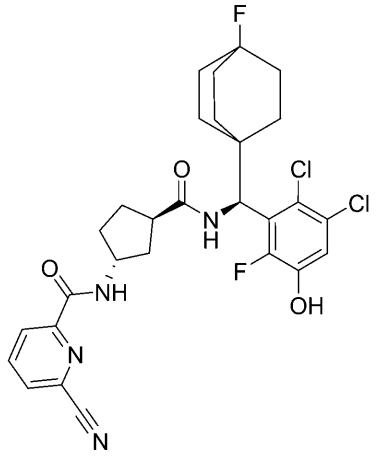
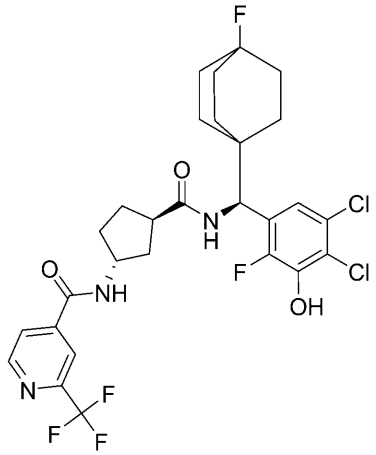
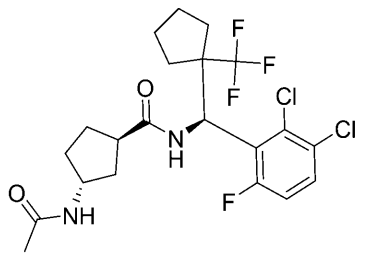
【表１－９０４】

I-2832		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.05 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.31 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.30 (dd, J = 8.5, 4.0 Hz, 1H), 2.01 - 1.87 (s, 4H), 1.60 (s, 7H), 1.54 - 1.37 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 1.26 (s, 2H), 1.24 (s, 2H), 1.19 - 1.04 (m, 2H), 0.99 - 0.81 (m, 3H).	533.2	C	A
I-2833		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.94 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.23 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.02 (dd, J = 5.1, 1.8 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.57 - 5.35 (m, 1H), 4.35 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.03 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.09 - 1.83 (m, 5H), 1.83 - 1.62 (m, 7H), 1.61 - 1.44 (m, 4H).	606.2	B	A
I-2834		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.96 (s, 1H), 8.50 (d, J = 14.6 Hz, 2H), 8.24 (s, 1H), 8.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.31 - 7.22 (m, 1H), 5.52 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.35 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 3.14 - 3.06 (m, 1H), 2.02 - 1.80 (m, 4H), 1.78 - 1.12 (dd, J = 13.1, 8.1 Hz, 10H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	532.15	B	A

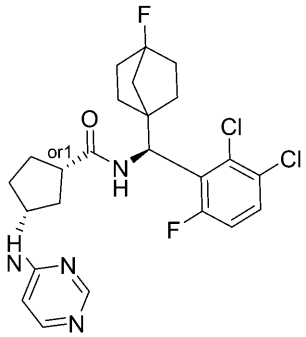
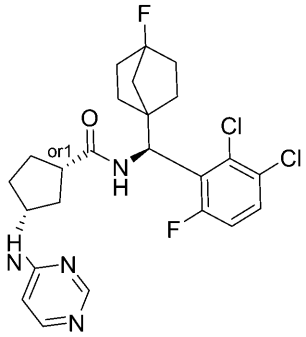
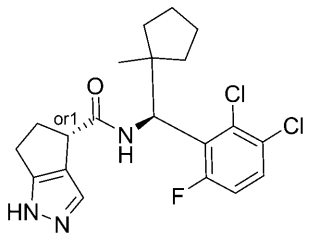
【表１－９０５】

I-2835		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.96 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.53 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 6.85 (s, 1H), 5.51 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.32 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.03 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 2.33 (ddd, J = 13.8, 9.0, 5.3 Hz, 1H), 2.00 - 1.82 (m, 5H), 1.78 - 1.65 (q, J = 12.7, 11.8 Hz, 7H), 1.56 (s, 4H), 1.13 (dt, J = 7.9, 3.1 Hz, 2H), 1.04 (dt, J = 4.9, 3.0 Hz, 2H).	579.15	B	A
I-2836		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.01 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.20 - 6.96 (m, 2H), 5.56 - 5.48 (m, 1H), 4.01 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 2.88 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.94 - 1.74 (m, 9H), 1.72 - 1.54 (m, 6H), 1.54 - 1.31 (m, 4H).	489.1	B	A
I-2837		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.86 (s, 1H), 8.12 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 5.00 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 2.84 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.89-1.82 (m, 1H), 1.85-1.44 (m, 19H), 1.38 (dt, J = 13.0, 6.9 Hz, 1H).	489.15	D	D

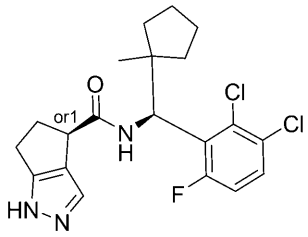
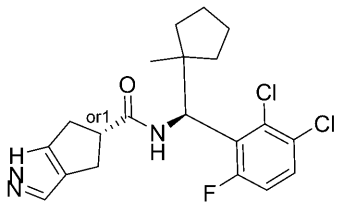
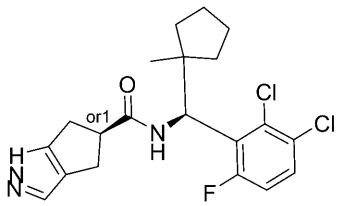
【表１－９０６】

I-2838		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.66 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.41 -8.19 (m, 3H), 8.01 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 5.41 C 5.13 (m, 1H), 4.33 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.11-2.89 (m, 1H), 2.07 C 1.79 (m, 4H), 1.78 - 1.43 (m, 14H).	577.25	C	B
I-2839		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.89 (s, 1H), 8.93 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.81 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 8.16 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 8.09 (dd, J = 5.0, 1.5 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.02 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 4.30 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.36 (s, 1H), 2.95 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.10 -1.92 (m, 2H), 1.96-1.82 (m, 2H), 1.73-1.51 (m, 14H).	620.2	D	D
I-2840		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.81 - 7.66 (m, 2H), 7.34 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 6.10 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.98 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.18 (dt, J = 13.9, 6.8 Hz, 1H), 1.95 - 1.58 (m, 11H), 1.58 - 1.30 (m, 5H).	683.15	B	B

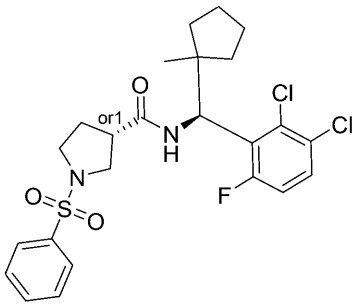
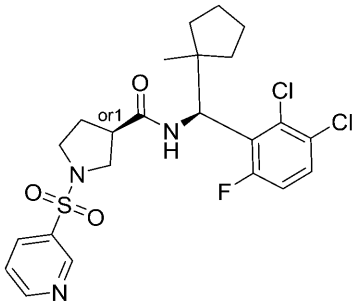
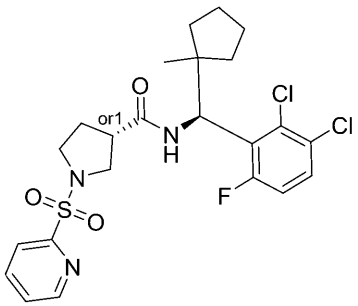
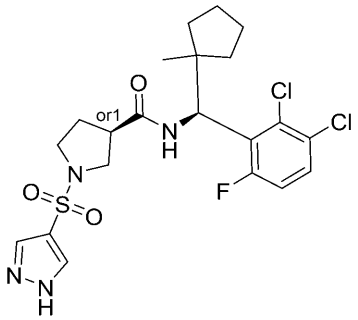
【表１－９０７】

I-2841		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.36 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.62 (dd, J = 8.8, 5.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 6.40 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 2.98 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.01 - 1.83 (m, 3H), 1.83 - 1.73 (m, 3H), 1.68 (d, J = 8.2 Hz, 5H), 1.58 - 1.24 (s, 5H).	495.15	A	A
I-2842		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.42 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.63 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 2H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 6.46 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 2.98 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.00 - 1.86 (m, 5H), 1.82 - 1.66 (m, 5H), 1.65 - 1.33 (m, 6H).	495.2	A	A
I-2843		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 12.32 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.32 - 7.23 (m, 2H), 5.49 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.85 (dd, J = 7.8, 5.1 Hz, 1H), 2.66 (ddd, J = 14.7, 9.4, 5.7 Hz, 1H), 2.60 - 2.51 (m, 1H), 2.47 - 2.32 (m, 1H), 1.60 (t, J = 5.2 Hz, 6H), 1.43 - 1.35 (m, 1H), 1.28 - 1.21 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	409.95	B	B

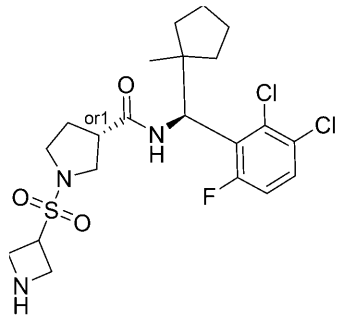
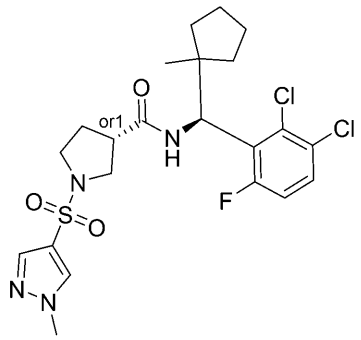
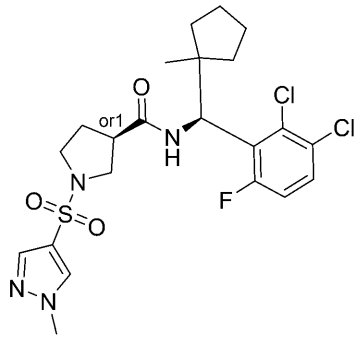
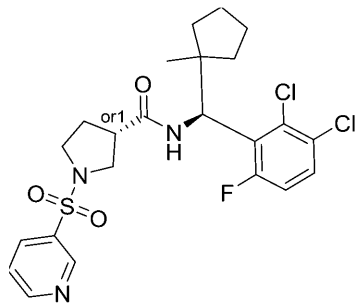
【表１－９０８】

I-2844		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 12.26 (s, 1H), 8.15 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.9, 9.0 Hz, 1H), 7.10 (s, 1H), 5.51 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.92 (dd, J = 8.1, 4.6 Hz, 1H), 2.69 - 2.52 (m, 3H), 1.61 (t, J = 4.3 Hz, 6H), 1.40 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 1.28 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 0.99 (d, J = 2.7 Hz, 3H).	409.95	B	C
I-2845		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 12.21 (s, 1H), 8.18 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.38 - 7.10 (m, 2H), 5.54 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.78 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.88 - 2.69 (m, 3H), 2.47 (dd, J = 14.4, 6.7 Hz, 1H), 1.62 (s, 6H), 1.41 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.30 (q, J = 6.6, 4.7 Hz, 1H), 1.00 (d, J = 2.9 Hz, 3H).	410	C	B
I-2846		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 12.21 (s, 1H), 8.19 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.33 - 7.22 (m, 2H), 5.54 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.77 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.85 (dd, J = 14.6, 8.9 Hz, 1H), 2.80 - 2.54 (m, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.41 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.33 - 1.21 (m, 1H), 0.99 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	410.05	B	A

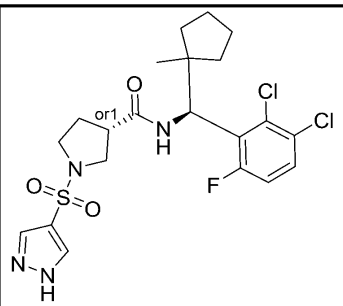
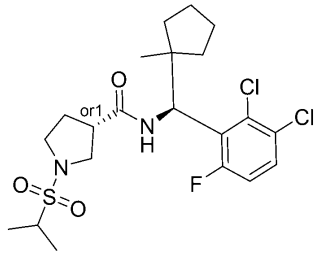
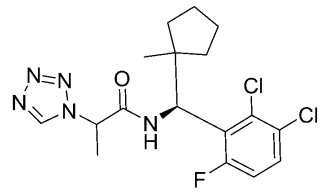
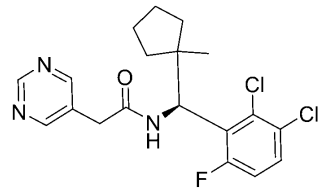
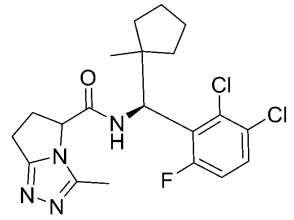
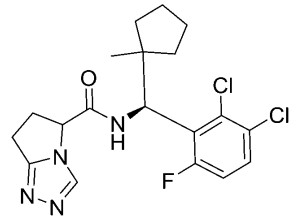
【表１－９０９】

I-2847			513.1	C	
I-2848			514.1	B	
I-2849			514.1	C	
I-2850			503.05	B	

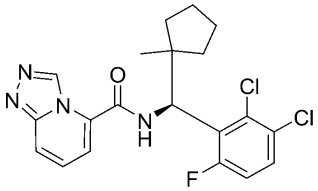
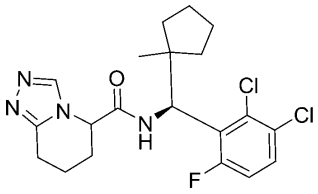
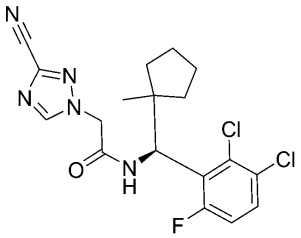
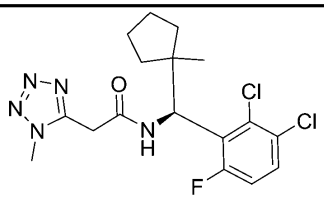
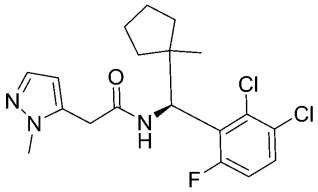
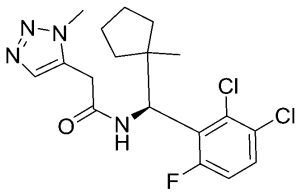
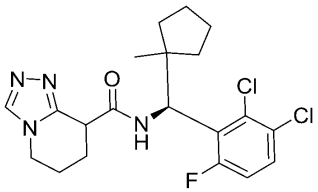
【表１－９１０】

I-2851			492.1	C	
I-2852			517.1	B	A
I-2853			517.05	B	
I-2854			514.05	A	

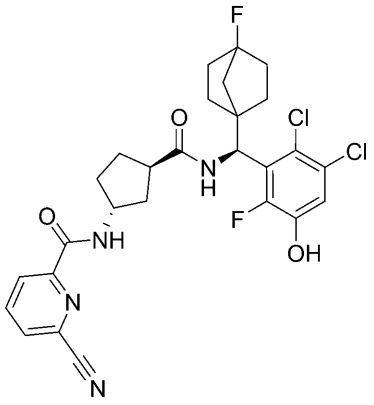
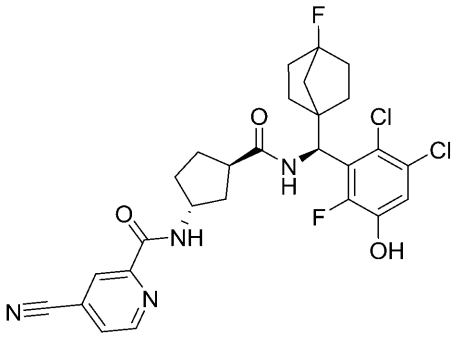
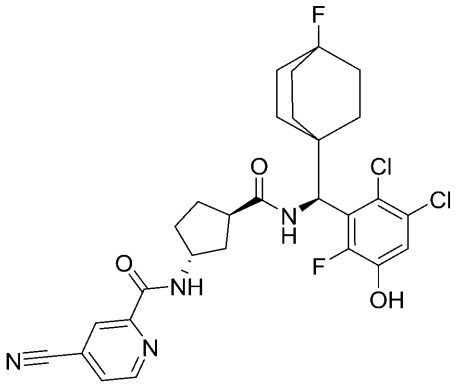
【表１－９１１】

I-2855			503.1	A	A
I-2856			479.1	B	
I-2857				B	
I-2858				B	
I-2859				D	
I-2860				B	

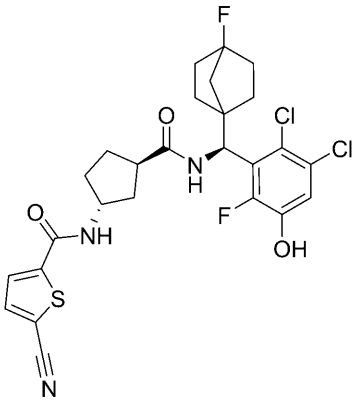
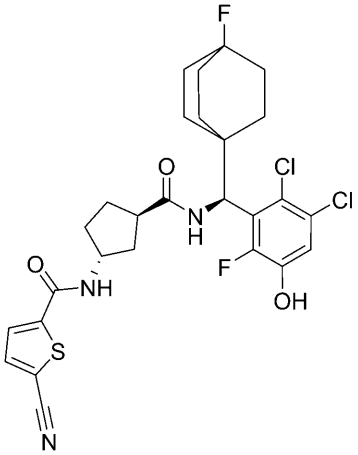
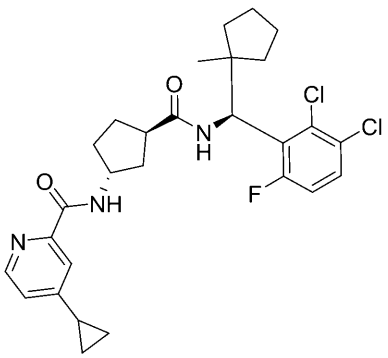
【表１－９１２】

I-2861				D	
I-2862				B	
I-2863				B	
I-2864				B	
I-2865				B	
I-2866				B	
I-2867				D	

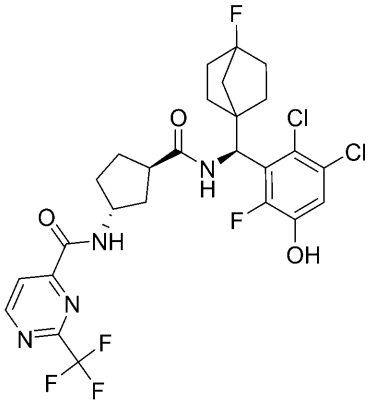
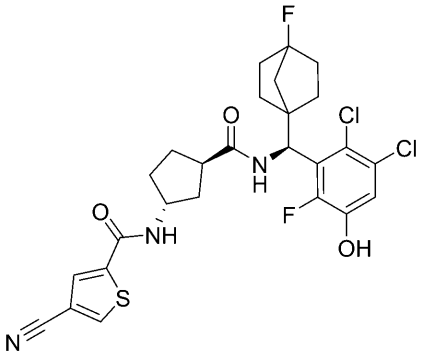
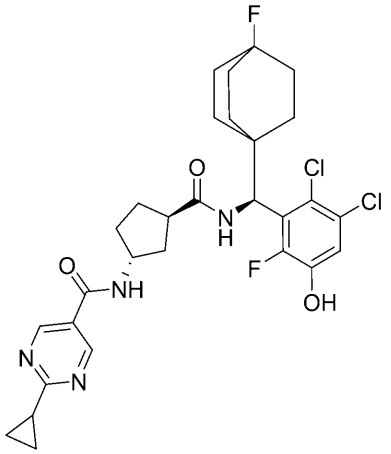
【表１－９１３】

I-2868		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.65 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.25 (dtd, J = 16.9, 10.1, 8.4, 4.1 Hz, 3H), 8.11 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.33 (h, J = 7.2 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.10 - 1.41 (m, 16H).	563.15	B	A
I-2869		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.90 (t, J = 4.3 Hz, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.13 - 8.06 (m, 2H), 7.11 (s, 1H), 5.50 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.33 (s, 1H), 3.04 (s, 1H), 2.06 - 1.45 (m, 16H).	561.05	B	A
I-2870		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.89 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.39 - 8.24 (m, 1H), 8.09 (dd, J = 4.9, 1.7 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.32 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 2.06 - 1.80 (m, 5H), 1.80 - 1.60 (m, 12H), 1.59 - 1.41 (m, 1H).	575.05	B	

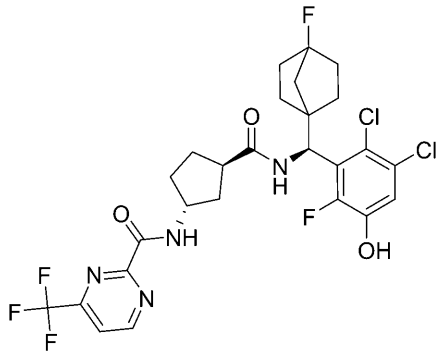
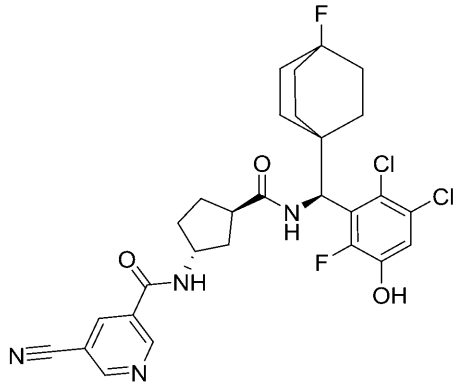
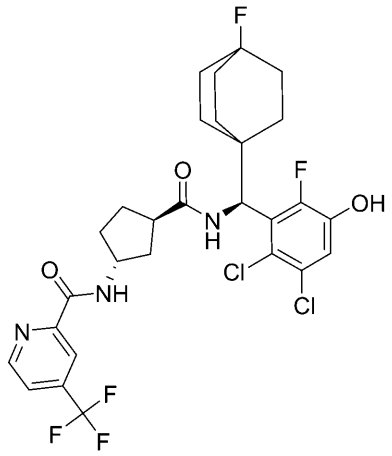
【表１－９１４】

I-2871		1H NMR (400 MHz, メタノール-d4) 7.73 (s, 2H), 7.05 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.71 (s, 1H), 4.42-4.34 (m, 1H), 3.08 (p, J = 8.3, 7.7 Hz, 1H), 2.19 (dt, J = 14.3, 7.5 Hz, 1H), 2.10 (dd, J = 11.5, 6.4 Hz, 1H), 2.05-1.83 (m, 2H), 1.81 (s, 3H), 1.76 (dd, J = 17.4, 8.6 Hz, 3H), 1.67 (s, 4H), 1.65 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 1.57 (d, J = 10.6 Hz, 1H).	568.1	B	A
I-2872		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.67 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.04- 7.96 (m, 2H), 7.89 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.21 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.04 - 2.96 (m, 1H), 1.95 (dt, J = 13.4, 7.1 Hz, 2H), 1.70 (s, 14H), 1.55 (dd, J = 11.6, 6.5 Hz, 2H), 1.24 (s, 1H).	582.2	B	
I-2873		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.44 (t, J = 8.3 Hz, 2H), 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.62 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 15.9, 7.3 Hz, 2H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.31 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 3.11 - 3.03 (m, 1H), 2.07 (s, 1H), 1.97 - 1.79 (m, 4H), 1.60 (s, 8H), 1.52 (s, 1H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 1.12 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 0.97 (s, 3H), 0.88 - 0.82 (m, 2H).	532.2	D	

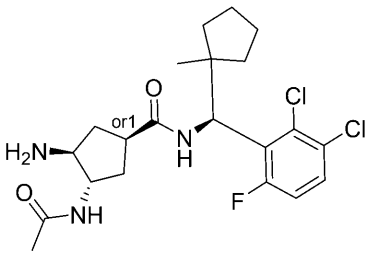
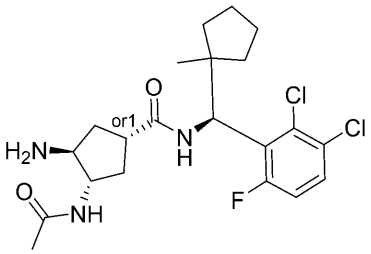
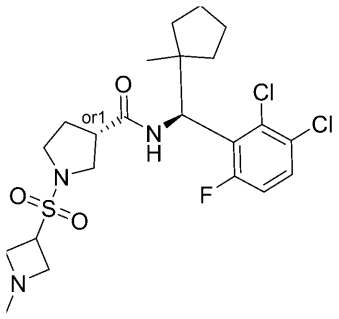
【表１－９１５】

I-2874		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 9.32-9.26 (m, 1H), 8.75 (d, J = 7.9 Hz, 1H),8.26 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.36 (s, 1H), 3.09-3.01 (m, 1H), 1.92 (s, 3H), 1.73-1.66 (m, 9H), 1.61-1.49 (m, 4H).	607.1	B	
I-2875		1H NMR (400 MHz, メタノール-d4) 8.40 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.71 (s, 1H), 4.42 -4.34 (m, 1H), 3.09 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 2.25-1.83 (m, 4H), 1.83-1.68 (m, 2H), 1.74 (s, 6H), 1.66 (dt, J = 9.9, 3.5 Hz, 3H), 1.57 (d, J = 10.4 Hz, 1H).	568.1	B	A
I-2876		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.97 (s, 2H), 8.49 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.10 - 7.96 (m, 1H), 7.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.34 - 5.12 (m, 1H), 4.25 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 2.99 (q, J = 7.7 Hz, 1H), 2.35 - 2.22 (m, 1H), 2.07 - 1.34 (m, 18H), 1.15 - 1.02 (m, 4H).	591.1	B	

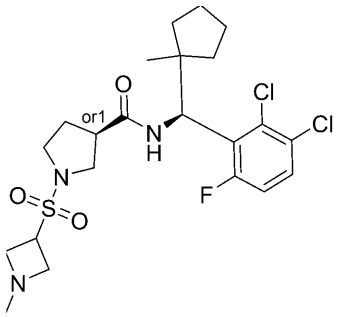
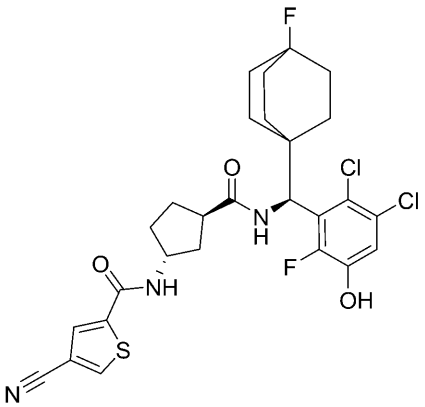
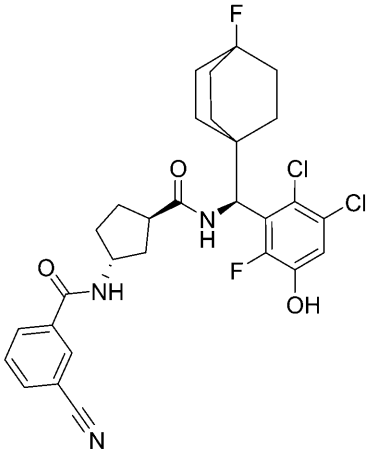
【表１－９１６】

I-2877		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)9.31 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.79 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.09 (s, 1H), 5.49 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.32 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 3.07-2.99 (m, 1H), 1.87 (s, 4H), 1.81 (d, J = 7.6 Hz, 3H), 1.69 (d, J = 13.6 Hz, 5H), 1.56 (s, 4H).	607.1	B	
I-2878		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)9.27- 9.12 (m, 2H), 8.65 (d, J = 18.9 Hz, 2H), 8.11 - 7.54 (m, 1H), 7.15 - 7.03 (m, 1H), 5.38 -5.13 (m, 1H), 4.26 (d, J = 11.5 Hz, 1H), 3.02 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 2.09- 1.43 (m, 18H).	577.15	C	
I-2879		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.95 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.25 - 7.98 (m, 3H), 7.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.35 - 5.13 (m, 1H), 4.41 - 4.28 (m, 1H), 3.04 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.01 - 1.80 (m, 4H), 1.72 (td, J = 13.6, 11.9, 6.7 Hz, 13H), 1.51 (ddd, J = 16.7, 10.3, 6.2 Hz, 1H).	618.05	C	

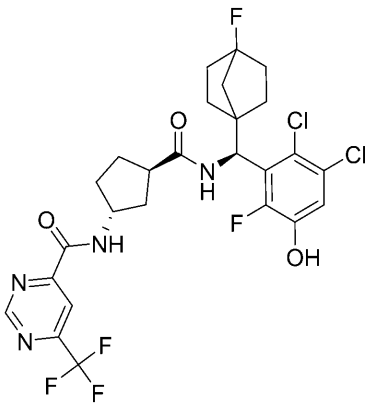
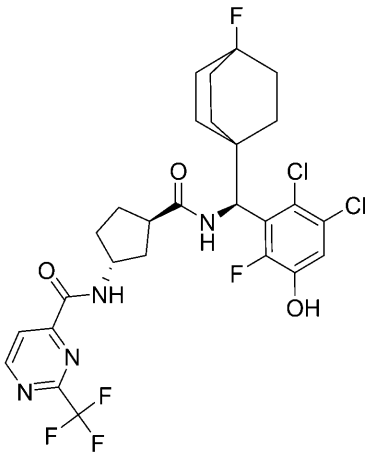
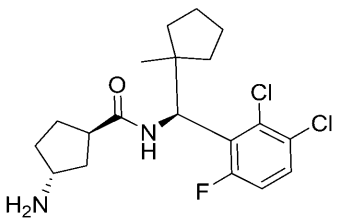
【表１－９１７】

I-2880		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.31-7.21 (m, 1H), 5.49 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 1H), 3.89 (s, 1H), 3.75-3.62 (m, 1H), 2.99 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 2.16 (dt, J = 12.5, 7.7 Hz, 1H), 1.86-1.74 (m, 1H), 1.80 (s, 3H), 1.59 (s, 5H), 1.54 (s, 1H), 1.47 (qd, J = 9.6, 4.7 Hz, 2H), 1.40-1.32 (m, 1H), 1.25 (dd, J = 9.7, 5.2 Hz, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	444.15	B	
I-2881		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (dd, J = 8.8, 4.2 Hz, 1H), 8.00 (q, J = 7.3 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 7.9, 5.0, 2.7 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 11.0, 8.9 Hz, 1H), 6.43 (s, 1H), 5.47 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.93-3.81 (m, 1H), 3.16-3.03 (m, 2H), 2.07 (ddd, J = 11.2, 7.5, 4.0 Hz, 2H), 1.78 (s, 3H), 1.59 (s, 6H), 1.54 (s, 1H), 1.41-1.24 (m, 3H), 0.97 (d, J = 3.0 Hz, 3H).	444.1	B	
I-2882			506.05	B	

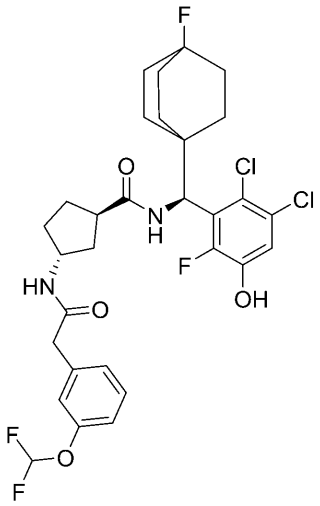
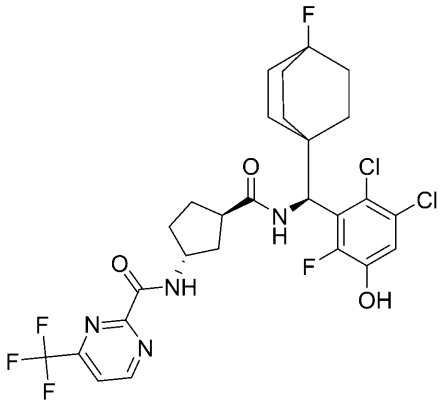
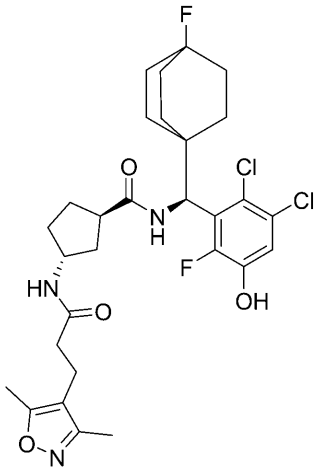
【表１－９１８】

I-2883			506.05	B	
I-2884		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 8.71 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.20 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.95 - 1.80 (m, 4H), 1.83 - 1.66 (m, 12H), 1.56 - 1.44 (m, 2H).	582.2	B	B
I-2885		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.47 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.15 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 8.12 - 7.96 (m, 2H), 7.69 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.27 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.07 - 2.97 (m, 1H), 1.95 (dq, J = 11.7, 5.9, 4.7 Hz, 2H), 1.89 - 1.81 (m, 2H), 1.81 - 1.55 (m, 12H), 1.56 - 1.43 (m, 2H).	576.05	B	B

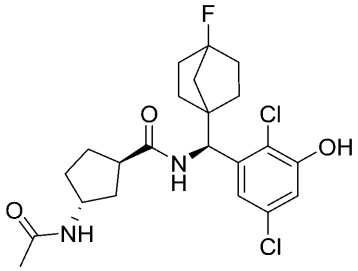
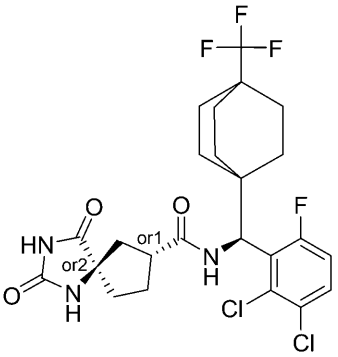
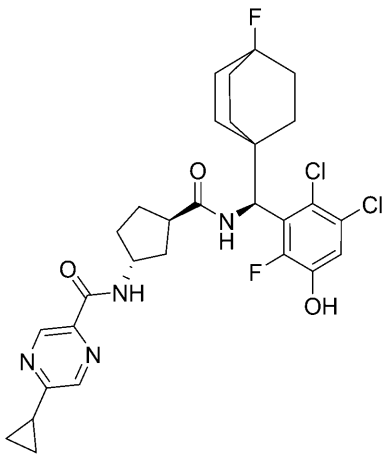
【表１－９１９】

I-2886		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.59 (s, 1H), 9.04 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.11 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.35 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.04 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.03 - 1.46 (m, 16H).	607.05	B	A
I-2887		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 9.29 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.14 - 7.06 (m, 1H), 5.29 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.33 (p, J = 7.4 Hz, 1H), 3.04 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.04 - 1.81 (m, 4H), 1.79 - 1.61 (m, 13H), 1.49 (dq, J = 12.4, 8.3 Hz, 1H).	621.15	C	
I-2888		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.31 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 1.85 - 1.64 (m, 3H), 1.59 (s, 6H), 1.56 - 1.33 (m, 3H), 1.27 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 1.27 - 1.16 (m, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	387.1	C	

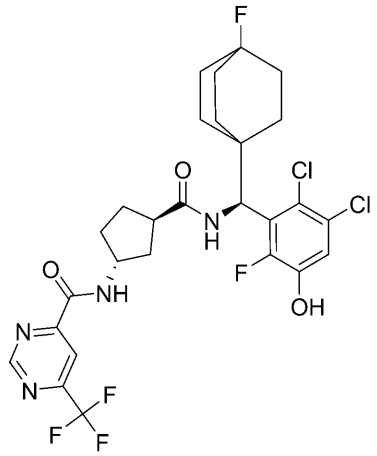
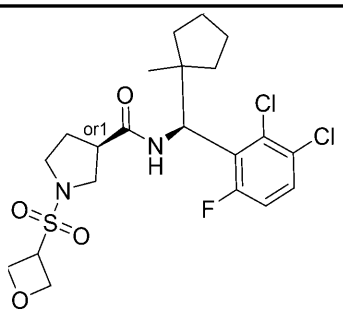
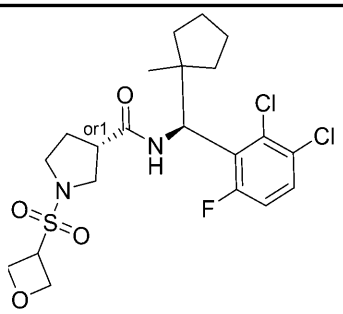
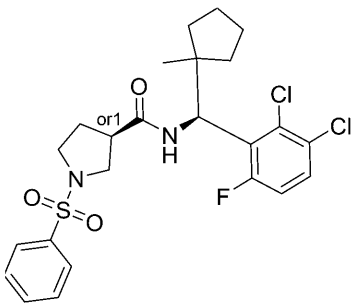
【表１－９２０】

I-2889		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.53 (s, 1H), 8.05 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 15.8, 8.0 Hz, 1H), 7.20 (s, 1H), 7.15 - 6.99 (m, 4H), 5.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.00-3.35 (q, J = 6.6 Hz, 3H), 2.94 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 1.95 - 1.57 (m, 16H), 1.41 (ddt, J = 24.1, 13.0, 7.4 Hz, 2H).	631.15	B	
I-2890		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 9.31 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.78 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.31 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.02 - 1.79 (m, 4H), 1.78 - 1.58 (m, 13H), 1.52 (dt, J = 12.5, 7.9 Hz, 1H).	621.1	B	B
I-2891		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 7.93 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.97 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 2.90 - 2.81 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 2.16 (d, J = 14.8 Hz, 5H), 1.74 (s, 2H), 1.88 - 1.65 (m, 14H), 1.57 - 1.37 (m, 2H), 1.32 - 1.21 (m, 2H).	598.2	C	

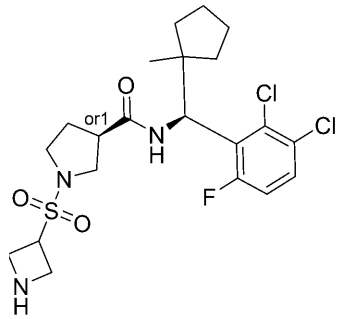
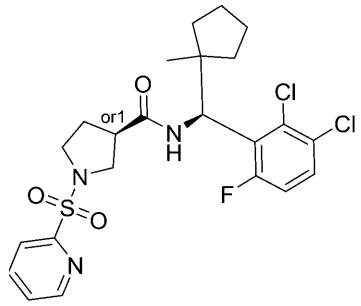
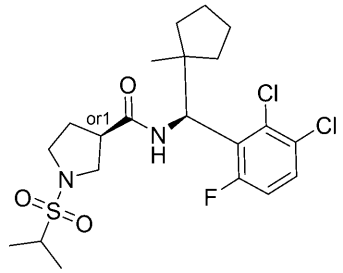
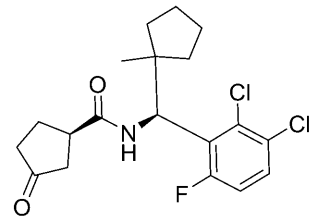
【表１－９２１】

I-2892		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.21 (s, 1H), 8.16 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 33.0, 2.4 Hz, 2H), 5.52 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.85 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.95 - 1.63 (m, 13H), 1.62 -1.48 (m, 3H), 1.47 - 1.28 (m, 3H).	457.2	D	
I-2893		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.20 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.37 - 7.19 (m, 1H), 5.34 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.09 (dd, J = 13.1, 10.1 Hz, 1H), 1.93 (dddd, J = 21.9, 15.9, 13.9, 9.4 Hz, 3H), 1.59 (p, J = 9.7 Hz, 14H).	550.2	D	
I-2894		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 8.96 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.53 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.12 - 7.95 (m, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.36 - 5.13 (m, 1H), 4.31 (h, J = 7.2 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.34 (ddd, J = 12.8, 8.1, 4.7 Hz, 1H), 2.02 - 1.80 (m, 4H), 1.68 (th, J = 16.0, 7.6 Hz, 13H), 1.50 (dq, J = 12.4, 8.0 Hz, 1H), 1.13 (dt, J = 7.9, 3.2 Hz, 2H), 1.04 (dt, J = 5.0, 3.0 Hz, 2H).	593.15	B	A

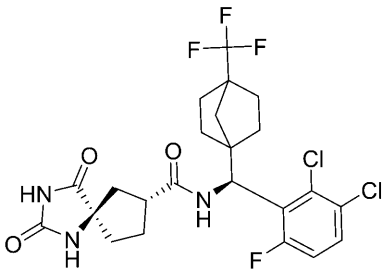
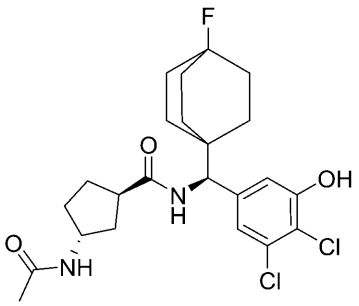
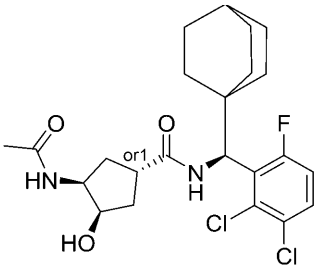
【表１－９２２】

I-2895		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 9.60 (s, 1H), 9.03 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.14 - 7.97 (m, 1H), 7.11 (dd, J = 8.1, 1.9 Hz, 1H), 5.35 - 5.14 (m, 1H), 4.34 (q, J = 7.3 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 1.93 (ddt, J = 33.5, 13.2, 6.7 Hz, 5H), 1.69 (dd, J = 16.5, 9.8 Hz, 12H), 1.50 (dq, J = 17.0, 9.2 Hz, 1H).	621.1	B	
I-2896			493.1	B	B
I-2897			493.1	D	
I-2898			513.1	B	

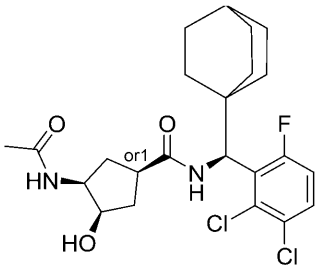
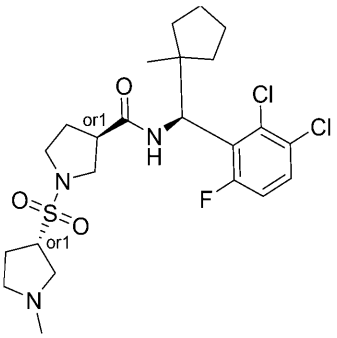
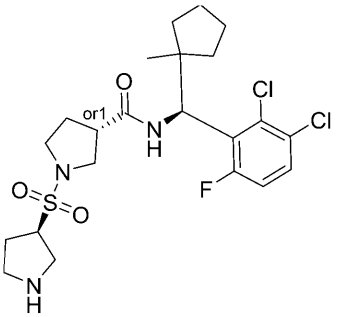
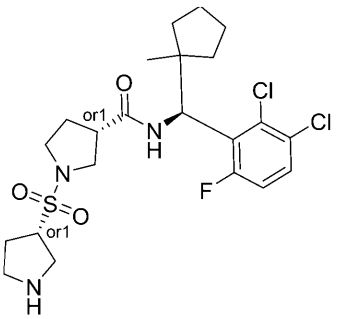
【表１－９２３】

I-2899			492.1	B	B
I-2900			514.1	B	B
I-2901			479.1	B	B
I-2902		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.32 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.46 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.24 (d, J = 14.3 Hz, 1H), 2.33 - 2.16 (m, 2H), 2.15-1.99 (m, 3H), 1.76 - 1.52 (m, 7H), 1.38 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.98 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	386.1	D	

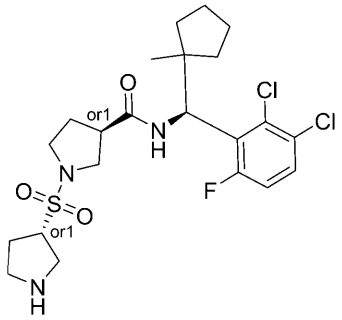
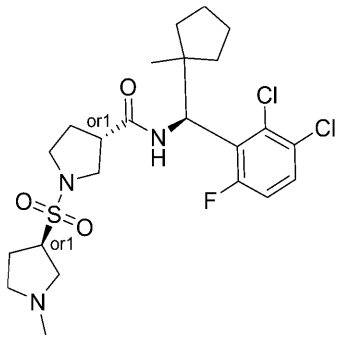
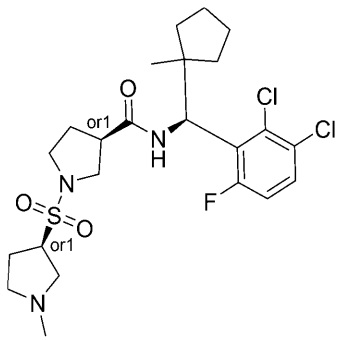
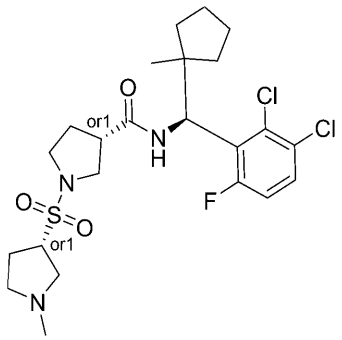
【表１－９２４】

I-2903		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)10.42 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.63 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.32-7.21 (m, 1H), 5.61 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.01 (s, 1H), 2.17-2.05 (m, 1H), 2.04-1.85 (m, 1H), 1.82 (s, 2H), 1.76 (s, 1H), 1.74-1.47 (m, 10H), 1.45-1.38 (m, 1H).	536.1	D	
I-2904		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 6.73 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 4.51 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 4.05-3.96 (m, 1H), 2.91-2.82 (m, 1H), 1.86-1.78 (m, 1H), 1.77 (s, 2H), 1.70-1.63 (m, 12H), 1.54 (t, J = 8.2 Hz, 5H), 1.38 (dt, J = 13.2, 6.9 Hz, 1H).	471.2	B	C
I-2905		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.98 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.98- 3.92 (m, 1H), 3.86 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 1.79 (d, J = 2.6 Hz, 5H), 1.72-1.52 (m, 1H), 1.49 (s, 11H), 1.43 (d, J = 9.8 Hz, 4H).	471.1	B	B

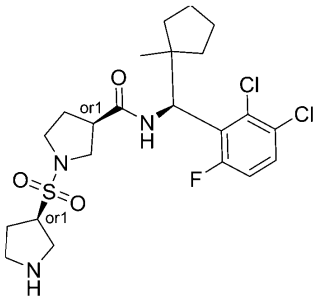
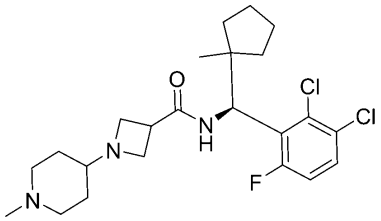
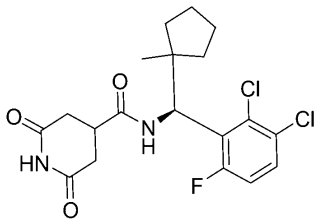
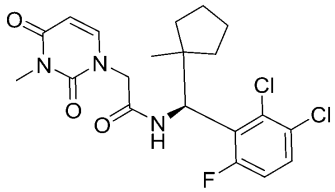
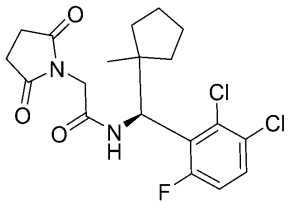
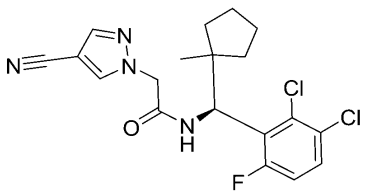
【表１－９２５】

I-2906		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.98 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.27-7.17 (m, 1H), 5.24 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.09 (s, 2H), 1.80 (s, 4H), 1.47 (d, J = 17.0 Hz, 15H).	471.15	B	A
I-2907			520.1	B	B
I-2908			506.1	B	
I-2909			506.1	B	B

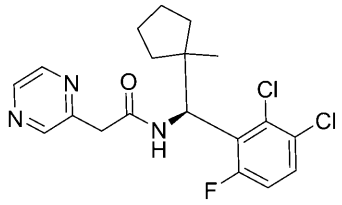
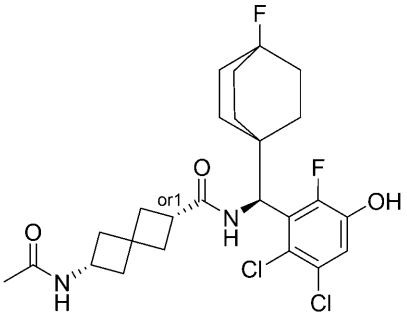
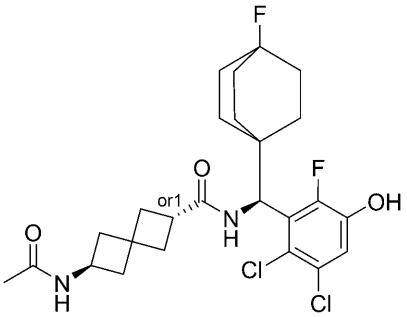
【表１－９２６】

I-2910			506.05	B	
I-2911			520.1	B	
I-2912			520.1	C	
I-2913			520.1	C	

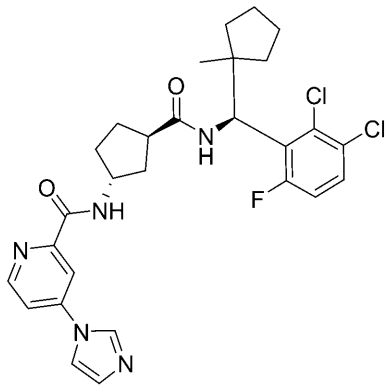
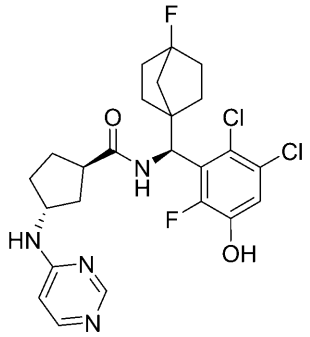
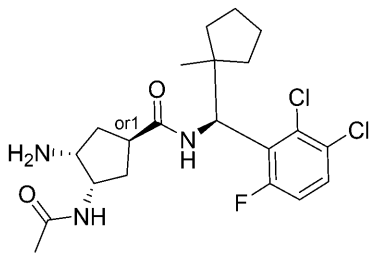
【表１－９２７】

I-2914			506.1	B	B
I-2915				C	
I-2916				C	
I-2917				C	
I-2918					
I-2919				D	

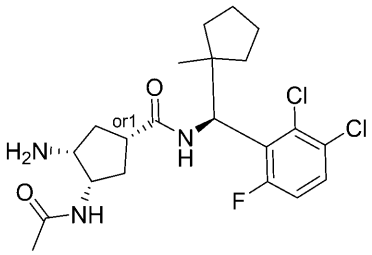
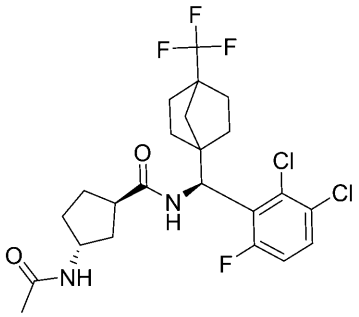
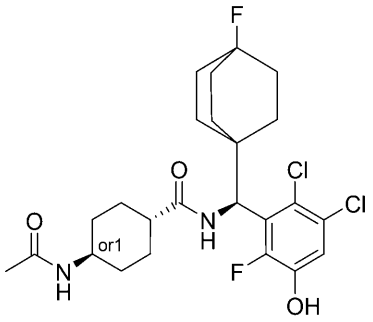
【表１－９２８】

I-2920				D	
I-2921		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.52 (s, 1H), 7.97 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.97 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 3.06 (q, J = 8.5 Hz, 1H), 2.11 - 1.92 (m, 5H), 1.96 - 1.82 (m, 1H), 1.86 - 1.62 (m, 16H), 1.24 (s, 1H).	515.2	D	
I-2922		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.52 (s, 1H), 7.97 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 8.0 Hz, 1H), 3.06 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.18 - 2.03 (m, 3H), 1.95 (dd, J = 11.2, 8.5 Hz, 1H), 1.85 (td, J = 8.1, 7.4, 3.1 Hz, 2H), 1.84 - 1.66 (m, 16H), 1.24 (s, 1H).	515.15	D	

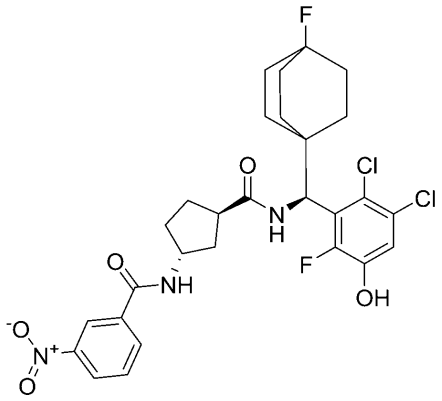
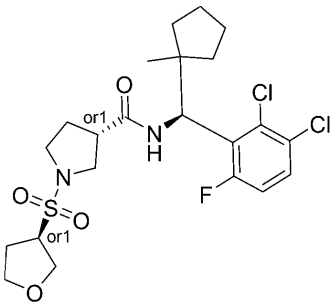
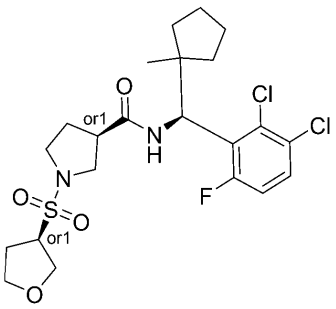
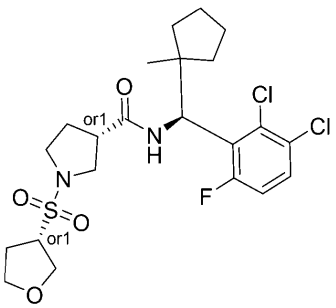
【表１－９２９】

I-2923		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.29 (s, 1H), 8.81 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.04 (dd, J = 5.5, 2.4 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.27 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.35 (p, J = 7.0 Hz, 1H), 3.09 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.04-1.82 (m, 3H), 1.60 (s, 7H), 1.55-1.44 (m, 1H), 1.38 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	558.2	B	B
I-2924		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.55 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.35 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.42 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.22 (s, 1H), 2.97 (q, J = 8.2 Hz, 1H), 2.03 (s, 1H), 1.97 (dt, J = 14.1, 7.8 Hz, 2H), 1.86 - 1.65 (m, 8H), 1.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 1.52 (s, 3H), 1.50 (s, 1H).	511.1	B	A
I-2925		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.08 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.59 (s, 2H), 7.25 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.90 (s, 1H), 3.31 (s, 1H), 3.12-3.04 (m, 2H), 2.31 (s, 1H), 1.82 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.59 (s, 9H), 1.37 (s, 1H), 1.23 (s, 3H), 0.96 (s, 3H).	444.15	B	B

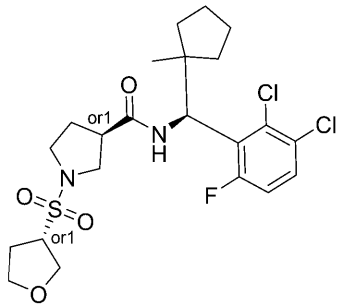
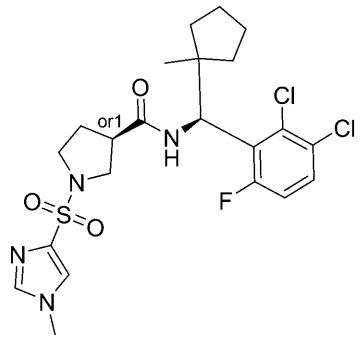
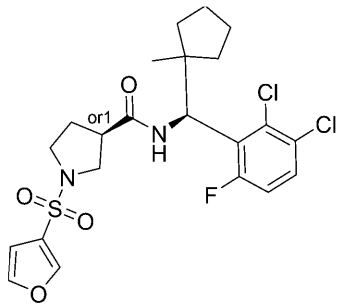
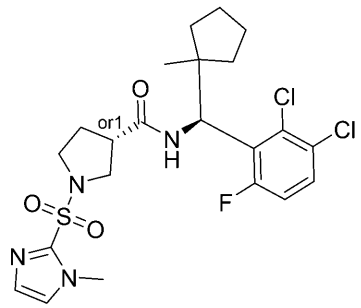
【表１－９３０】

I-2926		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 2H), 7.25 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.46 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.89 (s, 1H), 1.82 (s, 3H), 1.70 (d, J = 9.6 Hz, 4H), 1.59 (s, 9H), 1.36 (d, J = 10.6 Hz, 1H), 1.25 (d, J = 11.8 Hz, 2H), 0.99-0.93 (m, 3H)	444.15	B	B
I-2927		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.61 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 2.91 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.85 (dt, J = 18.5, 6.8 Hz, 2H), 1.78 (s, 2H), 1.76 (s, 6H), 1.67-1.57 (m, 4H), 1.55 (d, J = 9.4 Hz, 4H), 1.49-1.34 (m, 1H).	509.1	D	
I-2928		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.54 (s, 1H), 7.94 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.15 - 7.04 (m, 1H), 5.31 - 5.09 (m, 1H), 366 - 3.42 (m, 1H), 2.28 (td, J = 11.4, 10.7, 4.8 Hz, 1H), 1.76 (s, 6H), 1.70 (d, J = 6.1 Hz, 12H), 1.55 (d, J = 12.6 Hz, 1H), 1.41 - 1.20 (m, 2H), 1.20 - 1.05 (m, 2H).	503.1	D	

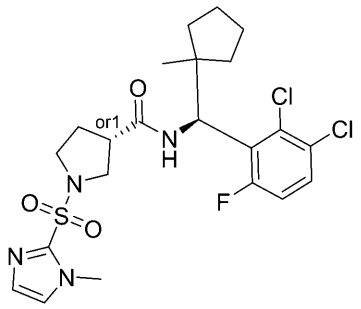
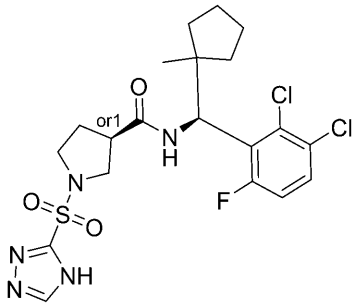
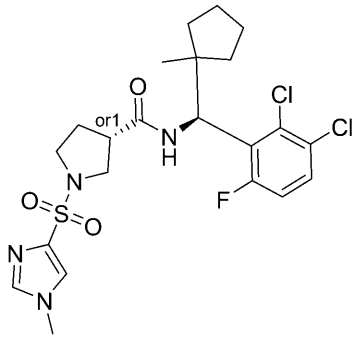
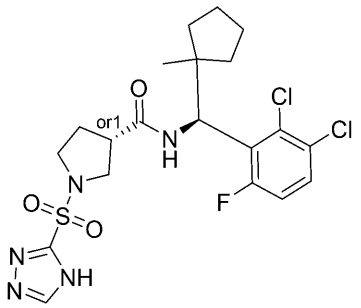
【表１－９３１】

I-2929		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.52 (s, 1H),8.73 - 8.66 (m, 2H), 8.39 (ddd, J = 8.2, 2.4, 1.0 Hz, 1H), 8.30 (dt, J = 7.9, 1.3 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.78 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.30 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.98 (dd, J = 13.4, 7.0 Hz, 2H), 1.96 - 1.73 (m, 2H), 1.73 - 1.44 (m, 14H).	596.2	B	B
I-2930			507.1	B	B
I-2931			507.1	B	B
I-2932			507.1	C	

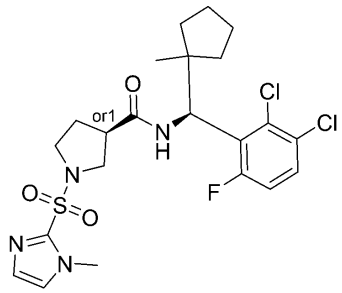
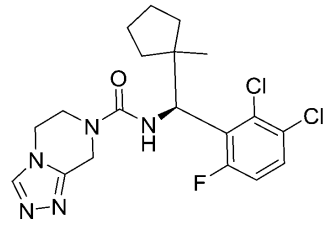
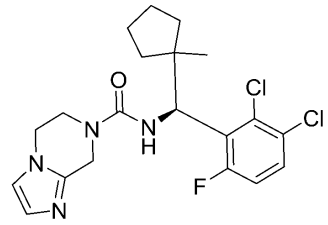
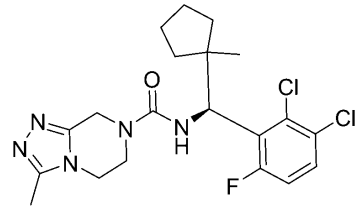
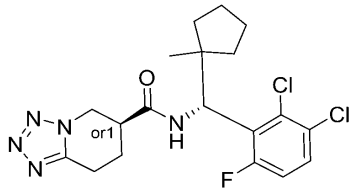
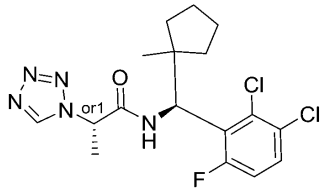
【表１－９３２】

I-2933			507.1	B	
I-2934			517.1	D	
I-2935			503.05	C	
I-2936			503.05	A	B

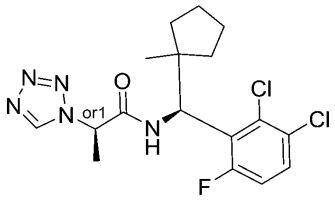
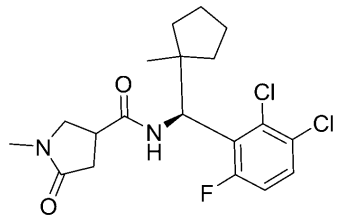
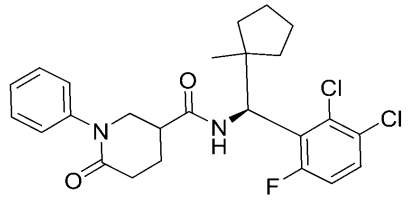
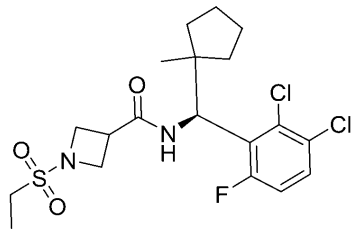
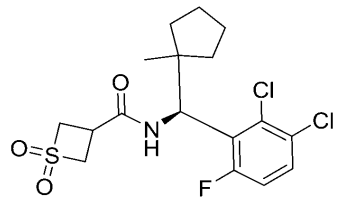
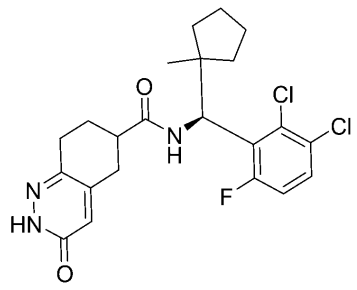
【表１－９３３】

I-2937			517	B	B
I-2938			504	D	
I-2939			517.05	B	B
I-2940			504.05	B	B

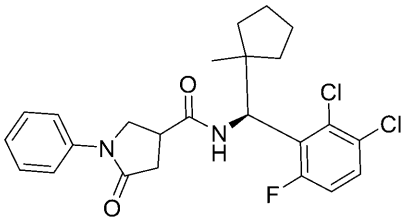
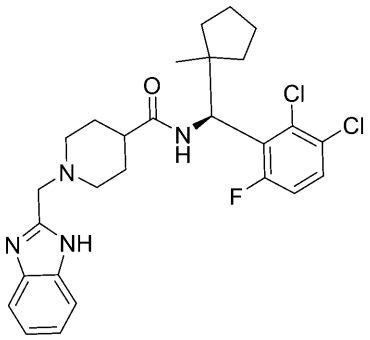
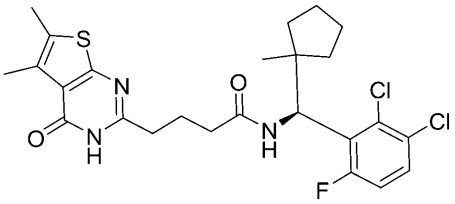
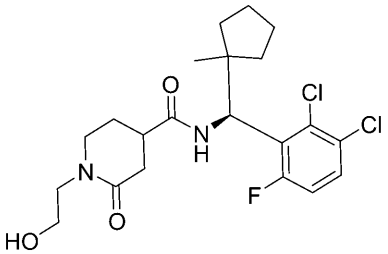
【表１－９３４】

I-2941			517	C	
I-2942				E	
I-2943				D	
I-2944				D	
I-2945				D	
I-2946				D	

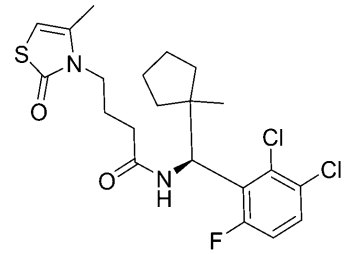
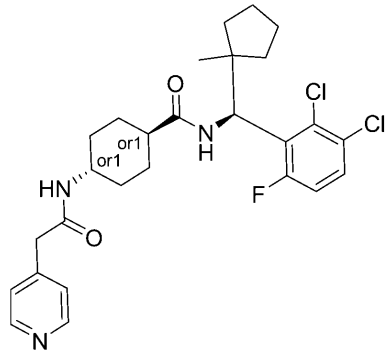
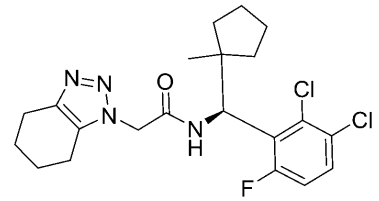
【表１－９３５】

I-2947				B	B
I-2948				C	
I-2949				C	
I-2950				B	B
I-2951				B	
I-2952				B	

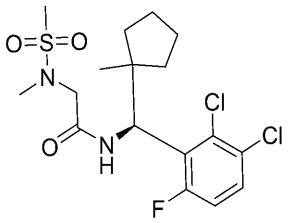
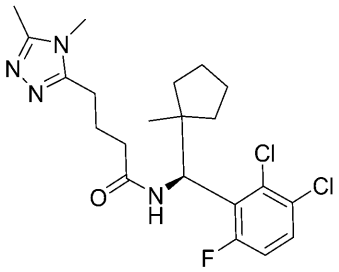
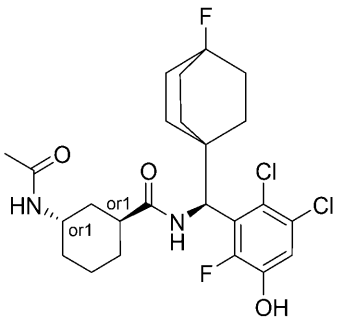
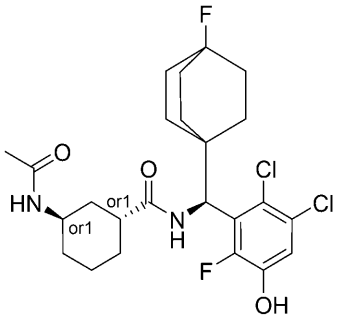
【表１－９３６】

I-2953				B	
I-2954				D	
I-2955				C	
I-2956				C	

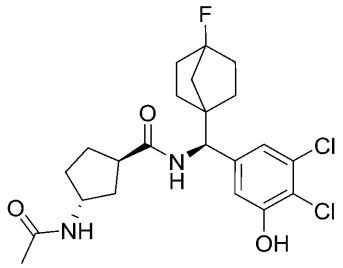
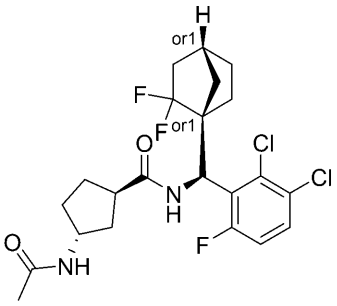
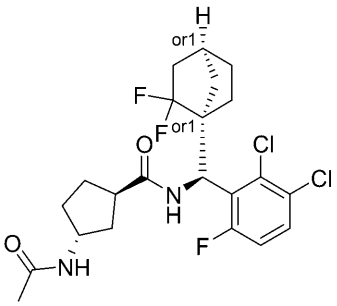
【表１－９３７】

I-2957				D	
I-2958				D	
I-2959				C	

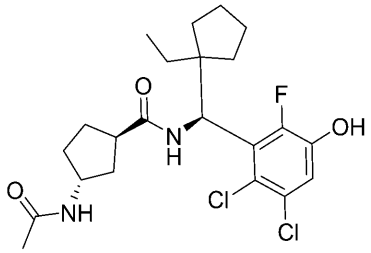
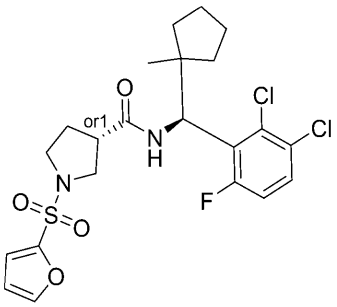
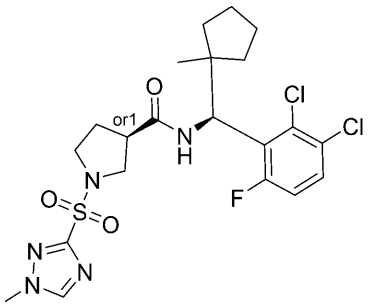
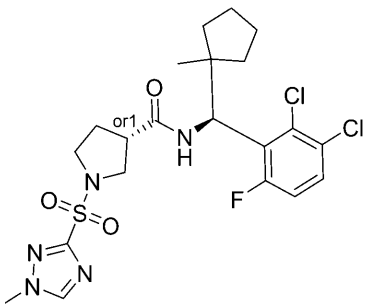
【表１－９３８】

I-2960				B	
I-2961				B	B
I-2962		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.56 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.34 - 5.14 (m, 1H), 3.88 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 2.59 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.78- 1.56 (m, 13H), 1.55 - 1.28 (m, 7H).	503.15	D	
I-2963		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.63 - 10.50 (m, 1H), 7.91 - 7.72 (m, 1H), 7.56 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.14 - 7.06 (m, 1H), 5.33 - 5.14 (m, 1H), 3.94 - 3.84 (m, 1H), 2.59 (tq, J = 8.9, 5.4, 4.7 Hz, 1H), 1.83 (s, 3H), 1.79 - 1.52 (m, 12H), 1.52 - 1.14 (m,8H).	503.1	D	

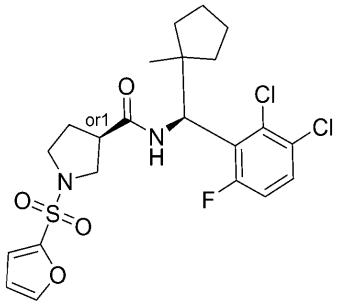
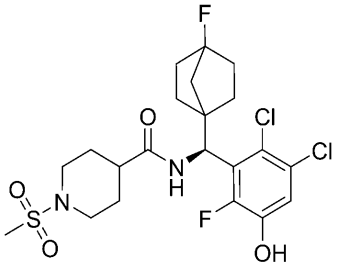
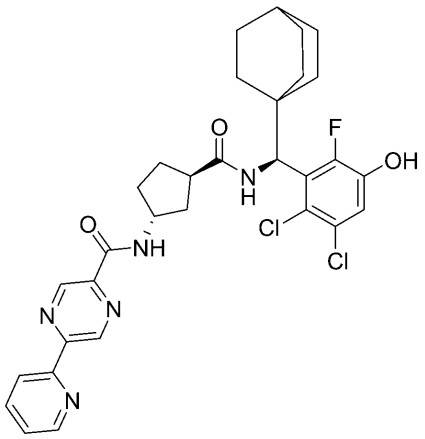
【表１－９３９】

I-2964		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.26 (s, 1H), 8.14 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 6.95 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 4.82 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.06 - 3.96 (m, 1H), 2.89 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.89 - 1.70 (m, 8H), 1.70 - 1.58 (m, 5H), 1.53 (dt, J = 11.5, 8.1 Hz, 2H), 1.44 - 1.15 (m, 4H).	457.05	B	A
I-2965		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 7.74 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.62 (dt, J = 9.0, 4.8 Hz, 1H), 7.27 (ddd, J = 10.6, 9.0, 3.8 Hz, 1H), 6.13 - 5.88 (m, 1H), 3.98 (dt, J = 12.8, 6.4 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.38 - 2.18 (m, 1H), 2.04 (d, J = 30.7 Hz, 1H), 1.91 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 1.87 - 1.68 (m, 7H), 1.68 - 1.41 (m, 6H), 1.35 (dt, J = 12.6, 7.5 Hz, 2H).	477.1	B	B
I-2966		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.36 - 7.22 (m, 1H), 6.16 - 5.95 (m, 1H), 3.99 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.93 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.23 (s, 1H), 2.16 - 1.94 (m, 2H), 1.91 - 1.69 (m, 8H), 1.60 (dq, J = 12.4, 5.7 Hz, 3H), 1.49 - 1.28 (m, 3H), 1.12 (d, J = 10.2 Hz, 1H).	477.1	C	B

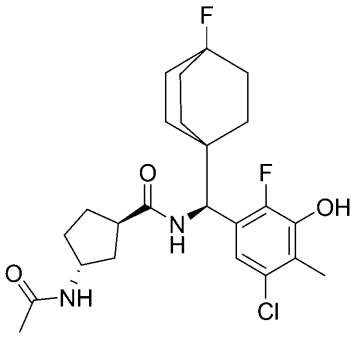
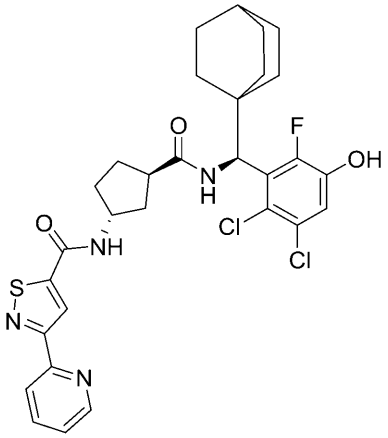
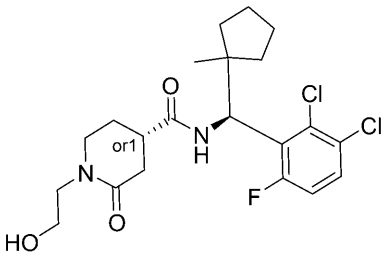
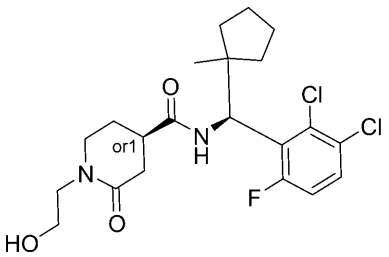
【表１－９４０】

I-2967		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)7.95 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.60-5.46 (m, 1H), 4.00 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.95 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.89-1.70 (m, 6H), 1.69-1.32 (m, 11H), 1.27 (dt, J = 13.7, 6.8 Hz, 1H), 1.15-1.04 (m, 1H), 0.76 (q, J = 8.7, 8.0 Hz, 3H).	459.1	B	B
I-2968			503.05	B	B
I-2969			518.1	B	A
I-2970			518.1	C	

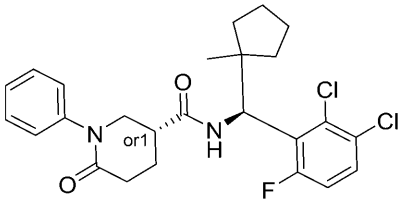
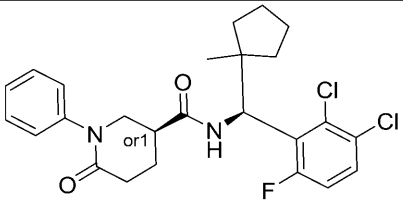
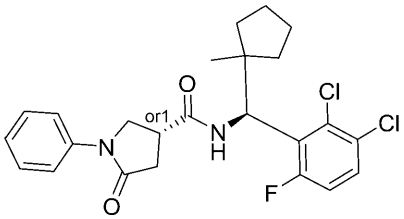
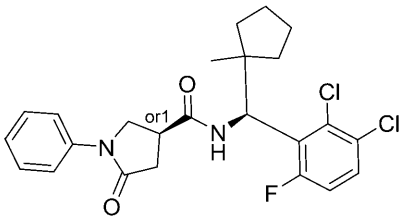
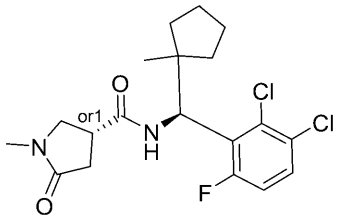
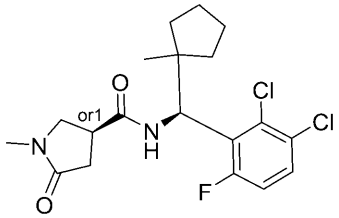
【表１－９４１】

I-2971			503	D	
I-2972		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.18 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.56 (t, J = 12.5 Hz, 2H), 2.86 (s, 3H), 2.78 - 2.63(t, J = 12.5 Hz, 2H)2.47 - 2.39 (m, 1H), 1.96 - 1.65 (dd, J = 22.5, 11.5 Hz, 8H), 1.64 (s, 1H), 1.57 - 1.39 (m, 5H).	511.1	B	B
I-2973		.1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.30 (s, 1H), 9.57 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 9.25 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.80 (dt, J = 4.9, 2.8 Hz, 2H), 8.43 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.05 (td, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.59 (ddd, J = 7.5, 4.7, 1.2 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 8.3, 2.3 Hz, 1H), 5.28 - 5.07 (m, 1H), 4.37 (h, J = 7.1 Hz, 1H), 3.07 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.00 - 1.81 (m, 4H), 1.67 (dq, J = 11.8, 7.9 Hz, 1H), 1.58 - 1.39 (m, 14H).	612.15	C	

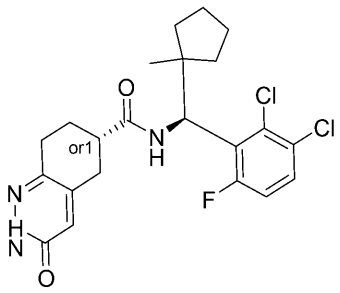
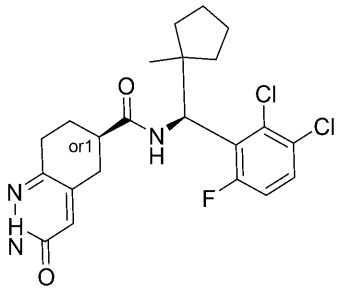
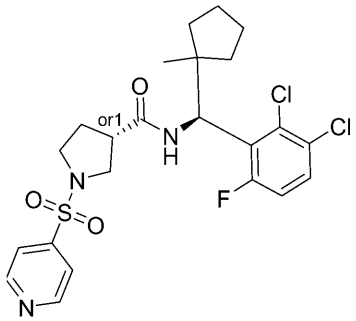
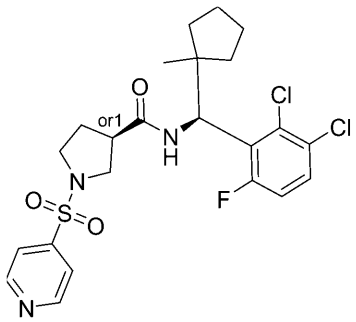
【表１－９４２】

I-2974		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.87 (s, 1H), 8.09 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.00 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.84 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.16 (s, 3H), 1.90 - 1.72 (m, 5H), 1.72 - 1.44 (m, 12H), 1.37 (dq, J = 14.5, 7.7 Hz, 1H).	469.2	D	
I-2975		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.48 (s, 1H), 8.88 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.70 (dt, J = 4.9, 1.3 Hz, 1H), 8.25 - 8.14 (m, 1H), 8.06 - 7.88 (m, 2H), 7.51 (ddd, J = 7.6, 4.8, 1.2 Hz, 1H), 7.13 - 7.04 (m, 1H), 5.29 - 5.07 (m, 1H), 4.25 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.95 (ddd, J = 12.4, 9.4, 5.7 Hz, 2H), 1.86 (ddt, J = 13.4, 8.3, 4.9 Hz, 2H), 1.66- 1.56 (m, 2H), 1.49 (h, J = 10.8, 9.8 Hz, 13H).	617.1	B	B
I-2976				E	
I-2977				B	B

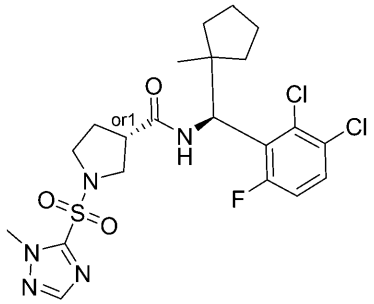
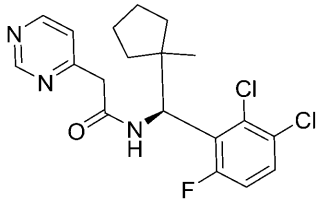
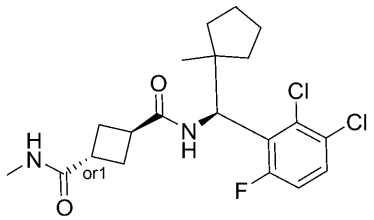
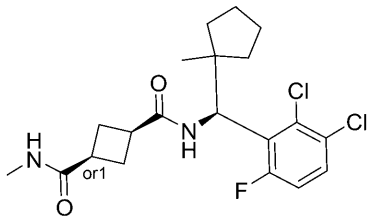
【表１－９４３】

I-2978				B	B
I-2979				D	
I-2980				B	B
I-2981				B	B
I-2982				D	
I-2983				B	B

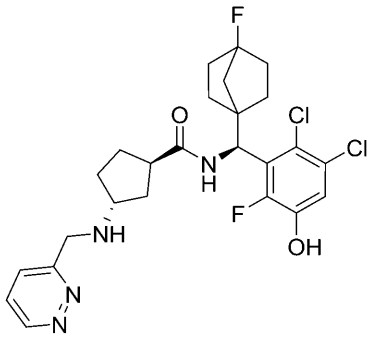
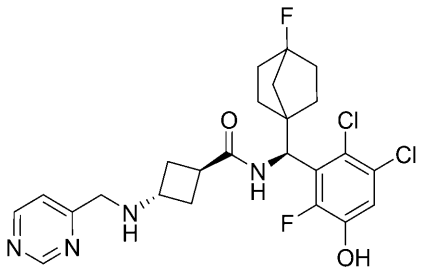
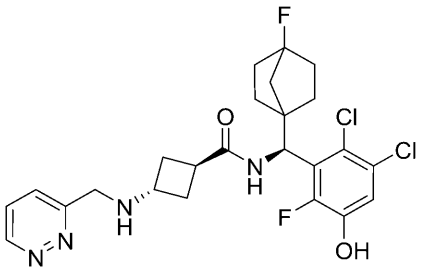
【表１－９４４】

I-2984					
I-2985				B	
I-2986			514.05	B	A
I-2987			514.05	C	

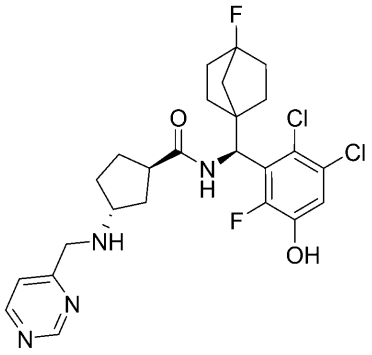
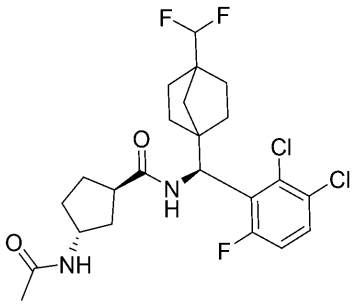
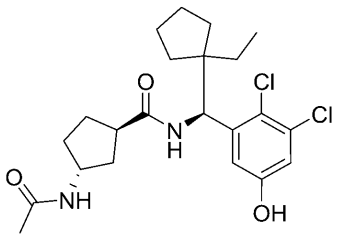
【表１－９４５】

I-2988			518	B	B
I-2989				D	
I-2990		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.97 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.60 (dt, J = 11.6, 5.7 Hz, 2H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.06 (p, J = 8.8 Hz, 1H), 2.81 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.53 (d, J = 4.6 Hz, 3H), 2.23 - 2.01 (m, 4H), 1.58 (d, J = 7.7 Hz, 6H), 1.43 - 1.20 (m, 2H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	415.1	B	A
I-2991		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 2H), 7.24 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.25 - 3.15 (m, 1H), 2.95 - 2.84 (m, 1H), 2.55 (d, J = 4.6 Hz, 3H), 2.18 (dtd, J = 17.7, 8.9, 3.8 Hz, 3H), 2.00 (dt, J = 11.6, 8.2 Hz, 1H), 1.59 (s, 6H), 1.31 (d, J = 40.9 Hz, 2H), 0.95 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	415	B	

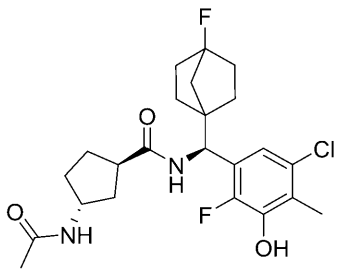
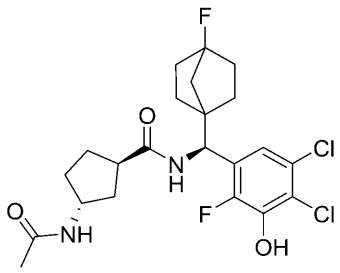
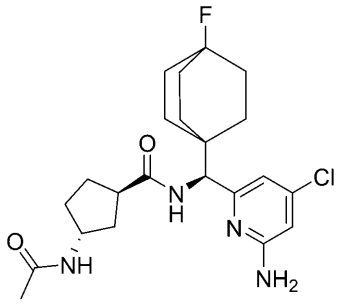
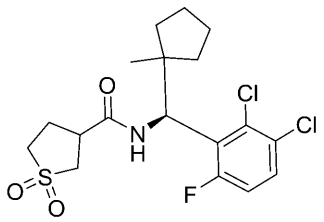
【表１－９４６】

I-2992		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.11 (dd, J = 4.8, 1.8 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 8.5, 1.8 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.5, 4.8 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.49 - 5.42 (m, 1H), 3.98 (s, 2H), 3.12 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 1.93 - 1.68 (m, 11H), 1.67 (dq, J = 7.9, 4.2, 3.7 Hz, 1H), 1.60 - 1.52 (m, 2H), 1.46 - 1.32 (m, 2H).	524.95	D	D
I-2993		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.09 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.53 (s, 1H), 6.30 (s, 1H), 5.48 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.79 (s, 2H), 3.39 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 3.08 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 2.25 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 1.93 (m, 3H), 1.81 - 1.59 (m, 6H), 1.52 (dd, J = 23.6, 10.2 Hz, 4H).	511.15	B	B
I-2994		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.11 (dd, J = 4.7, 1.9 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 8.5, 1.9 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.5, 4.7 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.53 (s, 1H), 6.29 (s, 1H), 5.51 - 5.33 (m, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.32 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 3.11 - 3.02 (m, 1H), 2.18 (dq, J = 7.8, 4.1, 3.2 Hz, 1H), 2.10 - 1.88 (m, 3H), 1.81 - 1.52 (dd, J = 22.7, 10.1 Hz, 10H).	511.15	B	B

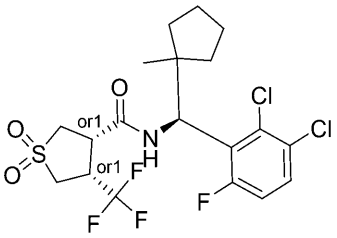
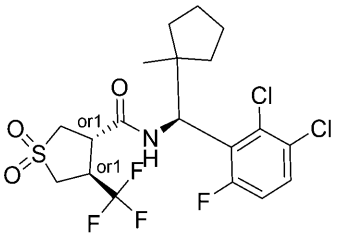
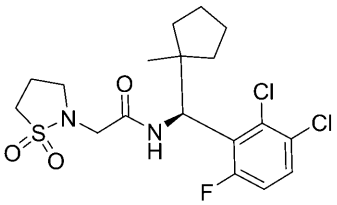
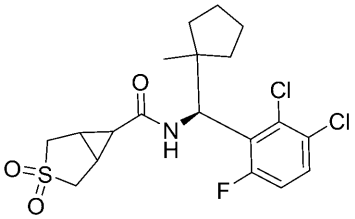
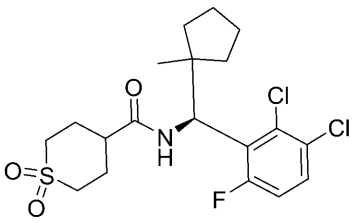
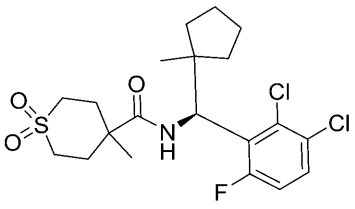
【表１－９４７】

I-2995		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.09 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.23 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 5.2, 1.4 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.46 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.13 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.88 (d, J = 12.8 Hz, 1H), 1.79 (ddt, J = 14.2, 10.1, 4.9 Hz, 9H), 1.67 - 1.52 (td, J = 13.2, 12.4, 8.4 Hz, 6H).	525	C	C
I-2996		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 6.10 (t, J = 56.7 Hz, 1H), 5.74 - 5.40 (m, 1H), 3.99 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.95 - 1.58 (m, 10H), 1.55 - 1.10 (m, 9H).	491.2	D	
I-2997		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.90 (s, 1H), 8.01 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 6.90 (q, J = 2.8 Hz, 2H), 5.51 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.88 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.83 (ddd, J = 15.5, 7.7, 4.3 Hz, 2H), 1.77 (s, 3H), 1.80-1.71 (m, 1H), 1.65 (ddd, J = 17.1, 8.9, 4.6 Hz, 2H), 1.57-1.46 (m, 5H), 1.50-1.32 (m, 4H), 1.30-1.14 (m, 2H), 0.80 (t, J = 7.3 Hz, 3H).	441.15	B	B

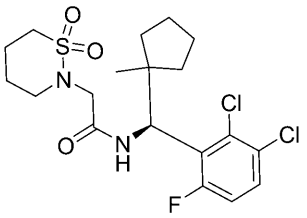
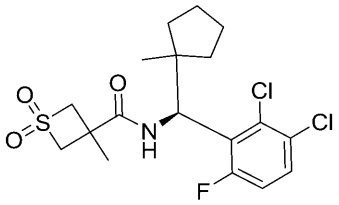
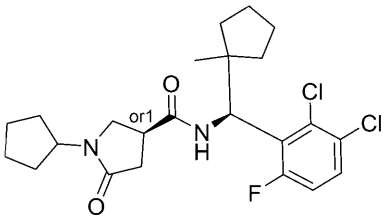
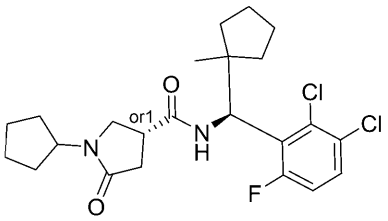
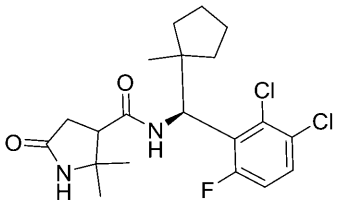
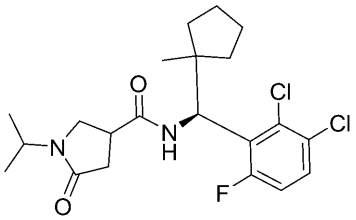
【表１－９４８】

I-2998		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.87 (s, 1H), 8.18 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.80 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.91 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 4.02 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.87 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.17 (s, 3H), 1.91 - 1.60 (m, 13H), 1.60 - 1.45 (m, 3H), 1.45 - 1.28 (m, 3H).	455.15	D	D
I-2999		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 6.97 (s, 1H), 5.26 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 2.86 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.86 (s, 3H), 1.90-1.68 (m, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.71-1.62 (m, 3H), 1.61-1.47 (m, 3H), 1.45-1.36 (m, 1H), 1.35 (s, 3H).	475.15	C	
I-3000		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.77 (dd, J = 8.3, 6.0 Hz, 2H), 6.52 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 6.34 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 6.16 (s, 2H), 4.52 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 4.02 (q, J = 6.5 Hz,1H), 2.88 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 1.92 -1.79 (m, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.71-1.61 (m, 7H), 1.61-1.51 (m, 7H), 1.38 (dt, J = 12.9, 7.0 Hz, 1H).	437.2	D	
I-3001				B	B

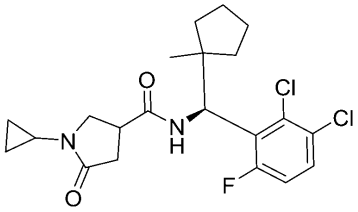
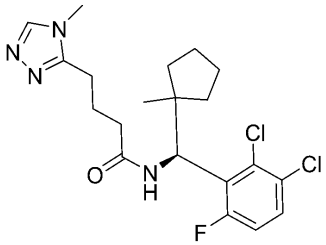
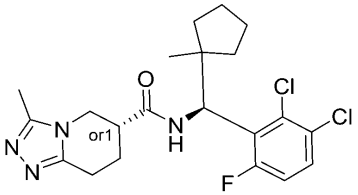
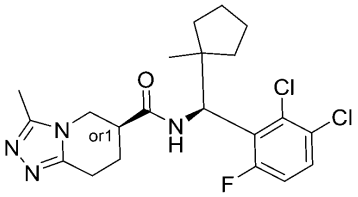
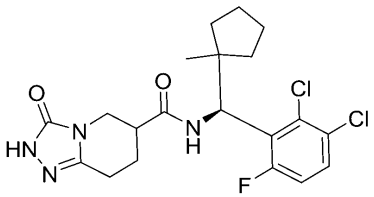
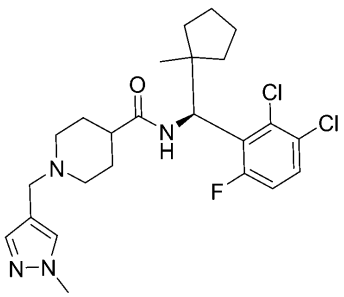
【表１－９４９】

I-3002				D	
I-3003				E	
I-3004				C	
I-3005				A	A
I-3006				B	
I-3007				D	

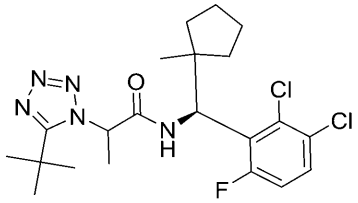
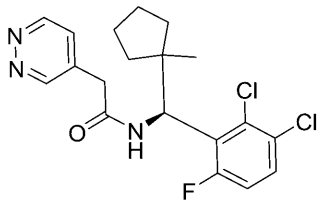
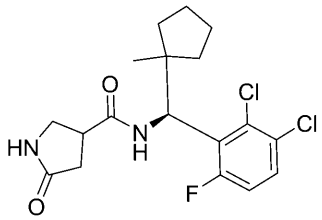
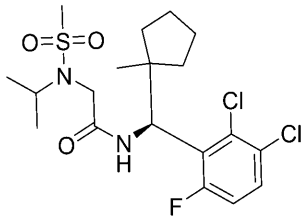
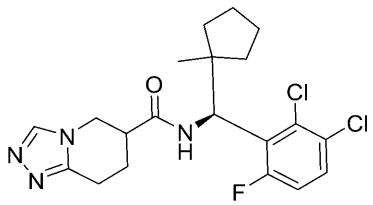
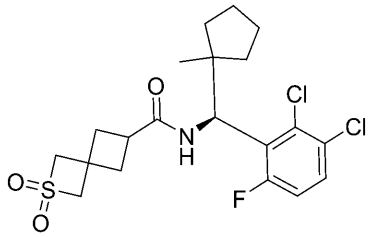
【表１－９５０】

I-3008				D	
I-3009				D	
I-3010				C	
I-3011				B	B
I-3012				D	
I-3013				B	B

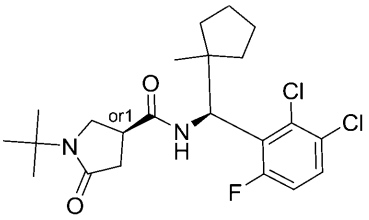
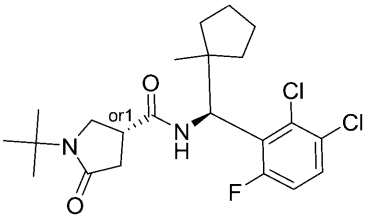
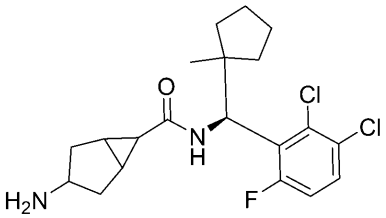
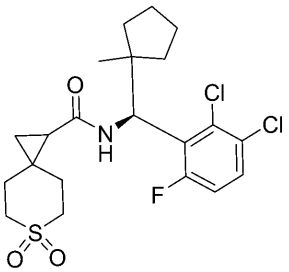
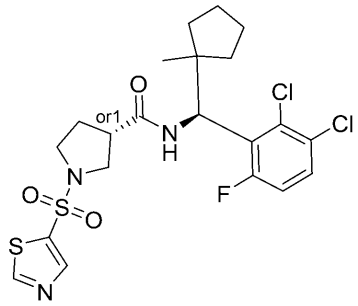
【表１－９５１】

I-3014				B	
I-3015				B	B
I-3016				D	
I-3017				B	
I-3018				C	
I-3019				C	

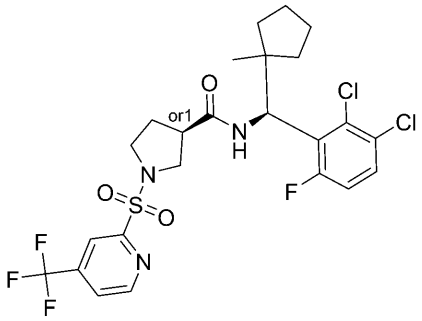
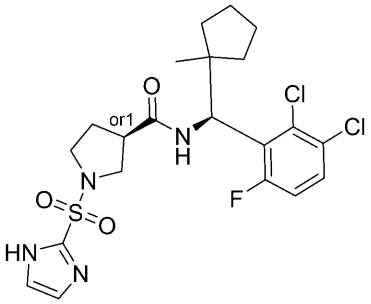
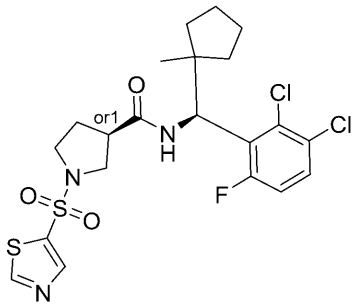
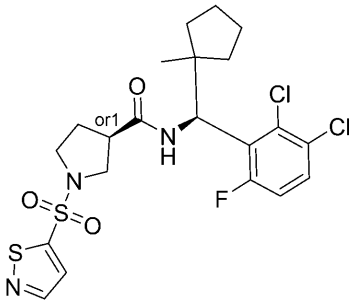
【表１－９５２】

I-3020				D	
I-3021				B	
I-3022				B	
I-3023				D	
I-3024				C	
I-3025				B	B

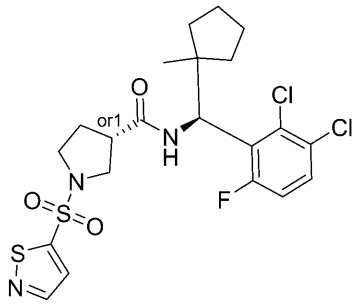
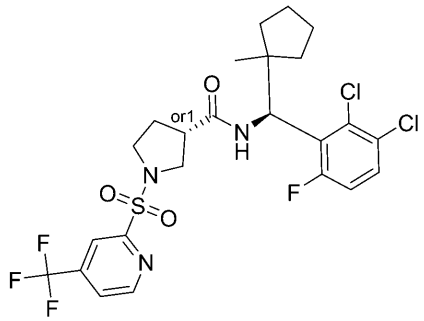
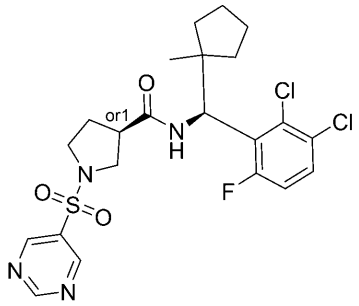
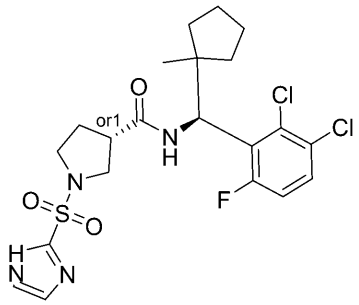
【表１－９５３】

I-3026				D	
I-3027				D	
I-3028				D	
I-3029				D	
I-3030			520	B	A

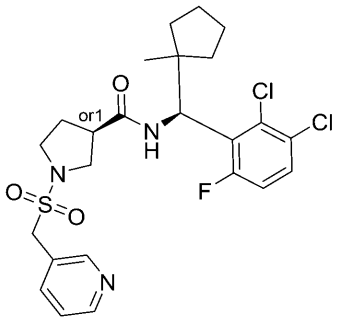
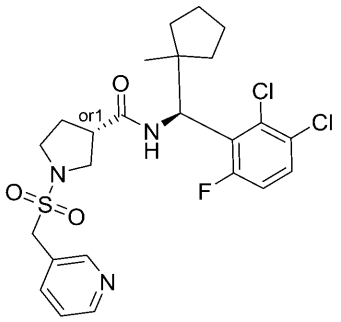
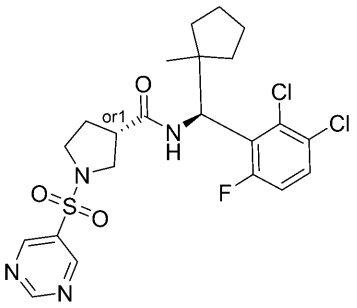
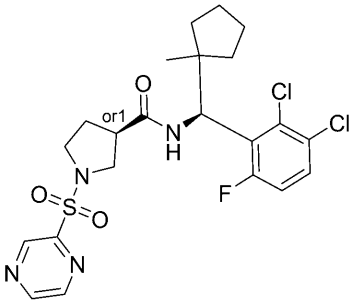
【表１－９５４】

I-3031			582.05	C	
I-3032			503.05	D	
I-3033			520	B	
I-3034			520	C	

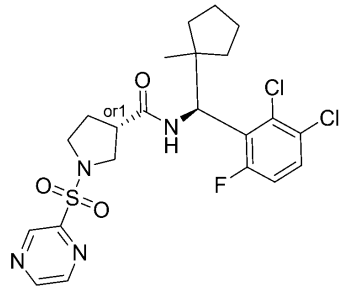
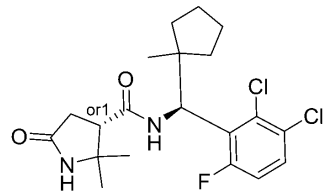
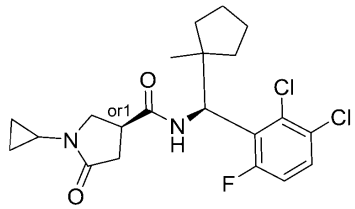
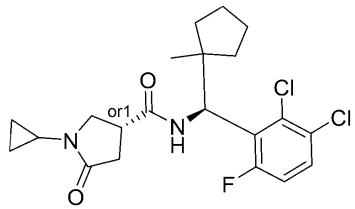
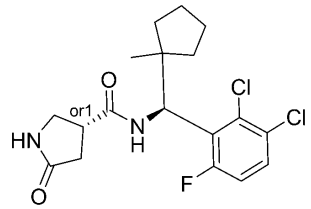
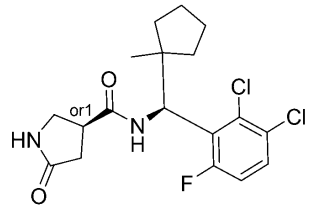
【表１－９５５】

I-3035			520	B	A
I-3036			582.05	D	
I-3037			515.05	A	A
I-3038			503.05	B	A

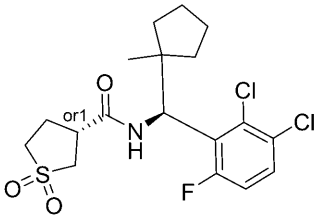
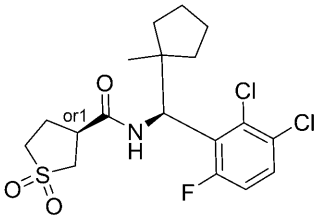
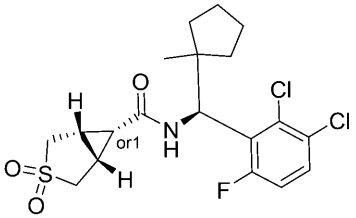
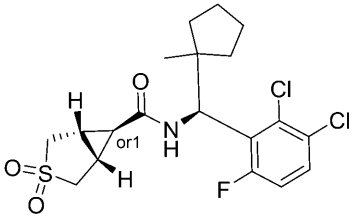
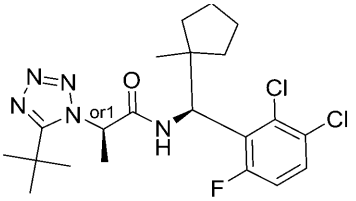
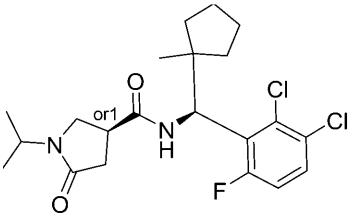
【表１－９５６】

I-3039			528.1	B	
I-3040			528.1	B	A
I-3041			515.05	C	
I-3042			515.05	B	A

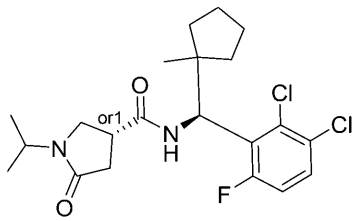
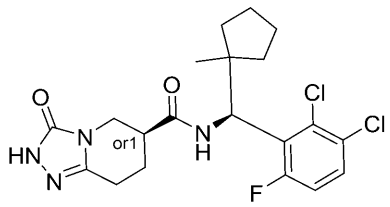
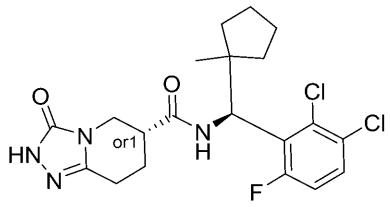
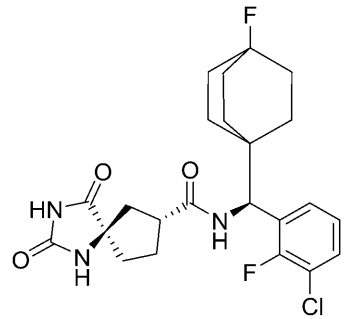
【表１－９５７】

I-3043			515.05	C	
I-3044				D	
I-3045				B	
I-3046				C	
I-3047				D	
I-3048				B	

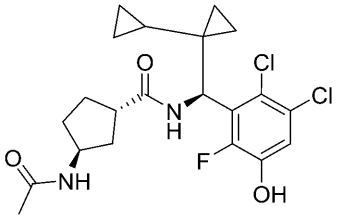
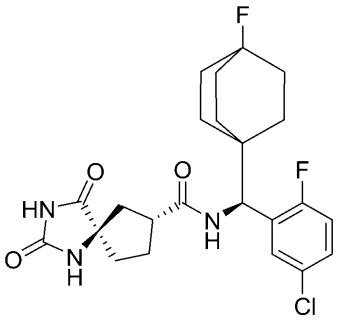
【表１－９５８】

I-3049				C	
I-3050				A	A
I-3051				A	A
I-3052				D	
I-3053				D	
I-3054				B	A

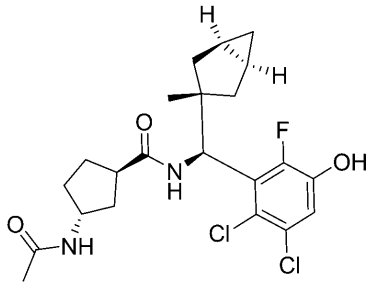
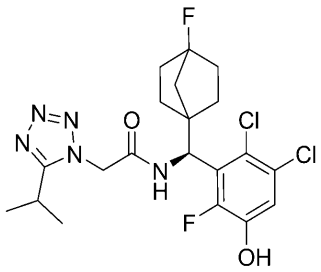
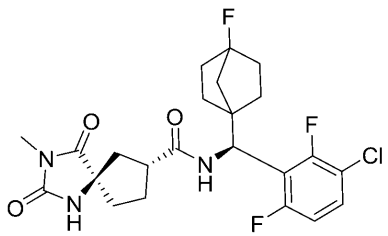
【表１－９５９】

I-3055				D	
I-3056				B	
I-3057				D	
I-3058		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.65 (s, 1H), 8.34 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.52 - 7.43 (m, 1H), 7.35 - 7.26 (m, 1H), 7.21 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.02 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.97 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 2.11 (dd, J = 13.1, 10.2 Hz, 1H), 2.03 - 1.81 (m, 3H), 1.71 - 1.54 (m, 14H).	466.2	B	B

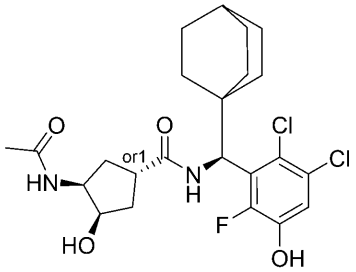
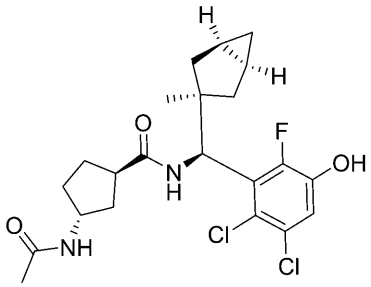
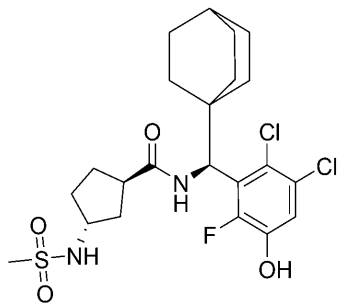
【表１－９６０】

I-3059		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.18 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.62 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.00 (dt, J = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 2.93 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.96-1.80 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.75-1.69 (m, 1H), 1.67-1.49 (m, 2H), 1.44-1.31 (m, 1H), 1.26-1.12 (m, 1H), 0.40 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 0.29-0.12 (m, 5H), 0.05 C -0.08 (m, 1H) ,-0.11 (dq, J = 9.9, 5.1, 4.7 Hz, 1H).	443.1	B	B
I-3060		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.65 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.26 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 6.3, 2.7 Hz, 1H), 7.37 (ddd, J = 8.9, 4.4, 2.7 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.04 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 2.96 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 2.10 (dd, J = 13.1, 10.4 Hz, 1H), 1.97 (tt, J = 11.8, 5.0 Hz, 2H), 1.92 - 1.82 (m, 1H), 1.67 (dh, J = 13.9, 7.3, 6.3 Hz, 8H), 1.55 (d, J = 9.3 Hz, 6H).	466.15	B	B

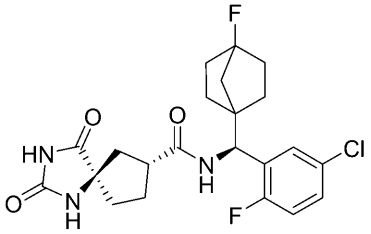
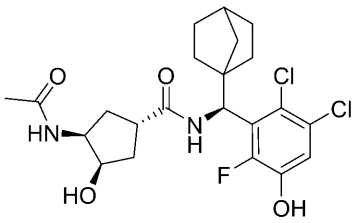
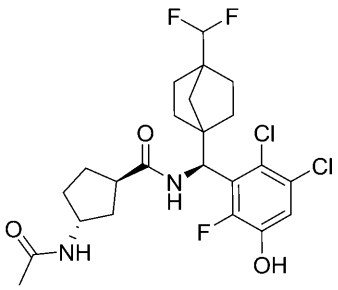
【表１－９６１】

I-3061		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.90 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.39 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.04 - 3.86 (m, 1H), 2.84 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 1.93 (dd, J = 12.9, 6.8 Hz, 1H), 1.73 (s, 6H), 1.58 (s, 1H), 1.51 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 1.32 (dt, J = 18.4, 12.8 Hz, 6H), 1.06 (s, 3H), 0.90 - 0.80 (m, 1H), 0.08 (d, J = 4.1 Hz, 1H).	457.25	B	A
I-3062		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.96 (s, 1H), 8.89 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.36 (d, J = 16.7 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 16.8 Hz, 1H), 3.12 (hept, J = 6.8 Hz, 1H), 1.91 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 1.80 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 1.75 - 1.70 (d, J = 12.6 Hz, 1H), 1.64 (s, 5H), 1.67 - 1.56 (m, 1H), 1.52 (q, J = 12.8, 10.6 Hz, 1H), 1.24 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.8 Hz, 3H).	474.25	B	A
I-3063		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.61 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.3 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.11 - 2.95 (m, 1H), 2.82 (d, J = 4.5 Hz, 3H), 2.22 - 1.88 (m, 4H), 1.88 - 1.53 (m, 10H), 1.46 (d, J = 10.0 Hz, 2H).	484.2	B	A

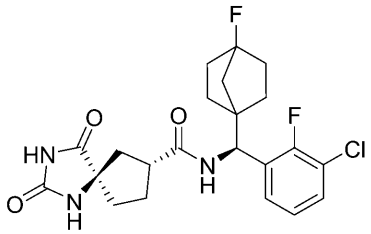
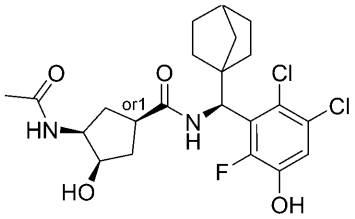
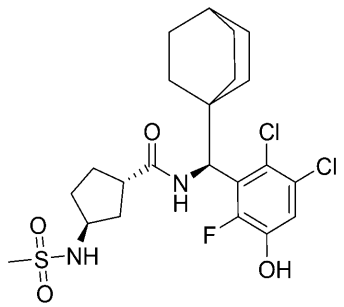
【表１－９６２】

I-3064		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.94 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.18 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.76 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.95 (s, 1H), 3.88 (dd, J = 10.9, 7.4 Hz, 1H), 3.13 - 3.08 (m, 1H), 1.79 (s, 6H), 1.69 - 1.55 (m, 4H), 1.53 - 1.32 (m, 15H), 1.25 (d, J = 8.6 Hz, 2H).	487.15	B	B
I-3065		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.87 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.37 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.07 - 3.85 (m, 1H), 2.93 (q, J = 12.3, 9.9 Hz, 1H), 2.07 (s, 1H), 1.77 (s, 5H), 1.62 (dt, J = 13.6, 7.5 Hz, 2H), 1.55 - 1.41 (m, 2H), 1.35 (dd, J = 19.9, 8.7 Hz, 5H), 1.06 (s, 3H), 0.88 - 0.70 (m, 1H), 0.14 - 0.04 (m, 1H).	457.2	B	A
I-3066		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.47 (s, 1H), 7.92 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 3.57 (s, 1H), 2.98 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.88 (s, 3H), 1.93 (d, J = 6.4 Hz, 3H), 1.85 - 1.80 (m, 1H), 1.71 - 1.27 (m, 15H).	506.9	B	A

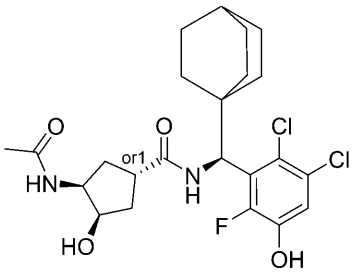
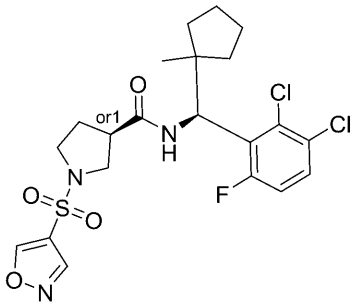
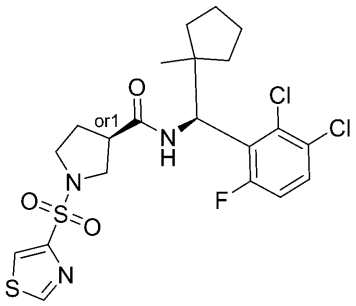
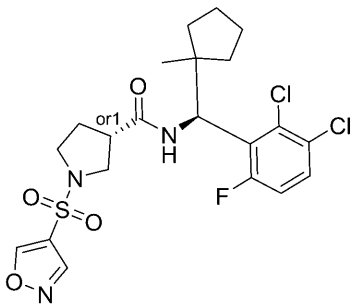
【表１－９６３】

I-3067		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.59 (s, 1H), 8.34 (t, J = 4.6 Hz, 2H), 7.49 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.24 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.31 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 2.98 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.15 - 2.10 (m, 1H), 2.09 - 1.99 (m, 3H), 1.93 (d, J = 11.0 Hz, 8H), 1.81 - 1.61 (m, 1H), 1.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 1.50 (d, J = 9.1 Hz, 2H).	452	A	A
I-3068		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.49 (s, 1H), 8.07 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.59 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.76 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.93 (s, 2H), 3.13-3.05 (m, 1H), 2.13 (s, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.73-1.57 (m, 5H), 1.52 (d, J = 17.8 Hz, 2H), 1.32 (d, J = 10.4 Hz, 2H), 1.21 (dd, J = 24.5, 9.1 Hz, 5H).	473.1	B	A
I-3069		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.87 (s, 1H), 8.12 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.11 (t, J = 56.8 Hz, 1H), 5.61 - 5.43 (m, 1H), 4.00 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.92 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.90 - 1.72 (m, 6H), 1.72 - 1.57 (m, 4H), 1.57 - 1.33 (m, 8H), 1.30 - 1.21 (m, 1H).	507.05	C	

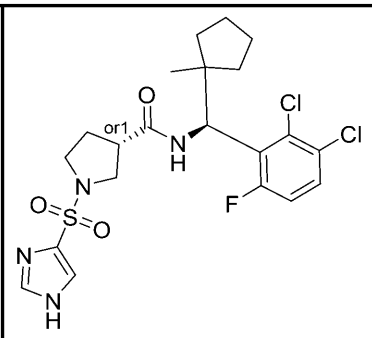
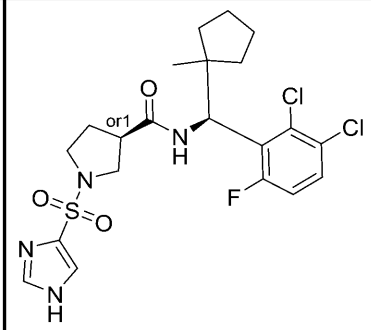
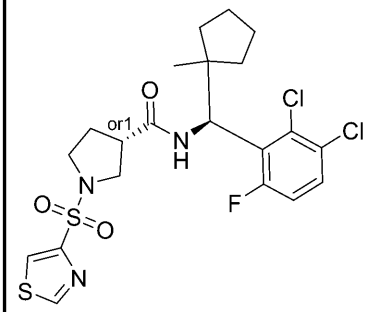
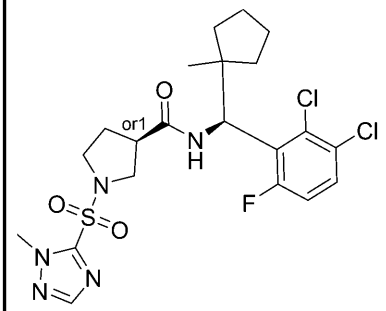
【表１－９６４】

I-3070		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.65 (s, 1H), 8.42 - 8.33 (m, 2H), 7.53 - 7.44 (m, 1H), 7.37 - 7.28 (m, 1H), 7.23 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.99 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.13 (dd, J = 13.1, 10.2 Hz, 1H), 2.04 - 1.85 (m, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.75 - 1.62 (m, 5H), 1.65 - 1.52 (m, 2H), 1.34 (s, 2H).	452.2	A	A
I-3071		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.50 (s, 1H), 8.06 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.56 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.76 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.96 (q, J = 3.5 Hz, 1H), 3.92-3.82 (m, 1H), 3.09 (dt, J = 13.1, 6.2 Hz, 1H), 2.12 (s, 1H), 1.82-1.66 (m, 5H), 1.69-1.56 (m, 1H), 1.51 (d, J = 16.6 Hz, 3H), 1.37-1.27 (m, 2H), 1.27-1.13 (m, 6H).	473.05	B	B
I-3072		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 7.93 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 3.66 (p, J = 6.6 Hz, 1H), 3.01 - 2.92 (m, 1H), 2.85 (s, 3H), 1.90 (qd, J = 9.9, 9.1, 4.9 Hz, 2H), 1.79 (dt, J = 13.3, 6.9 Hz, 1H), 1.59 - 1.38 (m, 16H).	507.05	B	A

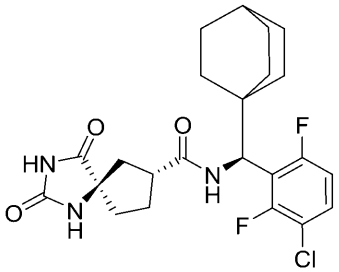
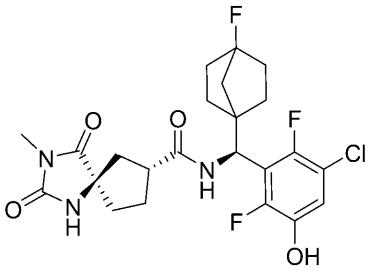
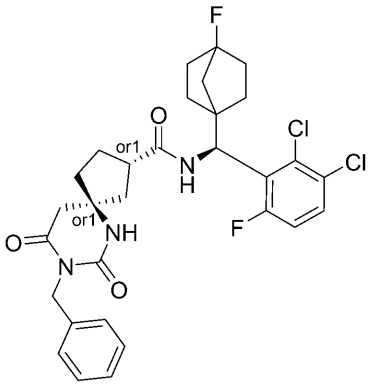
【表１－９６５】

I-3073		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.83 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.7, 3.6 Hz, 1H), 5.28 - 5.20 (m, 1H), 3.96 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 3.19 - 2.99 (m, 1H), 1.84 (d, J = 20.4 Hz, 6H), 1.74 - 1.62 (m, 2H), 1.45 (dd, J = 28.4, 12.5 Hz, 15H).	487.1	B	A
I-3074			504.05	B	
I-3075			520	B	
I-3076			504.05	B	D

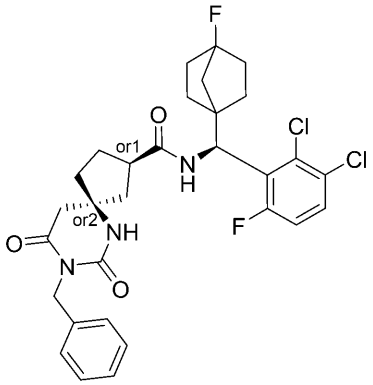
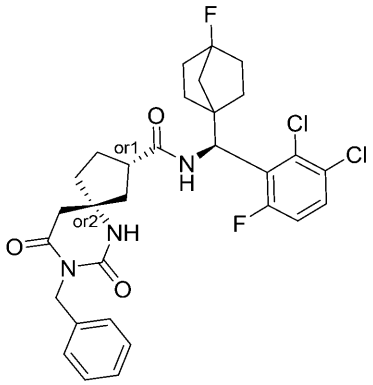
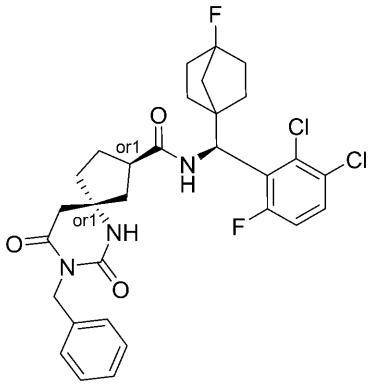
【表１－９６６】

I-3077			503.05	B	A
I-3078			503.1	C	
I-3079			520	A	A
I-3080			518.05	C	

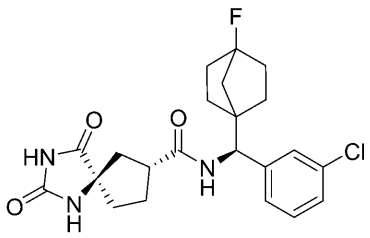
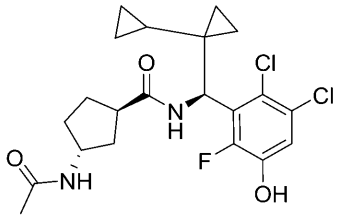
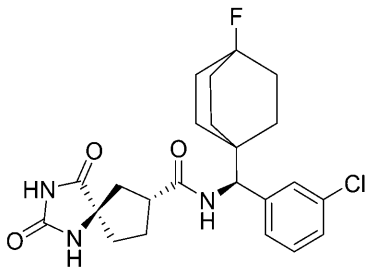
【表１－９６７】

I-3081		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.13 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.12 (s, 1H), 4.95 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.04 (t, J = 8.5 Hz, 1H), 2.09 (t, J = 11.6 Hz, 1H), 1.96 - 1.84 (m, 3H), 1.64 (q, J = 7.2, 6.6 Hz, 2H), 1.53 - 1.42 (s, 13H).	466.1	A	A
I-3082		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.09 (s, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.00 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.04 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.19 - 2.05 (m, 1H), 2.05 - 1.88 (m, 3H), 1.72 (ddd, J = 33.0, 21.1, 11.3 Hz, 9H), 1.57 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 10.7 Hz, 2H).	500.2	B	A
I-3083		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.30 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.63 (dd, J = 9.1, 5.1 Hz, 1H), 7.24 (ddd, J = 26.4, 11.0, 5.8 Hz, 6H), 5.54 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.01 (s, 1H), 2.78 (d, J = 15.5 Hz, 1H), 2.67 (d, J = 16.0 Hz, 1H), 1.96 (dd, J = 12.7, 8.3 Hz, 1H), 1.79 (s, 6H), 1.72 (dd, J = 12.2, 8.0 Hz, 4H), 1.60 (s, 5H).	590.05	B	

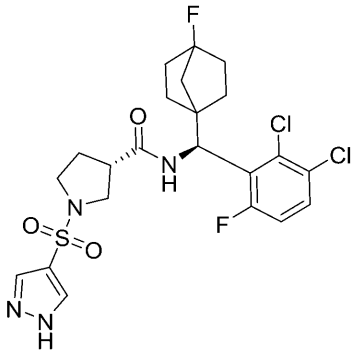
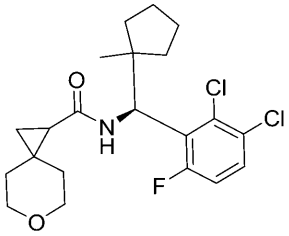
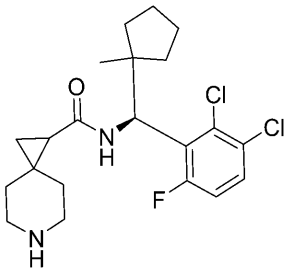
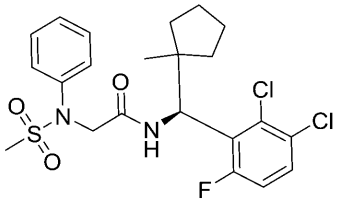
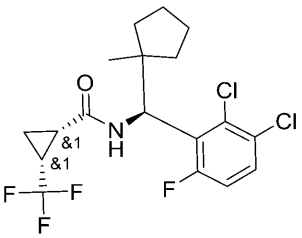
【表１－９６８】

I-3084		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.68-7.58 (m, 1H), 7.33-7.27 (m, 2H), 7.31-7.23 (m, 3H), 7.21 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.87-4.77 (m, 2H), 3.05 (s, 1H), 2.76-2.69 (m, 2H), 1.93 (dd, J = 13.1, 9.1 Hz, 1H), 1.83 (s, 3H), 1.81 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 1.71 (s, 5H), 1.70-1.62 (m, 2H), 1.61-1.55 (m, 3H), 1.16 (s, 1H).	590.15	C	
I-3085		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.31 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.64 (dd, J = 9.4, 5.0 Hz, 1H), 7.33-7.15 (m, 6H), 5.52 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.79 (s, 2H), 3.01 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 2.77 (d, J = 16.0 Hz, 1H), 2.65 (d, J = 16.4 Hz, 1H), 1.91 (s, 3H), 1.89-1.76 (m, 4H), 1.70 (d, J = 10.1 Hz, 4H), 1.65-1.51 (m, 5H).	590.05	B	B
I-3086		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.34-7.15 (m, 6H), 5.49 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.78 (s, 2H), 3.05 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.75-2.60 (m, 2H), 1.97 (dd, J = 12.4, 7.9 Hz, 1H), 1.90-1.76 (m, 4H), 1.71 (s, 5H), 1.69 (s, 1H), 1.67 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.67-1.49 (m, 3H), 1.16 (s, 1H).	590.1	D	

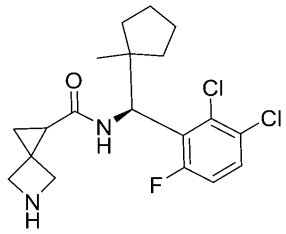
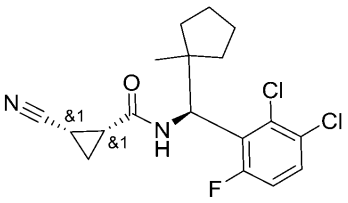
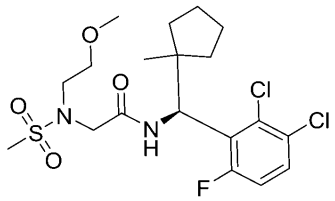
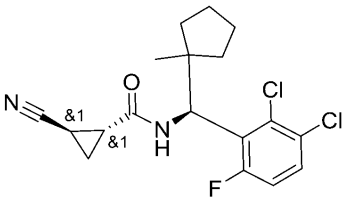
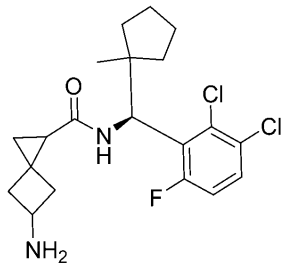
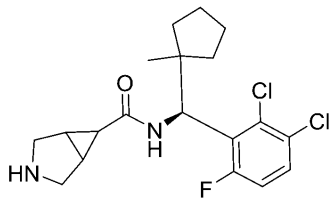
【表１－９６９】

I-3087		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.64 (s, 1H), 8.36 - 8.29 (m, 2H), 7.37 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.28 (m, 2H), 7.22 (dt, J = 7.4, 1.6 Hz, 1H), 5.00 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 3.03 - 2.95 (m, 1H), 2.13 (dd, J = 13.1, 10.4 Hz, 1H), 2.04 - 1.88 (m, 3H), 1.82 - 1.59 (m, 9H), 1.47 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.25 (d, J = 8.9 Hz, 2H).	434.05	B	B
I-3088		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.88 (s, 1H), 8.12 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.62 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 2.93 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.91-1.73 (m, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.62 (ddd, J = 13.5, 8.7, 5.4 Hz, 1H), 1.51 (dq, J = 12.5, 8.6, 7.8 Hz, 1H), 1.36 (dt, J = 13.0, 7.0 Hz, 1H), 1.26-1.12 (m, 1H), 0.40 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 0.21 (tt, J = 14.3, 7.2 Hz, 3H), 0.14 (s, 2H), -0.10 (s, 2H).	443.2	B	B
I-3089		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.65 (s, 1H), 8.34 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.42 - 7.28 (m, 3H), 7.19 (dt, J = 7.1, 1.7 Hz, 1H), 4.69 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.04 - 2.91 (m, 1H), 2.11 (dd, J = 13.0, 10.4 Hz, 1H), 2.03 - 1.79 (m, 3H), 1.74 - 1.43 (m, 14H).	448.1	B	

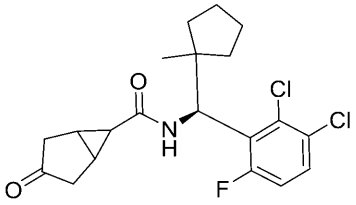
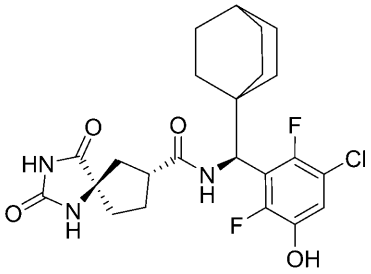
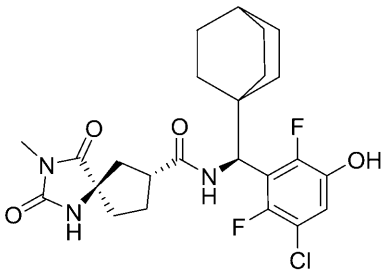
【表１－９７０】

I-3090		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 13.63 (s, 1H), 8.32 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.11 (s, 2H), 7.63 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dt, J = 9.8, 7.8 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 3.22 - 2.88 (m, 3H), 2.07 (s, 1H), 2.03 - 1.90 (m, 1H), 1.83 - 1.62 (q, J = 7.8, 5.9 Hz, 7H), 1.57 (d, J = 8.4 Hz, 4H).	533.15	A	A
I-3091				D	
I-3092				C	
I-3093				D	
I-3094				D	

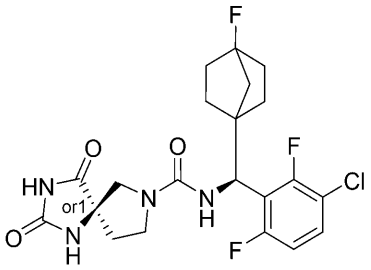
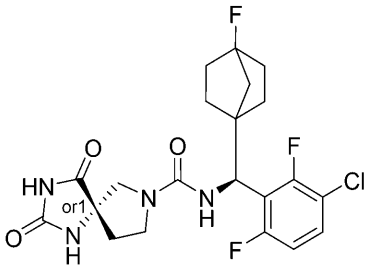
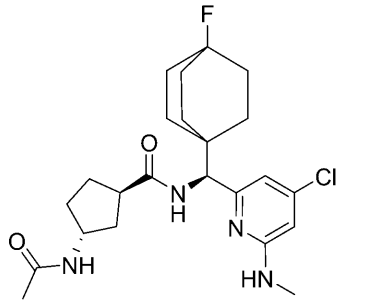
【表１－９７１】

I-3095				D	
I-3096				A	B
I-3097				D	
I-3098				C	
I-3099				B	B
I-3100				B	

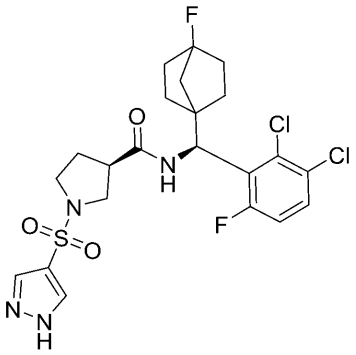
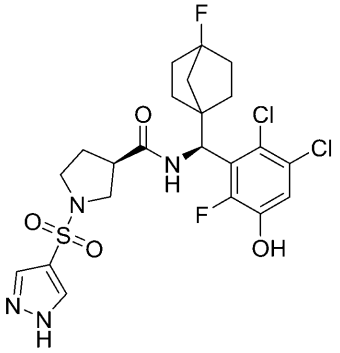
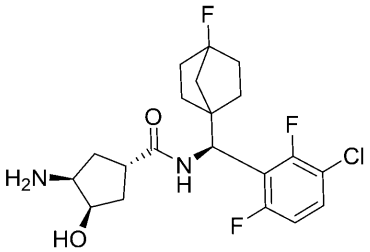
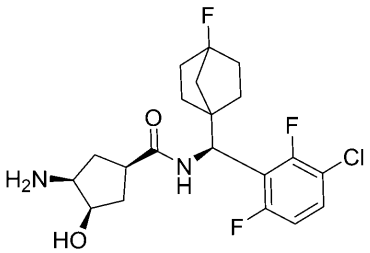
【表１－９７２】

I-3101				D	
I-3102		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.29 (s, 2H), 8.28 (s, 1H), 8.06 (s, 1H), 6.98 (dd, J = 8.6, 7.2 Hz, 1H), 4.94 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.14 - 1.81 (m, 4H), 1.65 (dq, J = 17.9, 6.1 Hz, 2H), 1.44 (dd, J = 31.5, 10.4 Hz, 13H).	482.15	A	A
I-3103		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.56 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 6.97 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 4.94 (d, J = 13.6 Hz, 1H), 3.05 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.16 - 2.05 (m, 1H), 2.04 - 1.81 (m, 3H), 1.77 - 1.58 (m, 2H), 1.44 (dd, J = 31.3, 10.6 Hz, 13H).	496.15	B	A

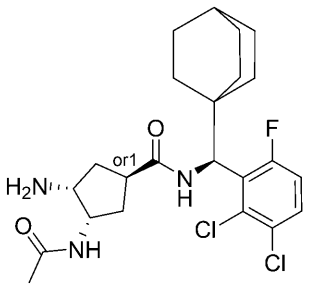
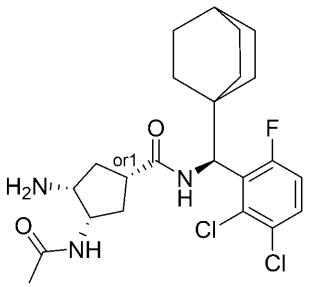
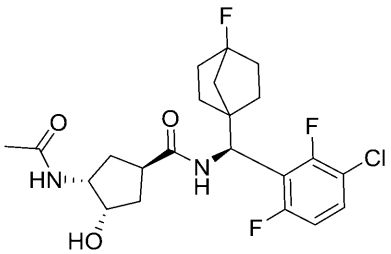
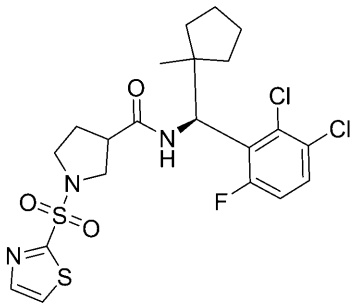
【表１－９７３】

I-3104		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.84 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 1H), 5.89 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.68 - 3.54 (m, 1H), 3.50 (s, 2H), 3.48 - 3.34 (m, 1H), 2.18 (dt, J = 12.7, 8.4 Hz, 1H), 1.97 (ddd, J = 12.2, 7.0, 4.2 Hz, 1H), 1.77 (ddt, J = 32.5, 28.0, 7.4 Hz, 7H), 1.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.46 (q, J = 11.4, 9.9 Hz, 2H).	471.2	D	
I-3105		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.84 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 1H), 5.89 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.68 - 3.54 (m, 1H), 3.50 (s, 2H), 3.48 - 3.34 (m, 1H), 2.18 (dt, J = 12.7, 8.4 Hz, 1H), 1.97 (ddd, J = 12.2, 7.0, 4.2 Hz, 1H), 1.77 (ddt, J = 32.5, 28.0, 7.4 Hz, 7H), 1.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.46 (q, J = 11.4, 9.9 Hz, 2H).	471.2	D	
I-3106		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.13 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 6.41 (dd, J = 27.1, 1.6 Hz, 2H), 6.13 (d, J = 29.8 Hz, 1H), 5.69 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.67 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.32 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 2.84 (m, 4H), 2.24 - 2.06 (m, 2H), 1.97 (m, 6H), 1.89 (ddd, J = 12.7, 8.5, 4.4 Hz, 6H), 1.64 (q, J = 7.2, 6.5 Hz, 6H), 1.48 (dtd, J = 13.6, 8.0, 5.6 Hz, 1H).	451.2	E	

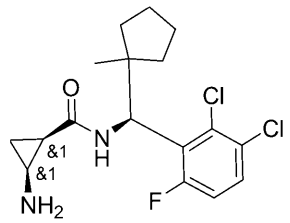
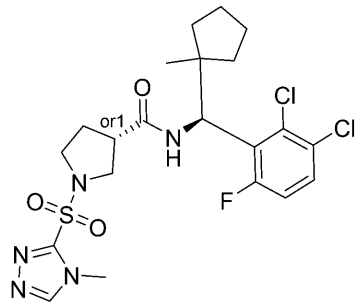
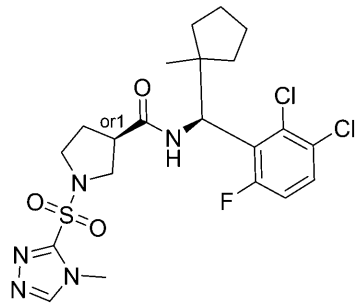
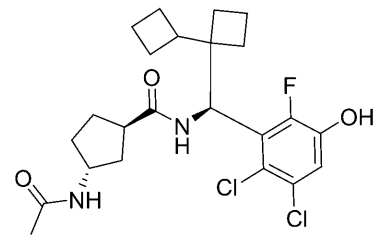
【表１－９７４】

I-3107		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 13.73 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dt, J = 10.6, 7.3 Hz, 1H), 5.45 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.15 (ddd, J = 9.8, 8.2, 4.5 Hz, 1H), 3.04 (ddt, J = 20.5, 13.3, 7.6 Hz, 4H), 1.91 - 1.67 (m, 8H), 1.67 -1.49 (t, J = 9.4 Hz, 4H).	533.1	B	B
I-3108		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.15 (s, 2H), 7.06 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.42 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.38 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 3.16 (ddd, J = 9.8, 8.2, 4.5 Hz, 1H), 3.11 - 3.03 (m, 1H), 3.02 (t, J = 4.9 Hz, 1H), 3.03 - 2.94 (m, 1H), 1.90 - 1.66 (m, 5H), 1.71 (s, 4H), 1.69 - 1.53 (m, 2H), 1.49 (d, J = 10.9 Hz, 1H)	549.15	B	B
I-3109		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.61-7.50 (m, 1H), 7.14 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.76 (s, 1H), 3.07 (d, J = 4.6 Hz,2H), 1.76 (dd, J = 21.4, 10.3 Hz, 7H), 1.68 (s, 2H), 1.62-1.50 (m, 3H), 1.44 (s, 2H).	417.1	C	
I-3110		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.79 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 3.04 (qd, J = 8.5, 7.5, 5.1 Hz, 2H), 1.82-1.67 (m, 9H), 1.63-1.53 (m, 2H), 1.53-1.39 (m, 3H).	417.1	B	C

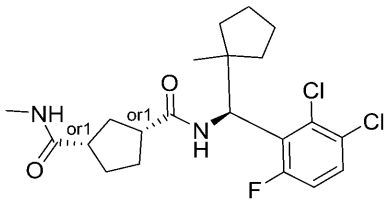
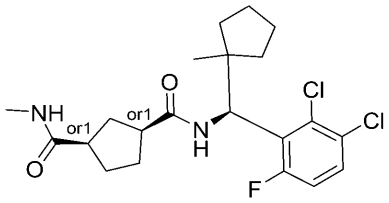
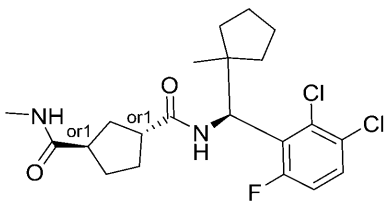
【表１－９７５】

I-3111		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.97 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.63-7.53 (m, 2H), 7.23 (dt, J = 10.7, 6.8 Hz, 1H), 5.22 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.87 (dd, J = 7.5, 5.2 Hz, 1H), 3.25 (dd, J = 12.7, 7.5 Hz, 1H), 3.07 (s, 1H), 2.53 (s, 3H), 1.82 (d, J = 5.8 Hz, 4H), 1.77-1.55 (m, 2H), 1.50 (d, J = 8.0 Hz, 9H), 1.47-1.36 (m, 4H).	470.15	B	B
I-3112		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)7.97 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.66-7.47 (m, 2H), 7.32-7.18 (m, 1H), 5.23 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.90 (dd, J = 7.6, 5.1 Hz, 1H), 3.29-2.99 (m, 2H), 1.81 (d, J = 13.8 Hz, 5H), 1.61-1.50 (m, 4H), 1.44 (d, J = 10.2 Hz, 12H).	470.15	B	B
I-3113		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.55 (ddd, J = 21.9, 11.0, 6.6 Hz, 2H), 7.20-7.09 (m, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.97 (p, J = 3.4 Hz, 1H), 3.88 (qd, J = 8.6, 3.7 Hz, 1H), 3.09 (dh, J = 8.3, 4.5 Hz, 1H), 2.01-1.56 (m, 15H), 1.46 (d, J = 8.2 Hz, 2H).	459.15	D	
I-3114				B	B

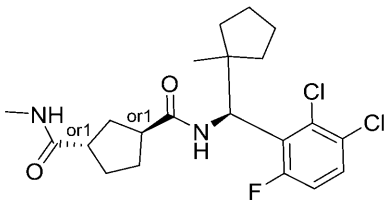
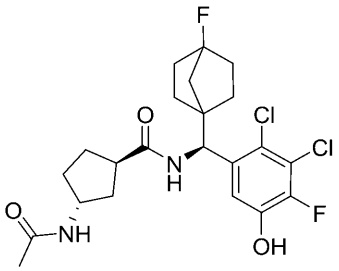
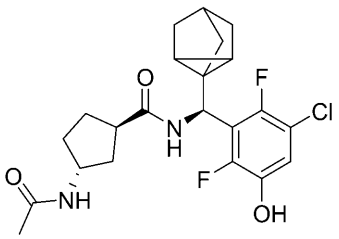
【表１－９７６】

I-3115				D	
I-3116			518.05	B	B
I-3117			518.05	C	
I-3118		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.06 (s, 1H), 7.92 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.31 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.96 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.06 (ddd, J = 12.1, 10.0, 7.2 Hz, 1H), 2.01 - 1.86 (m, 4H), 1.86 - 1.74 (m, 8H), 1.73 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 1.70 - 1.59 (m, 3H), 1.59 - 1.44 (m, 4H), 1.42 - 1.29 (m, 1H).	471.1	C	

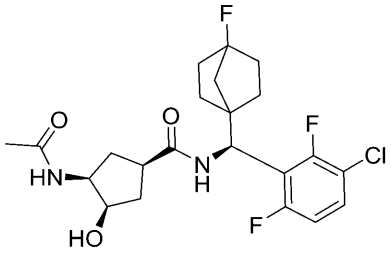
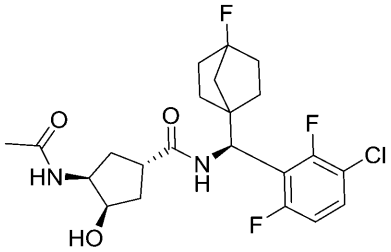
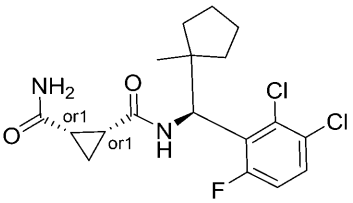
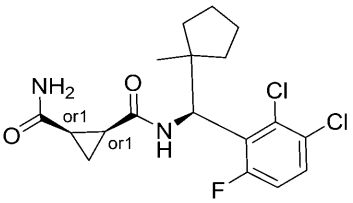
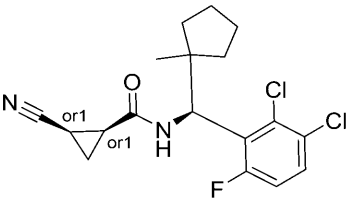
【表１－９７７】

I-3119		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.73 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.87 - 2.77 (m, 1H), 2.57 (d, J = 4.6 Hz, 4H), 1.96 (dt, J = 12.3, 7.5 Hz, 1H), 1.76 (dt, J = 12.5, 9.8 Hz, 1H), 1.69 (dd, J = 8.8, 4.2 Hz, 2H), 1.64 (dd, J = 14.4, 5.6 Hz, 2H), 1.59 (d, J = 3.9 Hz, 5H), 1.56 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 1.41 - 1.33 (m, 1H), 1.26 (q, J = 7.8, 7.3 Hz, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	429.15	B	B
I-3120		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.71 (q, J = 4.5 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 2.82 (dq, J = 16.0, 8.4, 7.8 Hz, 1H), 2.54 (d, J = 4.6 Hz, 4H), 1.86 (dt, J = 12.3, 7.6 Hz, 1H), 1.72 (dtd, J = 11.0, 6.9, 3.2 Hz, 4H), 1.70 - 1.46 (m, 7H), 1.38 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 1.31 - 1.21 (m, 1H), 0.97 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	429.15	B	B
I-3121		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.71 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 8.9 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.02 - 2.90 (m, 1H), 2.69 - 2.59 (m, 1H), 2.55 (d, J = 4.5 Hz, 3H), 1.91 - 1.68 (m, 4H), 1.65 - 1.51 (m, 7H), 1.49 - 1.33 (m, 2H), 1.30 - 1.21 (m, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	429.15	B	B

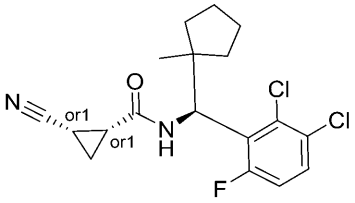
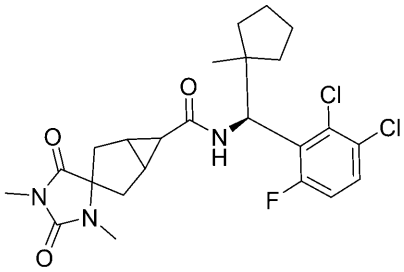
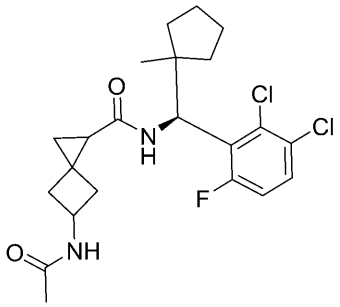
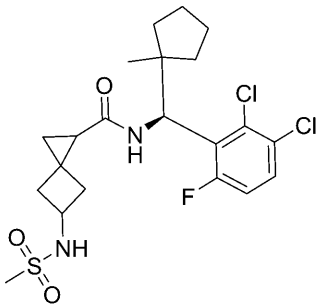
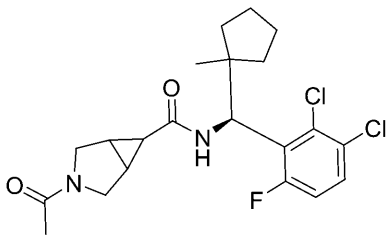
【表１－９７８】

I-3122		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.11 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.68 (q, J = 4.4 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 2.97 (q, J = 7.8 Hz, 1H), 2.59 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 2.53 (d, J = 4.6 Hz, 3H), 1.93 - 1.70 (m, 3H), 1.68 - 1.46 (m, 9H), 1.37 (s, 1H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	429.15	B	
I-3123		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (s, 1H), 7.90 - 7.83 (m, 1H), 6.42 - 6.34 (m, 1H), 5.33 (dd, J = 9.3, 1.4 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.7 Hz, 1H), 2.90 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 1.89 - 1.70 (m, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.67 (s, 6H), 1.68 - 1.56 (m, 2H), 1.58 - 1.50 (m, 2H), 1.53 - 1.32 (m, 3H).	475.25	B	A
I-3124		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 4.00 (dt, J = 12.9, 6.5 Hz, 1H), 2.90 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 1.95 (s, 1H), 1.86 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 1.85 - 1.74 (m, 3H), 1.59 (ddd, J = 13.5, 8.7, 5.3 Hz, 1H), 1.48 - 1.31 (m, 5H), 1.18 (ddd, J = 23.5, 14.8, 7.8 Hz, 4H), 1.10 - 1.03 (m, 2H).	439.15	B	A

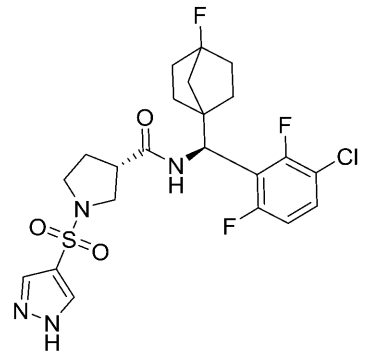
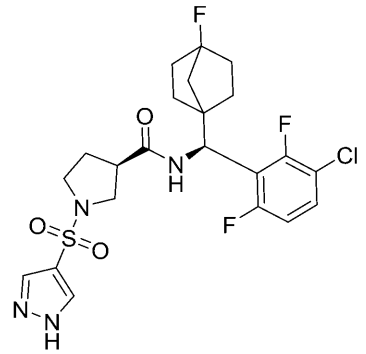
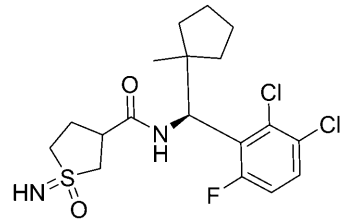
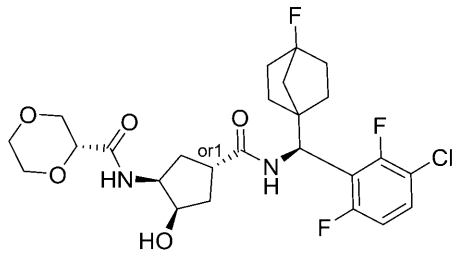
【表１－９７９】

I-3125		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.19-7.10 (m, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.96 (p, J = 3.4 Hz, 1H), 3.95-3.81 (m, 1H), 3.08 (dt, J = 13.3, 6.6 Hz, 1H), 1.79 (s, 3H), 1.84-1.66 (m, 10H), 1.66-1.55 (m, 2H), 1.45 (d, J = 9.5 Hz, 2H).	459.15	B	B
I-3126		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.77 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 3.91 (q, J = 8.5, 7.1 Hz, 2H), 3.09 (dd, J = 9.8, 4.4 Hz, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.89-1.67 (m, 10H), 1.62 (dd, J = 15.7, 6.6 Hz, 2H), 1.45 (d, J = 9.5 Hz, 2H).	459.1	B	A
I-3127				C	
I-3128				D	
I-3129				B	B

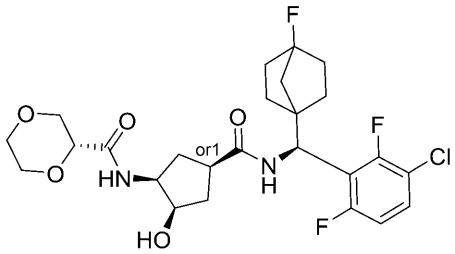
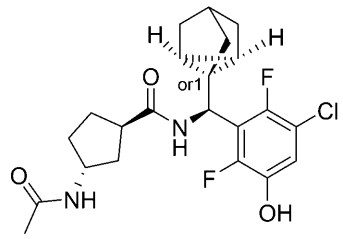
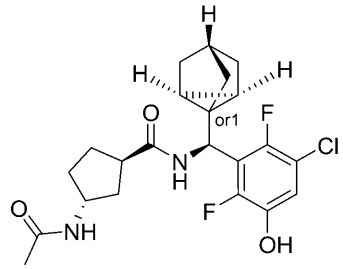
【表１－９８０】

I-3130				B	B
I-3131				B	B
I-3132				C	
I-3133				D	
I-3134				D	

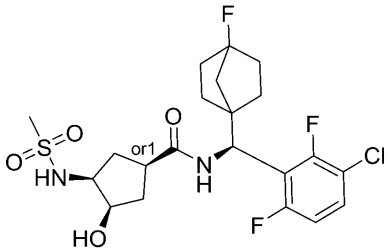
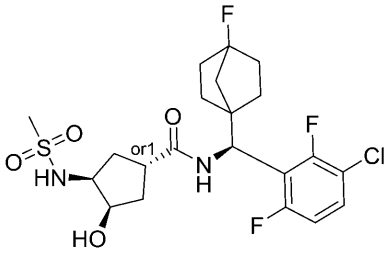
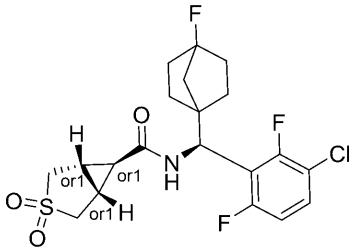
【表１－９８１】

I-3135			517.05	A	A
I-3136			517.1	C	
I-3137				B	
I-3138		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.31 - 6.96 (m, 2H), 5.22 (dd, J = 34.1, 5.9 Hz, 2H), 4.13 - 3.76 (m, 5H), 3.65 (t, J = 11.2 Hz, 2H), 3.53 - 3.42 (m, 1H),3.41 - 3.35 (m, 1H), 3.19 - 3.02 (m, 1H), 1.92 (s, 1H), 1.86 - 1.54 (m,11H), 1.54 - 1.37 (m, 2H).	531.35	B	B

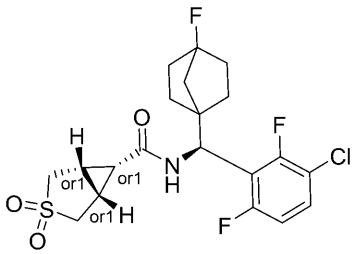
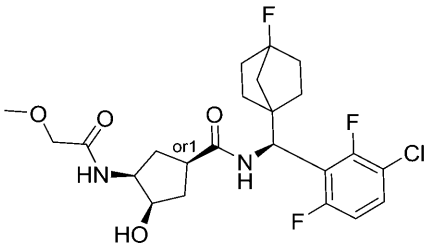
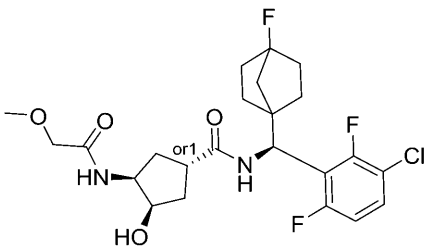
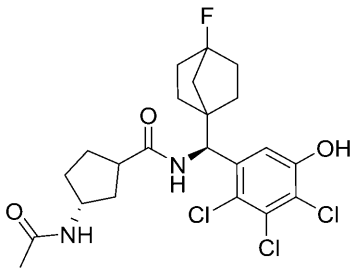
【表１－９８２】

I-3139		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.31 - 6.96 (m, 2H), 5.22 (dd, J = 34.1, 5.9 Hz, 2H), 4.13 - 3.76 (m, 5H), 3.65 (t, J = 11.2 Hz, 2H), 3.53 - 3.42 (m, 1H),3.41 - 3.35 (m, 1H), 3.19 - 3.02 (m, 1H), ; 1.86 - 1.75 (m,5H), 1.75 - 1.67 (m,5H),1.67 - 1.55 (m, 2H),1.52 - 1.35 (m, 2H).	531.3	B	B
I-3140		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.22 (s, 1H), 8.20 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.6, 7.2 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 3.98 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.96 - 2.83 (m, 1H), 1.96 (s, 1H), 1.86 (qd, J = 7.9, 3.6 Hz, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.74 - 1.51 (m, 3H), 1.37 (dd, J = 17.0, 8.5 Hz, 3H), 1.27 - 1.10 (m, 4H), 1.10 - 1.02 (m, 2H).	439.15	E	
I-3141		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.18 (s, 1H), 8.19 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.6, 7.2 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 4.00 (p, J = 6.4 Hz, 1H), 2.96 - 2.84 (m, 1H), 1.96 (s, 1H), 1.92 - 1.77 (m, 3H), 1.77 (s, 3H), 1.59 (ddd, J = 12.9, 8.8, 5.5 Hz, 1H), 1.53 - 1.39 (m, 1H), 1.35 (d, J = 10.0 Hz, 3H), 1.27 - 0.96 (m, 6H).	439.15	A	A

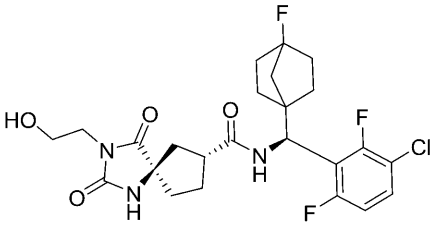
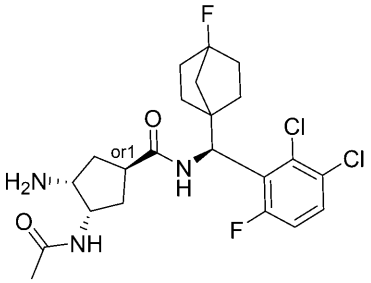
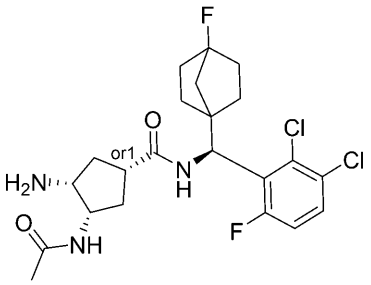
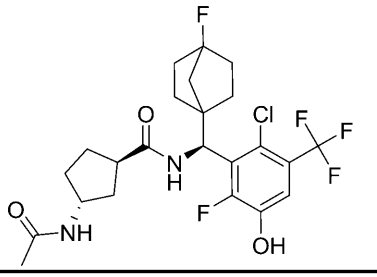
【表１－９８３】

I-3142		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.32 (td, J = 8.6, 5.6 Hz, 1H), 6.88 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 6.32 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.82 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.52 - 4.29 (m, 1H), 3.86 (dd, J = 8.2, 4.2 Hz, 1H), 2.98 (s, 4H), 2.39 (s, 2H), 2.20 (ddd, J = 13.1, 8.2, 4.7 Hz, 3H), 2.14 - 2.02 (m, 2H), 1.87 (dt, J = 13.7, 9.8 Hz,3H), 1.77 (t, J = 9.5 Hz, 2H), 1.64 (q, J = 9.0 Hz, 2H), 1.56 -1.38 (m, 1H).	495.15	B	B
I-3143		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.32 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 6.88 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.30 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 5.63 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.86 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.33 (s, 1H), 3.86 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 3.01 (d, J = 1.6 Hz, 4H), 2.30 (d, J = 13.0 Hz, 2H), 2.00 (d, J = 9.3 Hz, 3H), 1.94 - 1.82 (m, 3H), 1.77 (t, J = 10.4 Hz, 3H), 1.64 (q, J = 12.3, 10.7 Hz, 2H), 1.53 (s, 1H), 1.44 (s, 1H).	495.2	B	B
I-3144		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.75 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.21-7.09 (m, 1H), 5.30 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.53 (dddd, J = 23.1, 13.9, 6.7, 1.7 Hz, 2H), 3.02 (ddd, J = 14.0, 5.5, 2.1 Hz, 2H), 2.23 (t, J = 3.9 Hz, 1H), 1.97 (ddtd, J = 28.2, 8.9, 5.2, 4.4, 2.0 Hz, 2H), 1.88-1.65 (m, 7H), 1.62 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.44 (d, J = 12.7 Hz, 2H).	448.05	B	D

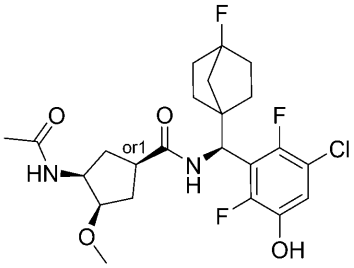
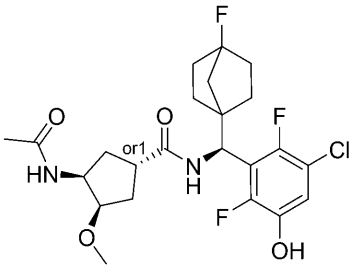
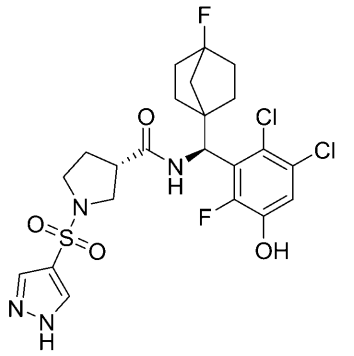
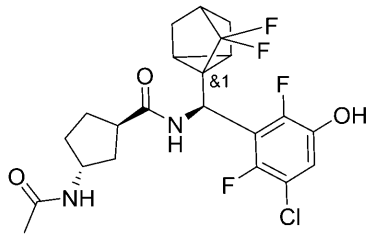
【表１－９８４】

I-3145		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.76 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.59 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 5.33 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.30-3.25 (m, 1H), 3.22-3.12 (m, 2H), 3.04 (dd, J = 13.4, 3.2 Hz, 1H), 2.27 (dd, J = 8.6, 7.1 Hz, 1H), 2.18 (qd, J = 8.2, 4.2 Hz, 2H), 1.76 (dd, J = 27.2, 10.5 Hz, 7H), 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.47 (s, 2H).	465.05	A	A
I-3146		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) |AE 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 4.03 - 3.89 (m, 2H), 3.78 (s, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.16 - 3.05 (m, 1H), 1.92 - 1.61 (m, 11H), 1.59 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 9.0 Hz, 2H).	489.15	C	
I-3147		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) |AE 8.24 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 2H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 4.03 - 3.95 (m, 2H), 3.80 (s, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.16 - 3.06 (m, 1H), 1.96 - 1.87 (m, 1H), 1.87 - 1.62 (m, 10H), 1.59 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 9.4 Hz, 2H).	489.15	B	B
I-3148		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.75 (s, 1H), 8.21 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 6.92 (s, 1H), 5.29 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 3.99 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 2.90 (s, 1H), 1.79 (d, J = 17.7 Hz, 9H), 1.66 (d, J = 17.9 Hz, 6H), 1.44 (d, J = 22.8 Hz, 4H).	491.15	B	A

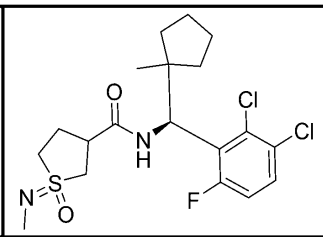
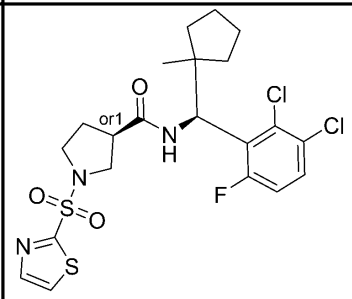
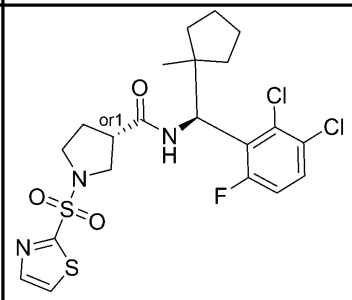
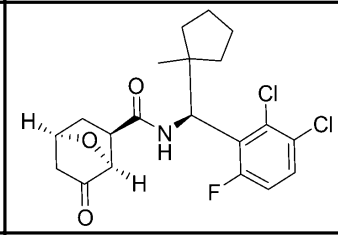
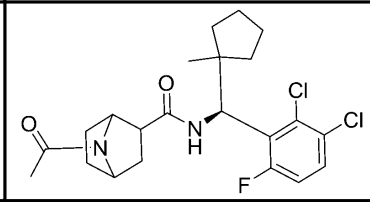
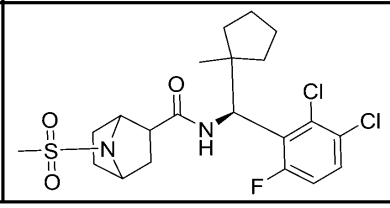
【表１－９８５】

I-3149		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.56 (s, 1H), 8.33 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.3 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.78 (s, 1H), 3.49 (t, J = 6.1 Hz, 2H), 3.41 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 3.05 (dt, J = 15.5, 7.5 Hz, 1H), 2.20 - 2.06 (m, 1H), 1.97 (tdd, J = 16.4, 8.7, 4.2 Hz, 3H), 1.88 - 1.53 (m, 10H), 1.47 (d, J = 9.7 Hz, 2H).	514.2	B	A
I-3150		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.2 Hz, 2H), 7.38 - 7.20 (m, 1H), 5.48 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.90 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 3.24 (s, 1H), 3.05 (s, 1H), 2.67 (p, J = 1.9 Hz, 7H), 2.46 - 2.30 (m, 5H), 1.88 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 1.76 - 1.53 (m, 4H), 1.24 (s, 1H).	474.05	C	
I-3151		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.09 - 3.93 (m, 1H), 3.31 (s, 1H), 3.07 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 3.05 (s, 2H), 2.67 (p, J = 1.9 Hz, 6H), 2.46 - 2.30 (m, 6H), 1.88 (d, J = 5.6 Hz, 4H), 1.24 (s, 1H).	474.05	A	B
I-3152		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 8.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.55 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.13 - 3.88 (m, 1H), 2.80 (d, J = 103.4 Hz, 1H) , 1.79 - 1.71 (m, 12H), 1.67 - 1.25 (m, 7H).	509.15	C	A

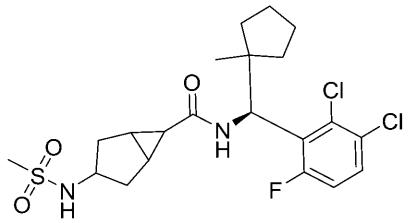
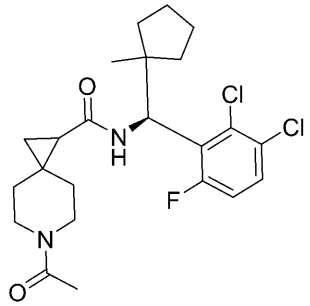
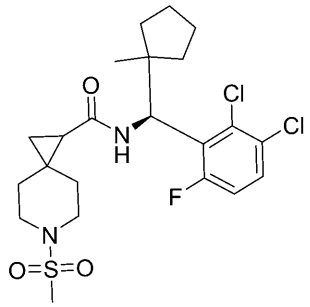
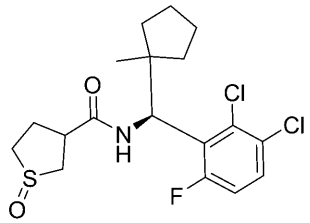
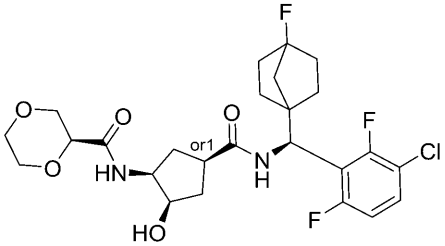
【表１－９８６】

I-3153		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.24 (s, 1H), 8.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 8.6, 7.3 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.12 - 4.01 (m, 1H), 3.60 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.21 (s, 3H), 3.00 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 1.93 (ddd, J = 12.1, 8.8, 2.7 Hz, 1H), 1.87 - 1.65 (m, 12H), 1.58 (t, J = 8.5 Hz, 2H), 1.45 (d, J = 10.0 Hz, 2H).	489.15	B	A
I-3154		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.23 (s, 1H), 8.15 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.17 - 3.84 (m, 1H), 3.63 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 3.23 (s, 3H), 3.12 - 2.87 (m, 1H), 2.03 (ddd, J = 13.6, 8.9, 2.7 Hz, 1H), 1.80 (s, 6H), 1.73 - 1.62 (m, 7H), 1.58 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.39 (dd, J = 41.4, 8.4 Hz, 2H).	489.25	B	B
I-3155		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.27 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.13 (s, 2H), 7.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.45 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 3.21 - 2.91 (m, 4H), 2.01 - 1.88 (m, 2H), 1.84 - 1.62 (m, 7H), 1.52 - 1.44 (m, 5H).	549.15	B	B
I-3156		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.63 (s,1H), 8.03 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.96 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 5.89 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 2.86 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.10 (d, J = 17.3 Hz, 1H), 1.95 - 1.72 (m, 8H), 1.71 - 1.56 (m, 3H), 1.56 - 1.29 (m, 4H).	475.15	C	

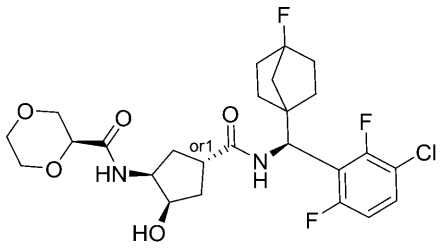
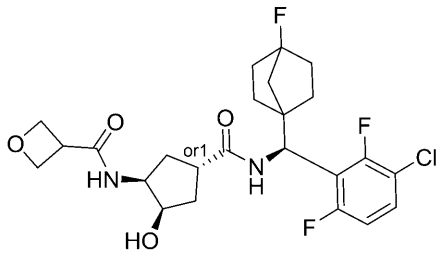
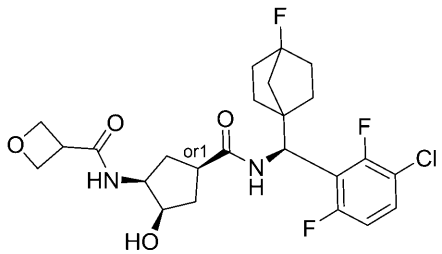
【表１－９８７】

I-3157				C	
I-3158				D	
I-3159				C	B
I-3160				D	
I-3161				D	
I-3162				D	

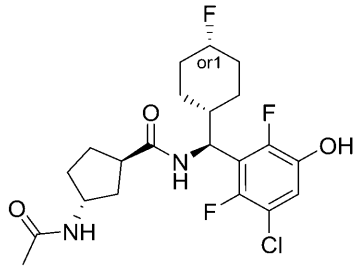
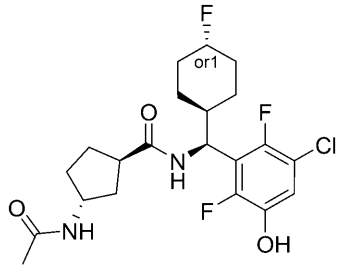
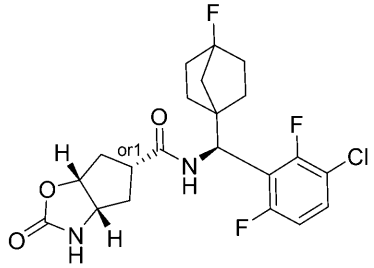
【表１－９８８】

I-3163				D	
I-3164				C	
I-3165				D	
I-3166				B	
I-3167		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 15.2, 8.3 Hz, 2H), 5.27 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.15 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 4.08-3.80 (m, 5H), 3.66 (t, J = 11.5 Hz, 2H), 3.50 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 3.12 (s, 2H), 2.37-1.54 (m, 12H), 1.47 (s, 2H).	531.1	B	B

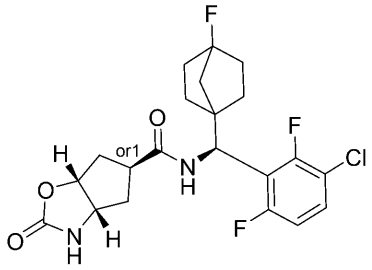
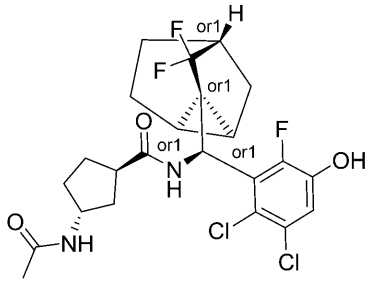
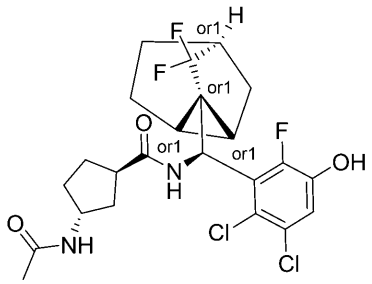
【表１－９８９】

I-3168		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 5.21 (dd, J = 28.1, 6.1 Hz, 2H), 4.02 (dt, J = 7.3, 2.7 Hz, 2H), 3.95-3.78 (m, 3H), 3.65 (td, J = 12.3, 11.6, 2.6 Hz, 2H), 3.47 (td, J = 11.1, 2.8 Hz, 1H), 3.38-3.33 (m, 1H), 3.10 (dt, J = 13.9, 6.9 Hz, 1H), 2.15-1.53 (m, 12H), 1.45 (d, J = 9.3 Hz, 2H).	531.15	B	B
I-3169		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63-7.49 (m, 2H), 7.21-7.10 (m, 1H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 4.67-4.46 (m, 4H), 4.02- 3.89 (m, 2H), 3.85-3.73 (m, 1H), 3.09 (dt, J = 13.2, 9.7 Hz, 1H), 1.75 (ddt, J = 23.7, 15.9, 10.2 Hz, 10H), 1.64-1.54 (m, 2H), 1.52-1.37 (m, 2H).	501.1	B	B
I-3170		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (tt, J = 8.7, 4.6 Hz, 2H), 7.20-7.07 (m, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.72-4.37 (m, 4H), 3.95 (dtd, J = 29.6, 8.6, 7.7, 3.5 Hz, 2H), 3.84- 3.71 (m, 1H), 3.08 (qd, J = 8.6, 4.5 Hz, 1H), 1.93-1.75 (m, 5H), 1.69 (ddd, J = 25.9, 15.3, 7.2 Hz, 5H), 1.60 (t, J = 8.3 Hz, 2H), 1.53-1.35 (m, 2H).	501.1	C	

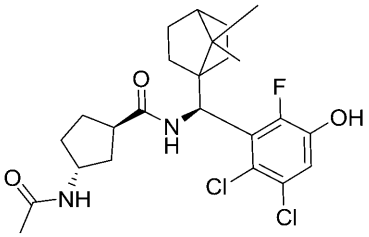
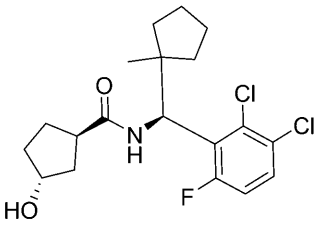
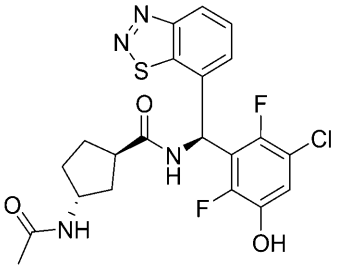
【表１－９９０】

I-3171		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.22 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.6, 7.3 Hz, 1H), 4.81 (dd, J = 10.5, 7.9 Hz, 1H), 4.45 (s, 1H), 4.01 (dt, J = 13.0, 6.6 Hz, 1H), 2.95-2.71 (m, 1H), 2.04 (d, J = 9.7 Hz, 2H), 1.94 (s, 1H), 1.89-1.77 (m, 3H), 1.80-1.70 (m, 1H), 1.76 (s, 2H), 1.74 (s, 1H), 1.61 (ddd, J = 13.5, 8.8, 5.4 Hz, 1H), 1.51-1.27 (m, 1H), 1.32 (s, 4H), 1.12-1.02 (m, 1H), 0.99 (d, J = 12.4 Hz, 1H).	447.15	D	
I-3172		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.22 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.02-6.94 (m, 1H), 4.87 (dd, J = 10.1, 7.6 Hz, 1H), 4.73 (s, 1H), 4.00 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 2.82 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.89 (s, 2H), 1.81 (td, J = 10.1, 5.1 Hz, 4H), 1.76 (s, 2H), 1.74 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 1.67-1.30 (m, 5H), 1.23 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 1.13 (s, 2H).	447.2	D	
I-3173		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.48 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 2H), 7.32 - 7.00 (m, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.14 - 4.81 (m, 1H), 4.19 (t, J = 6.5 Hz, 1H), 3.11 (tt, J = 12.0, 6.1 Hz, 1H), 2.09 - 1.87 (m, 1H), 1.88 - 1.31 (m, 13H).	443.1	D	

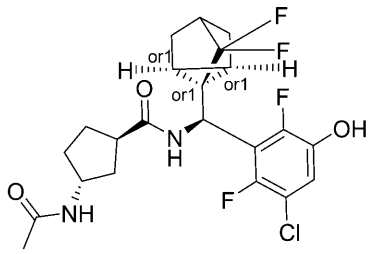
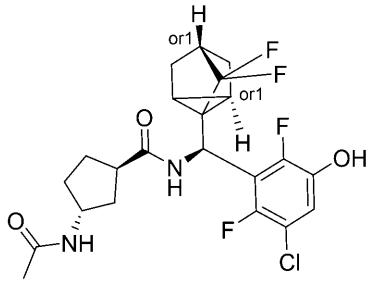
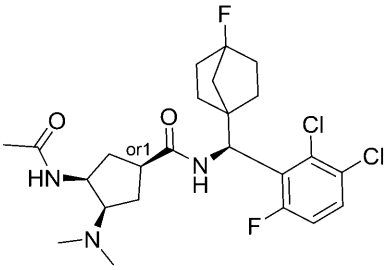
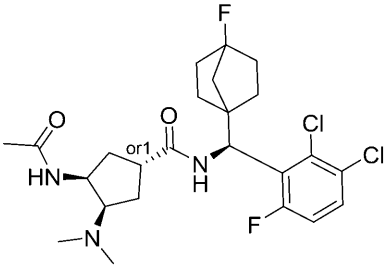
【表１－９９１】

I-3174		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.49 - 7.26 (m, 1H), 6.88 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 5.45 (s, 1H), 5.26 - 4.93 (m, 1H), 4.42 (s, 1H), 3.00 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 2.38 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 1.31 (m, 13H).	443.1	D	
I-3175		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.29 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.15 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.02 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 2.93 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.08 (dd, J = 12.0, 7.3 Hz, 2H), 1.86 (ddt, J = 15.7, 11.5, 6.7 Hz, 5H), 1.78 (s, 2H), 1.73 (s, 1H), 1.71-1.60 (m, 1H), 1.64-1.43 (m, 4H), 1.37 (dt, J = 13.8, 7.2 Hz, 1H), 1.35-1.28 (m, 1H), 0.96 (d, J = 7.9 Hz, 1H).	505.3	D	
I-3176		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)7.93 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.24 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.5 Hz, 1H), 2.83 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.01 (d, J = 9.7 Hz, 2H), 1.76 (s, 9H), 1.89-1.45 (m, 6H), 1.42 (s, 1H), 1.34 (dd, J = 12.4, 7.0 Hz, 1H).	522.3	D	

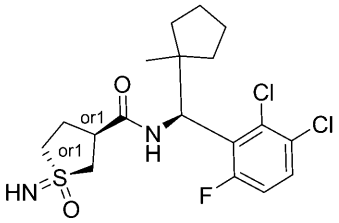
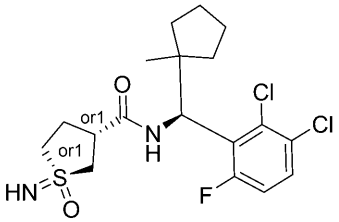
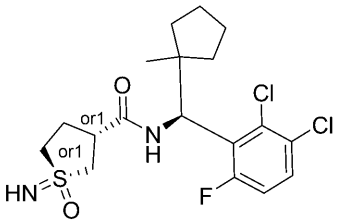
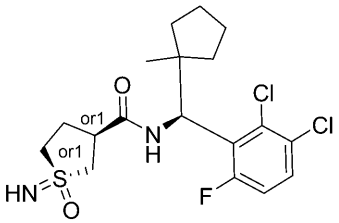
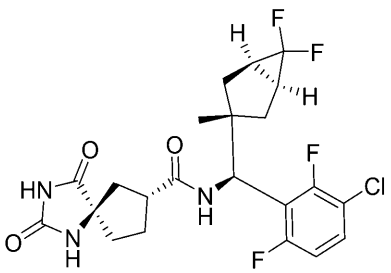
【表１－９９２】

I-3177		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.77 (dd, J = 15.7, 8.1 Hz, 2H), 7.05 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.02 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.93 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.33 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 1.88 - 1.70 (m, 2H), 1.63 - 1.52(m, 5H), 1.52 - 1.48 (m, 3H), 1.40 - 1.35(m, 2H), 1.35 - 1.30(m, 1H), 1.30 - 1.25 (m, 2H), 1.25 - 1.13(m, 8H), 1.10 - 1.05(m, 1H).	485.2	C	C
I-3178		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.43 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 4.15 (tq, J = 6.0, 3.2 Hz, 1H), 3.10- 3.00 (m, 1H), 1.86-1.66 (m, 4H), 1.59 (s, 6H), 1.38 (qd, J = 7.7, 7.0, 3.0 Hz, 3H), 1.26 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	388.1	C	
I-3179		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.38 (s, 1H), 9.11 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.85 - 7.73 (m, 2H), 7.54 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.17 - 7.09 (m, 1H), 6.68 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 4.09 (h, J = 6.4 Hz, 1H), 3.03 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.05 (dt, J = 13.0, 7.4 Hz, 1H), 1.98 - 1.85 (m, 2H), 1.79 (s, 4H), 1.60 (dq, J = 12.2, 7.3 Hz, 1H), 1.41 (dq, J = 12.9, 6.2 Hz, 1H).	481.15	D	

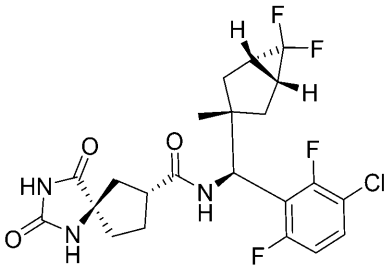
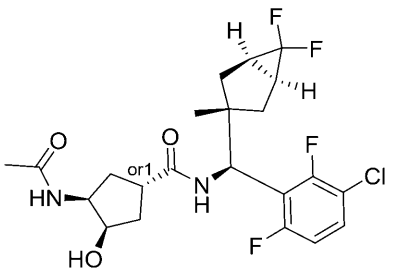
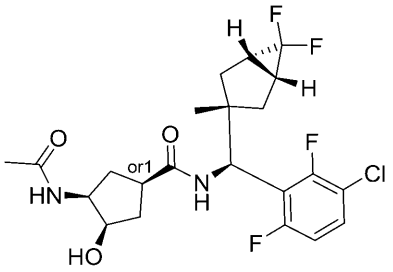
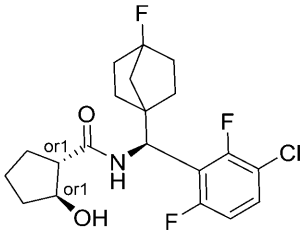
【表１－９９３】

I-3180		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.03 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.87 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 4.02 (s, 1H), 2.87 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 2.12 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 1.97 - 1.82 (m, 3H), 1.75 (d, J = 30.1 Hz, 6H), 1.67 - 1.48 (m, 3H), 1.47 - 1.31 (m, 3H).	475.25	E	
I-3181		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.15 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 8.6, 7.3 Hz, 1H), 5.93 - 5.81 (m, 1H), 4.03 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.87 (p, J = 7.9 Hz, 1H), 2.13 (s, 1H), 1.97 - 1.69 (m, 9H), 1.68 - 1.57 (m, 2H), 1.55 - 1.30 (m, 4H).	475.3	B	B
I-3182		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)8.20 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dt, J = 9.6, 5.3 Hz, 1H), 7.48 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 7.31-7.21 (m, 1H), 5.47 (dd, J = 13.1, 8.0 Hz, 1H), 4.02 (dq, J = 28.7, 5.7 Hz, 1H), 3.08-2.92 (m, 1H), 2.29 (s, 1H), 2.10 (d, J = 8.1 Hz,7H), 2.00 (dd, J = 12.7, 7.6 Hz, 1H), 1.91 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 1.85 (s, 5H), 1.84-1.63 (m, 5H), 1.54 (dt, J = 20.9, 9.0 Hz, 4H), 1.24 (s, 1H).	502.15	B	A
I-3183		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)8.42-8.20 (m, 1H), 7.62 (dtt, J = 8.9, 3.6, 1.8 Hz, 1H), 7.26 (tt, J = 9.0, 3.3 Hz, 1H), 5.49 (dd, J = 17.9, 7.8 Hz, 1H), 4.44- 4.24 (m, 1H), 4.22-3.99 (m, 1H), 3.75-3.59 (m, 1H), 3.25-3.16 (m, 1H), 3.04 (dt, J = 11.2, 6.1 Hz, 1H), 2.24 (t, J = 8.2 Hz, 3H), 2.04-1.41 (m, 18H).	500.35	D	

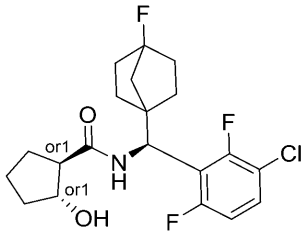
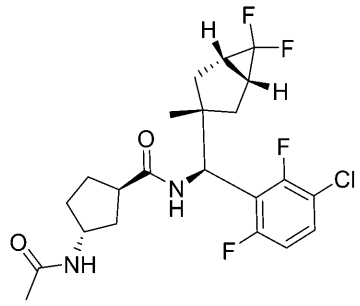
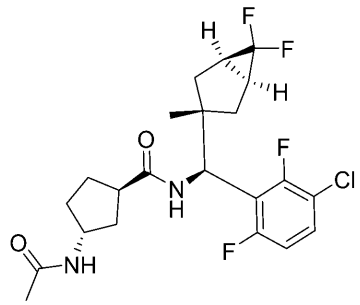
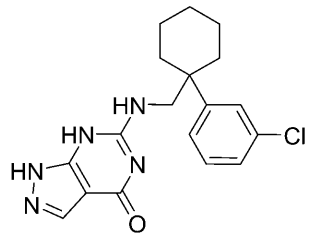
【表１－９９４】

I-3184				B	
I-3185				A	B
I-3186				B	B
I-3187				A	B
I-3188		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 8.37 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 6.87 (dd, J = 24.3, 15.4 Hz, 2H), 6.67 (d, J = 47.5 Hz, 1H), 5.55 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 2.99 (dd, J = 12.9, 7.0 Hz, 1H), 2.52 (t, J = 11.7 Hz, 1H), 2.37 (dd, J = 13.0, 7.7 Hz, 1H), 2.29 - 2.00 (m, 5H), 1.88 (t, J = 14.3 Hz, 3H), 1.61 (s, 2H), 1.04 (s, 3H).	448.15	D	

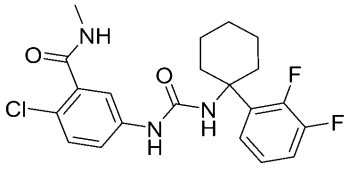
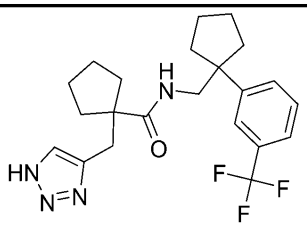
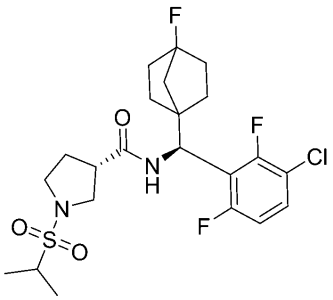
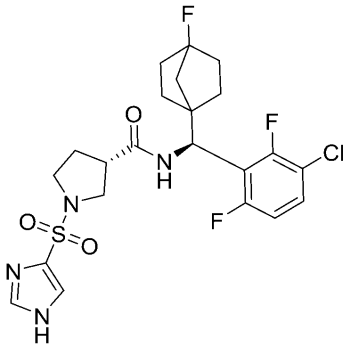
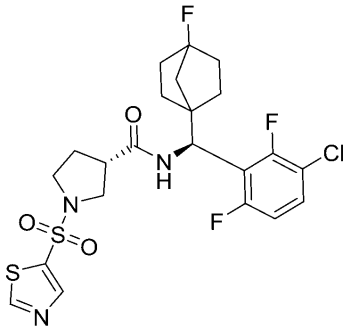
【表１－９９５】

I-3189		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 8.12 (s, 1H), 7.39 - 7.27 (m, 1H), 6.97 - 6.61 (m, 2H), 6.38 (s, 1H), 5.52 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 3.14 - 2.85 (m, 1H), 2.48 (dd, J = 14.0, 9.3 Hz, 1H), 2.38 (dt, J = 13.9, 7.3 Hz, 1H), 2.25 - 2.02 (m, 5H), 1.86 (d, J = 14.1 Hz, 3H), 1.63 (m, 2H), 1.06 (s, 3H).	488.15	D	
I-3190		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.33 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 6.89 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.54 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 6.31 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 4.77 - 4.32 (m, 2H), 4.30 - 4.14 (m, 1H), 3.00 (s, 1H), 2.80 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 2.55 (q, J = 10.5, 8.9 Hz,2H), 2.41 - 1.98 (m, 6H), 1.87 (dd, J = 23.7, 13.8 Hz, 2H), 1.57 (d, J = 13.9 Hz, 3H), 1.03 (d, J = 7.7 Hz, 3H).	477.15	D	
I-3191		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.5 Hz,1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.22 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.76 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 3.09 (dd, J = 9.4, 4.9 Hz, 1H), 2.24 (d, J = 14.0 Hz, 2H), 1.66 (ddd, J = 13.8, 10.3, 4.2 Hz, 6H), 1.53 (d, J = 13.3 Hz, 5H), 1.05 (s, 3H).	477.15	D	
I-3192		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.22 - 7.11 (m, 1H), 5.38 (dd, J = 8.7, 1.3 Hz, 1H), 4.89 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.29 - 4.22 (m, 1H), 2.56 (td, J = 8.5, 4.8 Hz, 1H), 1.90 - 1.35 (m, 16H).	402.05	C	

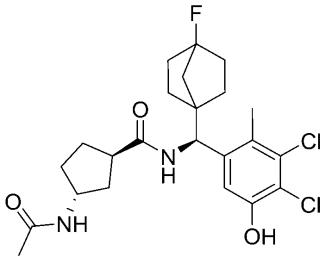
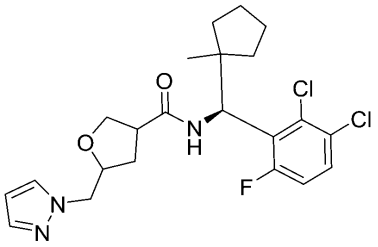
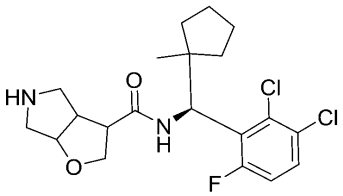
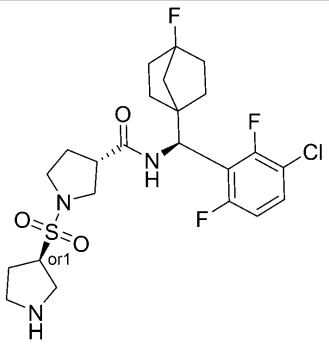
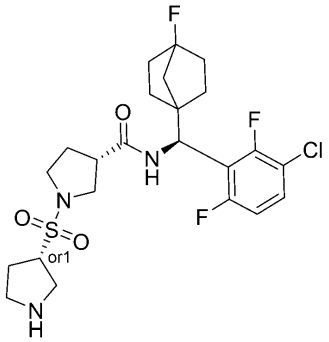
【表１－９９６】

I-3193		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.30 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.5, 1.7 Hz, 1H), 5.39 (dd, J = 9.0, 1.3 Hz, 1H), 4.84 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.21 (q, J = 3.7, 3.3 Hz, 1H), 2.56 (ddd, J = 9.9, 8.2, 4.5 Hz, 1H), 1.90 - 1.36 (m, 16H).	402.1	D	
I-3194		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 5.22 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.00 (h, J = 6.4 Hz, 1H), 2.93 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.32 - 2.16 (m, 2H), 1.89 - 1.78 (m, 3H), 1.77 (s, 4H), 1.66 - 1.40 (m, 5H), 1.35 (dd, J = 12.6, 6.5 Hz, 1H), 1.05 (s, 3H).	461.05	D	
I-3195		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (dd, J = 13.2, 8.9 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 14.8, 7.2 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 4.4 Hz, 1H), 7.17 (q, J = 9.3, 8.1 Hz, 1H), 5.28 (dd, J = 38.0, 8.8 Hz, 1H), 3.98 (dq, J = 21.6, 7.7, 7.2 Hz, 1H), 3.02 C 2.85 (m, 1H), 2.25 (d, J = 13.0 Hz, 1H), 2.20 - 2.07 (m, 1H), 1.94 (dq, J = 13.2, 6.7, 6.0 Hz, 1H), 1.89- 1.74 (m, 4H), 1.73 (s, 2H), 1.59 (dt, J = 31.6, 16.3 Hz, 2H), 1.49 - 1.14 (m, 4H), 1.05 (s, 3H).	461.1	D	
I-3196					

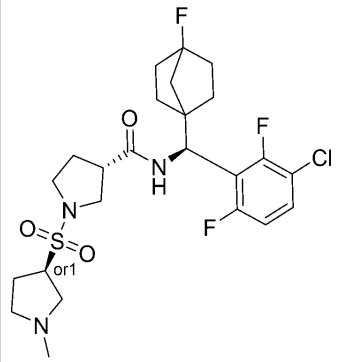
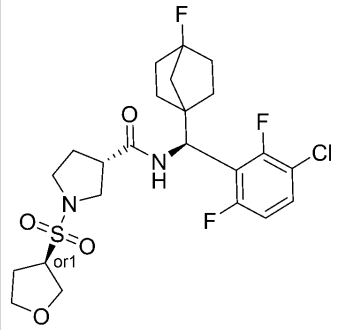
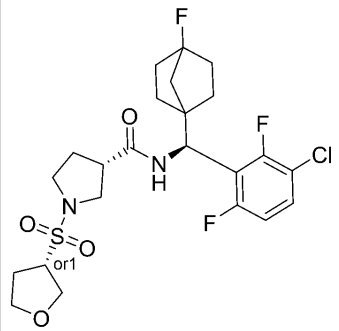
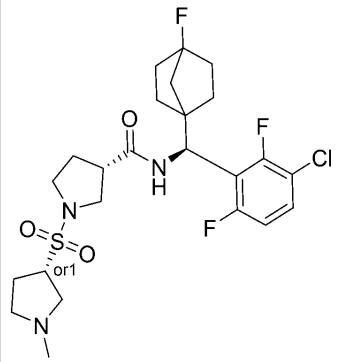
【表１－９９７】

I-3197					
I-3198					
I-3199			493.1	A	A
I-3200			517.05	A	A
I-3201			534.05	A	A

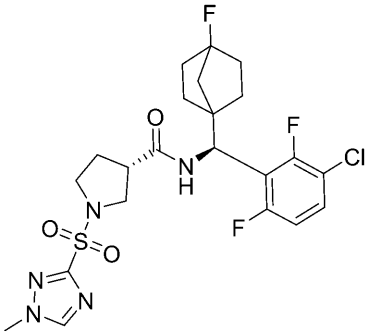
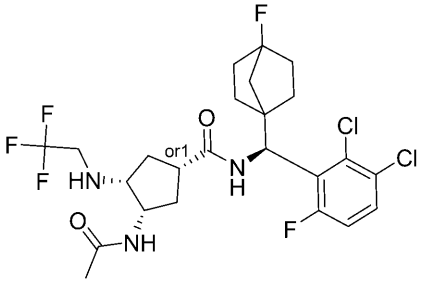
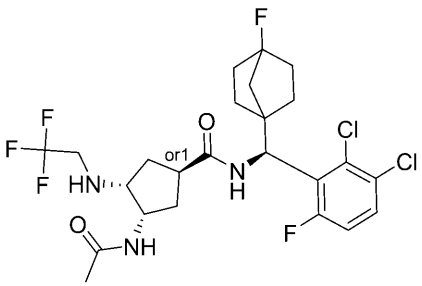
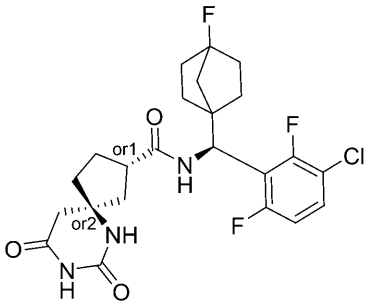
【表１－９９８】

I-3202		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.12 (s, 1H), 8.14 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.74 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 6.83 (s, 1H), 5.11 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 2.89 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.99 - 1.54 (m, 15H), 1.54 - 1.29 (m, 4H).	471.1	A	A
I-3203				D	
I-3204				D	
I-3205			520.2	B	B
I-3206			520.2	B	B

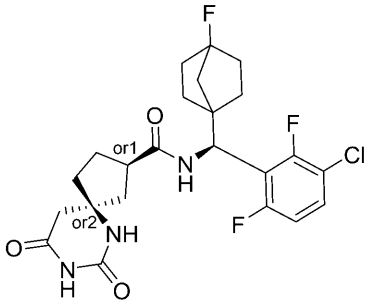
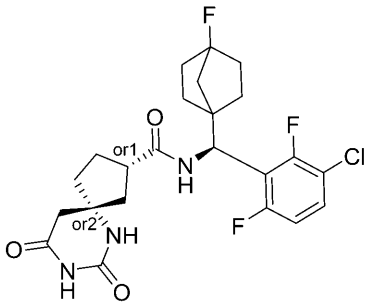
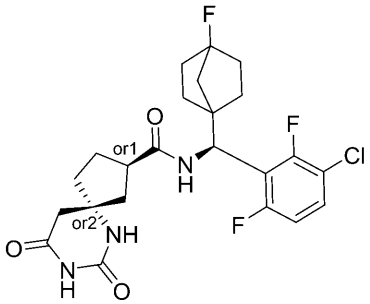
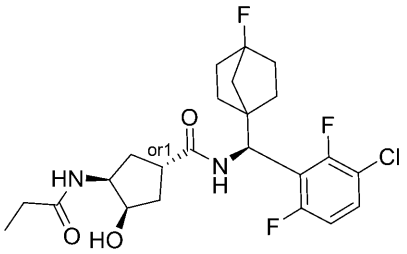
【表１－９９９】

I-3207			534.25	B	A
I-3208			521.2	B	B
I-3209			521.2	B	A
I-3210			534.25	B	A

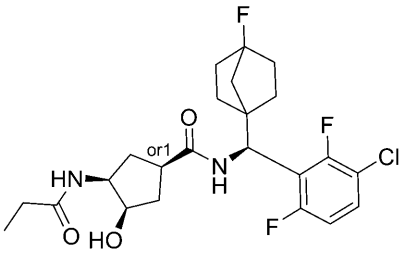
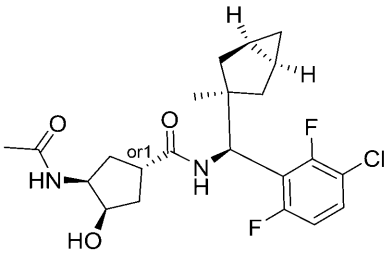
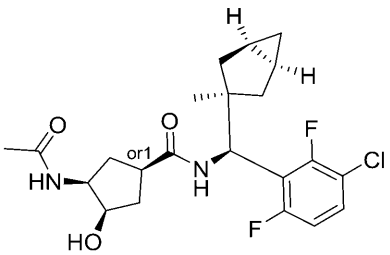
【表１－１０００】

I-3211			532.2	B	A
I-3212		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)8.13 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 4.12-3.84 (m, 1H), 3.28-3.11 (m, 3H), 2.96 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 2.11 (q, J = 7.4 Hz, 1H), 1.95 -1.43 (m, 16H).	556.35	C	
I-3213		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.06 (p, J = 6.0 Hz, 1H), 3.24-3.04 (m, 1H), 3.00 -2.92 (m, 3H), 2.09 (q, J = 7.3 Hz, 1H), 1.84 (s, 4H), 1.91-1.75 (m, 4H), 1.68 (qd, J = 18.8, 17.1, 7.3 Hz, 5H), 1.57 (d, J = 8.1 Hz, 2H), -0.06 (s, 2H).	556.35	B	A
I-3214		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.06 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.21 - 7.11 (m, 1H), 5.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.56 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 2.42 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 2.09 - 1.65 (m, 11H), 1.64 - 1.51 (m, 3H), 1.46 (s, 2H).	484.15	C	

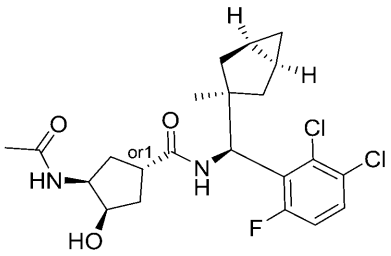
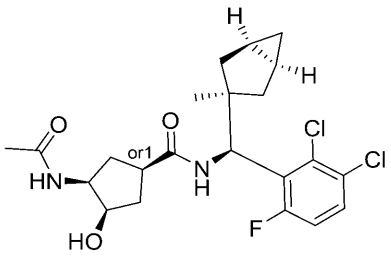
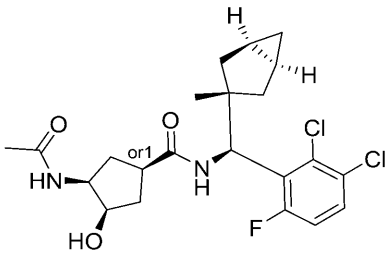
【表１－１００１】

I-3215		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.03 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.04 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 2.46 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 2.01 - 1.84 (m, 2H), 1.85 - 1.55 (m, 12H), 1.49 - 1.42 (m, 2H).	484.2	B	A
I-3216		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.07 (s, 1H), 8.34 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.21 - 7.11 (m, 1H), 5.30 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.00 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.57 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 2.44 (d, J = 16.2 Hz, 1H), 2.01 - 1.64 (m, 12H), 1.64 - 1.53 (m, 2H), 1.46 (s, 2H).	484.2	B	A
I-3217		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.02 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.19 - 7.09 (m, 1H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.05 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.49 - 2.39 (m, 2H), 2.03 - 1.92 (m, 1H), 1.70 (dddt, J = 45.2, 37.5, 26.6, 8.5 Hz, 13H), 1.46 (d, J = 10.0 Hz, 2H).	484.2	B	A
I-3218		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.18 C 7.09 (m, 1H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.97 (p, J = 3.5 Hz, 1H), 3.89 (qd, J = 8.4, 3.8 Hz, 1H), 3.09 (qd, J = 8.6, 4.6 Hz, 1H), 2.08 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 1.87 C 1.56 (m, 12H), 1.45 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 0.96 (t, J = 7.6 Hz, 3H).	473.35	C	B

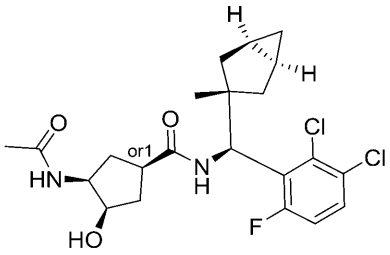
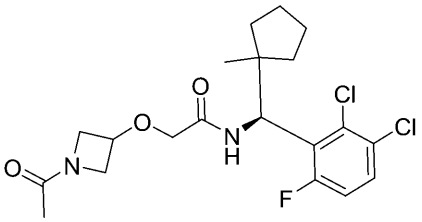
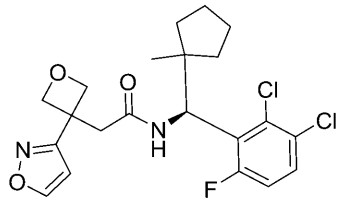
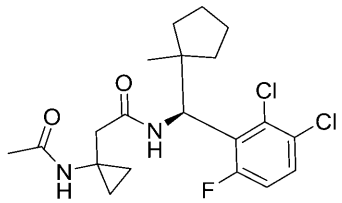
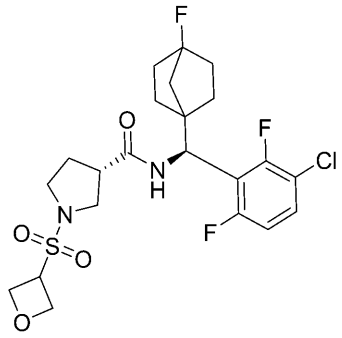
【表１－１００２】

I-3219		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.4, 5.2 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.74 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 3.93 (q, J = 8.8, 7.2 Hz, 2H), 3.09 (tt, J = 13.0, 6.8 Hz, 1H), 2.10 (tt, J = 9.3, 7.6, 3.2 Hz, 2H), 1.98 C 1.67 (m, 10H), 1.62 (ddd, J = 12.7, 8.5, 2.9 Hz, 2H), 1.46 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 0.97 (td, J = 7.6, 1.6 Hz, 3H).	473.35	B	A
I-3220		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.02 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.18 - 7.05 (m, 1H), 5.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.72 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.04 - 3.80 (m, 2H), 3.09 (td, J = 9.1, 5.0 Hz, 1H), 1.85 - 1.73 (m, 5H), 1.73 - 1.57 (m, 3H), 1.50 - 1.41 (m, 1H), 1.39 - 1.21 (m, 4H), 1.05 (s, 3H), 0.85 (td, J = 8.0, 4.1 Hz, 1H), 0.13 (q, J = 3.5 Hz, 1H).	441.2	B	A
I-3221		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.53 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.18 - 7.05 (m, 1H), 5.09 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.73 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.04 - 3.79 (m, 2H), 3.10 (qd, J = 8.7, 4.8 Hz, 1H), 1.80 (d, J = 7.8 Hz, 5H), 1.70 - 1.54 (m, 3H), 1.52 - 1.40 (m, 1H), 1.39 - 1.20 (m, 4H), 1.05 (s, 3H), 0.85 (td, J = 7.9, 4.0 Hz, 1H), 0.13 (q, J = 3.8 Hz, 1H).	441.15	D	B

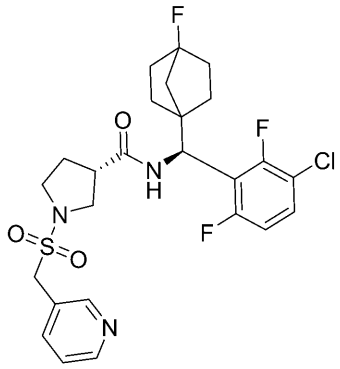
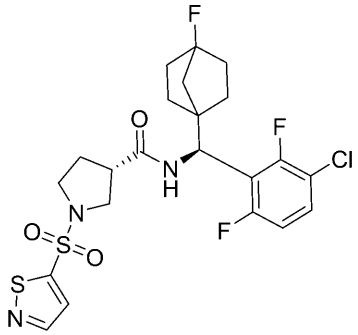
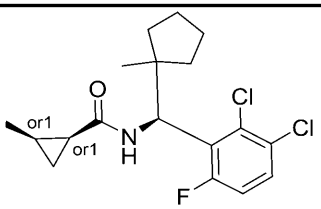
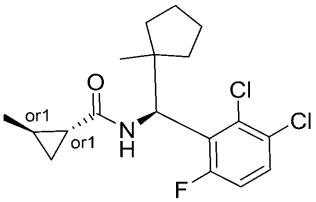
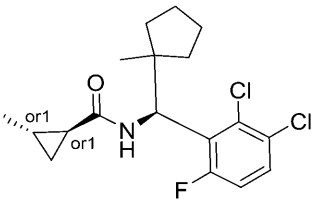
【表１－１００３】

I-3222		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.99 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.29 - 7.20 (m, 1H), 5.40 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.75 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 2H), 3.10 (s, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.75 (t, J = 9.5 Hz, 2H), 1.71 - 1.58 (m, 3H), 1.51 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 1.43 - 1.23 (m, 4H), 1.07 (s, 3H), 0.81 (s, 1H), 0.10 (d, J = 4.0 Hz, 1H).	457.1	B	A
I-3223		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.99 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.29 - 7.20 (m, 1H), 5.38 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.77 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.95 (s, 1H), 3.86 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 3.12 (s, 1H), 1.78 (s, 5H), 1.60 (dd, J = 11.5, 6.7 Hz, 3H), 1.50 (s, 1H), 1.42 - 1.31 (m, 4H), 1.06 (s, 3H), 0.89 (s, 1H), 0.09 (d, J = 4.2 Hz, 1H).	457.1	B	A
I-3224		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.66 - 7.55 (m, 2H), 7.31 - 7.22 (m, 1H), 5.43 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 4.94 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 3.87 (s, 2H), 2.81 (s, 1H), 2.03 - 1.93 (m, 2H), 1.81 (s, 3H), 1.62 - 1.52 (m, 4H), 1.49 - 1.33 (s, 4H), 1.06 (s, 3H), 0.86 (s, 1H), 0.09 (d, J = 4.2 Hz, 1H).	457.1	B	A

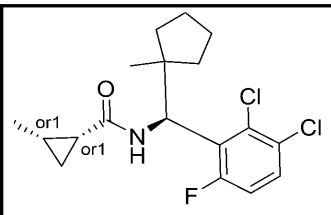
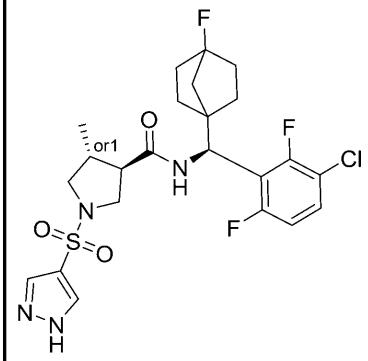
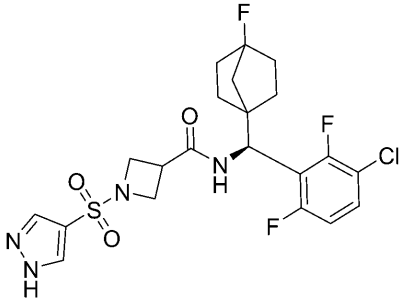
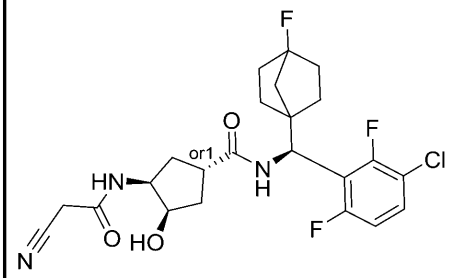
【表１－１００４】

I-3225		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.65 - 7.53 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.39 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.00 (s, 1H), 3.85 (d, J = 18.9 Hz, 2H), 2.80 (s, 1H), 2.07 - 1.86 (m, 2H), 1.79 (s, 3H), 1.64 (s, 2H), 1.48 - 1.33 (d, J = 11.6 Hz, 3H), 1.26 (s, 3H), 1.08 (s, 3H), 0.86 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 0.10 (d, J = 4.2 Hz, 1H).	457.1	C	B
I-3226			432.3	D	
I-3227			442.3	D	
I-3228			416.3	E	
I-3229			507.1	B	A

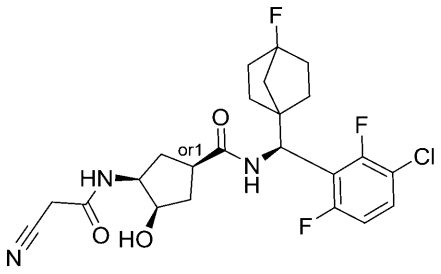
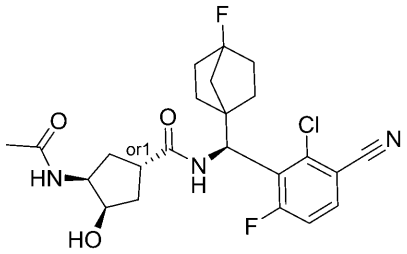
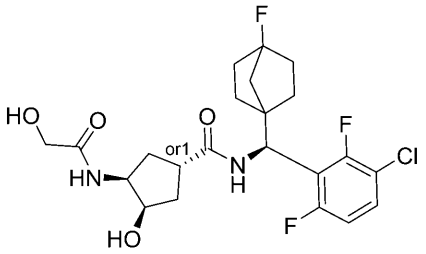
【表１－１００５】

I-3230			542.1	B	A
I-3231			534.1	B	A
I-3232			358.1	D	
I-3233			358.05	E	
I-3234			358.05	E	

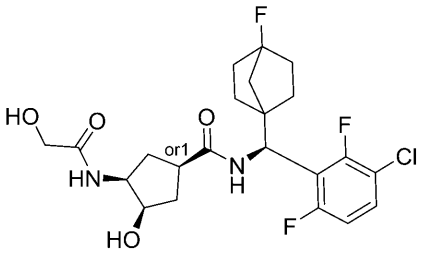
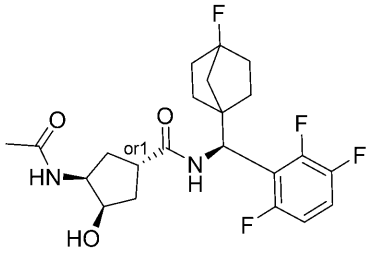
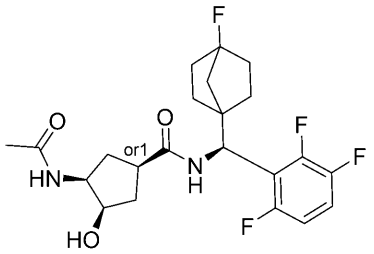
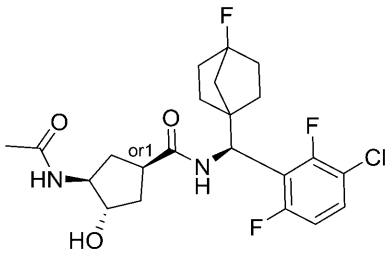
【表１－１００６】

I-3235			358.05	E	
I-3236			531.1	D	
I-3237			503	B	A
I-3238		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.94 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.98 (s, 1H), 3.91 (td, J = 12.3, 11.9, 6.3 Hz, 1H), 3.64 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 3.11 (dd, J = 9.2, 3.5 Hz, 1H), 1.93 - 1.56 (m, 12H), 1.46 (d, J = 9.5 Hz, 2H).	484.2	B	A

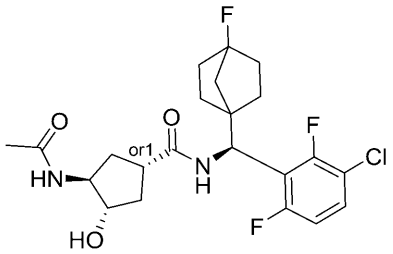
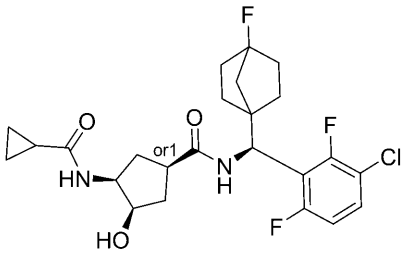
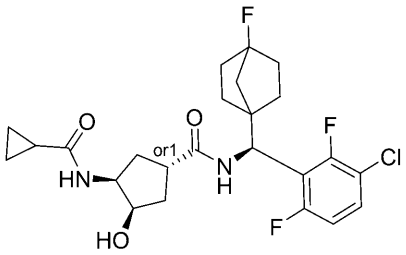
【表１－１００７】

I-3239		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.93 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.01 (p, J = 3.4 Hz, 1H), 3.87 (qd, J = 8.8, 3.9 Hz, 1H), 3.62 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 3.17 - 3.04 (m, 1H), 1.85 - 1.64 (m, 11H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 9.4 Hz, 2H).	484.2	D	C
I-3240		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 8.7, 5.2 Hz, 1H), 7.61 - 7.38 (m, 2H), 5.44 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.00 - 3.77 (m, 2H), 3.07 (dt, J = 13.0, 9.3 Hz, 1H), 1.84 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 1.80 (s, 6H), 1.71 (qt, J = 21.2, 12.6, 9.7 Hz, 5H), 1.62 - 1.46 (m, 4H).	466.1	D	
I-3241		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.59 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.12 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.98 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 3.79 (d, J = 5.5 Hz, 2H), 3.24 - 3.06 (m, 1H), 2.03 - 1.87 (m, 1H), 1.88 - 1.56 (m, 10H), 1.46 (d, J = 9.5 Hz, 3H).	475.15	B	B

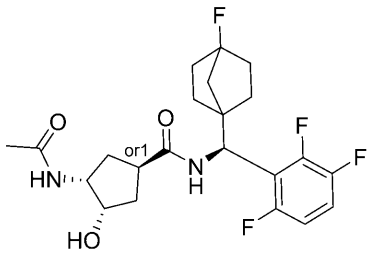
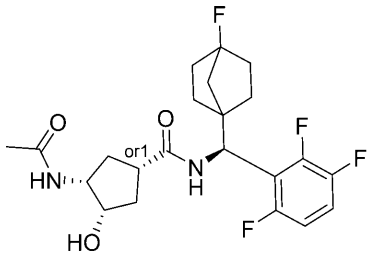
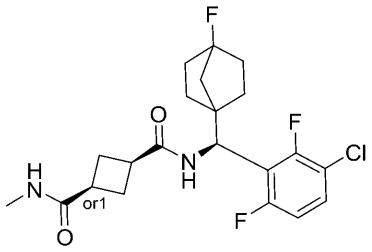
【表１－１００８】

I-3242		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.57 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.12 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 3.97 (ddd, J = 20.5, 7.9, 4.0 Hz, 2H), 3.78 (d, J = 5.5 Hz, 2H), 3.22 - 3.00 (m, 1H), 1.91 - 1.56 (m, 10H), 1.45 (d, J = 9.4 Hz, 3H).	475.15	C	B
I-3243		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.52 - 7.29 (m, 2H), 7.09 (td, J = 9.7, 9.2, 5.0 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.05 - 3.79 (m, 2H), 3.09 (qd, J = 8.7, 4.5 Hz, 1H), 1.89 - 1.66 (m, 13H), 1.62 (dd, J = 13.1, 8.5 Hz, 2H), 1.45 (d, J = 8.5 Hz, 2H).	441.2	D	
I-3244		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.52 - 7.29 (m, 2H), 7.09 (td, J = 9.7, 9.2, 5.0 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.05 - 3.79 (m, 2H), 3.09 (qd, J = 8.7, 4.5 Hz, 1H), 1.89 - 1.66 (m, 13H), 1.62 (dd, J = 13.1, 8.5 Hz, 2H), 1.45 (d, J = 8.5 Hz, 2H).	441.2	D	
I-3245		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 4.7 Hz, 1H), 3.79 (dp, J = 19.7, 5.9 Hz, 2H), 2.88 (p, J = 8.3 Hz, 1H), 2.06 - 1.95 (m, 2H), 1.79 (s, 7H), 1.71 (d, J = 9.3 Hz, 4H), 1.63 - 1.54 (m, 2H), 1.45 (p, J = 6.6 Hz, 3H).	459.35	B	A

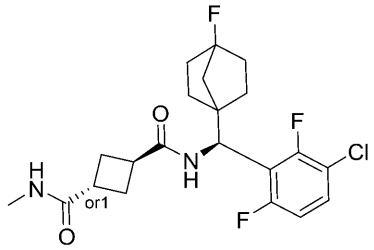
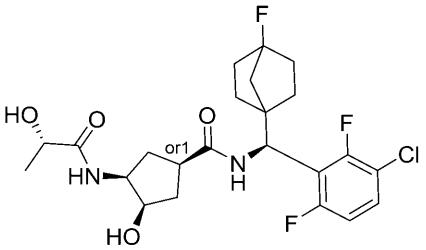
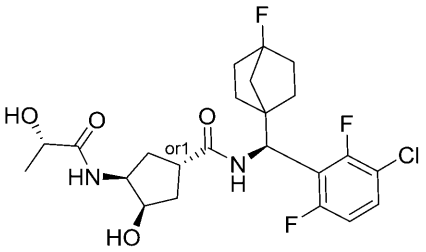
【表１－１００９】

I-3246		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 1H), 5.26 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.89 - 3.70 (m, 2H), 2.88 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 2.12 - 2.01 (m, 1H), 1.88 (dt, J = 14.4, 7.6 Hz, 1H), 1.78 (s, 6H), 1.71 (d, J = 13.5 Hz, 4H), 1.56 (ddd, J = 13.7, 11.1, 6.7 Hz, 3H), 1.44 (q, J = 7.4, 5.2 Hz, 2H).	459.35	B	A
I-3247		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.83 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.98 (ddd, J = 14.3, 9.1, 4.8 Hz, 1H), 3.93 (dq, J = 4.0, 2.1 Hz, 1H), 3.10 (qd, J = 8.6, 4.6 Hz, 1H), 1.89 - 1.57 (m, 13H), 1.49 - 1.42 (m, 2H), 0.69 - 0.55 (m, 4H).	485.2	C	B
I-3248		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.83 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.00 - 3.88 (m, 2H), 3.11 (tt, J = 13.2, 6.5 Hz, 1H), 1.75 - 1.56 (m, 13H), 1.45 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 0.61 (ddt, J = 18.5, 7.2, 3.4 Hz, 4H).	485.2	D	B

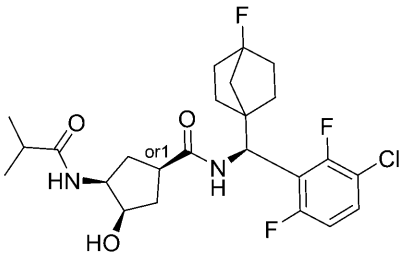
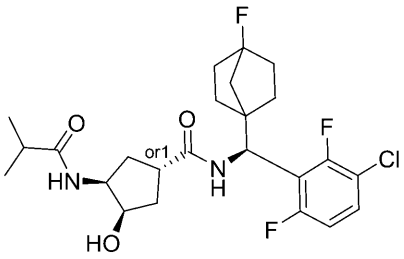
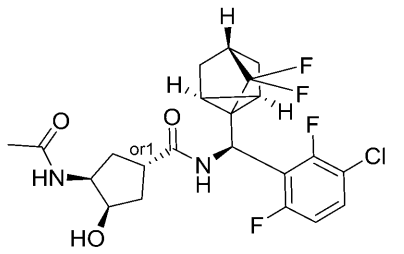
【表１－１０１０】

I-3249		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.41 (qd, J = 9.4, 4.8 Hz, 1H), 7.10 (td, J = 9.6, 8.7, 5.0 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.00 - 3.84 (m, 2H), 3.08 (td, J = 8.7, 3.8 Hz, 1H), 1.81 (s, 5H), 1.79 (d, J = 3.3 Hz, 2H), 1.73 (dt, J = 15.9, 6.4 Hz, 6H), 1.66 - 1.55 (m, 2H), 1.46 (d, J = 9.9 Hz, 2H).	443.2	D	
I-3250		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.41 (qd, J = 9.4, 4.8 Hz, 1H), 7.11 (p, J = 6.7, 5.6 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.95 (dt, J = 10.7, 5.4 Hz, 1H), 3.87 (qd, J = 8.6, 3.8 Hz, 1H), 3.19 - 3.03 (m, 1H), 1.93 - 1.73 (m, 9H), 1.74 - 1.63 (m, 4H), 1.63 - 1.54 (m, 2H), 1.46 (d, J = 9.9 Hz, 2H).	443.15	D	D
I-3251		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.67-7.48 (m, 2H), 7.15 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.18 (td, J = 8.7, 4.2 Hz, 1H), 2.96-2.84 (m, 1H), 2.55 (d, J = 4.6 Hz, 3H), 2.19 (tt, J = 11.1, 5.9 Hz, 3H), 2.03 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 1.94-1.54 (m, 7H), 1.44 (d, J = 8.6 Hz, 2H).	429.2	B	B

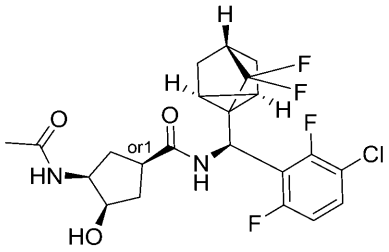
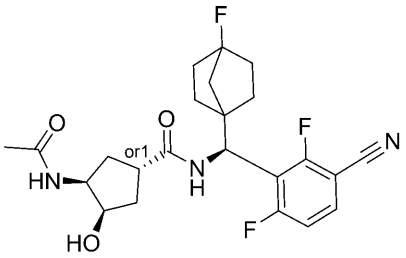
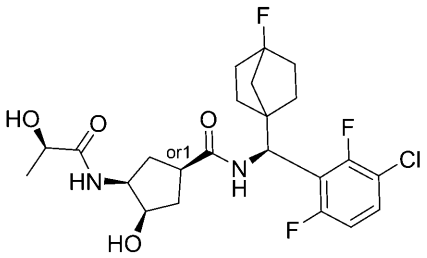
【表１－１０１１】

I-3252		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.13 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.57 (ddd, J = 14.1, 10.0, 5.4 Hz, 2H), 7.22-7.09 (m, 1H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.02 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.82 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 2.53 (d, J = 4.6 Hz, 3H), 2.35-1.98 (m, 4H), 1.75 (dd, J = 21.2, 10.3 Hz, 7H), 1.59 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.44 (d, J = 7.7 Hz, 2H).	429.15	B	B
I-3253		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.32 (td, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.88 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 6.49 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 4.48 - 4.12 (m, 3H), 3.49 (s, 1H), 3.03 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 2.18 (ddd, J = 13.7, 8.5, 5.3 Hz, 4H), 2.05 (td, J = 8.8, 8.1, 3.1 Hz, 7H), 1.94 - 1.68 (m, 2H), 1.68 - 1.22 (m, 5H).	489.25	C	C
I-3254		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 7.26 (s, 1H), 7.02 (s, 1H), 6.87 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 6.40 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 4.25 (d, J = 26.7 Hz, 3H), 3.60 (s, 1H), 3.16 (s, 1H), 3.00 (d, J = 9.8 Hz, 1H),2.28 (dd, J = 13.3, 6.9 Hz, 1H), 2.25 - 1.79 (m, 10H), 1.42 (d, J = 6.9 Hz, 6H).	489.25	C	B

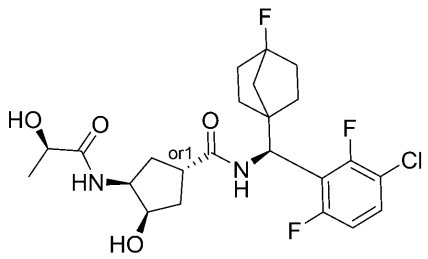
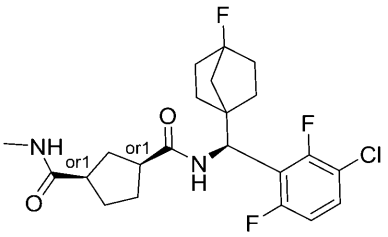
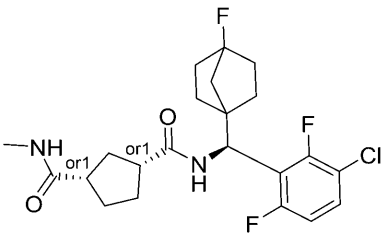
【表１－１０１２】

I-3255		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.18 - 7.09 (m, 1H), 5.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.75 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 3.98 - 3.86 (m, 2H), 3.13 - 3.03 (m, 1H), 2.41 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 1.90 - 1.67 (m, 10H), 1.61 (td, J = 11.2, 9.3, 2.7 Hz, 2H), 1.46 (d, J = 9.2 Hz, 2H), 0.98 (dd, J = 6.8, 2.7 Hz, 6H).	487.2	C	B
I-3256		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.18 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.19 - 7.09 (m, 1H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.76 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 3.97 (p, J = 3.4 Hz, 1H), 3.88 (qd, J = 8.6, 3.9 Hz, 1H), 3.08 (td, J = 9.1, 8.6, 4.8 Hz, 1H), 2.40 (h, J = 6.8 Hz, 1H), 1.87 - 1.60 (d, J = 8.6 Hz, 12H), 1.49 - 1.42 (m, 2H), 0.97 (t, J = 6.6 Hz, 6H).	487.25	D	B
I-3257		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.5 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 5.90 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.73 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 3.94 (s, 2H), 3.00 (dt, J = 13.2, 6.3 Hz, 1H), 2.12 (s, 1H), 1.87 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 1.78 (d, J = 25.4 Hz, 8H), 1.72 (s, 1H), 1.71-1.60 (m, 2H), 1.42 (t, J = 9.6 Hz, 2H).	475.1	D	D

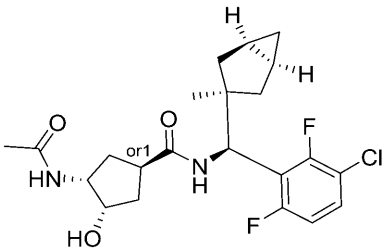
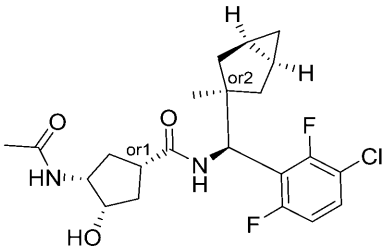
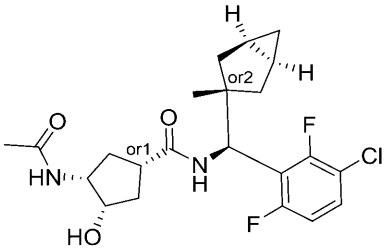
【表１－１０１３】

I-3258		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.09 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.8, 5.5 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 5.89 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.01-3.83 (m, 2H), 3.02 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 2.12 (s, 1H), 1.85 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 1.79 (s, 3H), 1.83-1.74 (m, 2H), 1.72 (dd, J = 12.9, 5.1 Hz, 3H), 1.70-1.60 (m, 2H), 1.42 (dd, J = 10.6, 8.7 Hz, 2H).	475.2	E	D
I-3259		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)8.29 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.96 (ddd, J = 8.6, 7.3, 5.7 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.34 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 3.97-3.82 (m, 2H), 3.15-3.02 (m, 1H), 1.80 (s, 5H), 1.88-1.66 (m, 7H), 1.65-1.54 (m, 2H), 1.47 (d, J = 9.8 Hz, 2H).	450.35	D	
I-3260		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.19 - 7.09 (m, 1H), 5.55 (s, 1H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.06 (s, 1H), 3.99 (t, J = 3.7 Hz, 1H), 3.97 - 3.85 (m, 2H), 3.11 (dt, J = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.86 - 1.67 (m, 10H), 1.60 (s, 2H), 1.48 - 1.37 (m, 2H), 1.29 - 1.16 (m, 3H).	489.1	D	C

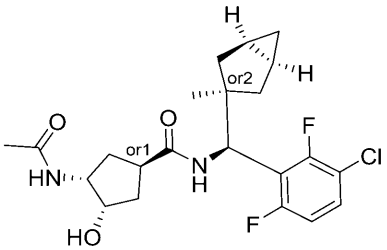
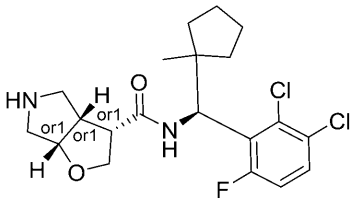
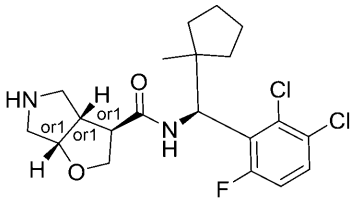
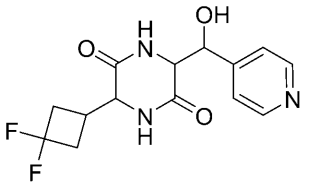
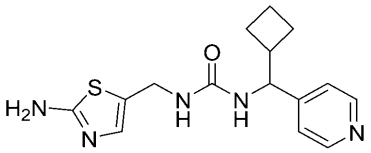
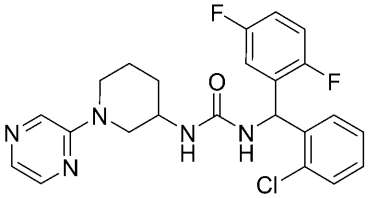
【表１－１０１４】

I-3261		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 5.57 (s, 1H), 5.27 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.08 (s, 1H), 3.94 (dd, J = 13.2, 5.2 Hz, 3H), 3.11 (dt, J = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.93 (ddd, J = 12.8, 8.2, 4.7 Hz, 1H), 1.80 (s, 1H), 1.74 (dd, J = 16.1, 7.3 Hz, 6H), 1.69 (s, 3H), 1.60 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.49 - 1.40 (m, 2H), 1.20 (dd, J = 6.8, 5.3 Hz, 3H).	489.15	D	B
I-3262		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.70 (q, J = 4.7 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 2.78 (q, J = 8.4 Hz, 1H), 2.55 (d, J = 4.7 Hz, 4H), 1.89 (dt, J = 12.3, 7.6 Hz, 1H), 1.80 - 1.57 (m, 14H), 1.46 (d, J = 8.8 Hz, 2H).	443.2	C	
I-3263		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.26 (dd, J = 17.2, 8.3 Hz, 1H), 7.72 (p, J = 5.8, 5.1 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 2.78 (dq, J = 16.3, 8.2, 7.4 Hz, 1H), 2.65 - 2.57 (m, 4H), 1.96 (dt, J = 12.5, 7.7 Hz, 1H), 1.86 - 1.56 (m, 13H), 1.46 (d, J = 9.2 Hz, 2H).	443.2	C	A

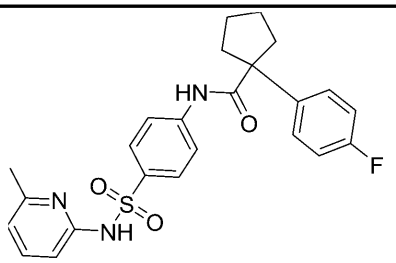
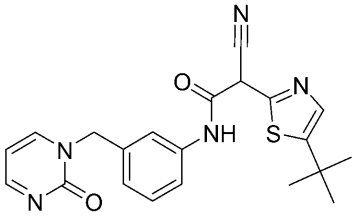
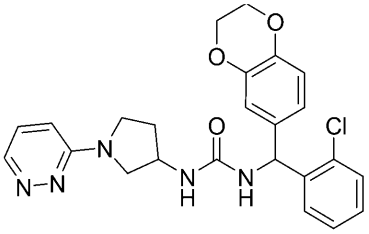
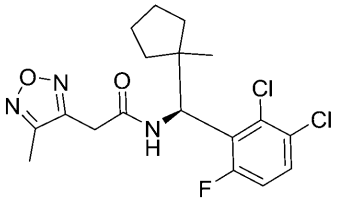
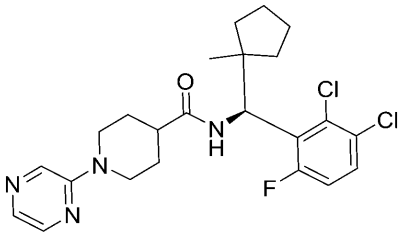
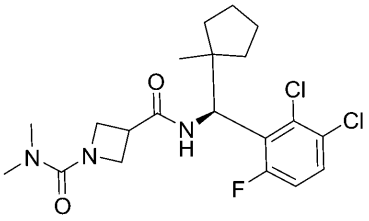
【表１－１０１５】

I-3264		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.68 - 7.43 (m, 2H), 7.12 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.75 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 3.97 - 3.74 (m, 2H), 3.17 - 3.04 (m, 1H), 1.81 (m, 5H), 1.70 - 1.59 (m, 3H), 1.46 (dd, J = 12.4, 5.8 Hz, 1H), 1.42 - 1.24 (m, 4H), 1.05 (s, 3H), 0.86 (dd, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 3.8 Hz, 1H).	441.15	B	A
I-3265		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 6.84 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 5.86 (s, 1H), 5.41 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 4.31 (d, J = 47.9 Hz, 2H), 2.97 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 2.04 (d, J = 32.4 Hz, 4H), 1.80 (s, 1H), 1.66 (d, J = 12.6 Hz, 2H), 1.49 (d, J = 12.6 Hz, 1H), 1.37 (d, J = 15.1 Hz, 4H), 1.08 (s, 3H), 0.93 (s, 1H), 0.09 (d, J = 4.0 Hz, 1H).	441.2	D	C
I-3266		1H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) 6.84 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 6.22 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 5.90 (s, 1H), 5.41 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.31 (d, J = 47.6 Hz, 2H), 2.97 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 2.04 (d, J = 31.0 Hz, 4H), 1.81 (s, 1H), 1.65 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 1.49 (d, J = 12.7 Hz, 1H), 1.37 (d, J = 14.9 Hz, 4H), 1.08 (s, 3H), 1.02 - 0.83 (m, 1H), 0.09 (d, J = 4.4 Hz, 1H).	441.2	D	

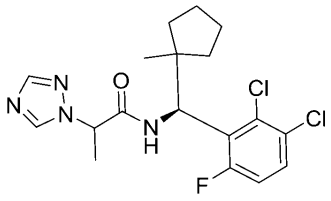
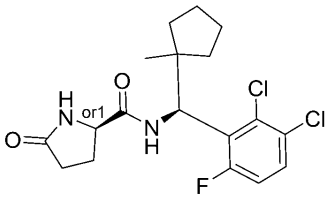
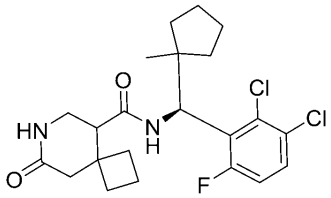
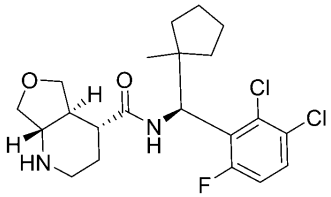
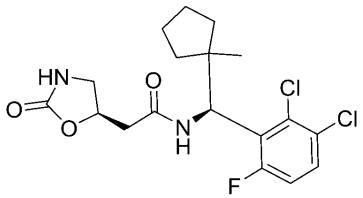
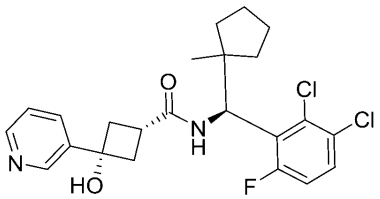
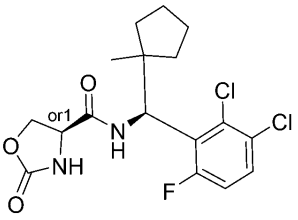
【表１－１０１６】

I-3267		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.66 - 7.47 (m, 2H), 7.12 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.10 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 4.76 (dd, J = 5.7, 3.4 Hz, 1H), 4.16 - 3.76 (m, 2H), 3.20 - 2.99 (m, 1H),1.86 - 1.71 (m, 5H), 1.73 - 1.54 (m, 3H), 1.45 (dd, J = 12.6, 5.8 Hz, 1H),1.42 - 1.24 (m, 4H), 0.94 - 0.75 (m, 2H), 0.14 (q, J = 3.6 Hz, 1H).	441.2	D	
I-3268				D	
I-3269				D	
I-3270					
I-3271					
I-3272					

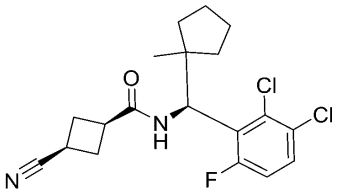
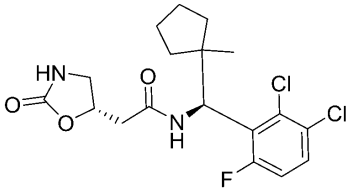
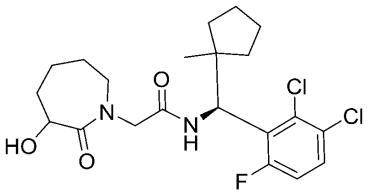
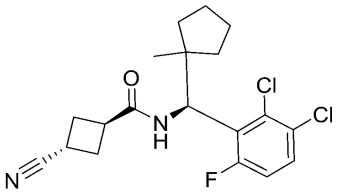
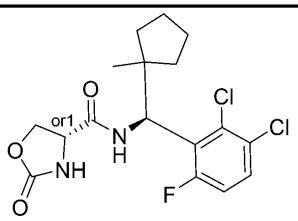
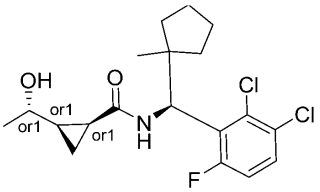
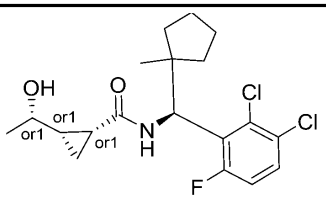
【表１－１０１７】

I-3273					
I-3274					
I-3275					
I-3276			401.3	D	
I-3277			466.4	D	
I-3278			431.4	C	

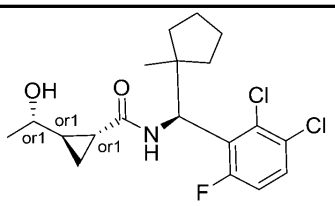
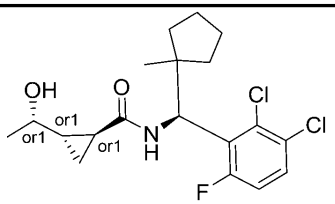
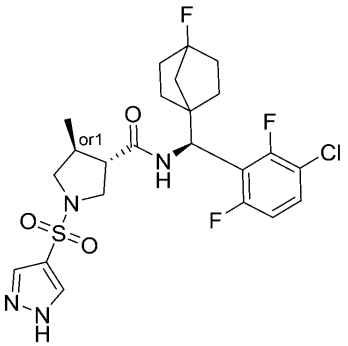
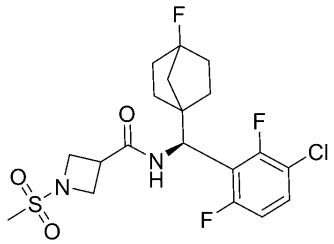
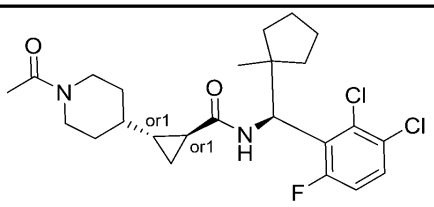
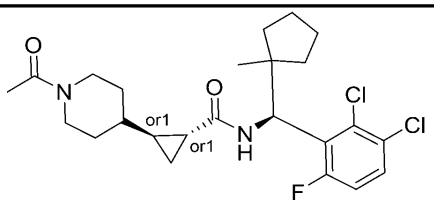
【表１－１０１８】

I-3279			400.3	D	
I-3280			388.3	D	
I-3281			442.4	E	
I-3282			430.4	D	
I-3283			404.3	D	
I-3284			452.4	C	
I-3285			390.3	D	

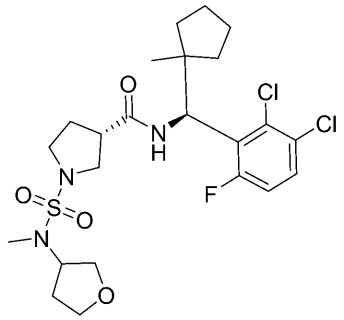
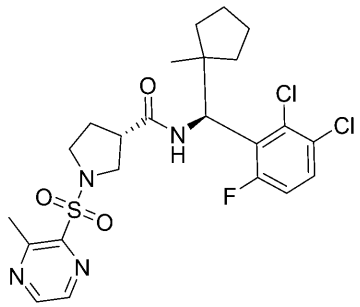
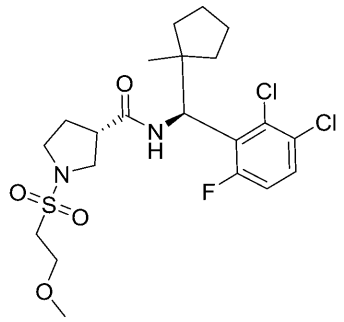
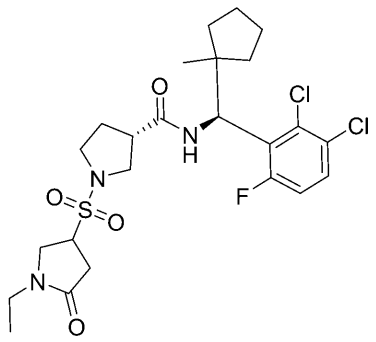
【表１－１０１９】

I-3286			384.3	C	
I-3287			404.3	D	
I-3288			446.4	D	
I-3289			384.3	D	
I-3290			390.3	D	
I-3291			388.05	D	
I-3292			388.05	E	

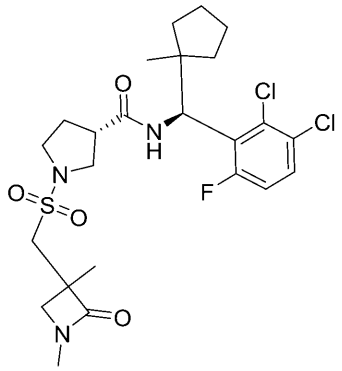
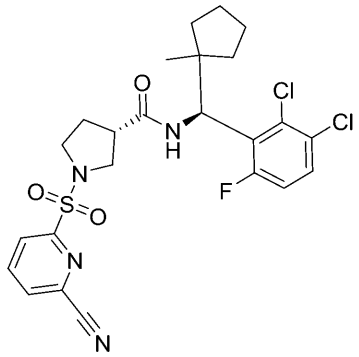
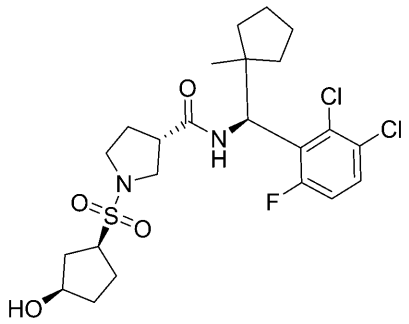
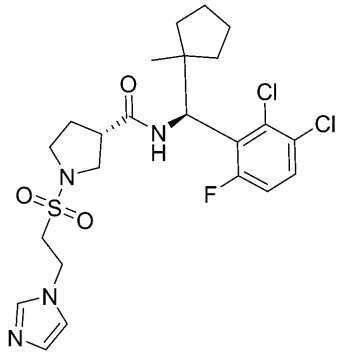
【表１－１０２０】

I-3293			388.05	D	
I-3294			388.1	C	
I-3295			531.1	D	
I-3296			451.05	B	A
I-3297			469.1	D	
I-3298			469.15	D	

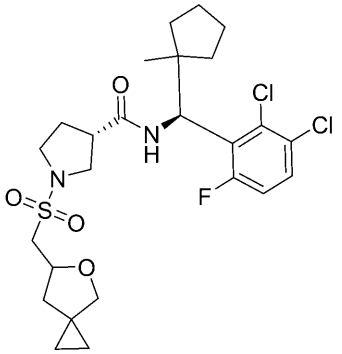
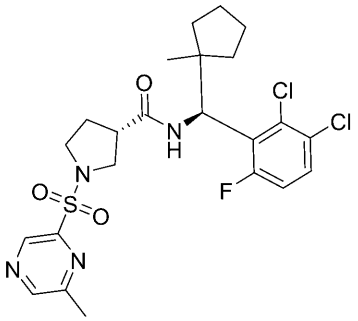
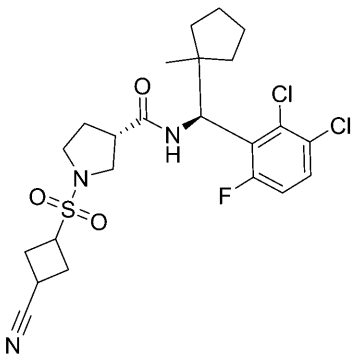
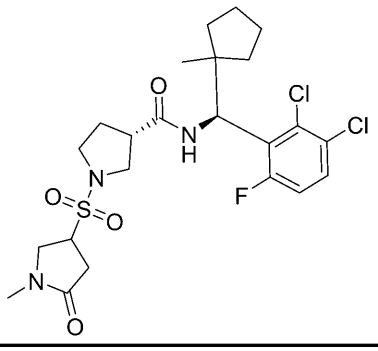
【表１－１０２１】

I-3299			537.5	C	
I-3300			530.5	D	
I-3301			496.4	C	
I-3302			549.5	B	

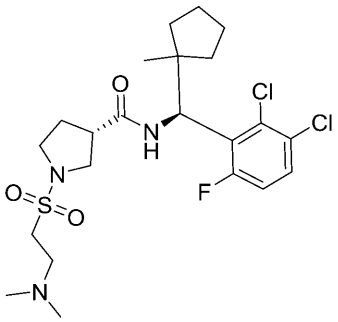
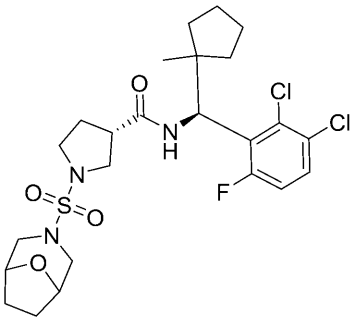
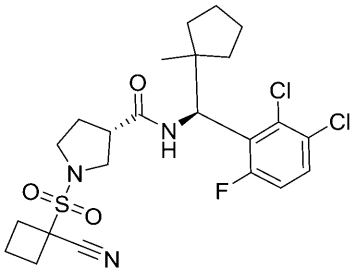
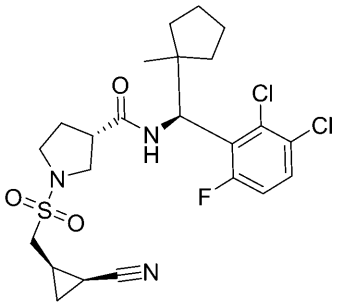
【表１－１０２２】

I-3303			549.5	B	
I-3304			540.5	B	A
I-3305			522.5	C	
I-3306			532.5	B	B

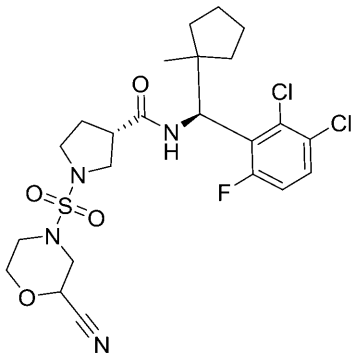
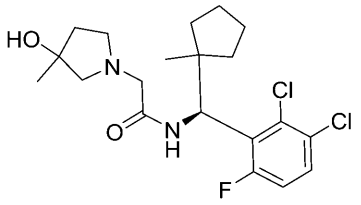
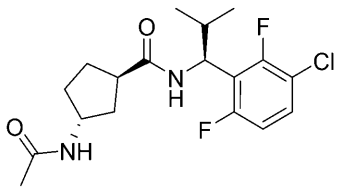
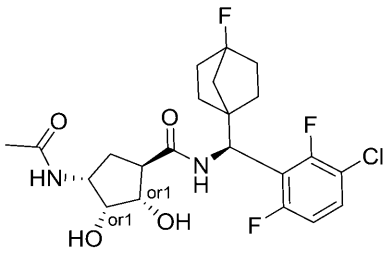
【表１－１０２３】

I-3307			548.5	D	
I-3308			530.5	C	
I-3309			517.5	B	A
I-3310			535.5	B	

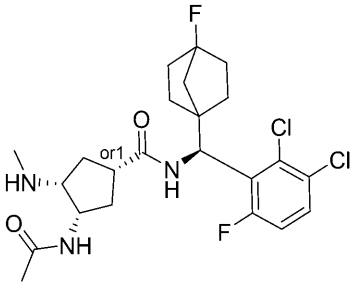
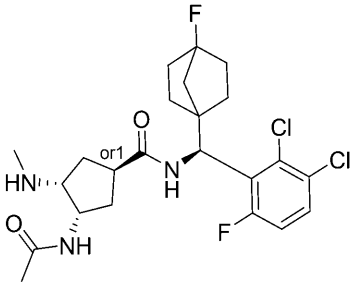
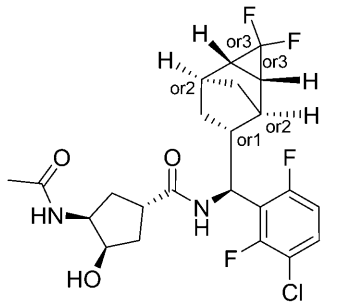
【表１－１０２４】

I-3311			509.5	B	
I-3312			549.5	C	
I-3313			517.5	D	
I-3314			517.5	B	A

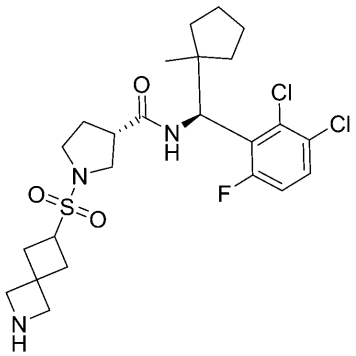
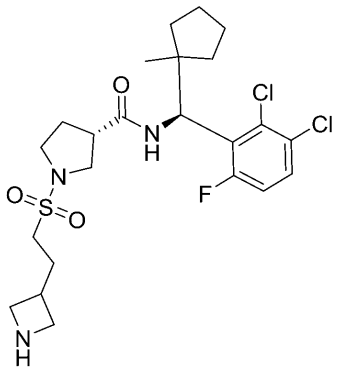
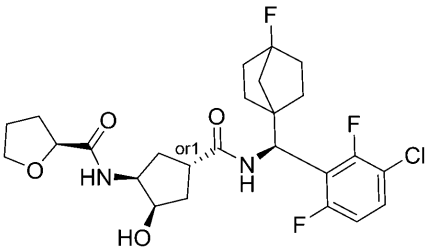
【表１－１０２５】

I-3315			548.5	B	
I-3316			418.4	D	
I-3317		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.31 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.18 - 7.07 (m, 1H), 4.82 - 4.68 (m, 1H), 3.99 (p, J = 6.5 Hz, 1H), 2.83 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 2.13 (q, J = 7.4 Hz, 1H), 1.93 - 1.69 (m, 6H), 1.61 (ddd, J = 13.5, 8.9, 5.5 Hz, 1H), 1.43 (dt, J = 12.1, 7.6 Hz, 1H), 1.35 (dt, J = 13.0, 7.0 Hz, 1H), 1.01 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 0.71 (d, J = 6.7 Hz, 3H).	372.95	D	
I-3318		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.62-7.51 (m, 2H), 7.21-7.11 (m, 1H), 5.34 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.99 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.91 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 4.00-3.88 (m, 1H), 3.92 (s, 2H), 3.72 (q, J = 3.5 Hz, 1H), 2.95-2.84 (m, 1H), 1.83 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 1.79 (s, 3H), 1.78-1.58 (m, 7H), 1.45 (dd, J = 18.3, 9.7 Hz, 2H).	475.3	E	

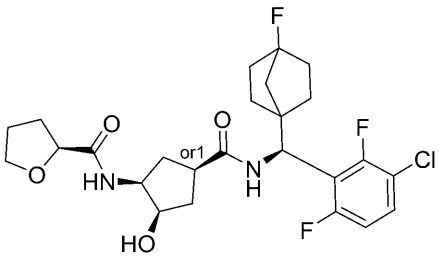
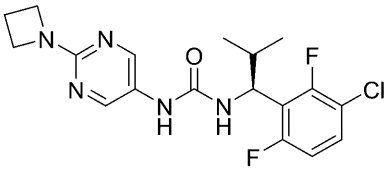
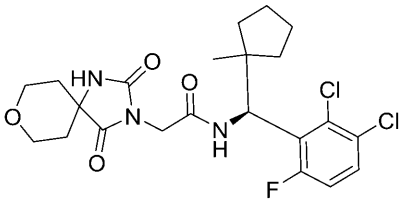
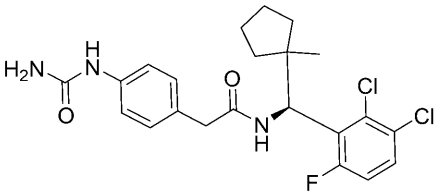
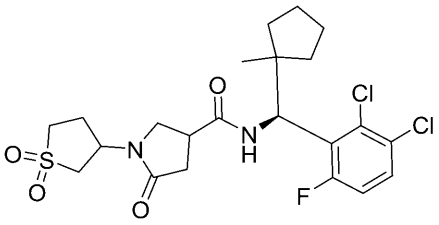
【表１－１０２６】

I-3319		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)8.07 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.92 (tq, J = 10.6, 5.4 Hz, 1H), 3.57 (p, J = 6.1 Hz, 1H), 3.19 (s, 2H), 2.90 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.15 (ddt, J = 28.7, 14.6, 7.6 Hz, 1H), 1.98-1.82 (m, 2H), 1.78 (d, J = 3.5 Hz, 5H), 1.72 (s, 2H), 1.70-1.56 (m, 5H), 1.58- 1.40 (m, 1H).	489.3	C	A
I-3320		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)8.07 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.92 (td, J = 7.4, 3.6 Hz, 1H), 3.57 (p, J = 6.0 Hz, 1H), 3.21 (d, J = 13.8 Hz, 3H), 2.90 (p, J = 8.4 Hz, 1H), 2.25-2.05 (m, 1H), 1.92 (dt, J = 13.6, 8.2 Hz, 1H), 1.78 (d, J = 3.5 Hz, 5H), 1.73 (s, 4H), 1.71 (dd, J = 12.4, 8.7 Hz, 1H), 1.70-1.55 (m, 3H), 1.50 (s, 1H).	489.3	C	B
I-3321		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.44 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.59 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 4.94 (dd, J = 11.9, 7.1 Hz, 1H), 4.75 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.90 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 2.63 (s, 2H), 2.10 (s, 1H), 1.99-1.89 (m, 2H), 1.80 (s, 3H), 1.72 (dd, J = 22.0, 11.2 Hz, 3H), 1.66-1.60 (m, 2H), 1.64-1.55 (m, 1H), 1.39 (d, J = 11.1 Hz, 1H), 1.03 (s, 2H).	489.15	D	

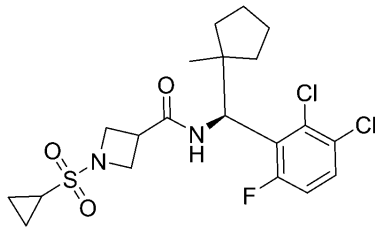
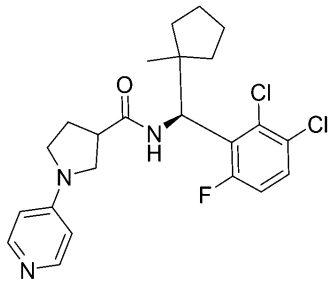
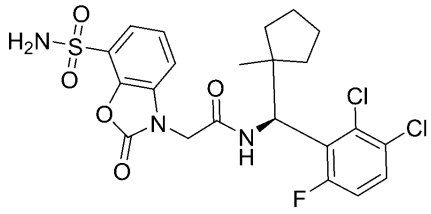
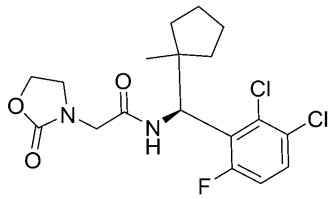
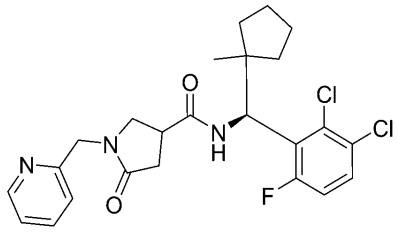
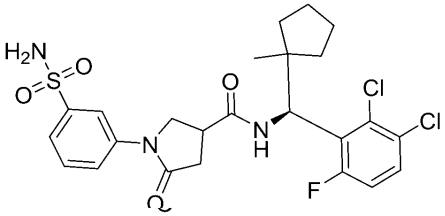
【表１－１０２７】

I-3322			533.5	B	
I-3323			521.5	B	B
I-3324		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.24 - 7.04 (m, 2H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.27 - 4.11 (m, 1H), 4.03 - 3.81 (m, 3H), 3.76 (dt, J = 8.0, 6.5 Hz, 1H), 3.10 (dt, J = 13.9, 6.9 Hz, 1H), 2.16 - 2.01 (m, 1H), 1.93 - 1.54 (m, 15H), 1.45 (d, J = 9.2 Hz, 2H).	515.3	C	

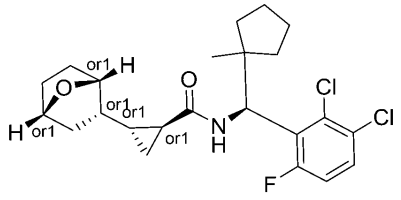
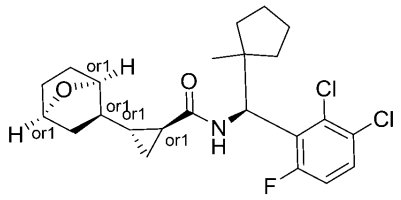
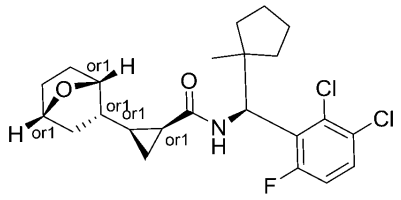
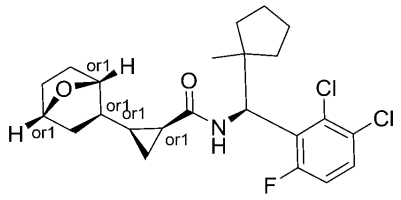
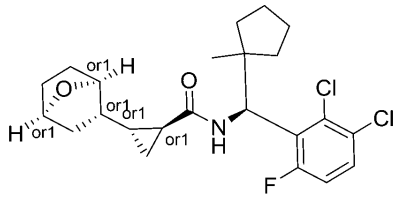
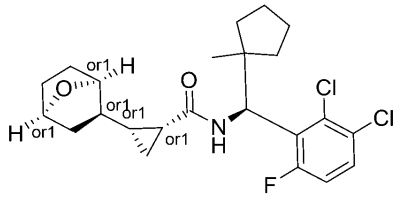
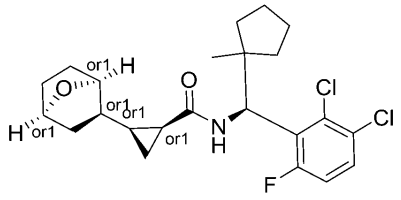
【表１－１０２８】

I-3325		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.17 - 5.05 (m, 1H), 4.20 (dd, J = 8.2, 5.0 Hz, 1H), 3.95 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 3.84 (q, J = 7.0, 6.5 Hz, 1H), 3.80 - 3.72 (m, 1H), 3.17 - 3.02 (m, 1H), 2.11 (dq, J = 10.5, 7.3 Hz, 1H), 1.99 - 1.55 (m, 15H), 1.53 - 1.30 (m, 2H).	515.3	C	
I-3326		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.31 (d, J = 13.2 Hz, 3H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.19 (td, J = 9.4, 1.7 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 4.84 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 3.96 (t, J = 7.5 Hz, 4H), 2.26 (p, J = 7.4 Hz, 2H), 2.05 (q, J = 7.8, 7.4 Hz, 1H), 1.02 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.76 (d, J = 6.7 Hz, 3H).	396.2	D	
I-3327				C	
I-3328				B	B
I-3329				B	

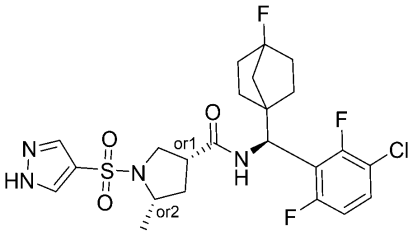
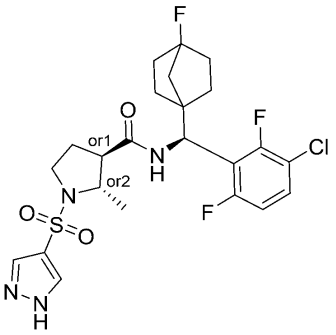
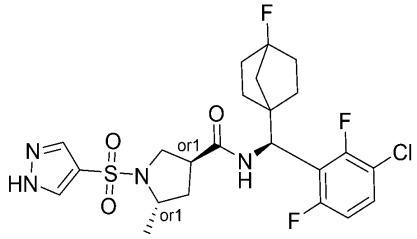
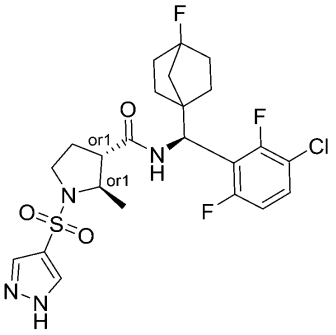
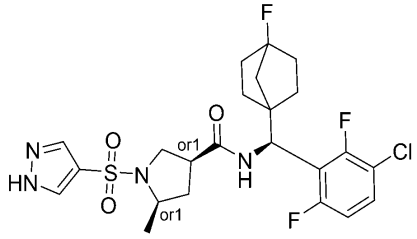
【表１－１０２９】

I-3330				B	
I-3331				B	
I-3332				A	A
I-3333				B	B
I-3334				B	
I-3335				B	

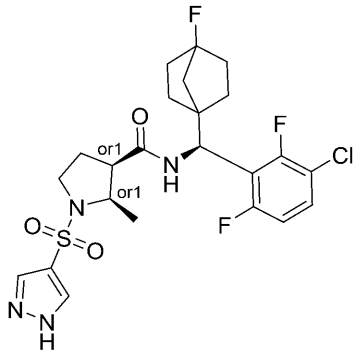
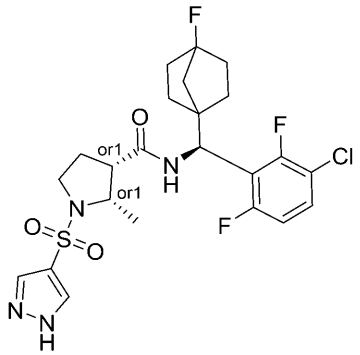
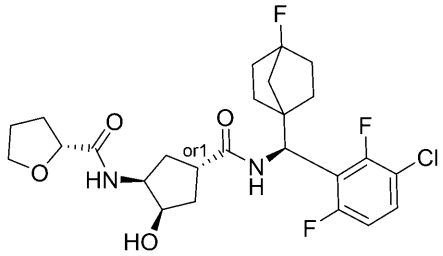
【表１－１０３０】

I-3336			440.1	D	
I-3337			440.05	C	
I-3338			440.1	D	
I-3339			440.05	D	
I-3340			440.1	E	
I-3341			440.1	D	
I-3342			440.1	E	

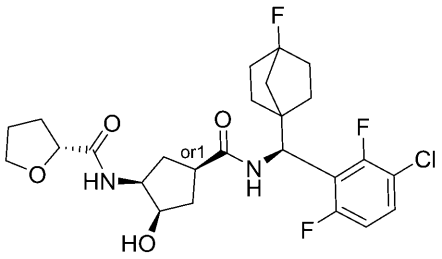
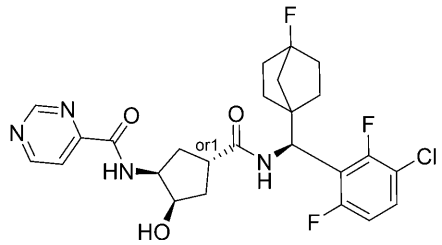
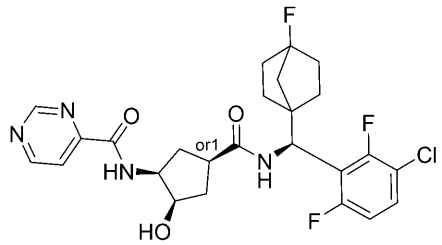
【表１－１０３１】

I-3343			531.1	B	A
I-3344			531.1	D	
I-3345			531.1	C	
I-3346			531.15	B	A
I-3347			531.15	D	

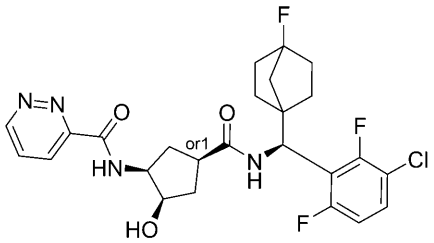
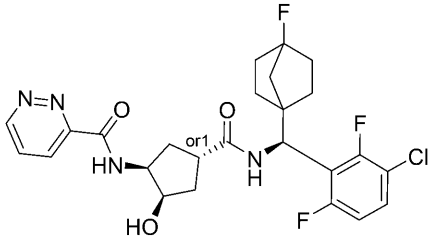
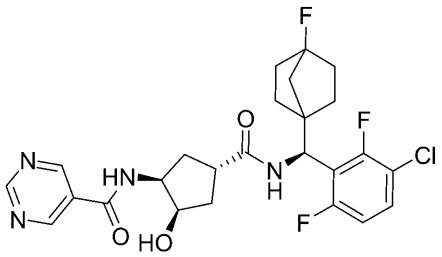
【表１－１０３２】

I-3348			531.1	C	
I-3349			531.1	B	B
I-3350		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.60 - 7.52 (m, 1H), 7.22 - 7.10 (m, 2H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 4.19 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.99 (s, 1H), 3.91 (dd, J = 8.3, 4.3 Hz, 1H), 3.83 (q, J = 7.0, 6.5 Hz, 1H), 3.76 (q, J = 7.7, 7.2 Hz, 1H), 3.15 - 3.06 (m, 1H), 2.14- 2.05 (m, 1H), 1.87 - 1.57 (m, 15H), 1.45 (d, J = 8.8 Hz, 2H).	515.1	C	

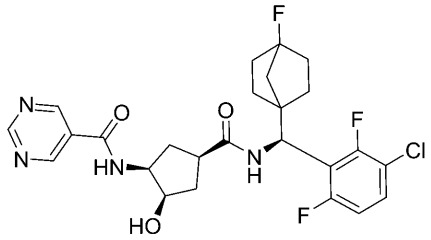
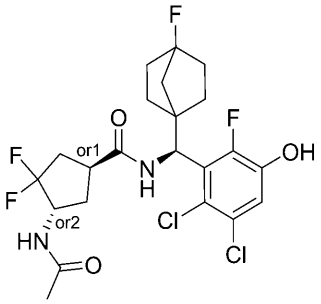
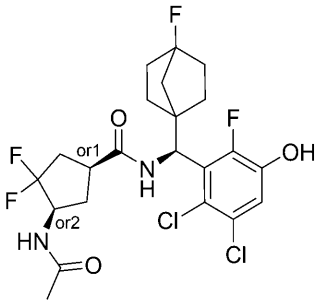
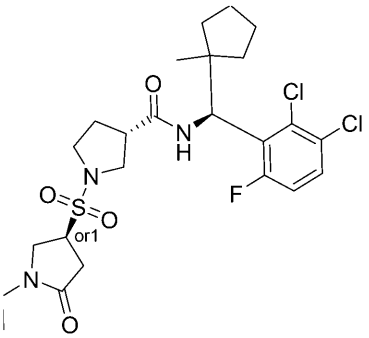
【表１－１０３３】

I-3351		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.22 - 7.10 (m, 2H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 4.21 (dd, J = 8.3, 5.2 Hz, 1H), 4.00 - 3.90 (m, 2H), 3.86 (dt, J = 8.1, 6.4 Hz, 1H), 3.76 (dt, J = 8.1, 6.6 Hz, 1H), 3.11 (tt, J = 13.6, 6.6 Hz, 1H), 2.10 (tt, J = 9.1, 3.0 Hz, 1H), 1.92 (ddd, J = 12.9, 8.1, 4.9 Hz, 1H), 1.87 - 1.56 (m, 14H), 1.45 (d, J = 9.2 Hz, 2H).	515.15	B	
I-3352		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.33 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 5.0, 1.4 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.18 - 7.11 (m, 1H), 5.33 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.14 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 3.23 - 3.14 (m, 1H), 1.93 - 1.66 (m, 11H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.9 Hz, 2H).	523.35	B	B
I-3353		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.34 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.05 (dd, J = 5.0, 1.4 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.31 (dd, J = 17.5, 6.1 Hz, 2H), 4.23 - 4.09 (m, 2H), 3.17 (dt, J = 13.8, 6.8 Hz, 1H), 2.06 (ddd, J = 13.0, 8.2, 5.0 Hz, 1H), 1.79 (ddt, J = 26.9, 19.0, 11.3 Hz, 10H), 1.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.3 Hz, 2H).	523.35	B	B

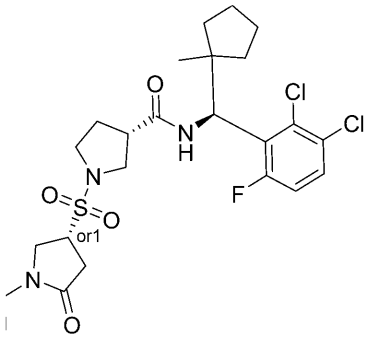
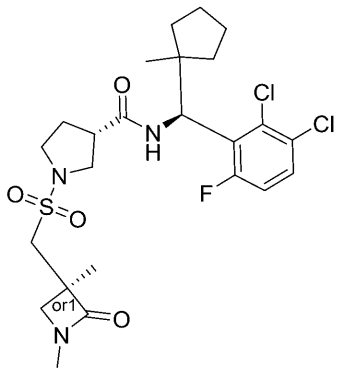
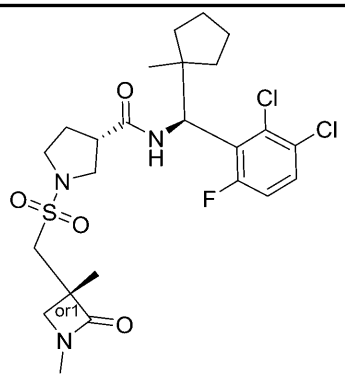
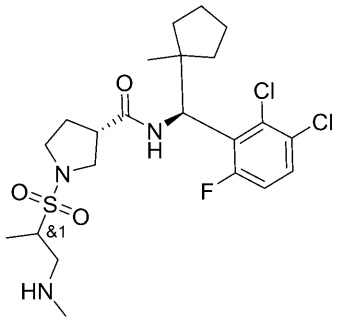
【表１－１０３４】

I-3354		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.42 (dd, J = 5.0, 1.7 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.30 - 8.20 (m, 2H), 7.93 (dd, J = 8.4, 5.0 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 1H), 5.34 - 5.26 (m, 2H), 4.24 (qd, J = 8.3, 4.4 Hz, 1H), 4.17 - 4.10 (m, 1H), 3.25 - 3.15 (m, 1H), 2.08 (ddd, J = 13.1, 8.3, 5.0 Hz, 1H), 2.03 - 1.63 (m, 10H), 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.0 Hz, 2H).	523.3	B	A
I-3355		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.41 (dd, J = 5.0, 1.7 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.31 - 8.19 (m, 2H), 7.92 (dd, J = 8.5, 5.0 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.19 - 7.11 (m, 1H), 5.37 - 5.25 (m, 2H), 4.20 (ddd, J = 16.0, 8.1, 3.7 Hz, 2H), 3.20 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 1.96 -1.67 (m, 11H), 1.61 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.9 Hz, 2H).	523.35	C	
I-3356		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.29 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 9.17 (d, J = 1.1 Hz, 2H), 8.43 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.88 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.20 - 4.12 (m, 1H), 4.10 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 3.17 (dt, J = 13.0, 6.4 Hz, 1H), 2.06 - 1.88 (m, 2H), 1.86 - 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 10H), 1.47 (d, J = 8.3 Hz, 2H).	523.3	B	A

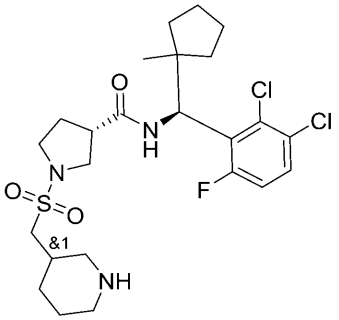
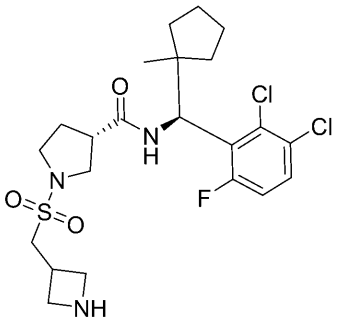
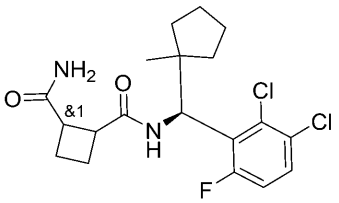
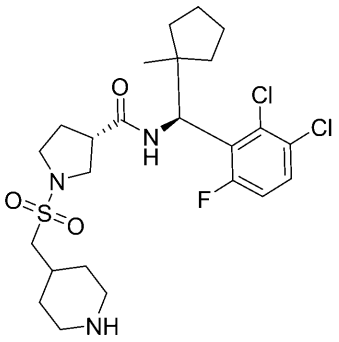
【表１－１０３５】

I-3357		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.28 (s, 1H), 9.15 (s, 2H), 8.42 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.5, 1.6 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.88 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 4.19 - 4.08 (m, 2H), 3.21 - 3.13 (m, 1H), 1.96 - 1.68 (m, 11H), 1.61 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.47 (d, J = 8.9 Hz, 2H).	523.35	C	
I-3358		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.18 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.46 (dq, J = 17.9, 8.9 Hz, 1H), 3.13 - 3.06 (m, 1H), 2.26 (s, 1H), 2.21 (dt, J = 18.1, 6.8 Hz, 1H), 1.97 (ddt, J = 12.5, 8.6, 4.8 Hz, 1H), 1.86 (s, 3H), 1.86 - 1.52 (d, J = 12.6 Hz, 11H).	511	B	A
I-3359		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.46 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.41 (dt, J = 18.1, 9.0 Hz, 1H), 3.18 - 3.08 (m, 1H), 2.28 (s, 2H), 1.86 - 1.58 (td, J = 30.3, 28.4, 13.0 Hz, 15H).	511.2	D	
I-3360				B	B

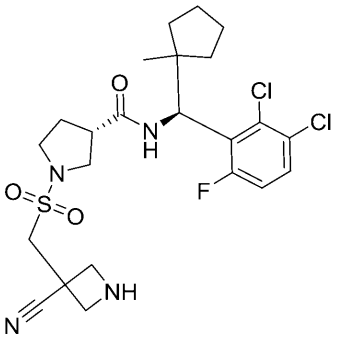
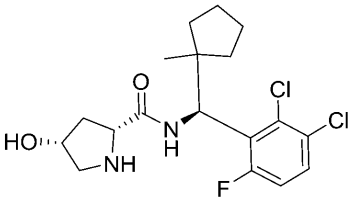
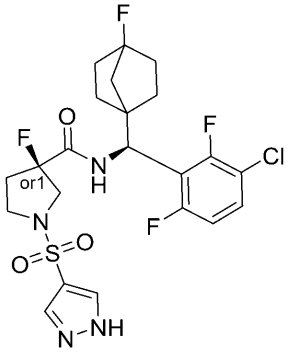
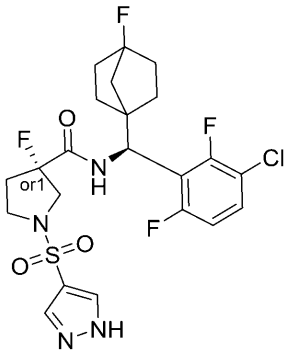
【表１－１０３６】

I-3361				B	
I-3362				C	
I-3363				B	
I-3364			509.5	B	

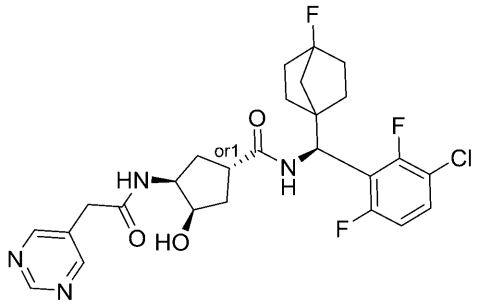
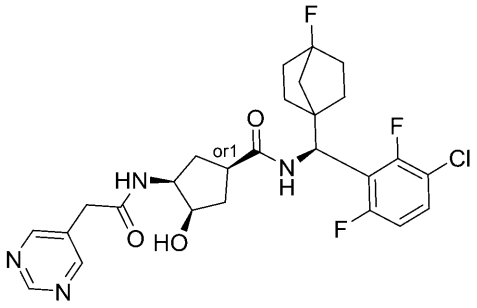
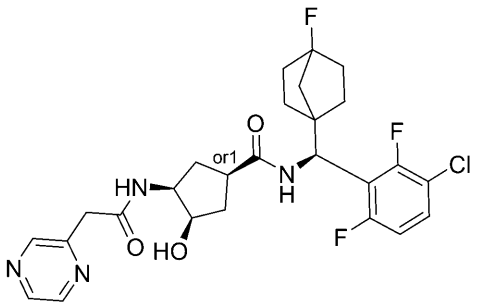
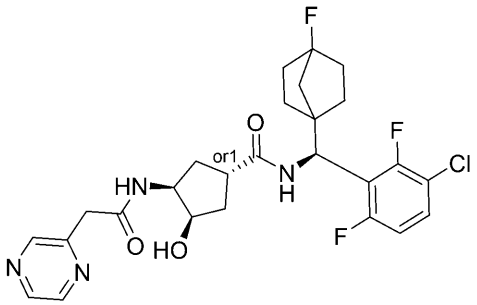
【表１－１０３７】

I-3365			535.5	B	
I-3366			507.5	B	
I-3367			402.3	E	
I-3368			535.5	B	

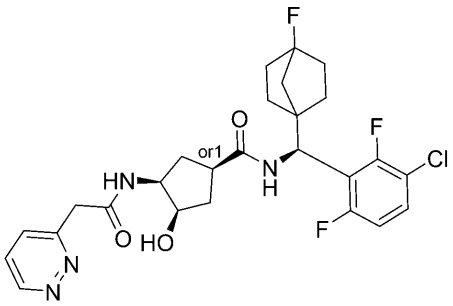
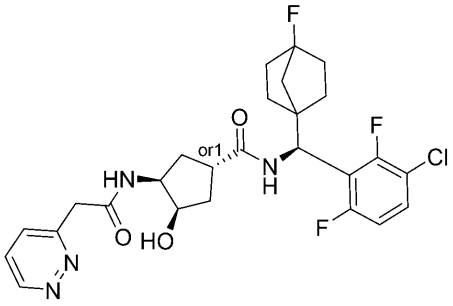
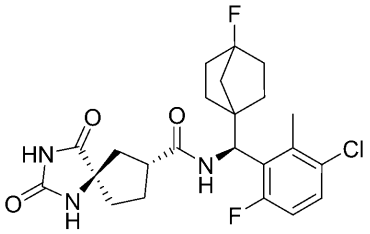
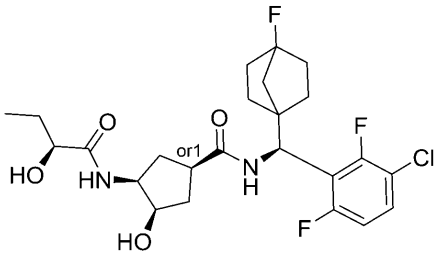
【表１－１０３８】

I-3369			532.5	B	
I-3370			390.3	D	
I-3371			535.05	D	
I-3372			535.05	D	

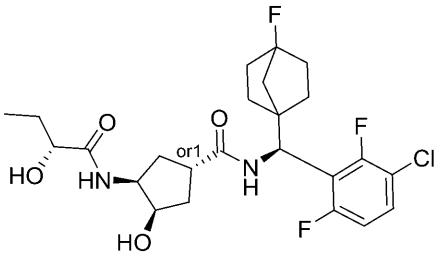
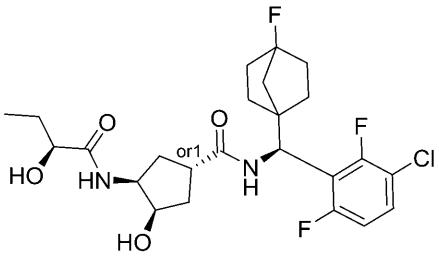
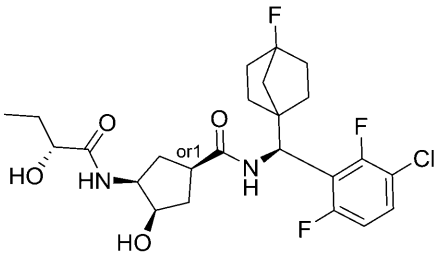
【表１－１０３９】

I-3373			537.15	B	B
I-3374			537.15	D	
I-3375			537.15	D	
I-3376			537.15	B	B

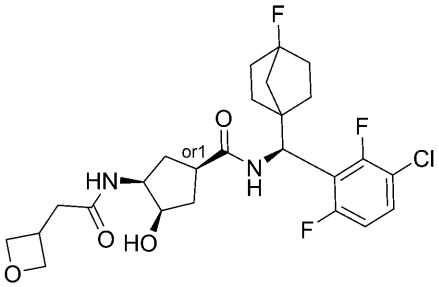
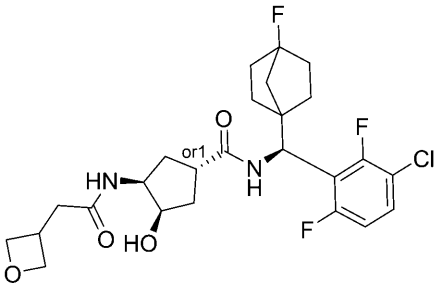
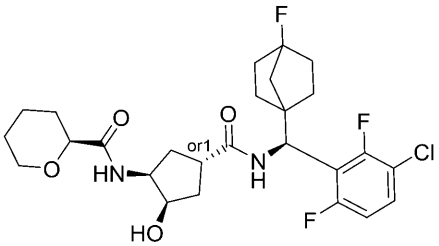
【表１－１０４０】

I-3377		-	537.1	C	
I-3378		-	537.1	B	B
I-3379		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.62 (s, 1H), 8.32 - 8.28 (m, 1H), 8.25 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.8, 4.8 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 11.0, 8.7 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.02 (q, J = 9.0, 8.4 Hz, 1H), 2.43 (s, 3H), 2.11 (dd, J = 13.1, 10.1 Hz, 1H), 2.00 - 1.83 (m, 5H), 1.65 (t, J = 8.8 Hz, 6H), 1.53 (s, 4H).	466.25	A	A
I-3380		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 3.99 - 3.90 (m, 2H), 3.80 (dt, J = 6.6, 4.4 Hz, 1H), 3.16 - 3.07 (m, 1H), 1.98 -1.90 (m, 1H), 1.76 (dd, J = 20.3, 10.5 Hz, 7H), 1.70 - 1.57 (m, 5H), 1.49 (td, J = 13.1, 12.0, 6.7 Hz, 3H), 0.84 (t, J = 7.4 Hz, 3H).	503.15	B	

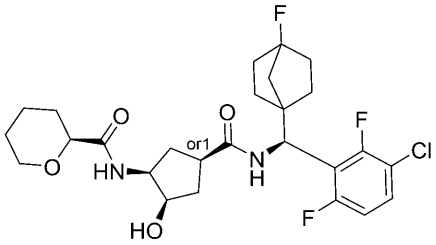
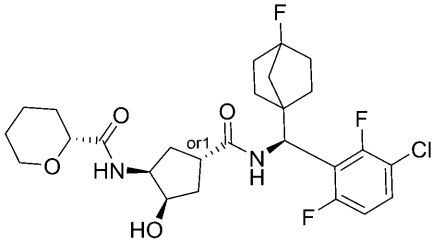
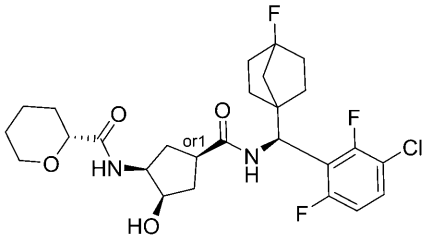
【表１－１０４１】

I-3381		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 3.99 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.91 (dd, J = 8.2, 4.2 Hz, 1H), 3.79 (dt, J = 6.3, 4.2 Hz, 1H), 3.10 (dt, J = 13.6, 6.9 Hz, 1H), 2.03 - 1.54 (m, 13H), 1.49 - 1.19 (m, 3H), 0.82 (t, J = 7.4 Hz, 3H).	503.2	C	
I-3382		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.5, 9.0, 1.6 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.98 (p, J = 3.5 Hz, 1H), 3.90 (tt, J = 8.4, 4.2 Hz, 1H), 3.78 (dt, J = 7.1, 4.4 Hz, 1H), 3.17 - 3.07 (m, 1H), 1.85 - 1.76 (m, 5H), 1.75 - 1.66 (m, 5H), 1.62 (ddd, J = 16.7, 7.6, 3.6 Hz, 3H), 1.46 (p, J = 7.2 Hz, 3H), 0.84 (t, J = 7.4 Hz, 3H).	503.15	C	
I-3383		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 5.35 - 5.19 (m, 1H), 5.10 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 3.94 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 3.79 (dt, J = 7.1, 4.6 Hz, 1H), 3.18 - 3.01 (m, 1H), 1.95 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 1.88 - 1.56 (m, 12H), 1.48 (dd, J = 14.6, 7.7 Hz, 3H), 0.84 (t, J = 7.4 Hz, 3H).	503.2	C	

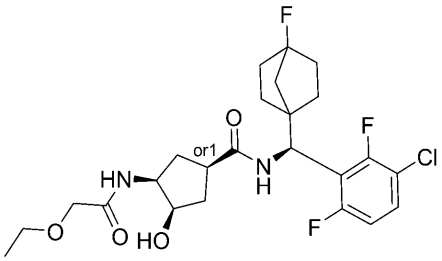
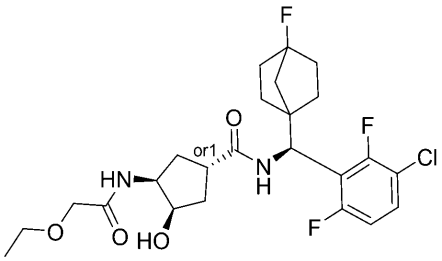
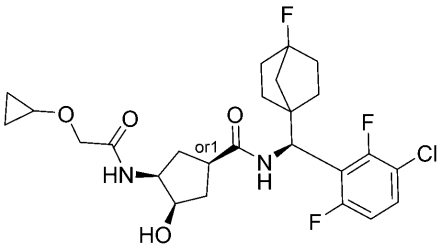
【表１－１０４２】

I-3384		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 8.4, 5.7 Hz, 2H), 7.20 - 7.04 (m, 1H), 5.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.61 (ddd, J = 8.0, 5.9, 2.4 Hz, 2H), 4.27 (q, J = 6.2 Hz, 2H), 4.07 - 3.76 (m, 2H), 3.25 - 3.03 (m, 2H), 2.51 (s, 1H), 196 - 1.65 (m, 12H), 1.45 (d, J = 9.5 Hz, 2H).	515.2	B	A
I-3385		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.79 - 7.46 (m, 2H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.62 (dd, J = 7.9, 5.9 Hz, 2H), 4.28 (td, J = 6.1, 4.4 Hz, 2H), 3.90 (d, J = 10.1 Hz, 2H), 3.17 (p, J = 7.3 Hz, 1H), 3.13 - 3.04 (m, 1H), 1.94 - 1.57 (m, 10H), 1.59 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 1.51 - 1.39 (m, 2H).	515.2	D	
I-3386		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.5, 1.6 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.17 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 4.03 - 3.87 (m, 3H), 3.69 (dd, J = 11.4, 2.4 Hz, 1H), 3.42 (td, J = 11.0, 3.4 Hz, 1H), 3.10 (qd, J = 8.6, 5.0 Hz, 1H), 1.90 - 1.76 (m, 7H), 1.72 (td, J = 8.2, 3.6 Hz, 5H), 1.66 - 1.57 (m, 2H), 1.53 - 1.40 (m, 5H), 1.30 - 1.22 (m, 1H).	529.15	C	

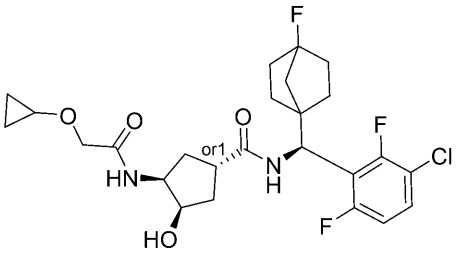
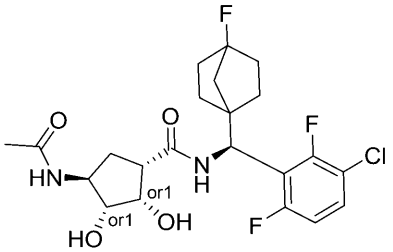
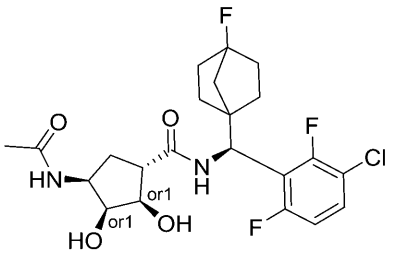
【表１－１０４３】

I-3387		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.18 - 7.11 (m, 1H), 7.05 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.14 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.96 (dd, J = 8.1, 4.1 Hz, 3H), 3.70 (dd, J = 11.4, 2.5 Hz, 1H), 3.43 (td, J = 10.9, 3.5 Hz, 1H), 3.11 (qd, J = 8.7, 4.8 Hz, 1H), 1.92 (td, J = 12.7, 12.2, 4.1 Hz, 2H), 1.83 - 1.72 (m, 7H), 1.71 - 1.57 (m, 5H), 1.53 - 1.41 (m, 5H), 1.31 - 1.22 (m, 1H).	529.15	B	
I-3388		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.38 - 3.88 (m, 3H), 3.68 (dd, J = 11.3, 2.5 Hz, 1H), 3.59 - 3.33 (m, 1H), 3.10 (dd, J = 9.7, 5.2 Hz, 1H), 2.12 - 1.55 (m, 15H), 1.47 (s, 4H), 1.24 (t, J = 12.0 Hz, 1H).	529.15	D	
I-3389		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.16 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 3.97 (d, J = 7.3 Hz, 3H), 3.71 (dd, J = 11.4, 2.4 Hz, 1H), 3.44 (t, J = 10.7 Hz, 1H), 3.10 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 2.08 - 1.84 (m, 14H), 1.47 (d, J = 8.0 Hz, 5H), 1.35 - 1.13 (m, 1H).	529.15	C	

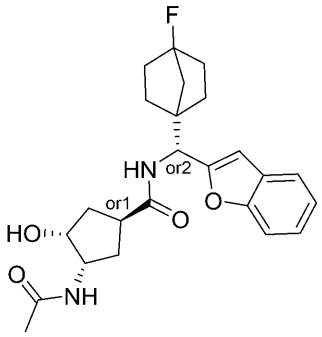
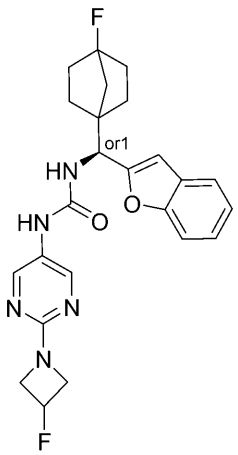
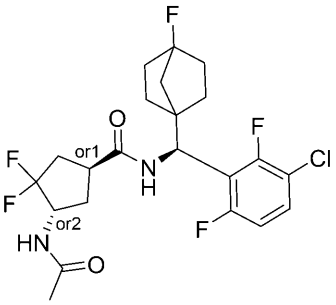
【表１－１０４４】

I-3390		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (q, J = 9.3, 8.0 Hz, 2H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.22 - 5.04 (m, 1H), 3.98 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 3.83 (s, 2H), 3.50 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 3.21 - 2.97 (m, 1H), 2.05 - 1.55 (m, 11H), 1.45 (d, J = 9.5 Hz, 3H), 1.15 (t, J = 7.0 Hz, 3H).	503.1	C	
I-3391		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.0 Hz, 2H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 4.16 - 3.88 (m, 2H), 3.81 (s, 2H), 3.49 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 3.20 - 3.03 (m, 1H), 2.03 - 1.55 (m, 11H), 1.65 - 1.36 (m, 3H), 1.14 (t, J = 7.0 Hz, 3H).	503.1	D	
I-3392		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.1 Hz, 2H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.98 (d, J = 6.5 Hz, 2H), 3.89 (s, 2H), 3.42 (tt, J = 5.9, 3.0 Hz, 1H), 3.12 (ddt, J = 18.7, 13.4, 7.0 Hz, 1H), 1.99 - 1.88 (m, 1H), 1.87 - 1.54 (m, 10H), 1.45 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 0.55 (h, J = 2.6 Hz, 2H), 0.46 (dt, J = 6.1, 2.3 Hz, 2H).	515.1	B	B

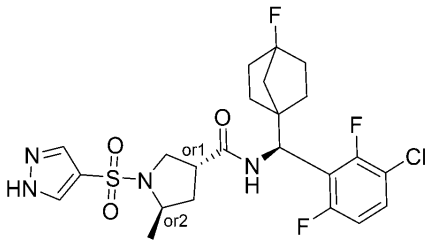
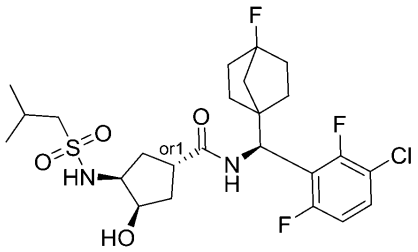
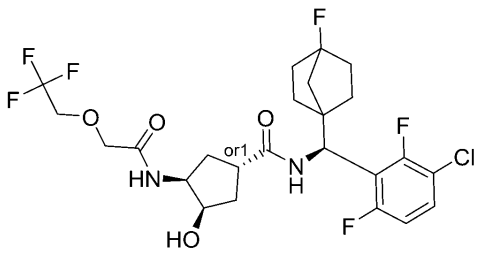
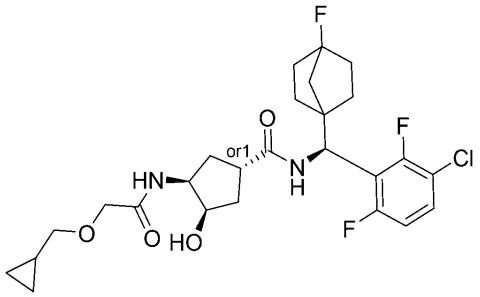
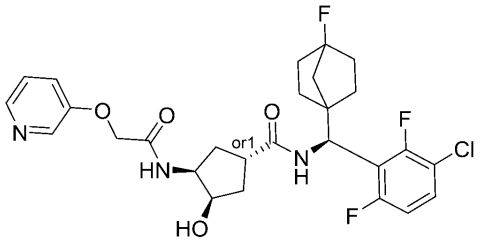
【表１－１０４５】

I-3393		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.31 - 6.97 (m, 2H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.11 (s, 1H), 4.11 - 3.76 (m, 4H), 3.41 (tt, J = 6.0, 2.9 Hz, 1H), 3.12 (ddd, J = 23.3, 12.5, 6.2 Hz, 1H), 2.02-1.50 (m, 11H), 1.45 (d, J = 9.4 Hz, 2H), 0.54 (p, J = 2.8, 2.3 Hz, 2H), 0.45 (dq, J = 5.9, 3.1, 2.6 Hz, 2H).	515.1	C	
I-3394		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.16 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 3.97 (d, J = 7.3 Hz, 3H), 3.71 (dd, J = 11.4, 2.4 Hz, 1H), 3.44 (t, J = 10.7 Hz, 1H), 3.10 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 2.08 - 1.84 (m, 14H), 1.47 (d, J = 8.0 Hz, 5H), 1.35 - 1.13 (m, 1H).	475	D	
I-3395		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.38 - 3.88 (m, 3H), 3.68 (dd, J = 11.3, 2.5 Hz, 1H), 3.59 - 3.33 (m, 1H), 3.10 (dd, J = 9.7, 5.2 Hz, 1H), 2.12 - 1.55 (m, 15H), 1.47 (s, 4H), 1.24 (t, J = 12.0 Hz, 1H).	475.1	E	

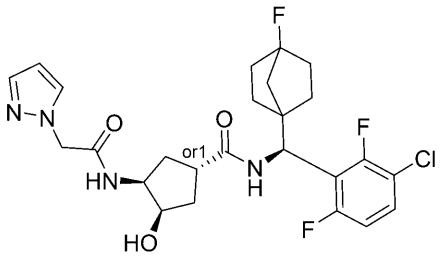
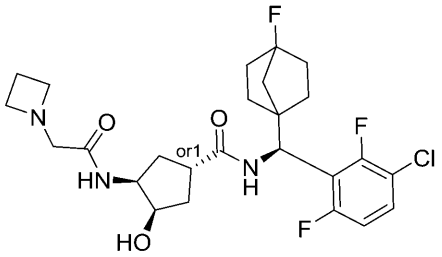
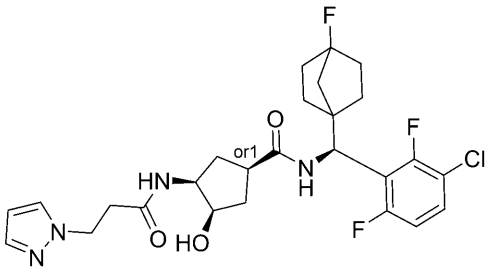
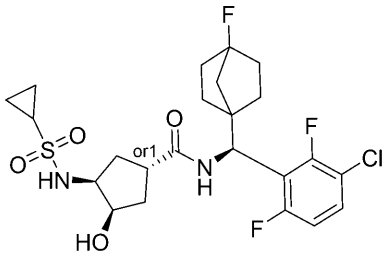
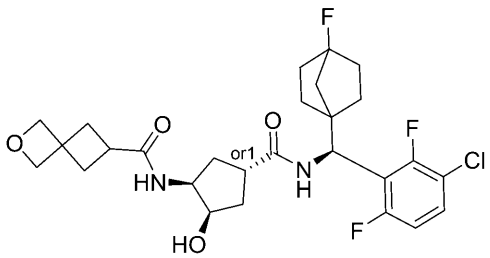
【表１－１０４６】

I-3396		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.44 - 8.39 (m, 2H), 8.25 (s, 1H), 7.59 (dd, J = 7.3, 1.8 Hz, 2H), 7.31 - 7.18 (m, 2H), 7.00 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 6.73 (s, 1H), 5.54 - 5.39 (tt, J = 6.0, 3.1 Hz, 1H), 5.06 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.30 (dddd, J = 21.6, 10.5, 5.9, 1.5 Hz, 2H), 4.01 (dddd, J = 24.7, 10.5, 3.2, 1.5 Hz, 2H), 1.80 (dt, J = 32.2, 7.3 Hz, 7H), 1.65 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.52 - 1.40 (m, 2H).	454.3		
I-3397		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.17 (q, J = 9.4, 8.8 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.46 (dt, J = 18.0, 9.0 Hz, 1H), 3.09 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 2.32-2.15 (m, 2H), 1.98 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 1.85 (s, 3H), 1.86-1.69 (m, 8H), 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (s, 2H).	479.3	D	
I-3398			531.1	B	A

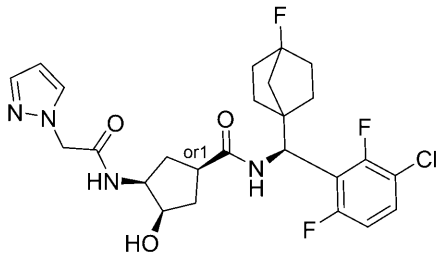
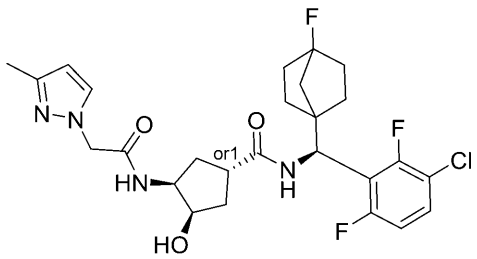
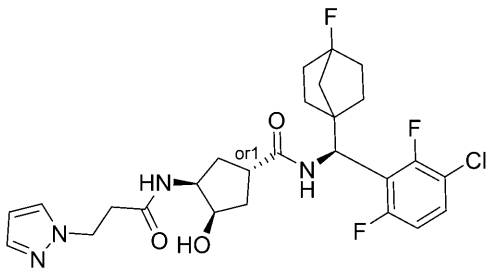
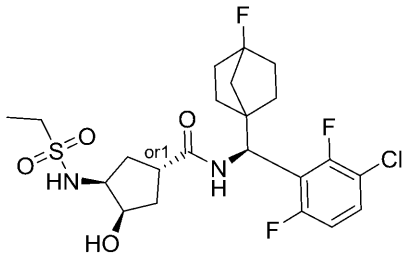
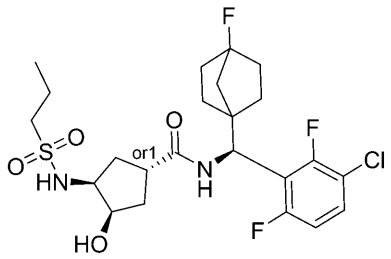
【表１－１０４７】

I-3399			537.15	B	A
I-3400			557.1	C	
I-3401			529.15	C	
I-3402			552.15	C	
I-3403			525.15	B	A

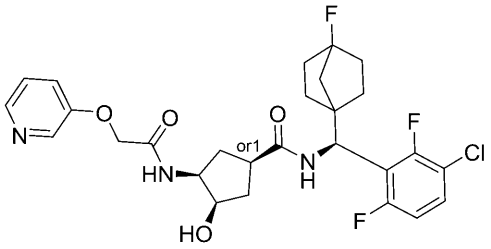
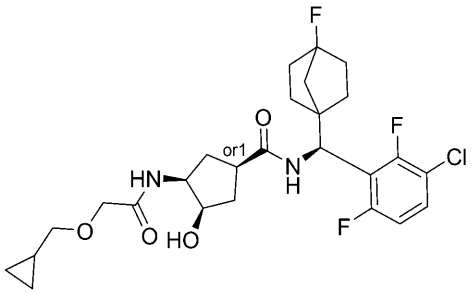
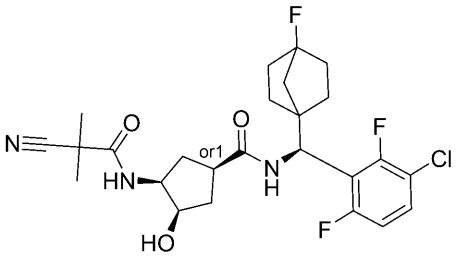
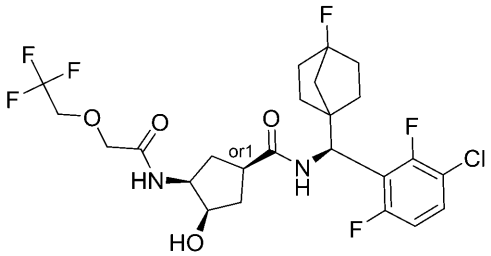
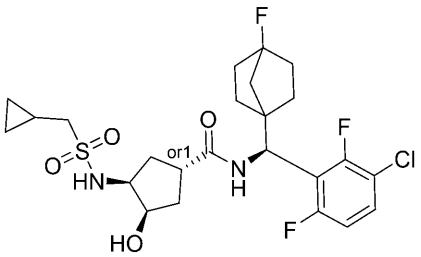
【表１－１０４８】

I-3404			514.15	B	
I-3405			539.15	C	
I-3406			521.1	C	
I-3407			541.15	C	
I-3408			525.15	D	

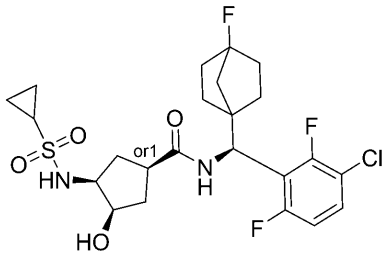
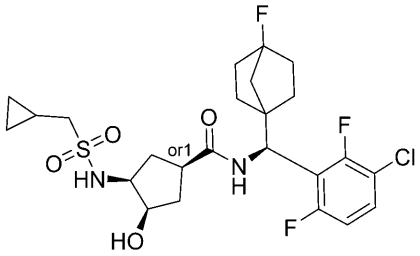
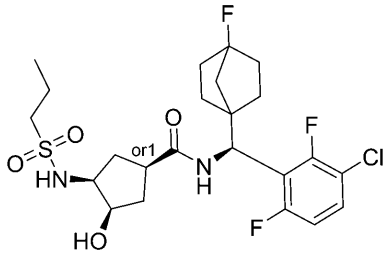
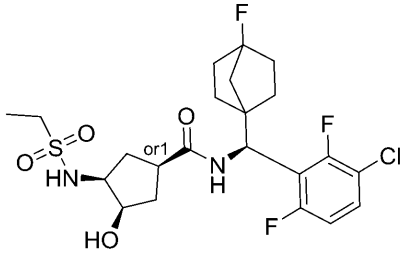
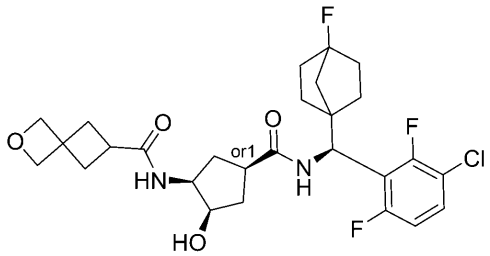
【表１－１０４９】

I-3409			539.15	B	A
I-3410			539.15	D	
I-3411			509.1	B	A
I-3412			523.05	C	
I-3413			552.1	C	

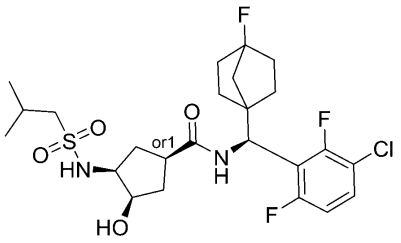
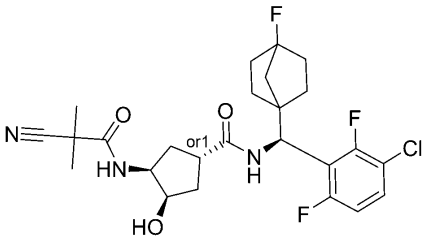
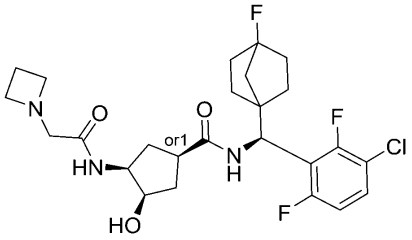
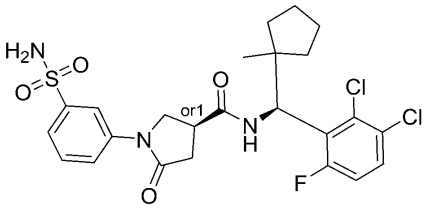
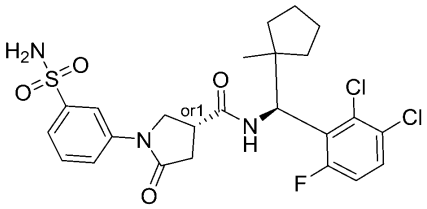
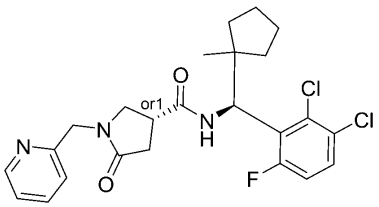
【表１－１０５０】

I-3414			529.15	B	A
I-3415			512.15	C	
I-3416			557.1	B	
I-3417			533.1	C	
I-3418			521.1	D	

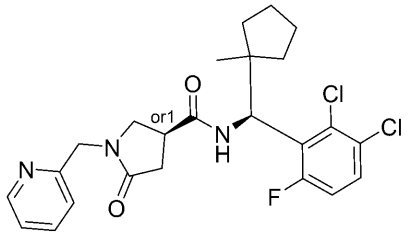
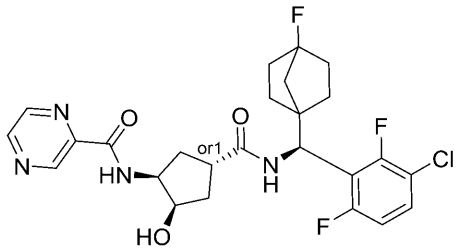
【表１－１０５１】

I-3419			535.1	B	B
I-3420			523.1	C	
I-3421			509.1	C	
I-3422			541.15	B	
I-3423			537.15	B	B

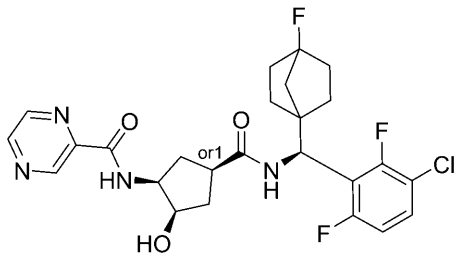
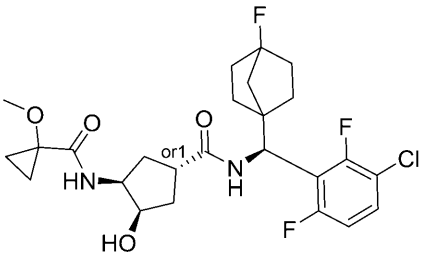
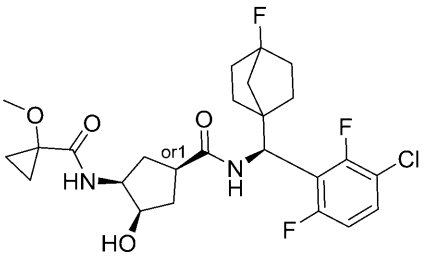
【表１－１０５２】

I-3424			512.15	C	
I-3425			514.15	C	
I-3426				B	B
I-3427				B	
I-3428				A	B
I-3429				D	

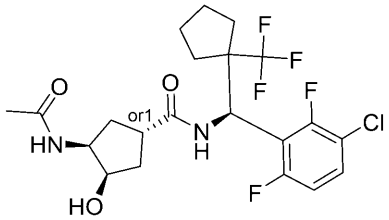
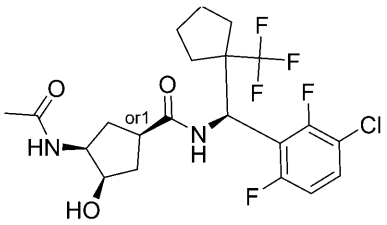
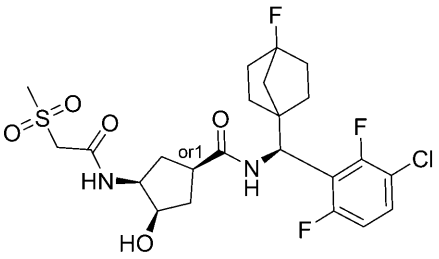
【表１－１０５３】

I-3430		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)? 9.21 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 2.5, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (s, 1H), 5.30 (dd, J = 12.5, 6.1 Hz, 2H), 4.25 - 4.15 (m, 1H), 4.11 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 3.17 (dt, J = 13.7, 6.8 Hz, 1H), 2.05 (ddd, J = 13.1, 8.3, 5.0 Hz, 1H), 1.78 (ddt, J = 33.0, 21.9, 12.5 Hz, 12H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.8 Hz, 3H).	523.1	B	A
I-3431		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.19 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.89 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 2.5, 1.5 Hz, 1H), 8.32 (dd, J = 20.2, 7.8 Hz, 2H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.32 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.15 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 3.18 (p, J = 8.5 Hz, 1H), 2.36-2.26 (m, 1H), 1.94-1.66 (m, 11H), 1.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 9.3 Hz, 2H).	523.1	B	A

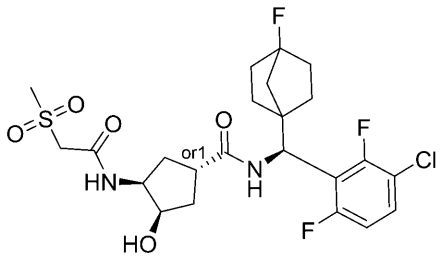
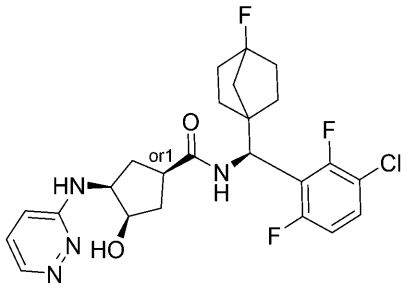
【表１－１０５４】

I-3432		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.07 - 3.91 (m, 2H), 3.26 (s, 3H), 3.13 (p, J = 8.0 Hz, 1H), 1.87 - 1.67 (m, 11H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 9.1 Hz, 2H), 1.07 - 0.95 (m, 4H).	515.15	B	
I-3433		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.19 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 4.00 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 3.13 (dt, J = 13.6, 6.9 Hz, 1H), 1.93 (s, 1H), 1.83 - 1.64 (m, 10H), 1.60 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 1.02 (dt, J = 12.8, 3.4 Hz, 4H).	515.15	B	
I-3434		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.34 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.63 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24 - 7.16 (m, 1H), 5.77 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.00 - 3.85 (m, 2H), 3.15 (p, J = 8.1 Hz, 1H), 1.99 - 1.86 (m, 3H), 1.85 - 1.70 (m, 6H), 1.69 - 1.60 (m, 3H), 1.60 - 1.50 (m, 3H).	483.05	C	

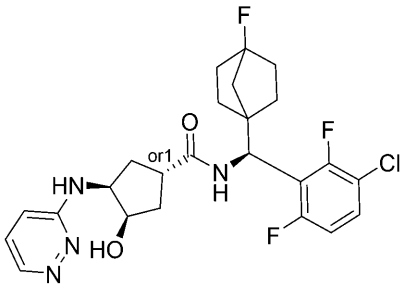
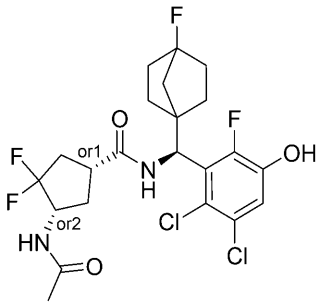
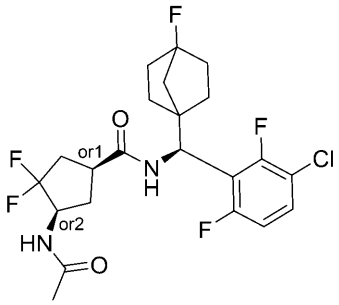
【表１－１０５５】

I-3435		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.35 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.63 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.24 - 7.16 (m, 1H), 5.79 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.98 - 3.87 (m, 2H), 3.20 - 3.10 (m, 1H), 1.92 (dp, J = 10.9, 5.8, 4.8 Hz, 3H), 1.85 - 1.72 (m, 6H), 1.67 (dd, J = 8.7, 2.9 Hz, 3H), 1.55 (s, 3H).	483.1	D	
I-3436		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) ?8.25 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.95 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.14 (d, J = 3.5 Hz, 2H), 3.96 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 3.10 (s, 4H), 1.96-1.85 (m, 1H), 1.84-1.55 (m, 11H), 1.46 (d, J = 10.2 Hz, 2H).	537.05	C	
I-3437		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.95 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.19-4.06 (m, 2H), 4.01 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 3.97-3.86 (m, 1H), 3.08 (s, 4H), 1.88-1.64 (m, 11H), 1.59 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 9.7 Hz, 2H).	537.15	B	B

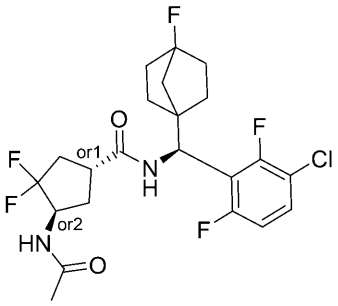
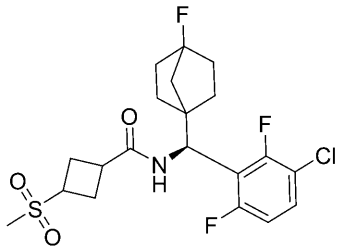
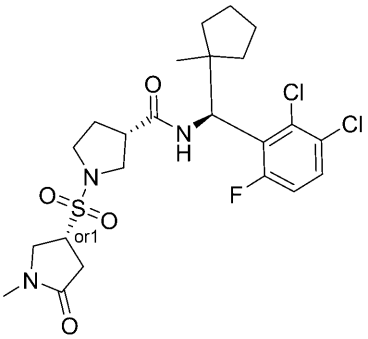
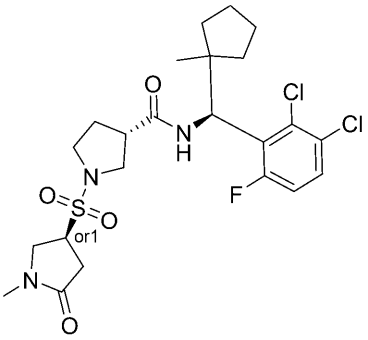
【表１－１０５６】

I-3438		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (dd, J = 4.4, 1.4 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.30 - 7.04 (m, 2H), 6.90 (dd, J = 9.1, 1.4 Hz, 1H), 6.50 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.88 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.28 - 4.10 (m, 2H), 3.14 (dd, J = 12.7, 7.9 Hz, 1H), 2.02 (ddd, J = 12.7, 8.1, 4.8 Hz, 1H), 1.90 - 1.78 (m, 4H), 1.77 - 1.65 (m, 6H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.6 Hz, 2H).	495.3	C	
I-3439		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.38 (dd, J = 4.4, 1.4 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.24 - 7.08 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 9.0, 1.4 Hz, 1H), 6.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.86 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.39 - 4.06 (m, 2H), 3.15 (tt, J = 13.5, 6.6 Hz, 1H), 2.12 - 1.94 (m, 1H), 1.90 - 1.65 (m, 10H), 1.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H).	495.15	A	A

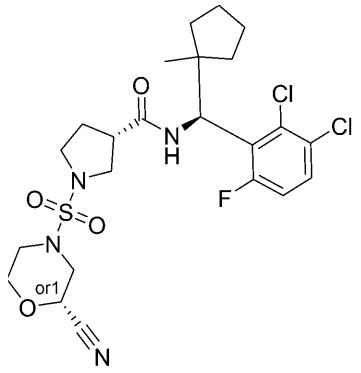
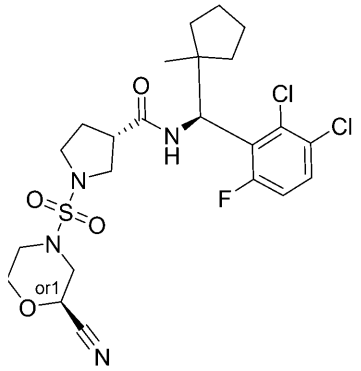
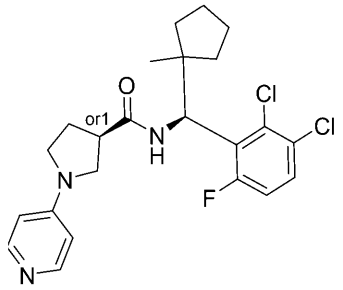
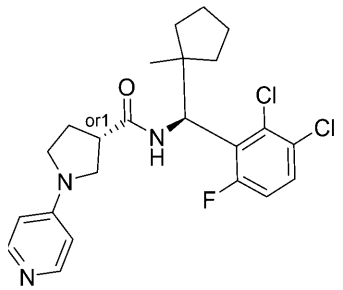
【表１－１０５７】

I-3440		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (dd, J = 4.3, 1.4 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.22 - 7.10 (m, 2H), 6.87 (dd, J = 9.0, 1.5 Hz, 1H), 6.47 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.88 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.17 (d, J = 5.5 Hz, 2H), 3.15 (qd, J = 8.6, 6.0 Hz, 1H), 1.93 - 1.85 (m, 2H), 1.84 - 1.74 (m, 6H), 1.71 (d, J = 12.3 Hz, 3H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 9.1 Hz, 2H).	495.35	B	
I-3441		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.28 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.48 - 4.30 (m, 1H), 3.08 - 2.92 (m, 1H), 2.36 - 2.06 (m, 3H), 1.85 (s, 7H), 1.73 - 1.59 (m, 4H), 1.57 (d, J = 9.2 Hz, 2H), 1.50 (d, J = 11.3 Hz, 2H).	511.05	B	A
I-3442		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.37 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 5.25 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.47 - 4.31 (m, 1H), 3.03 (ddd, J = 11.1, 9.2, 7.2 Hz, 1H), 2.40 - 2.17 (m, 2H), 2.11 (dt, J = 14.2, 7.7 Hz, 1H), 1.83 (s, 3H), 1.79 (d, J = 11.5 Hz, 3H), 1.76 - 1.57 (m, 5H), 1.55 - 1.34 (m, 3H).	479.1	C	

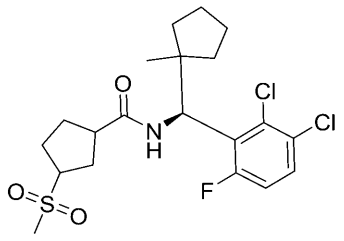
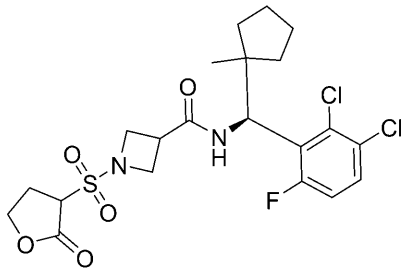
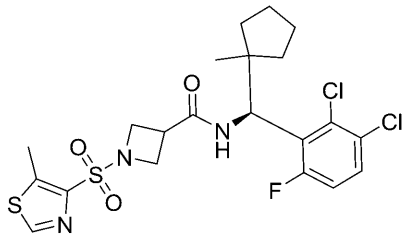
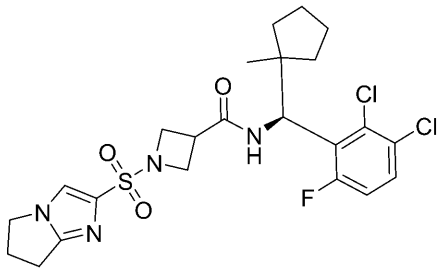
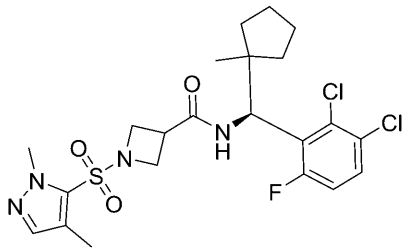
【表１－１０５８】

I-3443		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.52-4.27 (m, 1H), 3.10-2.92 (m, 1H), 2.37-2.04 (m, 3H), 1.90-1.54 (m, 12H), 1.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H).	479.1	B	A
I-3444				C	
I-3445				B	
I-3446				B	

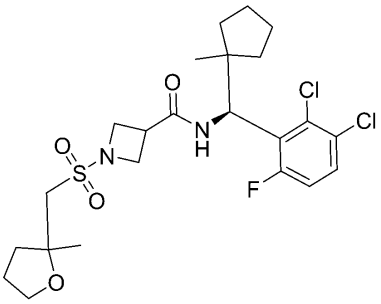
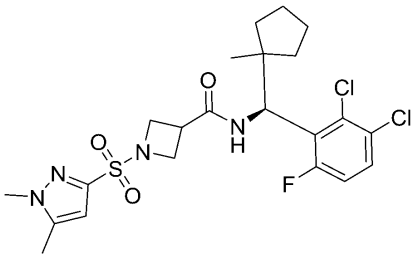
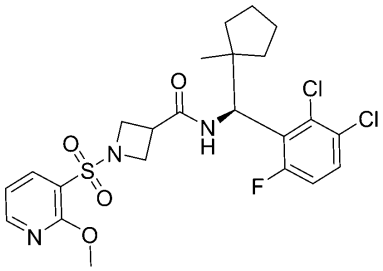
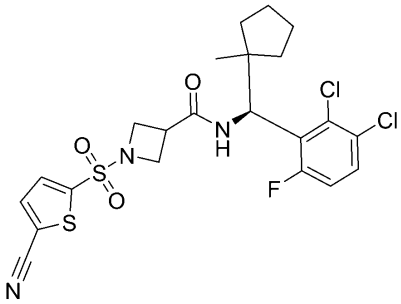
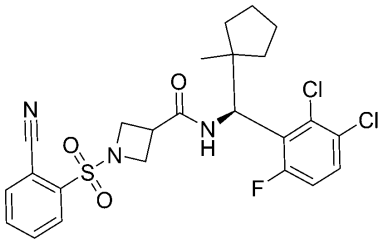
【表１－１０５９】

I-3447				C	
I-3448				C	
I-3449				C	
I-3450				B	

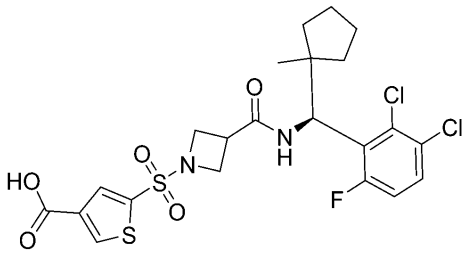
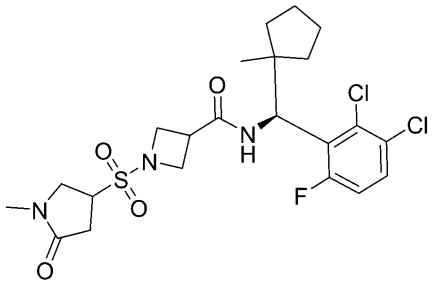
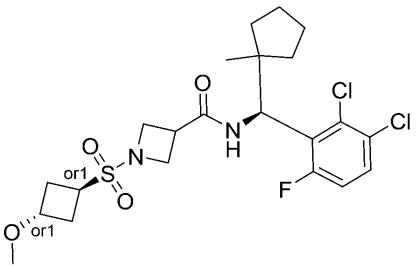
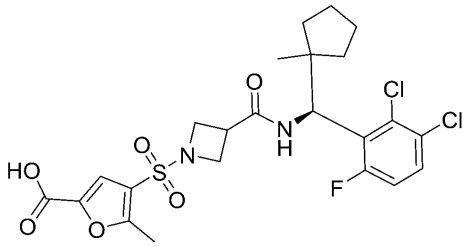
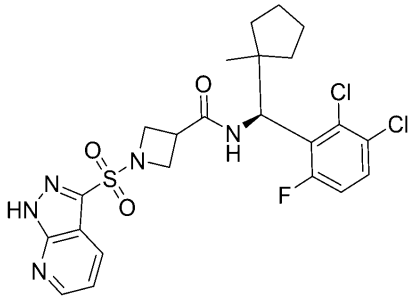
【表１－１０６０】

I-3451			451.4	C	
I-3452			508.4	B	
I-3453			521.5	C	
I-3454			530.5	B	
I-3455			518.4	C	

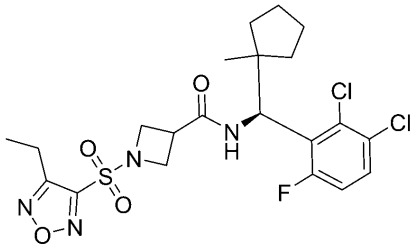
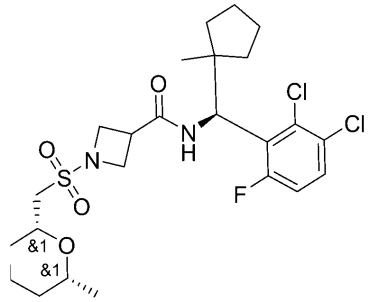
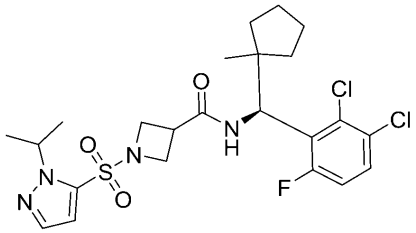
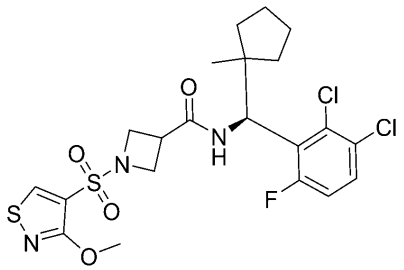
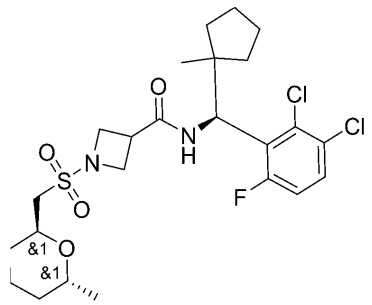
【表１－１０６１】

I-3456			522.5	C	
I-3457			518.4	B	
I-3458			531.4	D	
I-3459			531.5	B	B
I-3460			525.4	B	

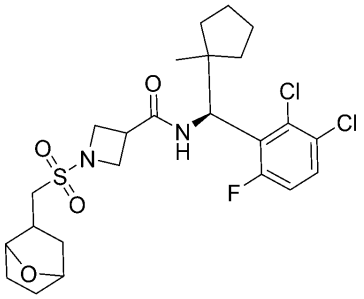
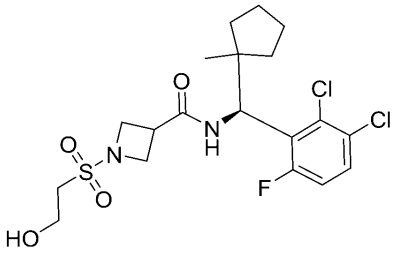
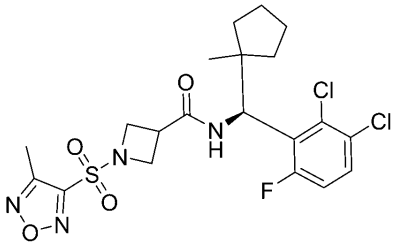
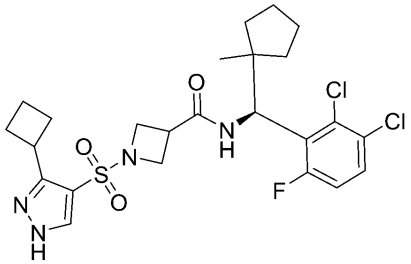
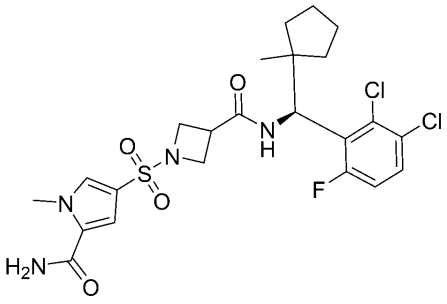
【表１－１０６２】

I-3461			550.5	B	
I-3462			521.4	B	
I-3463			508.4	B	
I-3464			548.4	B	
I-3465			541.4	B	

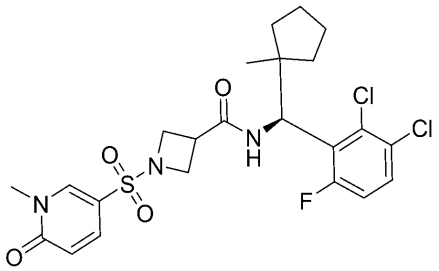
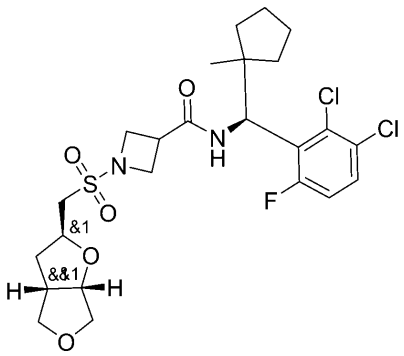
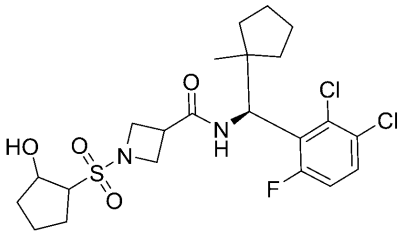
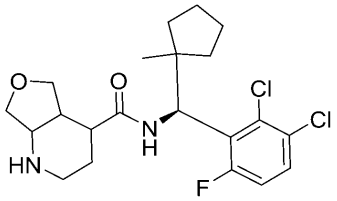
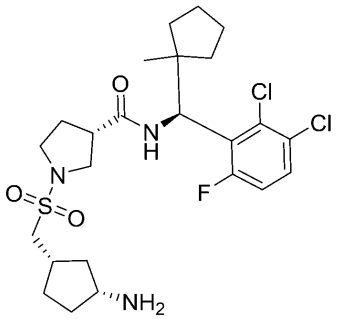
【表１－１０６３】

I-3466			520.4	D	
I-3467			536.5	D	
I-3468			532.5	D	
I-3469			537.5	C	
I-3470			536.5	D	

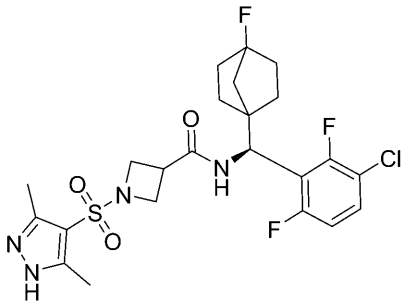
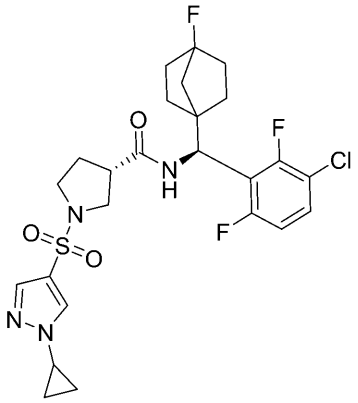
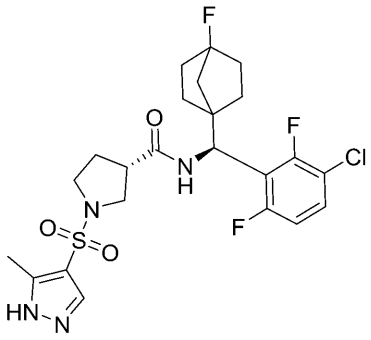
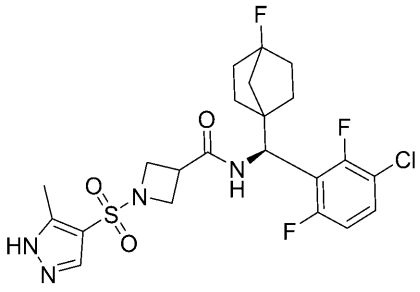
【表１－１０６４】

I-3471			534.5	B	
I-3472			468.4	B	B
I-3473			506.4	D	
I-3474			544.5	B	B
I-3475			546.5	A	C

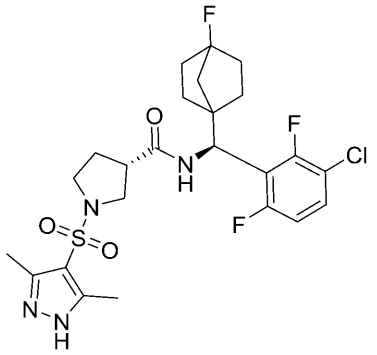
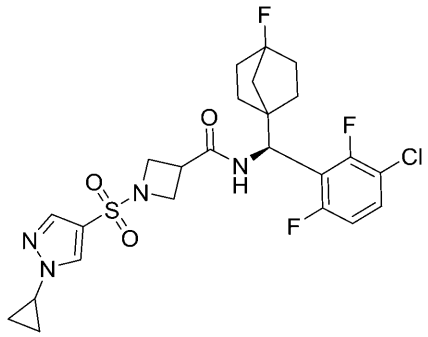
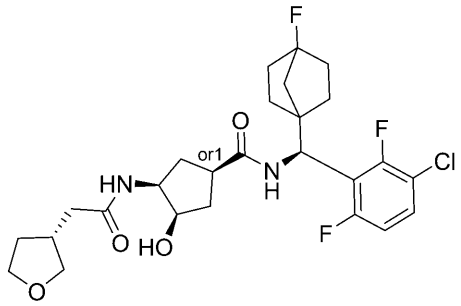
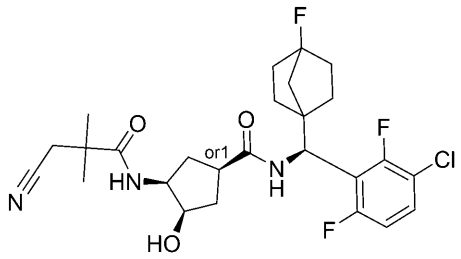
【表１－１０６５】

I-3476			531.4	B	
I-3477			550.5	B	
I-3478			508.4	B	
I-3479			466.2	D	
I-3480			535.1	B	

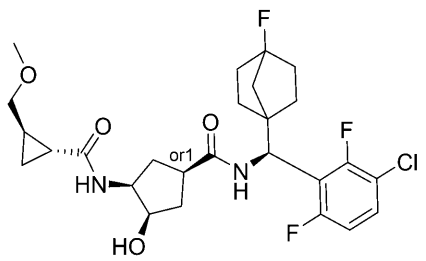
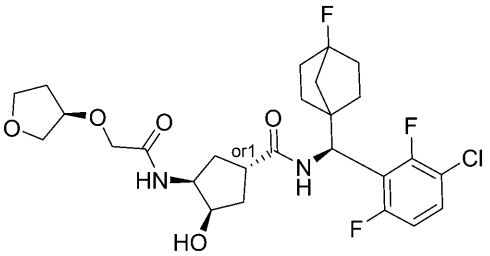
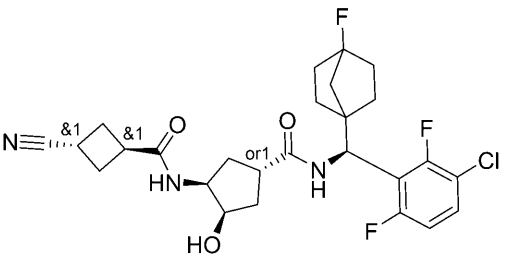
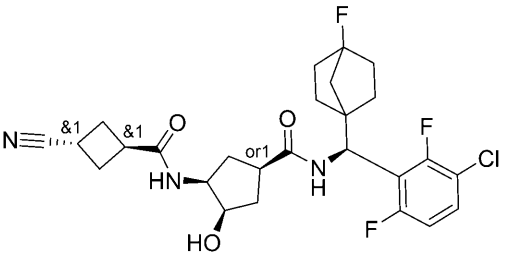
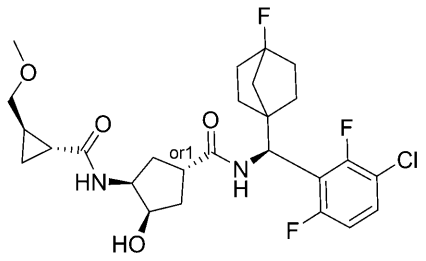
【表１－１０６６】

I-3481			531.05	A	A
I-3482			557.1	B	
I-3483			531.1	A	A
I-3484			517.05	B	

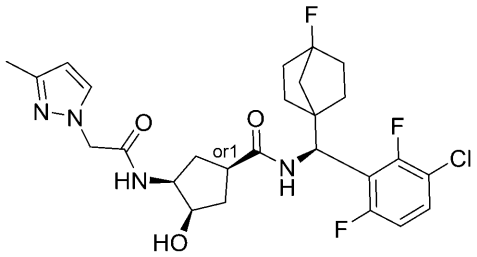
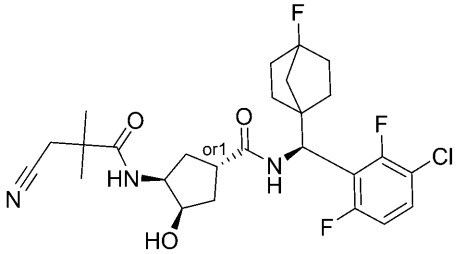
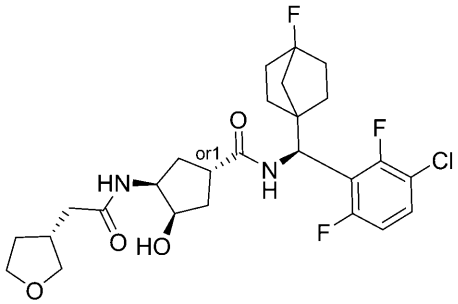
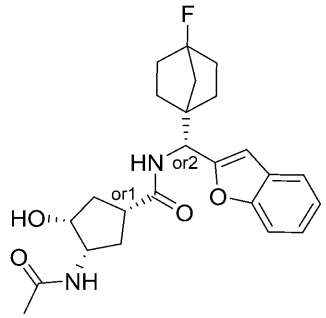
【表１－１０６７】

I-3485			545.1	A	A
I-3486			543.05	C	
I-3487			529.15	C	
I-3488			526.15	C	

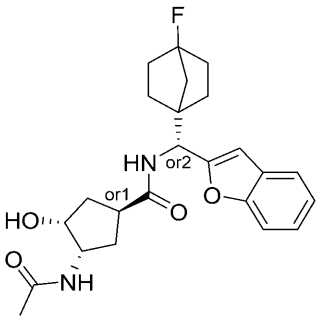
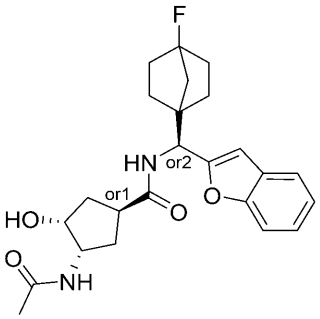
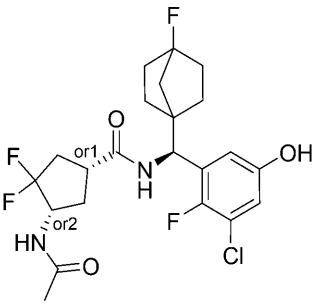
【表１－１０６８】

I-3489			529.15	B	
I-3490			545.15	C	
I-3491			524.1	B	
I-3492			524.1	B	A
I-3493			529.15	C	

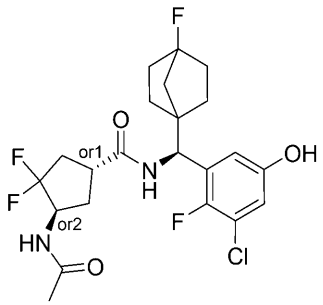
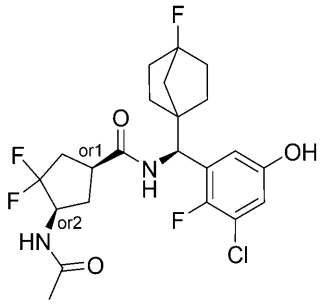
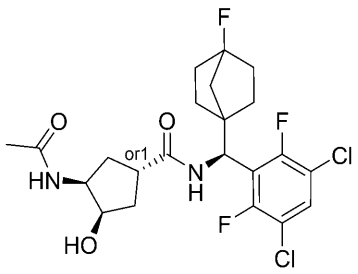
【表１－１０６９】

I-3494			539.15	B	A
I-3495			526.15	C	
I-3496			529.2	D	
I-3497		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.34 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.62 - 7.48 (m, 3H), 7.24 (dtd, J = 17.6, 7.3, 1.4 Hz, 2H), 6.71 (s, 1H), 5.23 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 3.98 (s, 2H), 3.14 - 3.01 (m, 1H), 1.82 - 1.72 (m, 12H), 1.69 (s, 3H), 1.48 (s, 1H), 1.42 (t, J = 10.9 Hz, 1H).	429.3		

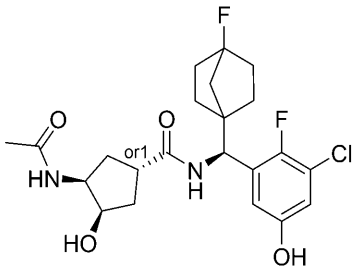
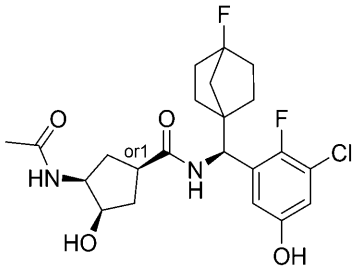
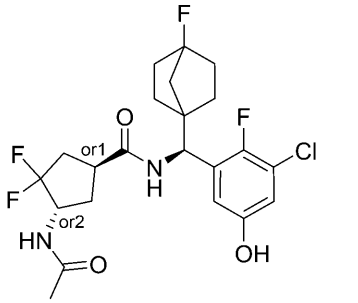
【表１－１０７０】

I-3498		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.35 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 7.3, 1.6 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.24 (dtd, J = 17.7, 7.3, 1.4 Hz, 2H), 6.71 (s, 1H), 5.22 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.97 (d, J = 6.5 Hz, 2H), 3.14 - 3.01 (m, 1H), 1.85 - 1.73 (m, 15H), 1.44 (dd, J = 23.3, 10.3 Hz, 2H).	429.35		
I-3499		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 7.8, 1.4 Hz, 1H), 7.55 - 7.40 (m, 2H), 7.34 - 7.21 (m, 1H), 7.21 (td, J = 7.4, 1.3 Hz, 1H), 6.72 (s, 1H), 5.22 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.01 - 3.89 (m, 2H), 3.07 (td, J = 9.0, 4.0 Hz, 1H), 1.91 - 1.80 (m, 9H), 1.79 - 1.63 (m, 6H), 1.43 (dd, J = 23.5, 10.7 Hz, 2H).	429.25		
I-3500		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.79 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 5.8, 2.9 Hz, 1H), 6.65 (dd, J = 5.4, 2.9 Hz, 1H), 5.17 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.43 (dt, J = 18.0, 9.0 Hz, 1H), 3.08 (qd, J = 9.0, 4.2 Hz, 1H), 2.44 - 2.19 (m, 2H), 1.92 - 1.64 (m, 11H), 1.61 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.54 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.36 (d, J = 10.0 Hz, 2H).	477.3	B	

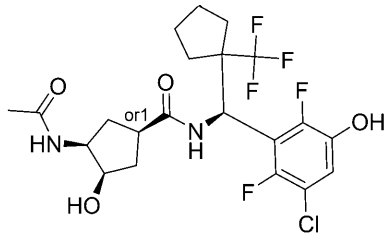
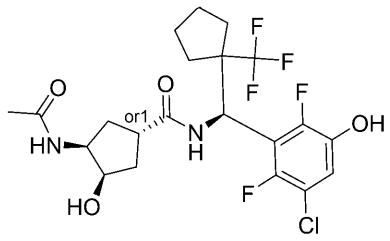
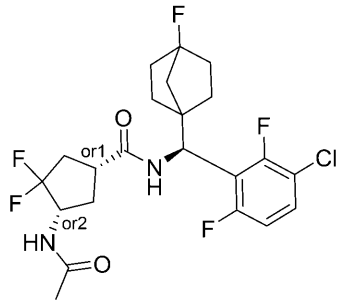
【表１－１０７１】

I-3501		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.78 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 5.8, 2.9 Hz, 1H), 6.67 (dd, J = 5.4, 2.9 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.42 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 2.98 (dt, J = 16.8, 8.3 Hz, 1H), 2.39-2.12 (m, 3H), 1.85 (s, 3H), 1.77 (s, 2H), 1.71 (s, 3H), 1.71-1.63 (m, 2H), 1.59 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.53 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 1.35 (s, 2H).	477.1	B	
I-3502		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.69 (s, 1H), 8.35 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 5.8, 2.9 Hz, 1H), 6.63 (dd, J = 5.3, 2.9 Hz, 1H), 5.15 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.44 - 4.35 (m, 1H), 3.07 - 2.93 (m, 1H), 2.46 - 2.22 (m, 2H), 2.16 (ddd, J = 30.0, 22.9, 13.6 Hz, 1H), 1.84 (s, 3H), 1.77 - 1.68 (s, 6H), 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.58 - 1.46 (m, 2H), 1.35 (s, 2H).	477.05	B	
I-3503		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.32 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.96 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.00 - 3.83 (m, 2H), 3.08 (dt, J = 13.1, 6.6 Hz, 1H), 1.81 (s, 5H), 1.74 (dd, J = 23.1, 8.7 Hz, 8H), 1.61 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 1.47 (d, J = 11.4 Hz, 2H).	493	D	

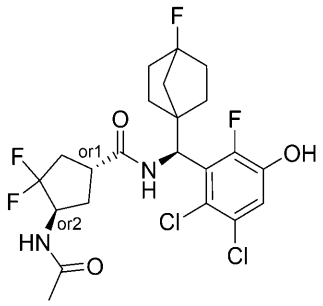
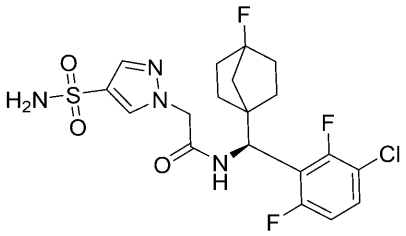
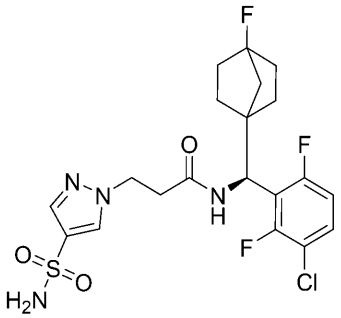
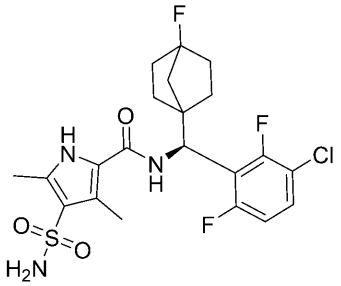
【表１－１０７２】

I-3504		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.78 (s, 1H), 8.20 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 5.9, 2.9 Hz, 1H), 6.66 (dd, J = 5.5, 2.9 Hz, 1H), 5.16 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 4.81 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 1H), 3.95 - 3.83 (m, 1H), 3.18 - 2.99 (m, 1H), 1.74 (d, J = 46.7 Hz, 13H), 1.63 - 1.44 (m, 2H), 1.34 (s, 2H).	457.25	B	
I-3505		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.78 (s, 1H), 8.21 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 5.8, 2.8 Hz, 1H), 6.66 (dd, J = 5.4, 3.0 Hz, 1H), 5.17 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.07 - 3.74 (m, 2H), 3.05 (dd, J = 9.6, 4.9 Hz, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.80 - 1.72 (m, 5H), 1.72 - 1.61 (m, 5H), 1.60 - 1.44 (m, 2H), 1.35 (s, 2H).	457.3	B	A
I-3506		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.81 (s, 1H), 8.37 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 5.8, 2.9 Hz, 1H), 6.65 (dd, J = 5.4, 2.9 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.48 (dt, J = 18.1, 9.2 Hz, 1H), 3.08 (s, 1H), 2.37 - 2.17 (m, 2H), 2.04 - 1.94 (m, 1H), 1.86 (s, 4H), 1.81 - 1.64 (m, 6H), 1.62 - 1.52 (m, 2H), 1.36 (s, 2H).	475.15	A	A

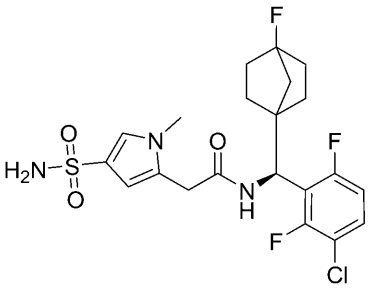
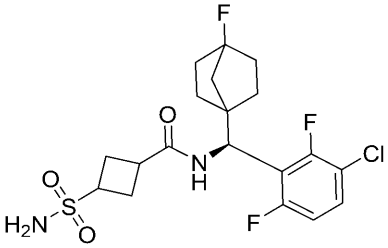
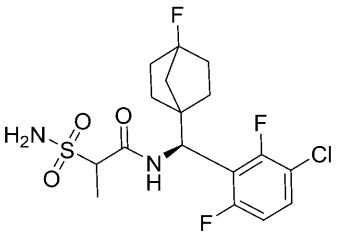
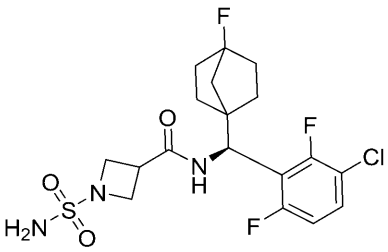
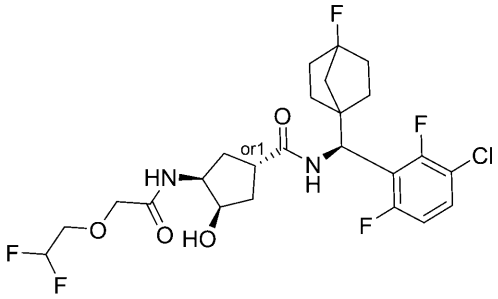
【表１－１０７３】

I-3507		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.38 (s, 1H), 8.30 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.11 - 7.03 (m, 1H), 5.77 (s, 1H), 4.78 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.98 - 3.87 (m, 2H), 3.20 - 3.09 (m, 1H), 1.97 - 1.86 (m, 3H), 1.86 - 1.71 (m, 6H), 1.67 (dt, J = 12.7, 6.3 Hz, 3H), 1.60 - 1.48 (m, 3H).	499.05	D	
I-3508		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.38 (s, 1H), 8.30 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 8.6, 7.3 Hz, 1H), 5.76 (s, 1H), 4.80 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.93 (dtt, J = 29.8, 8.8, 3.6 Hz, 2H), 3.19 - 3.09 (m, 1H), 1.96 - 1.86 (m, 3H), 1.85 - 1.69 (m, 6H), 1.69 - 1.59 (m, 3H), 1.59 - 1.47 (m, 3H).	499.05	D	
I-3509		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.39 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.40 (dq, J = 18.0, 8.9 Hz, 1H), 3.12 (dd, J = 8.4, 5.1 Hz, 1H), 2.35 (s, 1H), 2.31 (s, 1H), 1.83 (s, 3H), 1.75 (dd, J = 28.1, 9.7 Hz, 9H), 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (s, 2H).	479.2	B	

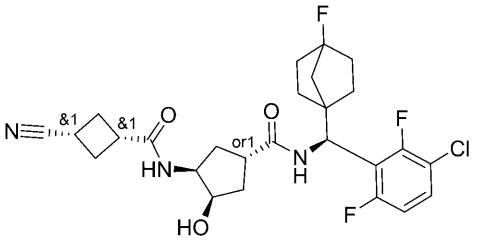
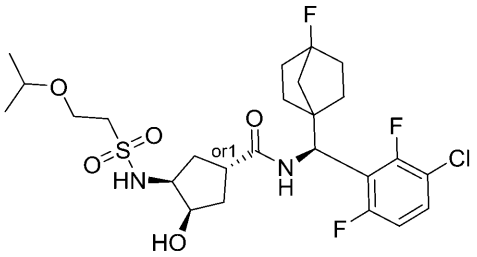
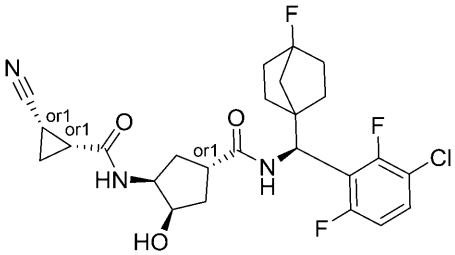
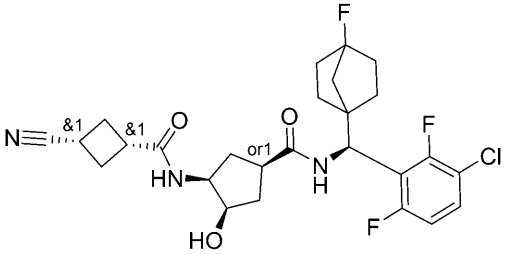
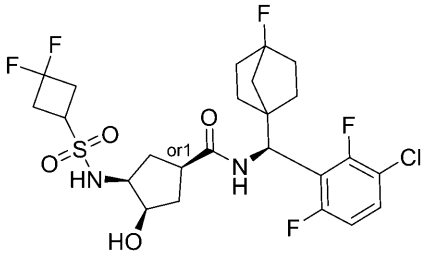
【表１－１０７４】

I-3510		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.72 - 10.13 (m, 1H), 8.42 - 8.26 (m, 1H), 8.13 - 7.96 (m, 1H), 7.09 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.52- 5.30 (m, 1H), 4.41 (d, J = 12.0 Hz, 1H), 3.04 (dt, J = 19.9, 10.2 Hz, 1H), 2.42 - 2.02 (m, 4H), 1.81 (d, J = 19.0 Hz, 5H), 1.70 (d, J = 10.9 Hz, 3H), 1.64 - 1.40 (m, 5H).	511.05	C	
I-3511				D	
I-3512				D	
I-3513				E	

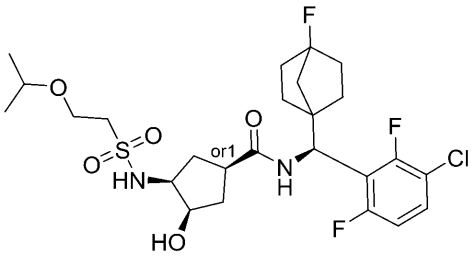
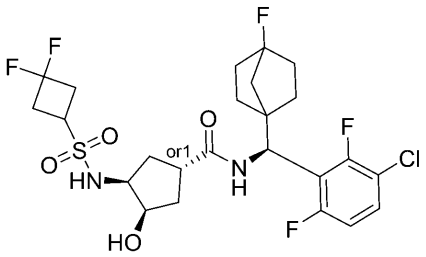
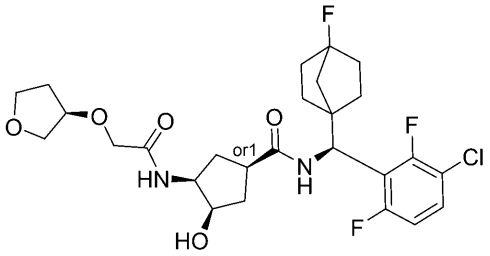
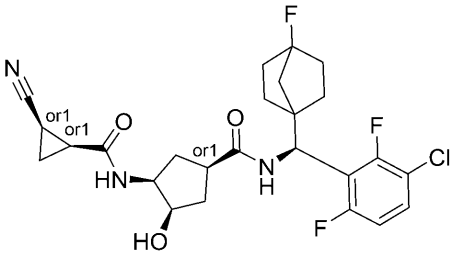
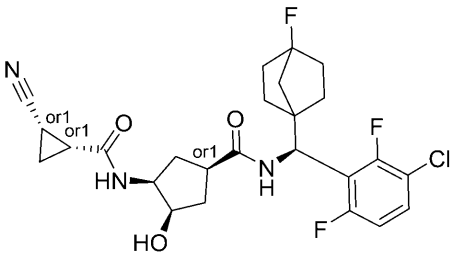
【表１－１０７５】

I-3514				C	
I-3515				B	
I-3516				D	
I-3517				B	
I-3518			539.2	D	

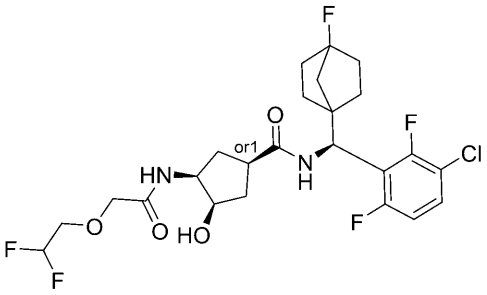
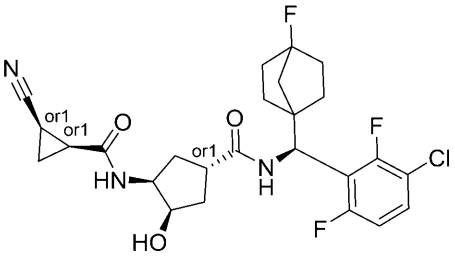
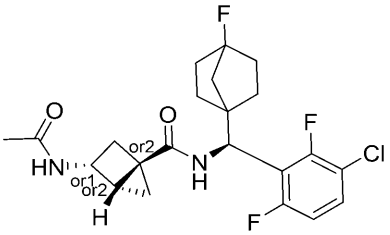
【表１－１０７６】

I-3519			524.25	C	
I-3520			567.15	D	
I-3521			510.1	A	A
I-3522			524.25	B	
I-3523			571.1	D	

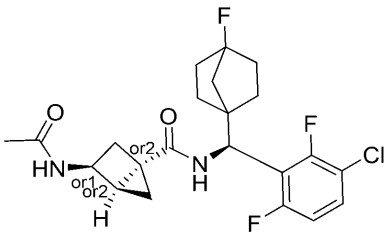
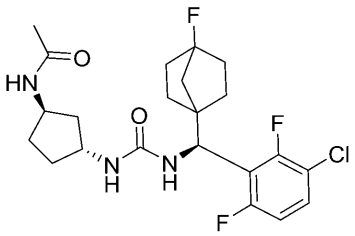
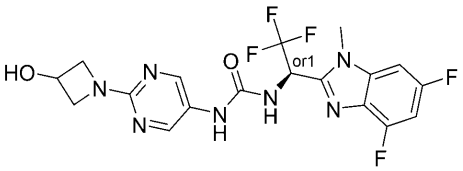
【表１－１０７７】

I-3524			567.15	D	
I-3525			571.1	D	
I-3526			545.15	C	
I-3527			510.15	A	A
I-3528			510.1	C	

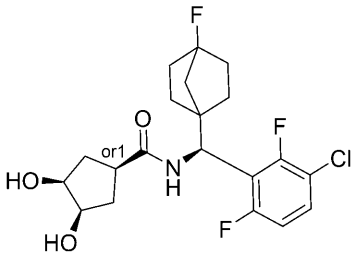
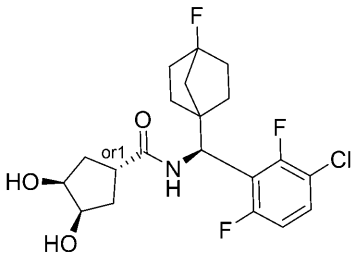
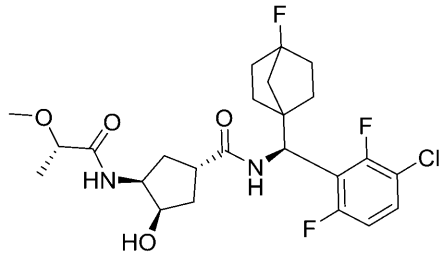
【表１－１０７８】

I-3529			539.25	B	
I-3530			510.1	C	
I-3531		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.95 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 1H), 5.32 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.22 (td, J = 10.0, 8.9, 4.3 Hz, 1H), 2.79 (ddd, J = 11.7, 9.7, 1.9 Hz, 1H), 2.34 - 2.26 (m, 1H), 1.77 (d, J = 13.6 Hz, 11H), 1.59 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.48 (d, J = 15.5 Hz, 3H), 1.43 - 1.35 (m, 2H), 1.29 (dd, J = 4.6, 2.5 Hz, 1H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -112.63, -112.96, -173.56.	441.1	D	

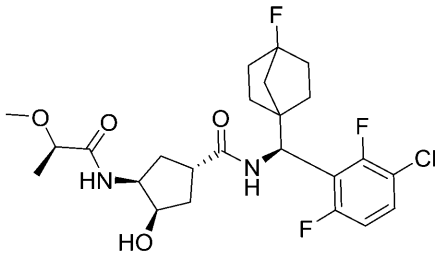
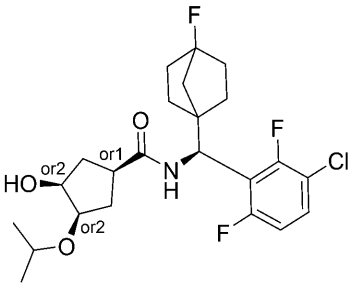
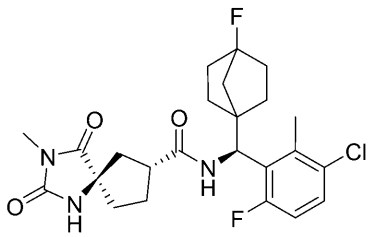
【表１－１０７９】

I-3532		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.95 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 1H), 5.37 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.15 (dt, J = 9.4, 5.4 Hz, 1H), 2.64 (dd, J = 11.6, 9.8 Hz, 1H), 2.31 (t, J = 3.9 Hz, 1H), 1.76 (d, J = 9.7 Hz, 8H), 1.70 (t, J = 9.0 Hz, 2H), 1.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 1.45 (dt, J = 11.9, 6.0 Hz, 3H), 1.38 - 1.29 (m, 2H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -112.56, -113.33, -173.54.	441.1	D	
I-3533		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.84 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.37 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 6.24 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 4.09 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.93 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 2.02 - 1.85 (m, 2H), 1.85 - 1.60 (m,9H), 1.60 - 1.45 (m, 4H), 1.46 - 1.22 (m, 4H).	458.15	D	
I-3534		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.58 (s, 1H), 8.37 (s, 2H), 7.74 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.9, 2.3 Hz, 1H), 7.19 (td, J = 10.6, 2.2 Hz, 1H), 6.28 ¨C 6.18 (m, 1H), 5.65 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.59 ¨C 4.49 (m, 1H), 4.18 (dd, J = 9.1, 6.6 Hz, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.80 ¨C 3.71 (m, 2H).	458.15	D	

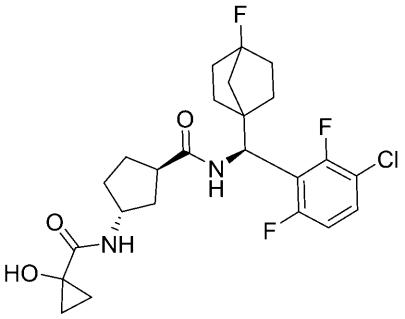
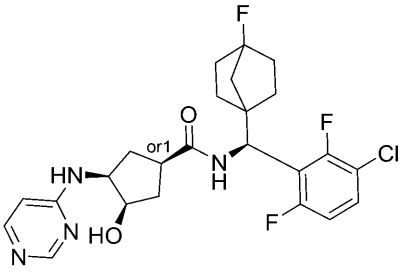
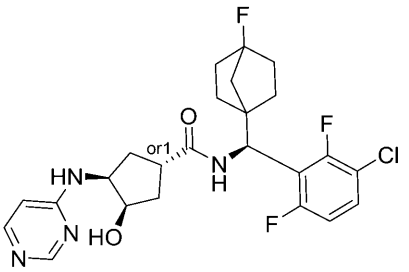
【表１－１０８０】

I-3535		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.31 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (td, J = 9.5, 9.0, 1.6 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.68 (dd, J = 20.4, 4.4 Hz, 2H), 3.78 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 2.72 - 2.61 (m, 1H), 2.29 - 1.89 (m, 2H), 1.88 - 1.29 (m, 12H).	418.1	C	
I-3536		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)? 8.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.14 (td, J = 9.5, 1.6 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.37 (dd, J = 4.4, 1.2 Hz, 2H), 3.83 (dp, J = 14.3, 4.5 Hz, 2H), 3.08 (tt, J = 9.3, 6.8 Hz, 1H), 1.82 - 1.52 (m, 12H), 1.44 (dd, J = 13.6, 6.0 Hz, 2H).	418.1	D	
I-3537		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.07 (s, 1H), 4.03 - 3.89 (m, 2H), 3.74 - 3.64 (m, 1H), 3.27 (s, 3H), 3.11 (qd, J = 8.5, 4.5 Hz, 1H), 1.92 (ddd, J = 12.9, 8.3, 4.7 Hz, 1H), 1.85 - 1.55 (m, 11H), 1.46 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 1.21 (d, J = 6.7 Hz, 3H).	503.1	C	

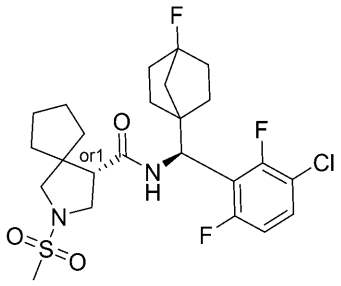
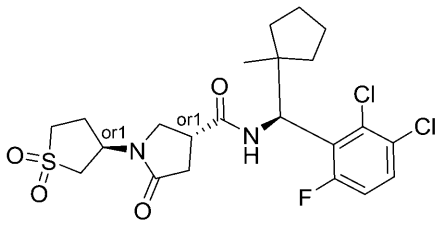
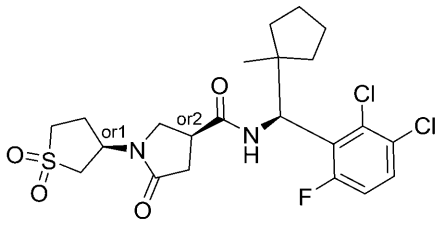
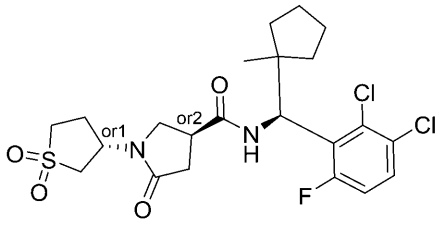
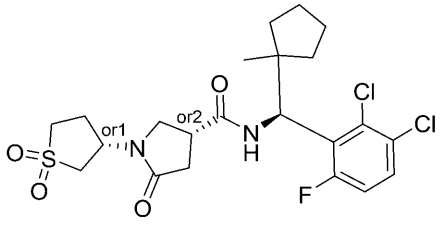
【表１－１０８１】

I-3538		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.28 - 7.03 (m, 2H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.10 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 3.95 (dt, J = 12.9, 4.7 Hz, 2H), 3.70 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 3.27 (s, 3H), 3.12 (qd, J = 8.6, 4.6 Hz, 1H), 1.93 (ddd, J = 12.9, 8.3, 4.8 Hz, 1H), 1.87 - 1.53 (m, 11H), 1.45 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 1.21 (d, J = 6.6 Hz, 3H).	503.15	C	
I-3539		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.19 - 7.08 (m, 1H), 5.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.06 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 3.92 (p, J = 4.1 Hz, 1H), 3.73 (td, J = 6.8, 3.6 Hz, 1H), 3.64 (h, J = 6.1 Hz, 1H), 3.14 - 3.00 (m, 1H), 1.87 - 1.66 (m, 10H), 1.59 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.48 (ddd, J = 20.7, 10.3, 6.7 Hz, 3H), 1.08 (t, J = 5.7 Hz, 6H).	460.2	D	
I-3540		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.59 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.07 (t, J = 10.0 Hz, 1H), 5.25 (s, 1H), 3.03 (s, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.13 (t, J = 11.7 Hz, 1H), 1.87 (s, 5H), 1.68 (s, 6H), 1.53 (s, 4H).	480.15	B	A

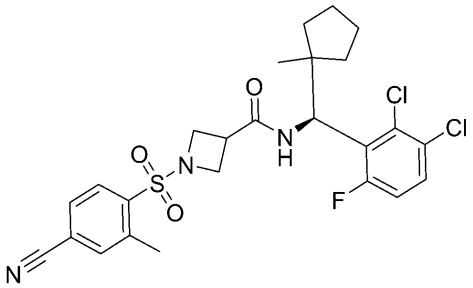
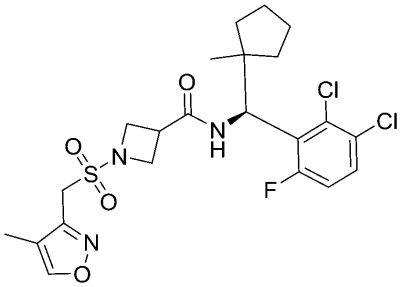
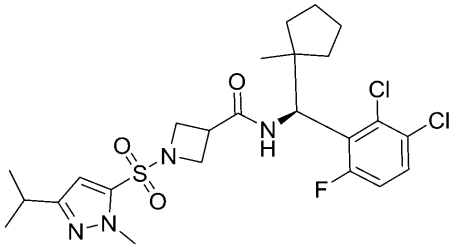
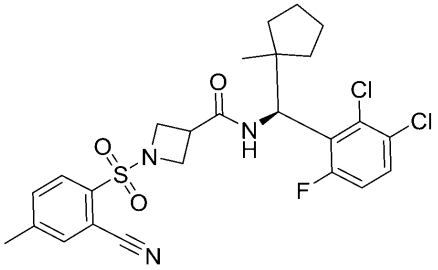
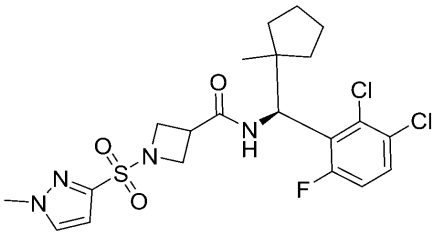
【表１－１０８２】

I-3541		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) ?8.20 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 11.3, 6.8 Hz, 2H), 7.15 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 6.20 (s, 1H), 5.28 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.11 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.05-2.91 (m, 1H), 1.93-1.66 (m, 11H), 1.60 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 9.7 Hz, 4H), 1.00 (q, J = 4.1 Hz, 2H), 0.80 (q, J = 4.0 Hz, 2H).	485.1	C	
I-3542		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.35 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.29 - 7.04 (m, 2H), 6.56 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.96 (s, 1H), 4.22 (t, J = 6.5 Hz, 1H), 4.08 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 3.25 - 3.00 (m, 1H), 2.10 - 1.89 (m, 1H), 1.93 - 1.53 (m, 11H), 1.46 (d, J = 8.6 Hz, 2H).	495.2	B	A
I-3543		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.7 Hz, 2H), 6.65 - 6.47 (m, 1H), 5.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.94 (s, 1H), 4.14 (d, J = 26.6 Hz, 3H), 3.14 (p, J = 7.7 Hz, 1H), 2.04 - 1.66 (m, 11H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 9.5 Hz, 2H).	495.2	C	

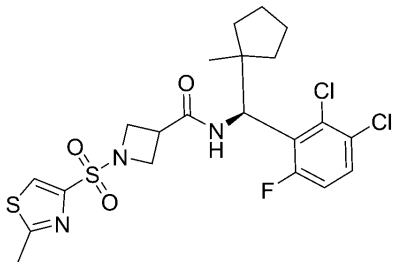
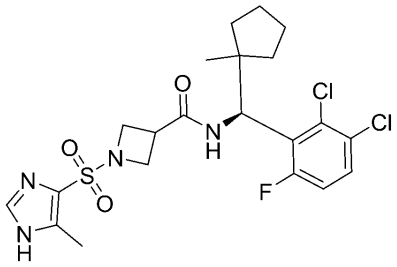
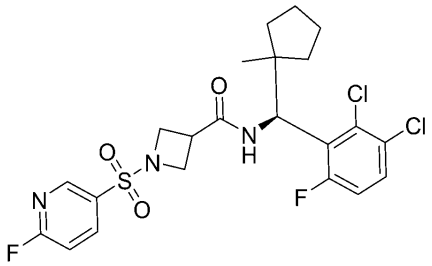
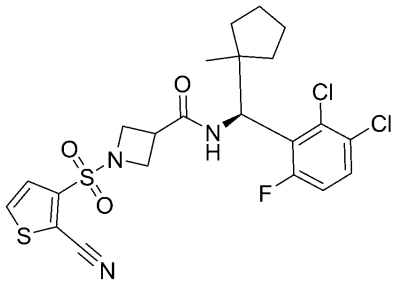
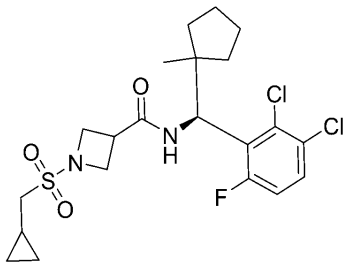
【表１－１０８３】

I-3544		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.46 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.64-7.53 (m, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.41 (dd, J = 10.4, 7.2 Hz, 1H), 3.21-3.13 (m, 2H), 3.03 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 2.98-2.91 (m, 1H), 2.81 (s, 3H), 1.89-1.57 (m, 14H), 1.58-1.32 (m, 4H).	519.1	D	
I-3545				D	
I-3546				D	
I-3547				B	
I-3548				B	

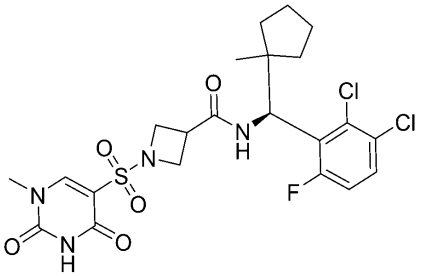
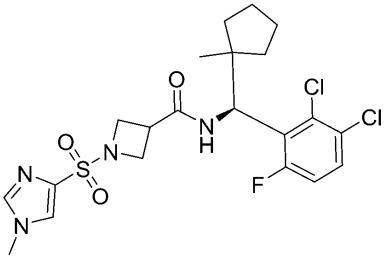
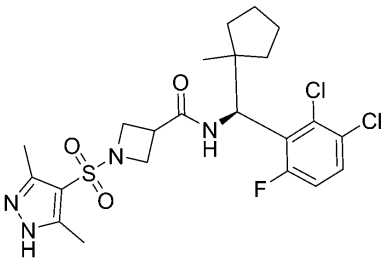
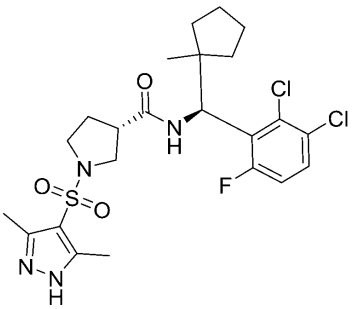
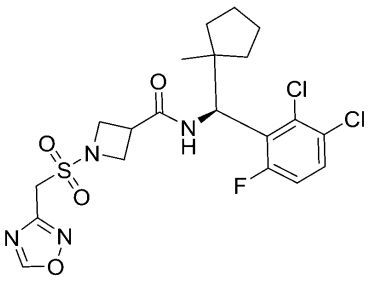
【表１－１０８４】

I-3549			539.5	C	
I-3550			519.4	C	
I-3551			546.5	D	
I-3552			539.5	D	
I-3553			504.4	C	

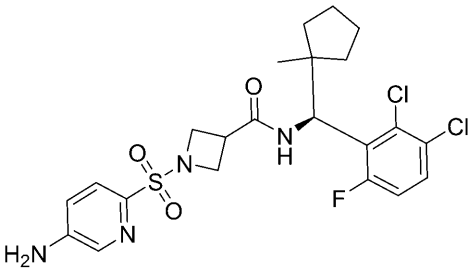
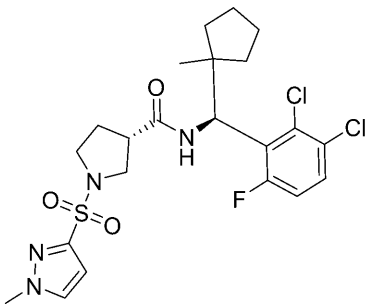
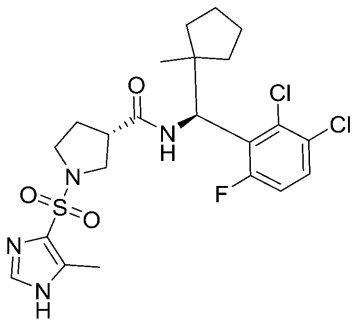
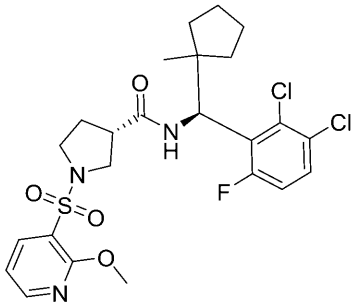
【表１－１０８５】

I-3554			521.5	C	
I-3555			504.4	C	
I-3556			519.4	C	
I-3557			531.5	C	
I-3558			478.4	C	

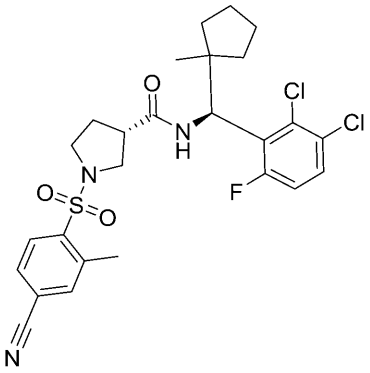
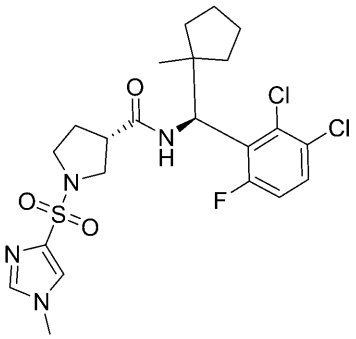
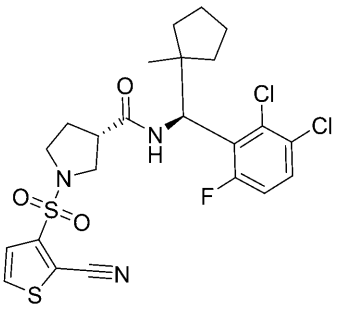
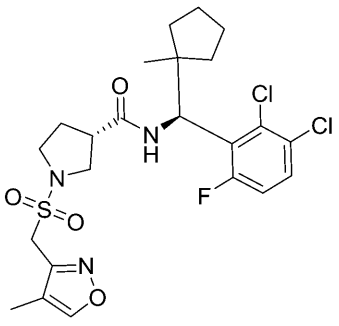
【表１－１０８６】

I-3559			548.4	B	
I-3560			504.4	C	
I-3561			518.4	B	A
I-3562			532.5	B	B
I-3563			506.4	B	

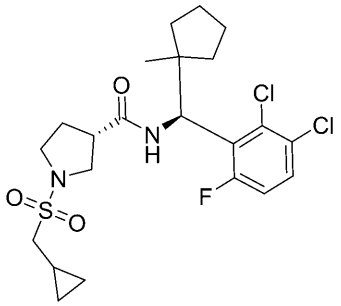
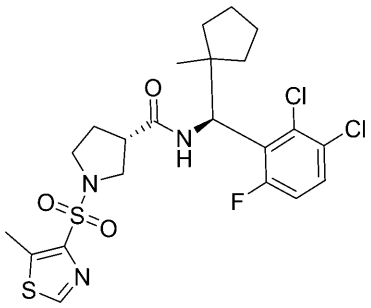
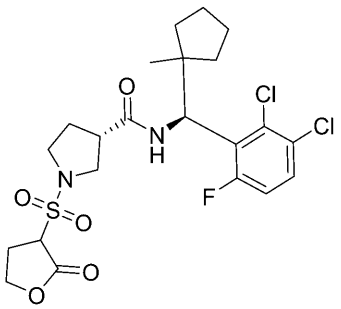
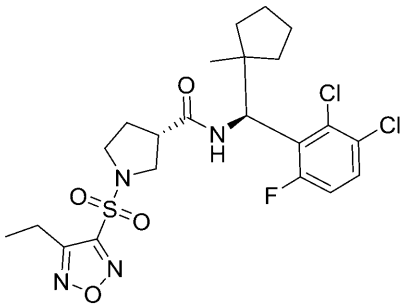
【表１－１０８７】

I-3564			516.4	B	
I-3565			518.4	B	
I-3566			518.4	B	B
I-3567			545.5	D	

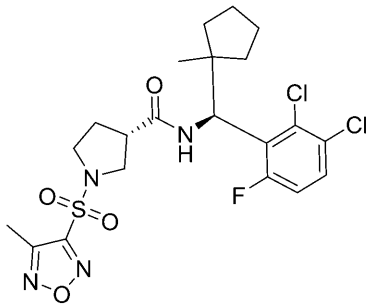
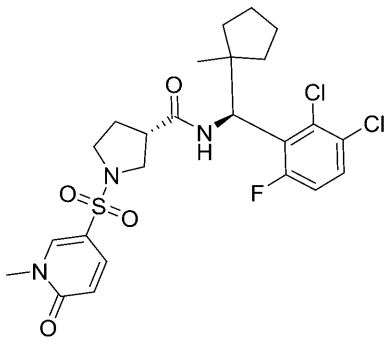
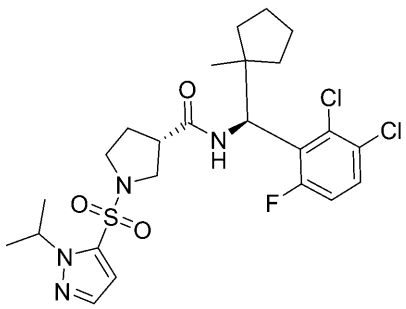
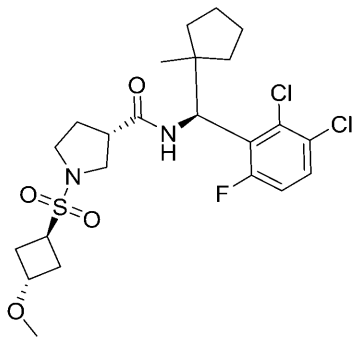
【表１－１０８８】

I-3568			553.5	D	
I-3569			518.4	B	
I-3570			545.5	C	
I-3571			533.5	D	

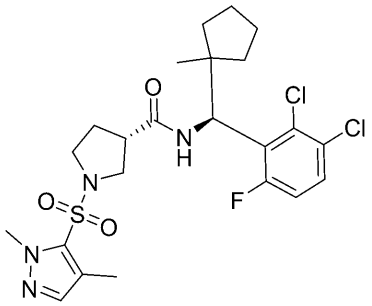
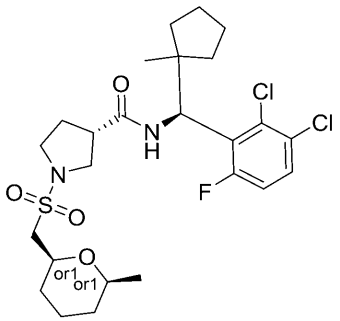
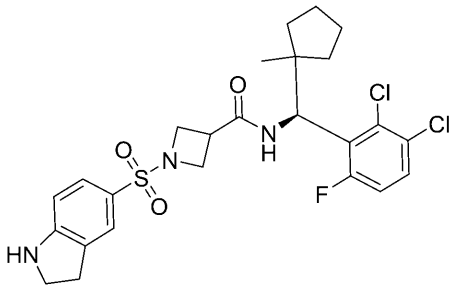
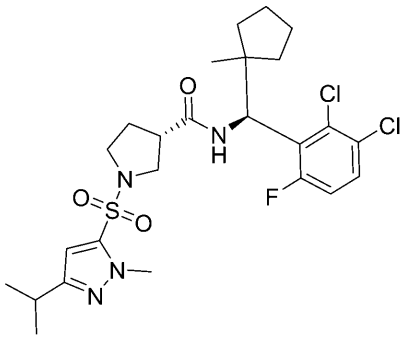
【表１－１０８９】

I-3572			492.4	D	
I-3573			535.5	D	
I-3574			522.4	B	
I-3575			534.4	D	

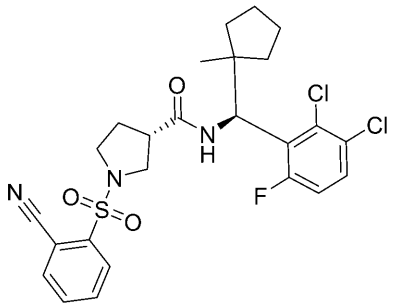
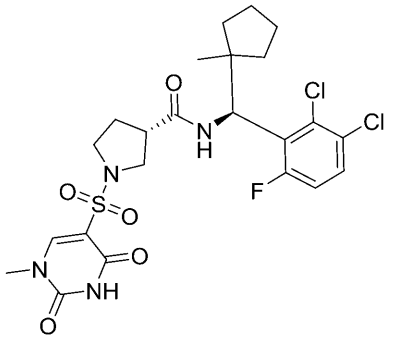
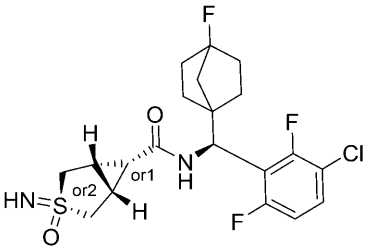
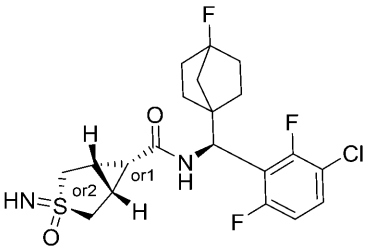
【表１－１０９０】

I-3576			520.4	D	
I-3577			545.5	B	B
I-3578			546.5	D	
I-3579			522.5	C	

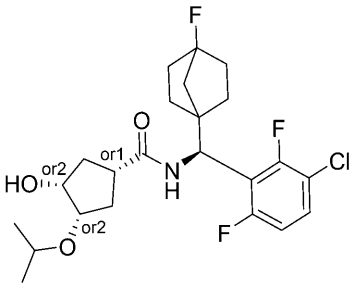
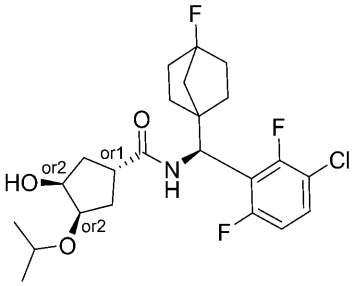
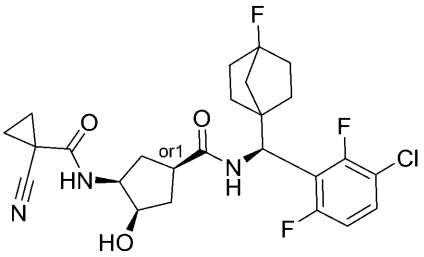
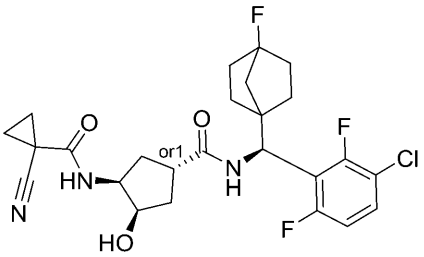
【表１－１０９１】

I-3580			532.5	D	
I-3581			550.5	D	
I-3582			541.5	C	
I-3583			560.5	D	

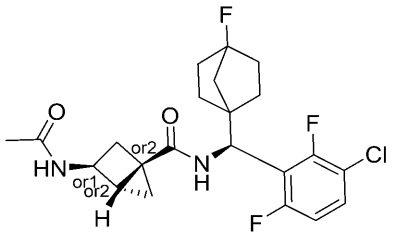
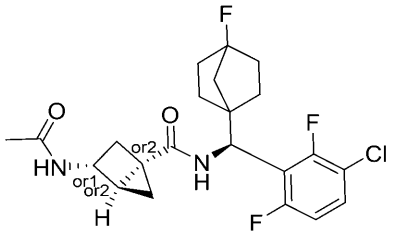
【表１－１０９２】

I-3584			539.5	D	
I-3585			562.5	B	B
I-3586		1H NMR (300 MHz, メタノール-d4) 7.46 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.02 (td, J = 9.4, 1.8 Hz, 1H), 5.50 (s, 1H), 3.69-3.51 (m, 2H), 3.10 (ddd, J = 13.4, 10.8, 2.2 Hz, 2H), 2.35-2.10 (m, 3H), 1.95-1.49 (m, 10H).	447.1	D	
I-3587		1H NMR (300 MHz, メタノール-d4) 7.46 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.02 (td, J = 9.4, 1.8 Hz, 1H), 5.49 (s, 1H), 3.68-3.48 (m, 2H), 3.15 (ddd, J = 13.4, 11.1, 1.9 Hz, 2H), 2.38-2.12 (m, 3H), 1.97-1.51 (m, 10H).	447.1	D	

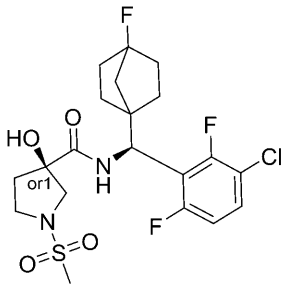
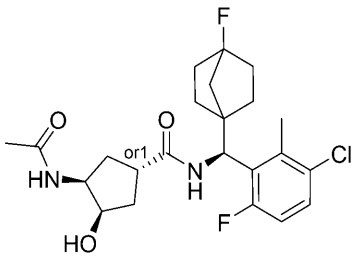
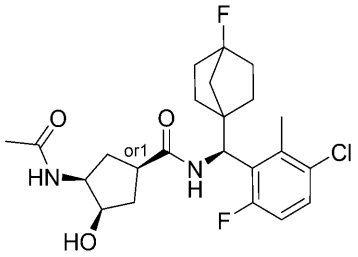
【表１－１０９３】

I-3588		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.5, 1.6 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.07 (d, J = 4.3 Hz, 1H), 3.95 (p, J = 4.2 Hz, 1H), 3.72 - 3.58 (m, 2H), 3.06 (ddd, J = 15.8, 8.9, 6.2 Hz, 1H), 1.84 - 1.54 (m, 12H), 1.45 (d, J = 9.2 Hz, 2H), 1.06 (dd, J = 8.9, 6.1 Hz, 6H).	460.2	D	
I-3589		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (td, J = 9.5, 1.7 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.45 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 3.90 (p, J = 4.6 Hz, 1H), 3.73 - 3.59 (m, 2H), 2.68 (qd, J = 8.9, 6.1 Hz, 1H), 2.06 - 1.54 (m, 12H), 1.46 (s, 2H), 1.08 (dd, J = 13.2, 6.1 Hz, 6H).	460.15	C	
I-3590			510.15	B	
I-3591			510.15	B	

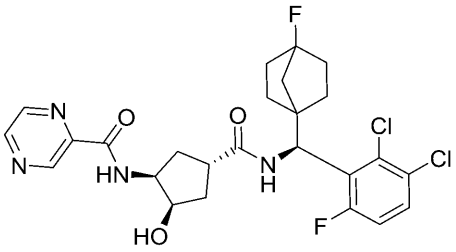
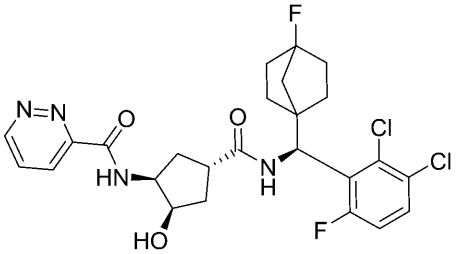
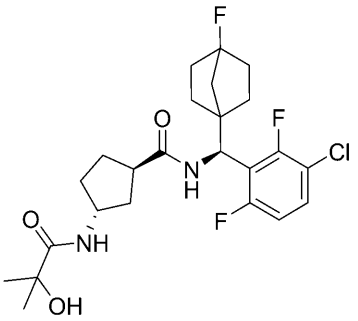
【表１－１０９４】

I-3592		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.35 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.59 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.22 - 7.13 (m, 1H), 5.42 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.37 (q, J = 5.1 Hz, 1H), 2.23 (dd, J = 6.5, 2.1 Hz, 1H), 2.10 - 1.94 (m, 2H), 1.80 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 1.78 - 1.65 (m, 3H), 1.56 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.52 - 1.44 (m, 2H), 1.41 (d, J = 10.4 Hz, 1H), 1.15 (dd, J = 4.3, 2.3 Hz, 1H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -112.18, -113.19, -173.52.	441.15	D	
I-3593		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.36 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 1H), 5.32 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.39 (td, J = 5.7, 3.2 Hz, 1H), 2.21 - 2.05 (m, 2H), 1.97 (dd, J = 11.5, 5.3 Hz, 1H), 1.81 (s, 3H), 1.85 - 1.76 (m, 5H), 1.70 (d, J = 8.2, 6.5 Hz, 2H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.56 - 1.41 (m, 3H), 1.12 (dd, J = 4.4, 2.3 Hz, 1H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -112.21, -112.99, -173.54.	441.15	D	

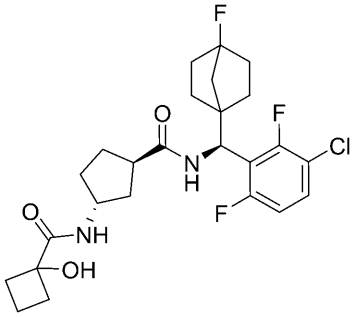
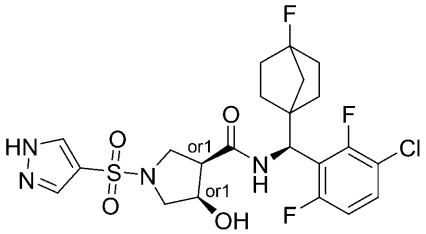
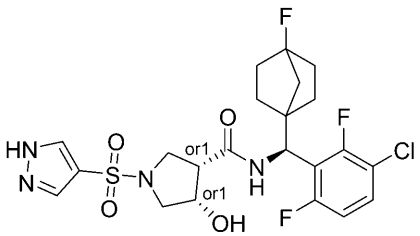
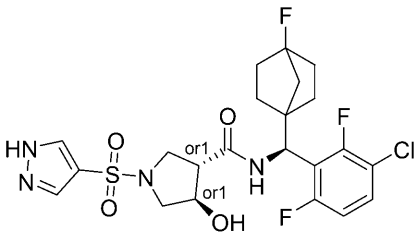
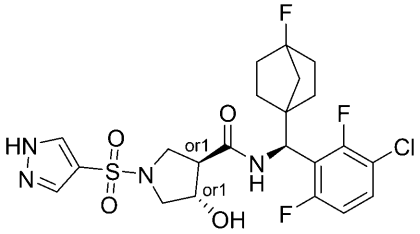
【表１－１０９５】

I-3594		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.00 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 7.65 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.24 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.30 (s, 1H), 5.43 (d, J = 9.7 Hz, 1H), 3.50-3.36 (m, 3H), 3.23 (d, J = 11.0 Hz, 1H), 2.88 (s, 3H), 2.30-2.18 (m, 1H), 2.04 (dd, J = 11.6, 6.0 Hz, 1H), 1.86-1.78 (m, 4H), 1.72 (d, J = 11.0 Hz, 3H), 1.63 (q, J = 8.7 Hz, 1H), 1.48 (s, 1H), 1.43 (d, J = 11.2 Hz, 1H).	481.05	D	
I-3595		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.15 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.8, 4.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 10.9, 8.8 Hz, 1H), 5.21 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.77 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 3.95 (p, J = 3.4 Hz, 1H), 3.86 (dt, J = 12.7, 8.6 Hz, 1H), 3.06 (s, 1H), 2.42 (s, 3H), 1.86 - 1.62 (m, 12H), 1.52 (s, 5H).	455.15	D	
I-3596		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.9, 4.8 Hz, 1H), 7.06 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.76 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 3.91 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 3.07 (s, 1H), 2.42 (s, 3H), 1.87 - 1.63 (m, 12H), 1.52 (s, 5H).	455.15	B	A

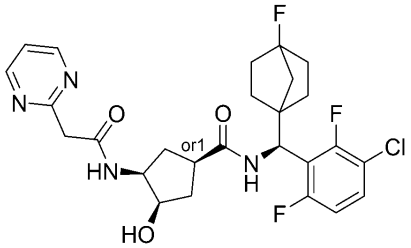
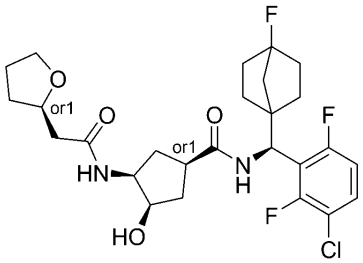
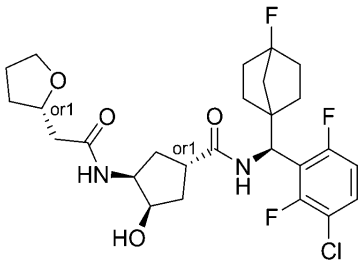
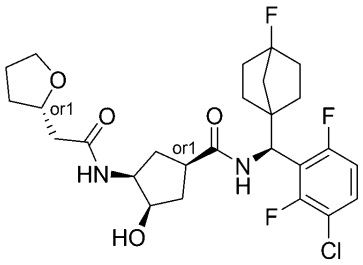
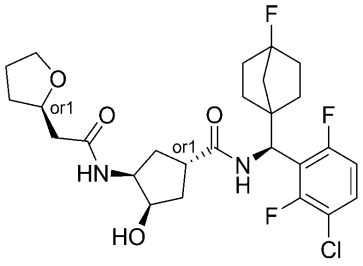
【表１－１０９６】

I-3597		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.21 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 2.5, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.31 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 4.24 - 4.06 (m, 2H), 3.17 (qd, J = 8.6, 4.8 Hz, 1H), 2.11 - 2.01 (m, 2H), 1.85 (ddd, J = 18.3, 11.1, 3.3 Hz, 3H), 1.80 - 1.62 (m, 6H), 1.62 - 1.45 (m, 3H).	539.1	B	A
I-3598		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.42 (dd, J = 5.1, 1.7 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.31-8.20 (m, 2H), 7.93 (dd, J = 8.4, 5.0 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (s, 1H), 5.33 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.30 C 4.17 (m, 1H), 4.13 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 3.26-3.14 (m, 1H), 2.07 (ddd, J = 13.0, 8.3, 4.9 Hz, 1H), 1.96-1.45 (m, 13H) .	539.1	B	A
I-3599		1H NMR (400 MHz, CDCl3) δ 7.35 - 7.27 (m, 1H), 6.92 - 6.83 (m, 1H), 6.73 - 6.67 (m, 1H), 6.29 - 6.22 (m, 1H), 5.71 - 5.64 (m, 1H), 4.34 - 4.22 (m, 1H), 2.84 - 2.71 (m, 1H), 2.28 - 2.11 (m, 2H), 2.02 - 2.00 (m, 3H), 2.00 - 1.47 (m, 10H), 1.47 - 1.44 (m, 7H).	487	C	

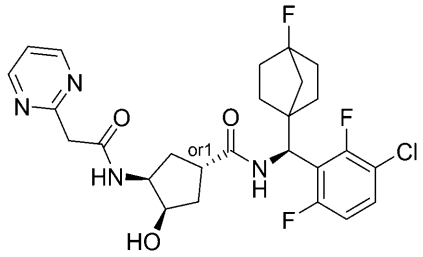
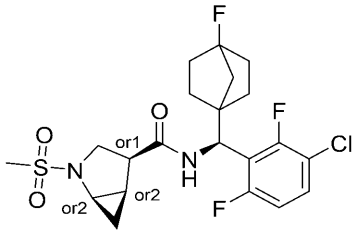
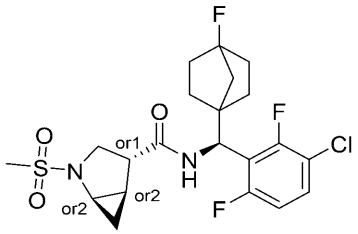
【表１－１０９７】

I-3600		1H NMR (400 MHz, CDCl3) δ 7.36 - 7.27 (m, 1H), 6.93 - 6.80 (m, 1H), 6.60 - 6.48 (m, 1H), 6.28 - 6.17 (m, 1H), 5.71 - 5.62 (m, 1H), 4.40 - 4.20 (m, 1H), 2.96 - 1.08 (m, 23H).	499	B	
I-3601			533.1	D	
I-3602			533.2	D	
I-3603			533.1	D	
I-3604			533.1	B	B

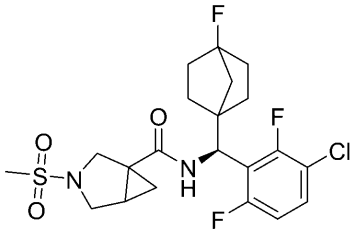
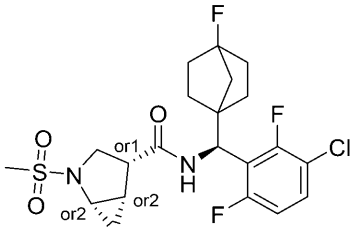
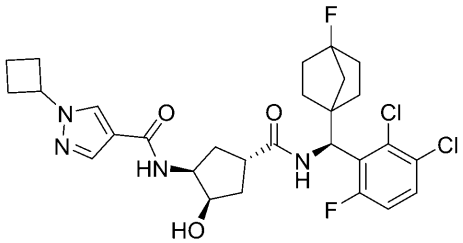
【表１－１０９８】

I-3605			537.15	B	B
I-3606			529.2	B	
I-3607			529.3	B	
I-3608			529.2	D	
I-3609			529.2	C	

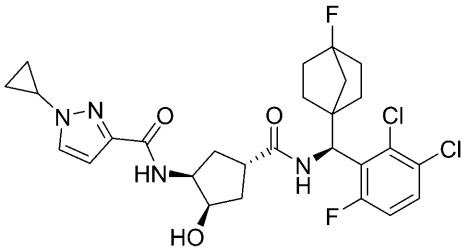
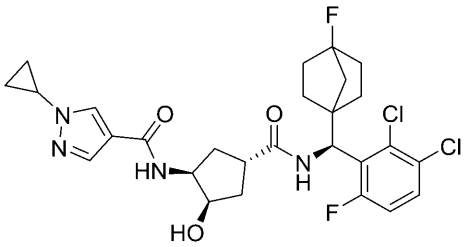
【表１－１０９９】

I-3610			537.2	D	
I-3611		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.44 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.59 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.17 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 5.38 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.41 - 3.34 (m, 2H), 3.20 (td, J = 6.1, 2.7 Hz, 1H), 3.04 - 2.95 (m, 1H), 2.91 (s, 3H), 2.09 - 1.98 (m, 1H), 1.88 - 1.68 (m, 7H), 1.63 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.47 (d, J = 10.9 Hz, 2H), 1.00 (ddd, J = 6.9, 4.5, 2.8 Hz, 1H), 0.57 (dt, J = 8.6, 6.2 Hz, 1H).	477.05	B	A
I-3612		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.43 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.29 (s, 1H), 3.16 (dt, J = 8.6, 6.8 Hz, 2H), 3.05 (dd, J = 10.5, 7.9 Hz, 1H), 2.88 (s, 3H), 1.87 - 1.68 (m, 8H), 1.63 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 10.8 Hz, 2H), 0.94 (ddd, J = 7.0, 4.7, 2.7 Hz, 1H), 0.68 (dt, J = 9.0, 6.1 Hz, 1H).	477.05	B	

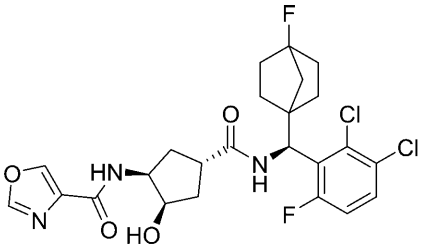
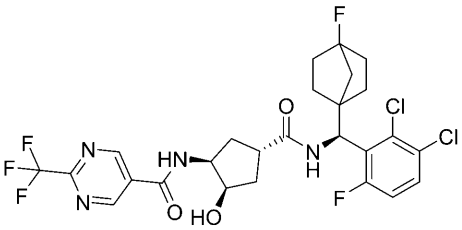
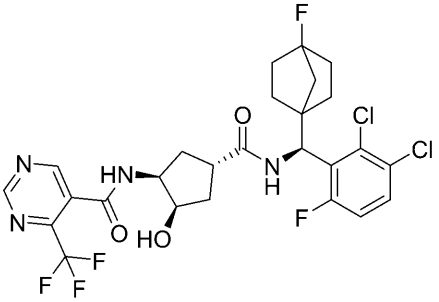
【表１－１１００】

I-3613		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.48 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.59 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 3.46 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 3.21 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 3.13 - 3.03 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 1.87 - 1.67 (m, 7H), 1.65 - 1.56 (m, 2H), 1.47 (s, 2H), 0.94 (ddd, J = 6.8, 4.6, 2.7 Hz, 1H), 0.67 (dt, J = 9.1, 6.0 Hz, 1H).	477.05	D	
I-3614		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.40 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 3.40 (t, J = 4.5 Hz, 2H), 3.17 (td, J = 6.0, 2.7 Hz, 1H), 3.06 - 2.97 (m, 1H), 2.90 (s, 3H), 1.93 - 1.69 (m, 8H), 1.63 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.47 (q, J = 10.7, 7.6 Hz, 2H), 0.83 (ddd, J = 6.9, 4.5, 2.8 Hz, 1H), 0.42 (dt, J = 8.7, 6.2 Hz, 1H).	477.1	D	
I-3615		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.32 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.91 - 4.76 (m, 2H), 4.10 (qd, J = 9.0, 3.5 Hz, 1H), 4.05 - 3.93 (m, 1H), 3.13 (p, J = 8.9, 8.4 Hz, 1H), 2.40 (p, J = 8.0, 6.5 Hz, 4H), 1.99 - 1.45 (m, 16H).	581.1	B	B

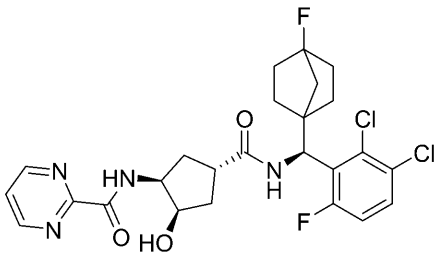
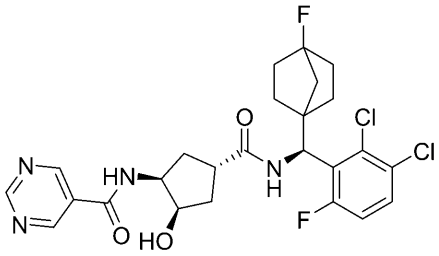
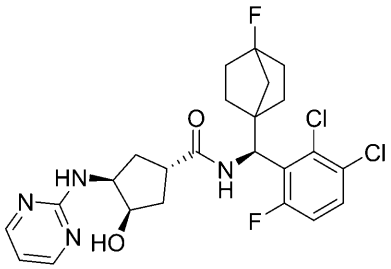
【表１－１１０１】

I-3616		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 6.59 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.21 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.10 (q, J = 8.5, 6.5 Hz, 1H), 4.03 (s, 1H), 3.78 (tt, J = 7.4, 3.9 Hz, 1H), 3.14 (s, 1H), 2.03 ?C 1.61 (m, 11H), 1.61 - 1.44 (m, 3H), 1.12 - 1.04 (m, 2H), 1.01 (dd, J = 7.0, 4.6 Hz, 2H).	567.3	A	A
I-3617		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.24 (d, J = 26.3 Hz, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.27 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.84 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.08 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.99 (s, 1H), 3.74 (dq, J = 7.5, 3.9 Hz, 1H), 3.12 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 1.85 (d, J = 22.6 Hz, 4H), 1.73 (d, J = 10.7 Hz, 4H), 1.67 - 1.42 (m, 6H), 1.07- 0.91 (m, 4H).	567.35	B	B

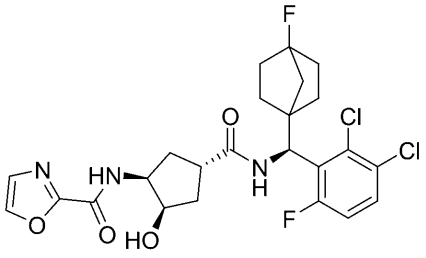
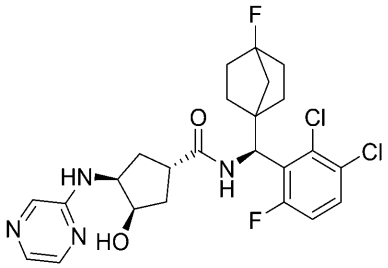
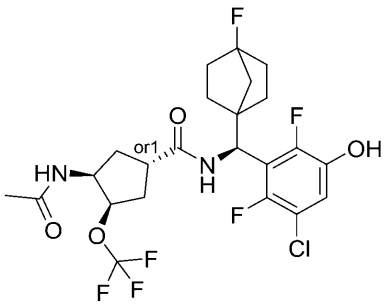
【表１－１１０２】

I-3618		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.66 (d, J = 1.1 Hz, 1H),8.54 - 8.50 (m, 1H), 8.24 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.65 - 7.56 (m, 2H), 7.27 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.12 (dd, J = 8.3, 4.5 Hz, 1H), 4.05 (s, 1H), 3.15 (s, 1H), 1.86 - 1.66 (m, 11H), 1.58 (d, J = 8.5 Hz, 3H).	528.15	B	A
I-3619		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.39 (s, 2H), 8.66 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.92 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.24 - 4.08 (m, 2H), 3.18 (dd, J = 9.3, 4.9 Hz, 1H), 2.06 - 1.51 (m, 14H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -69.04, -109.32, -173.53, -173.76.	607.15	B	B
I-3620		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 9.48 (s, 1H), 9.16 (s, 1H), 8.60 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.96 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.21 - 4.03 (m, 2H), 3.15 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 2.03 - 1.48 (m, 14H).	607.2	C	

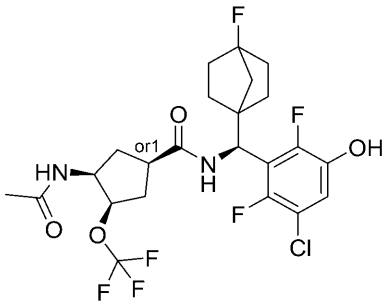
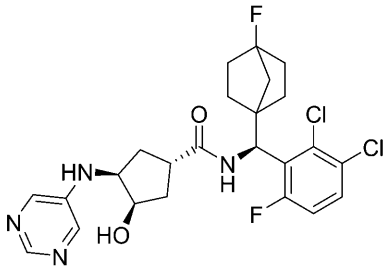
【表１－１１０３】

I-3621		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)8.97 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 8.46 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.70-7.60 (m, 2H),? 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 4.23-4.07 (m, 2H), 3.16 (dt, J = 13.8, 6.9 Hz, 1H), 2.05 (ddd, J = 12.9, 8.2, 5.0 Hz, 1H), 1.95-1.48 (m, 13H).	539.2	B	A
I-3622		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.29 (s, 1H), 9.17 (s, 2H), 8.45 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.89 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.21 - 4.04 (m, 2H), 3.16 (td, J = 9.1, 8.5, 4.2 Hz, 1H), 2.05 - 1.48 (m, 14H).	539.2	B	A
I-3623		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.23 (dd, J = 17.8, 6.5 Hz, 3H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 6.57 (t, J = 4.7 Hz, 1H), 6.39 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.85 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.16 - 4.05 (m, 2H), 3.16 - 3.08 (m, 1H), 1.91 - 1.58 (m, 1H), 1.81 (m, 14H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -109.23, -111.42, -173.52, -173.76.	511.15	B	A

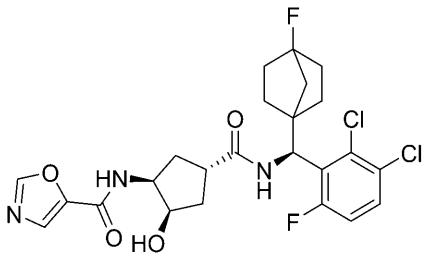
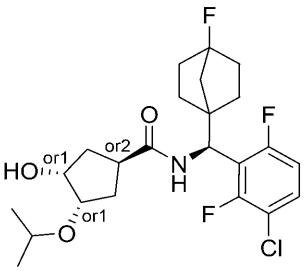
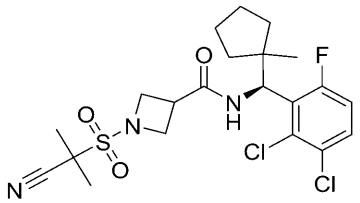
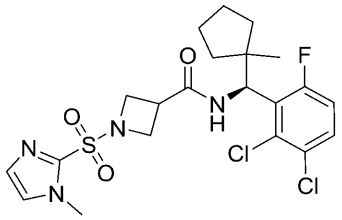
【表１－１１０４】

I-3624		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.20 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.09 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 3.16 (s, 1H), 1.92 - 1.58 (m, 14H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -109.29, -111.40, -173.53, -173.76.	528.15	B	A
I-3625		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.88 (dd, J = 2.9, 1.5 Hz, 1H), 7.67-7.54 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 6.74 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.84 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.09 (d, J = 6.5 Hz, 2H), 3.13 (dt, J = 13.0, 9.4 Hz, 1H), 1.96-1.54 (m, 14H). 19F NMR (282 MHz, DMSO) -109.259, 173.778.	511.2	A	A
I-3626		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.27 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.01 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.73 (s, 1H), 4.09 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.21 -3.06 (m, 1H), 2.14 (dd, J = 14.6, 8.6 Hz, 1H), 2.04 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 1.83 - 1.65 (m, 12H), 1.58 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.45 (s, 2H).	543.15	C	

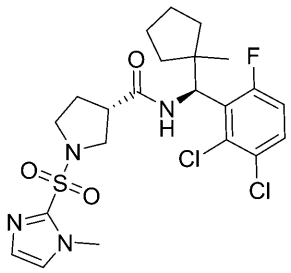
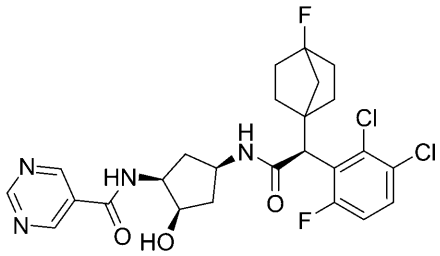
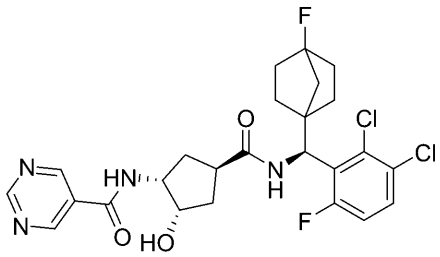
【表１－１１０５】

I-3627		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.27 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.00 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.70 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 4.14 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.14 (t, J = 10.3 Hz, 1H), 2.03 (dd, J = 14.6, 8.7 Hz, 1H), 1.99 - 1.87 (m, 2H), 1.82-1.65 (s, 11H), 1.58 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 9.5 Hz, 2H).	543.15	C	
I-3628		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.35 (s, 1H), 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.15 (s, 2H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.83 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.88 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 4.13 (t, J = 3.8 Hz, 1H), 3.72 - 3.61 (m, 1H), 3.14 (s, 1H), 2.04 (ddd, J = 17.6, 7.8, 3.8 Hz, 1H), 1.92 - 1.55 (m, 9H), 1.55 - 1.42 (m, 4H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -109.33, -111.40, -173.52, -173.76.	511.15	B	A

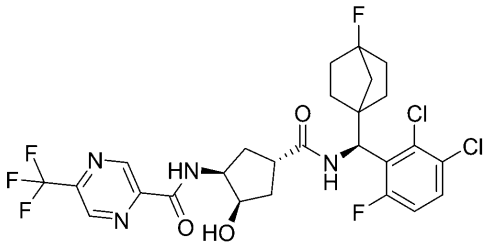
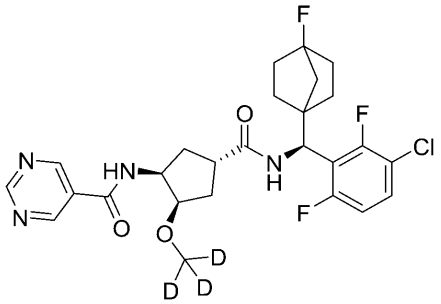
【表１－１１０６】

I-3629		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.54 (s, 1H), 8.24 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.01 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.15 - 4.02 (m, 2H), 3.13 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 1.92 - 1.58 (m, 14H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -109.31, -111.40, -173.54, -173.77.	528.2	B	A
I-3630		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.20 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.44 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 3.89 (p, J = 4.7 Hz, 1H), 3.72 - 3.62 (m, 2H), 2.66 (qd, J = 8.9, 6.2 Hz, 1H), 2.05 - 1.39 (m, 14H), 1.09 (dd, J = 12.0, 6.0 Hz, 6H).	460.2	C	
I-3631			491.4	D	
I-3632			504.4	C	

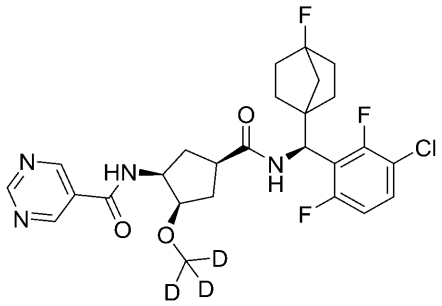
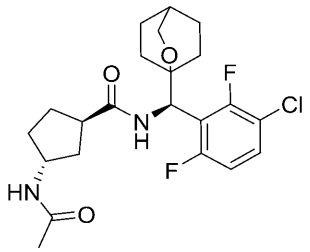
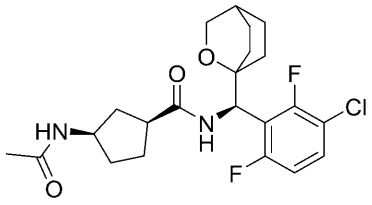
【表１－１１０７】

I-3633			518.4	B	
I-3634		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.28 (s, 1H), 9.15 (s, 2H), 8.42 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.89 (s, 1H), 4.13 (s, 2H), 3.21 - 3.10 (m, 1H), 2.02 C 1.48 (m, 14H).	539.05	D	
I-3635		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 9.29 (s, 1H), 9.16 (s, 2H), 8.42 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.89 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.14 (s, 2H), 3.17 (s, 1H), 2.03-1.65 (m, 11H), 1.57 (t, J = 12.3 Hz, 3H).	539.25	B	

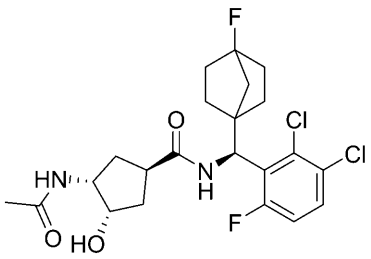
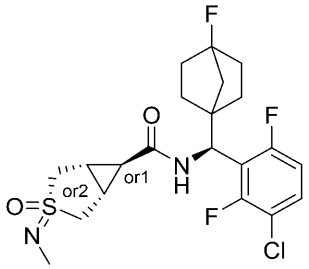
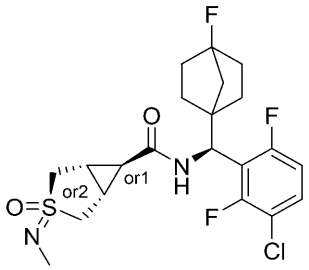
【表１－１１０８】

I-3636		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.37 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 9.29 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.33 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 4.25 - 4.15 (m, 1H), 4.12 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.27 - 3.18 (m, 1H), 2.07 (dq, J = 13.0, 7.8, 6.5 Hz, 1H), 1.93 - 1.73 (m, 10H), 1.71 - 1.58 (m, 3H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -66.18, -66.21, -109.28, -173.76.	607.15	B	
I-3637		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.30 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 9.17-9.08 (m, 2H), 8.57 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.30 (dt, J = 12.6, 6.2 Hz, 1H), 3.77 (s, 1H), 3.16-3.02 (m, 1H), 2.07-1.93 (m, 3H), 1.86-1.56 (m, 9H), 1.46 (s, 2H). 19F NMR (282 MHz, DMSO) -111.047, -113.597, -173.563.	540.25	B	

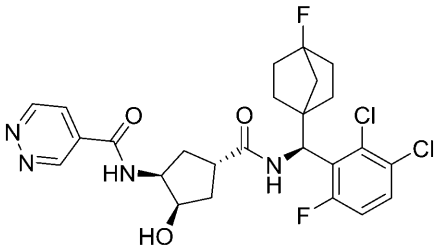
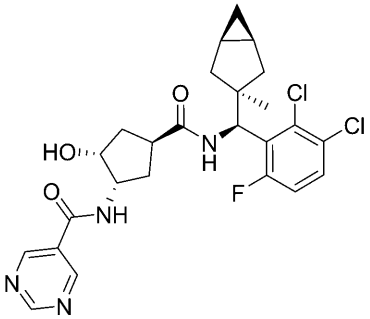
【表１－１１０９】

I-3638		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.30 (s, 1H), 9.14 (d, J = 1.4 Hz, 2H), 8.56 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.23-7.09 (m, 1H), 5.29 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.35-4.18 (m, 1H), 3.80 (td, J = 4.5, 2.4 Hz, 1H), 3.10 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 2.12 (ddd, J = 13.6, 8.8, 2.5 Hz, 1H), 1.94 (q, J = 10.5 Hz, 1H), 1.85-1.68 (m, 9H), 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.47 (d, J = 8.0 Hz, 2H). 19F NMR (282 MHz, DMSO) -111.635, -113.401, -173.565.	540.25	C	
I-3639		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.06 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.11 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.12 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.05-3.88 (m, 1H), 3.74 (s, 2H), 2.88 (t, J = 8.3 Hz, 1H), 1.96 (dt, J = 12.3, 7.4 Hz, 1H), 1.88-1.51 (m, 15H), 1.46-1.24 (m, 2H).	441.15	E	
I-3640		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.00 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.22-7.00 (m, 1H), 5.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.00 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 3.74 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 2.97 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 1.91-1.74 (m, 7H), 1.73-1.48 (m, 9H), 1.47-1.28 (m, 2H).	441.15	D	

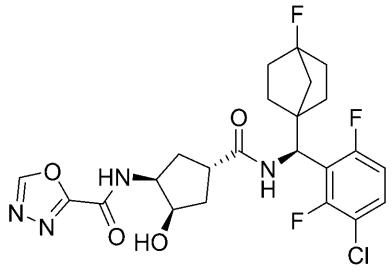
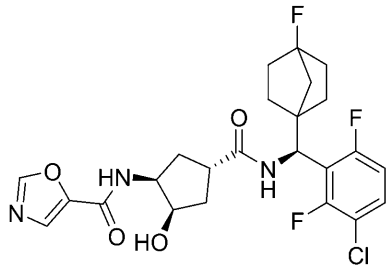
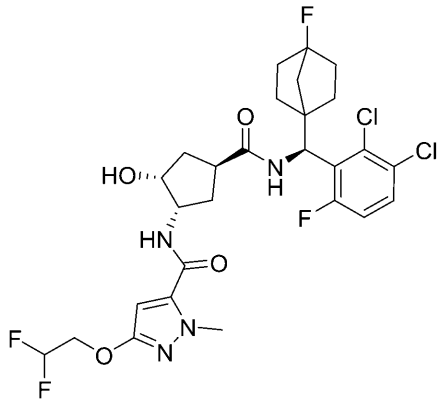
【表１－１１１０】

I-3641		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.19 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.00-3.92 (m, 1H), 3.88 (dd, J = 10.8, 7.0 Hz, 1H), 3.19-3.03 (m, 1H), 1.93-1.65 (m, 12H), 1.59 (dd, J = 11.0, 6.9 Hz, 5H).	475.15	B	
I-3642		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.71 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.65-7.52 (m, 1H), 7.16 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.62 (ddd, J = 22.5, 13.7, 6.8 Hz, 2H), 2.88 (d, J = 13.4 Hz, 2H), 2.62 (s, 3H), 2.28 (t, J = 3.9 Hz, 1H), 1.96 (d, J = 26.6 Hz, 2H), 1.77 (dd, J = 23.2, 12.9 Hz, 7H), 1.62 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.45 (s, 2H).	461.1	E	
I-3643		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.71 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.20-7.11 (m, 1H), 5.30 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 3.71-3.49 (m, 2H), 2.88 (dd, J = 13.7, 2.0 Hz, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.28 (t, J = 3.9 Hz, 1H), 2.06-1.89 (m, 2H), 1.86-1.68 (m, 7H), 1.62 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.44 (d, J = 13.9 Hz, 2H).	461.1	D	

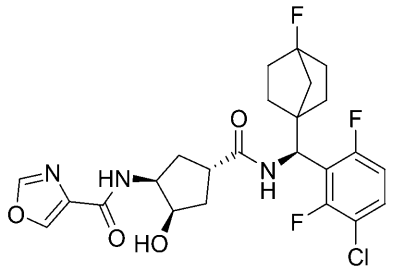
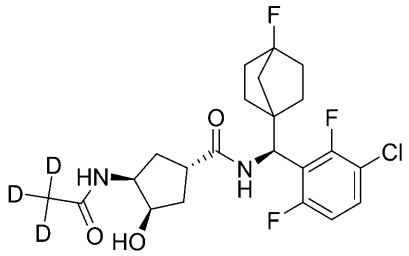
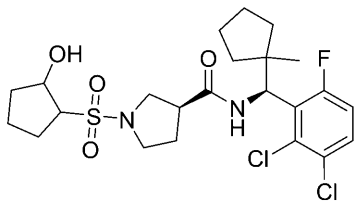
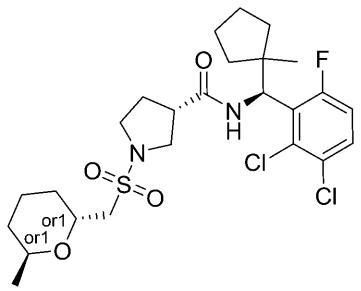
【表１－１１１１】

I-3644		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.56 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 9.42 (dd, J = 5.4, 1.3 Hz, 1H), 8.60 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 5.4, 2.3 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.92 (s, 1H), 4.13 (d, J = 24.3 Hz, 2H), 3.24-3.12 (m, 1H), 2.08 (s, 1H), 2.07-1.48 (m, 13H).	539.1	B	A
I-3645		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.29 (s, 1H), 9.17 (s, 2H), 8.44 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.32 - 7.20 (m, 1H), 5.42 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.86 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.21 - 4.04 (m, 2H), 3.19 (tt, J = 12.5, 6.2 Hz, 1H), 2.01 (dt, J = 12.7, 10.3 Hz, 1H), 1.88 (ddd, J = 12.5, 8.5, 3.9 Hz, 1H), 1.69 (dtd, J = 23.5, 13.4, 7.1 Hz, 3H), 1.53 (dd, J = 12.8, 5.8 Hz, 1H), 1.46 - 1.20 (m, 4H), 1.17 - 0.93 (m, 3H), 0.85 (td, J = 7.9, 4.0 Hz, 1H), 0.11 (q, J = 3.9 Hz, 1H).	521.1	B	A

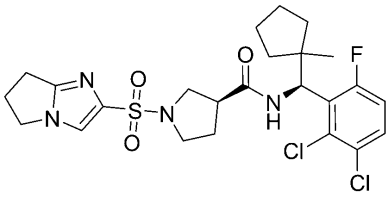
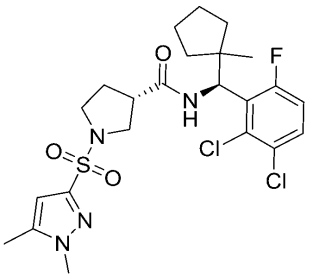
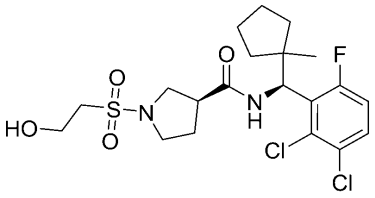
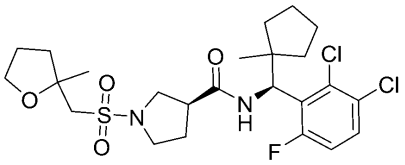
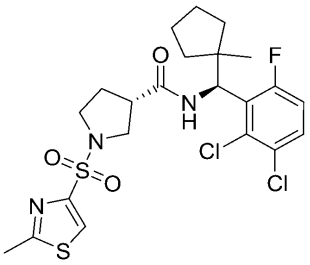
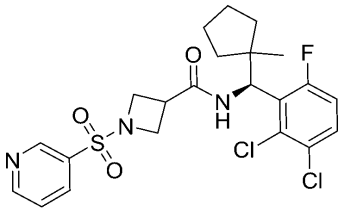
【表１－１１１２】

I-3646		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.44 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.12 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.15 - 4.05 (m, 2H), 3.16 (p, J = 7.8 Hz, 1H), 1.98 (t, J = 8.2 Hz, 2H), 1.83 - 1.63 (m, 9H), 1.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 9.0 Hz, 2H).	513.3	B	A
I-3647		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.54 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.3 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.02 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.09 (ddt, J = 20.7, 8.4, 4.1 Hz, 2H), 3.15 (p, J = 8.2 Hz, 1H), 1.93 (t, J = 8.6 Hz, 2H), 1.85 - 1.58 (m, 10H), 1.46 (d, J = 9.1 Hz, 2H).	512.15	B	A
I-3648		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 6.53-6.17 (m, 2H), 5.50 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.91 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.35 (td, J = 14.9, 3.6 Hz, 2H), 4.11-4.02 (m, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.21-3.06 (m, 1H), 1.97-1.47 (m, 14H).	621.25	B	

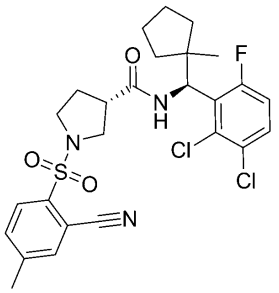
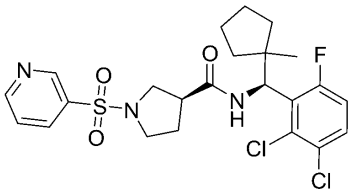
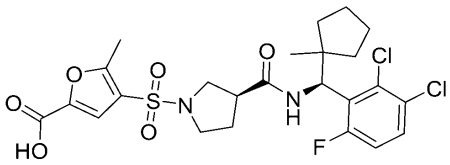
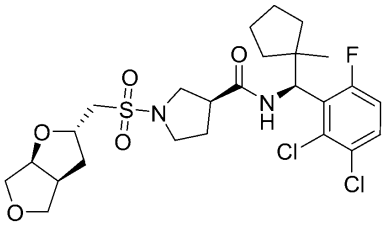
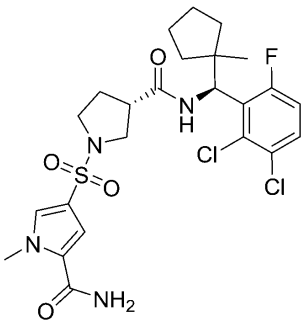
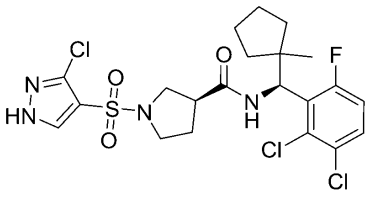
【表１－１１１３】

I-3649		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.66 (s, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 2H), 7.15 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.32 - 5.22 (m, 2H), 4.11 (dtd, J = 28.0, 9.3, 8.8, 4.6 Hz, 2H), 3.16 (qd, J = 8.6, 4.8 Hz, 1H), 2.00 (ddd, J = 13.0, 8.3, 4.9 Hz, 1H), 1.76 (dtt, J = 17.3, 12.6, 7.1 Hz, 10H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.54 - 1.38 (m, 2H).	512.1	B	A
I-3650		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.77 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 3.92 (q, J = 8.5, 6.9 Hz, 2H), 3.08 (td, J = 9.3, 8.7, 4.5 Hz, 1H), 1.88-1.62 (m, 10H), 1.60 (td, J = 9.1, 3.6 Hz, 2H), 1.45 (d, J = 9.6 Hz, 2H).	462.15	B	
I-3651			522	B	
I-3652			550	D	

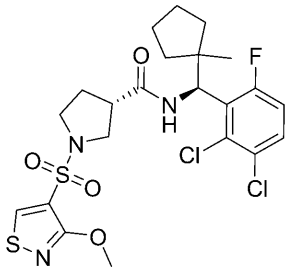
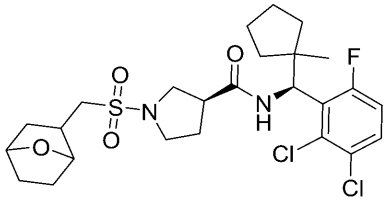
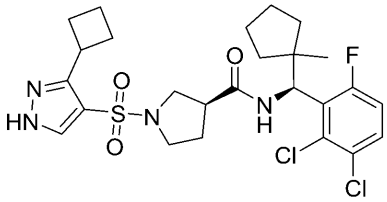
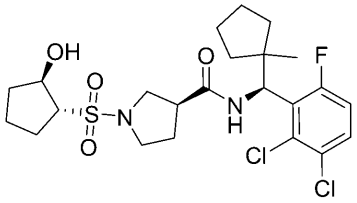
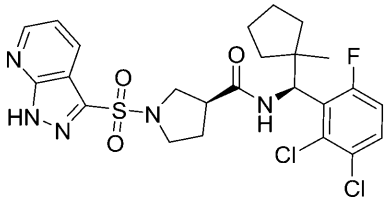
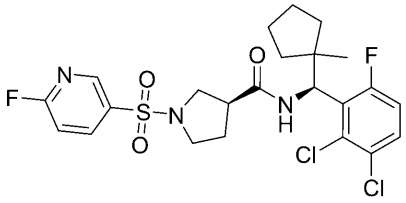
【表１－１１１４】

I-3653			544	B	
I-3654			532	B	
I-3655			482	B	
I-3656			536	D	
I-3657			535	C	
I-3658			501	B	

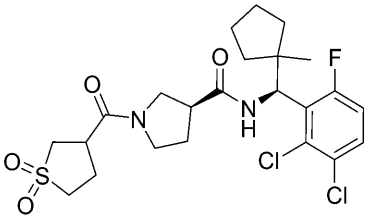
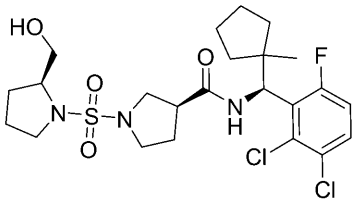
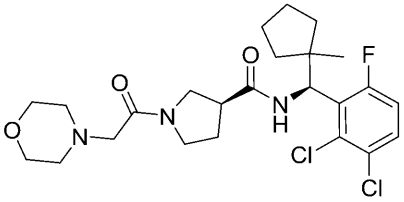
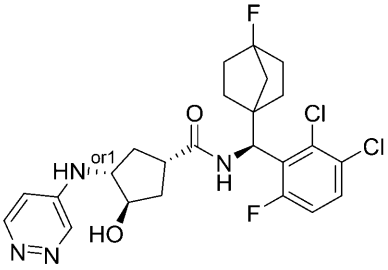
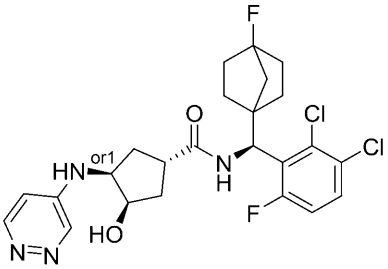
【表１－１１１５】

I-3659			553	D	
I-3660			515	B	
I-3661			562	B	D
I-3662			564	B	B
I-3663			560	A	A
I-3664			538	B	A

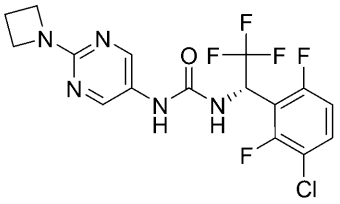
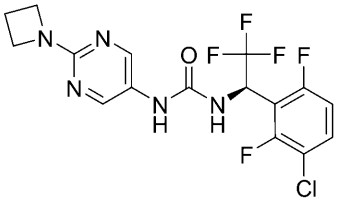
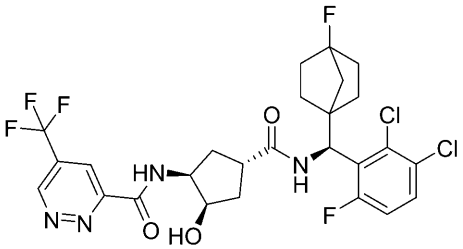
【表１－１１１６】

I-3665			551	D	
I-3666			548	C	
I-3667			558	B	
I-3668			522	B	
I-3669			555	B	A
I-3670			533	C	

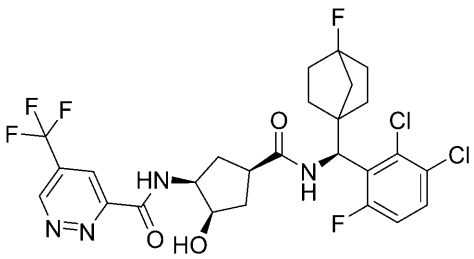
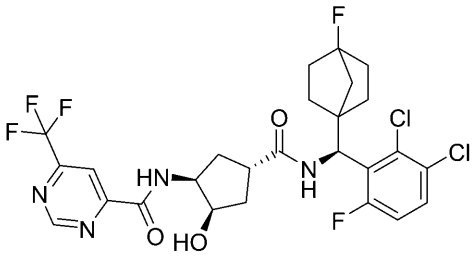
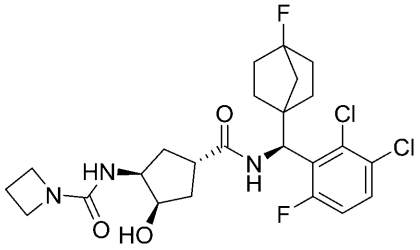
【表１－１１１７】

I-3671			520	B	
I-3672			537	C	
I-3673			501	C	
I-3674		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.63 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 6.75 - 6.57 (m, 2H), 5.52 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.15 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 4.07 (s, 1H), 3.66 (s, 1H), 2.88 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 2.23 - 1.48 (m, 14H).	511.15	B	
I-3675		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.64 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.33 - 7.22 (m, 1H), 6.70 - 6.56 (m, 2H), 5.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.96 (s, 1H), 4.12 (s, 1H), 2.15 - 1.42 (m, 14H).	511.15	A	A

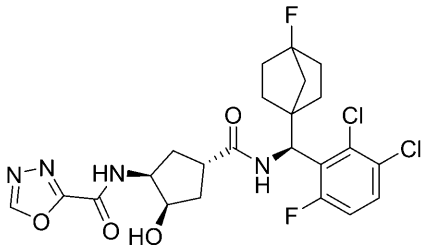
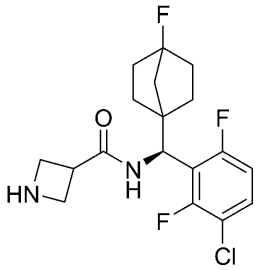
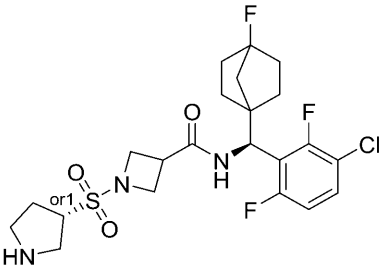
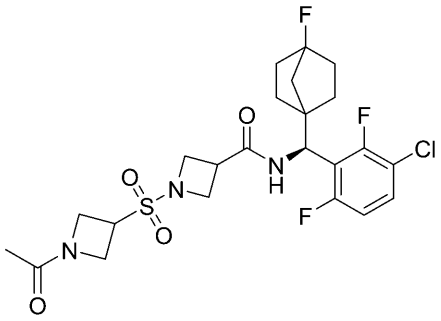
【表１－１１１８】

I-3676		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.66 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.93-7.81 (m, 1H), 7.59 (d, J = 10.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 9.7 Hz, 1H), 6.08 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 4.13-3.91 (m, 4H), 2.28 (t, J = 7.5 Hz, 2H). 19F NMR (282 MHz, DMSO) -73.64, -113.28, -113.34.	422.05	E	
I-3677		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.67 (s, 1H), 8.36 (s, 2H), 7.84 (td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.9 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 6.09 (p, J = 9.0 Hz, 1H), 3.99 (t, J = 7.4 Hz, 4H), 2.28 (p, J = 7.5 Hz, 2H). 19F NMR (282 MHz, DMSO) -73.678, -113.286, -113.344.	422.05	D	
I-3678		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.91 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.33 - 7.22 (m, 1H), 5.53 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.31 - 4.11 (m, 2H), 3.25 - 3.12 (m, 1H), 2.17 - 1.45 (m, 14H).	607.15	B	

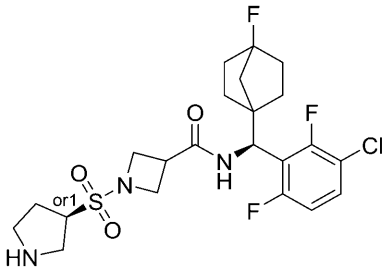
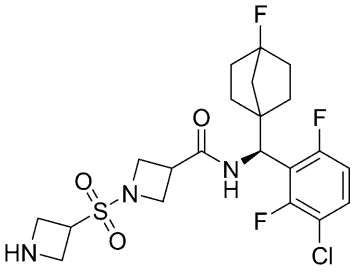
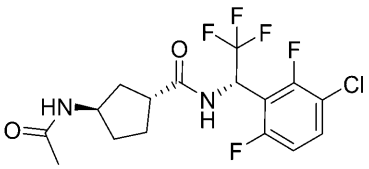
【表１－１１１９】

I-3679		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.90 (s, 1H), 8.72 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 4.9 Hz, 1H), 7.26 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.31 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 4.19 (s, 2H), 3.24 - 3.16 (m, 1H), 1.96 - 1.46 (m, 14H).	607.1	E	
I-3680		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.61 (s, 1H), 8.57 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.55-5.31 (m, 2H), 4.28-4.07 (m, 2H), 3.18 (qd, J = 8.5, 4.7 Hz, 1H), 2.07 (ddd, J = 12.9, 8.3, 4.8 Hz, 1H), 1.92-1.48 (m, 13H). 19F NMR (377 MHz, DMSO) -68.686, -109.290, -173.779.	607.2	B	
I-3681		19F NMR (282 MHz, DMSO) -109.27, -173.53, -173.77. 1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 4.77 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.91-3.85 (m, 1H), 3.78 (dd, J = 9.9, 5.1 Hz, 4H), 3.12-2.98 (m, 1H), 2.10 (p, J = 7.4 Hz, 2H), 1.85-1.49 (m, 15H).	516.2	B	A

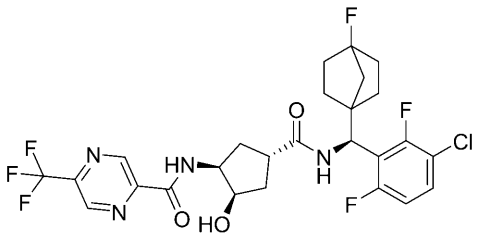
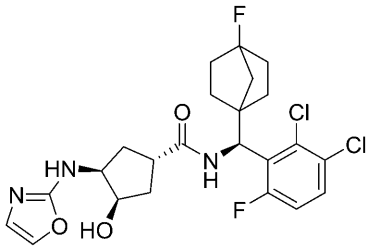
【表１－１１２０】

I-3682		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 9.44 (s, 1H), 8.50 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.12 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 4.11 (s, 2H), 3.16 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 2.03 - 1.46 (m, 14H).	527.1	B	A
I-3683				D	
I-3684			506.15	B	
I-3685			534.15	C	

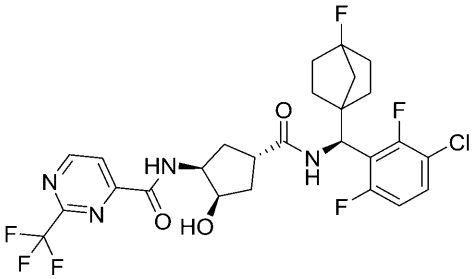
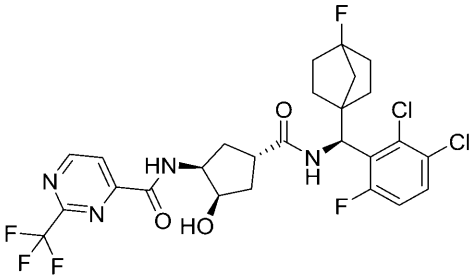
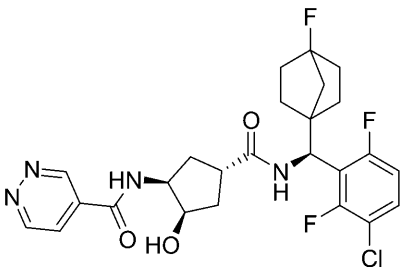
【表１－１１２１】

I-3686			506.15	B	
I-3687			492.1	B	
I-3688		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 9.18 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.86-7.73 (m, 2H), 7.33 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 6.12 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 4.01 (h, J = 6.6 Hz, 1H), 3.08-2.94 (m, 1H), 2.00-1.82 (m, 2H), 1.76 (s, 4H), 1.69-1.54 (m, 2H), 1.47-1.34 (m, 1H). 19F NMR (282 MHz, DMSO) -72.03, -112.78.	399.1	E	

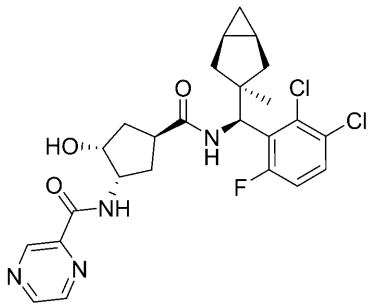
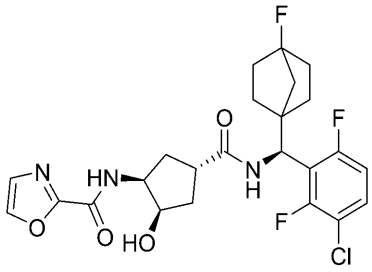
【表１－１１２２】

I-3689		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 1H), 8.43 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.34 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.25 - 4.16 (m, 1H), 4.13 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 3.19 (s, 1H), 2.07 (q, J = 8.3, 7.5 Hz, 1H), 1.94 - 1.70 (m, 10H), 1.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.0 Hz, 2H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -66.22, -111.67, -113.78, -173.55.	591.15	B	
I-3690		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 6.77-6.65 (m, 2H), 5.50 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 4.06 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 3.78 (qd, J = 8.4, 3.8 Hz, 1H), 3.10 (dt, J = 13.4, 9.0 Hz, 1H), 2.03-1.40 (m, 14H).	500.1	B	A

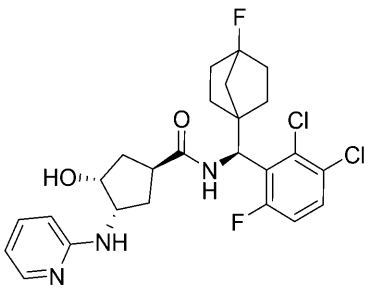
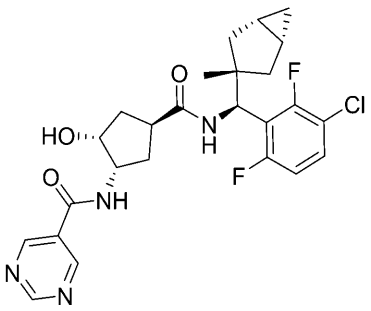
【表１－１１２３】

I-3691		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.33 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.37-8.24 (m, 2H), 7.57 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.17 (dt, J = 24.7, 4.8 Hz, 2H), 3.20 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 2.08 (dq, J = 11.1, 6.4, 5.7 Hz, 1H), 1.93-1.57 (m, 11H), 1.46 (d, J = 8.5 Hz, 2H).	591.15	B	B
I-3692		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.32 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.26 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.38 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.20 (qd, J = 8.3, 4.4 Hz, 1H), 4.13 (t, J = 4.3 Hz, 1H), 3.25 -3.13 (m, 1H), 2.08 (ddd, J = 13.1, 8.4, 5.0 Hz, 1H), 1.93 - 1.46 (m, 13H).	607.15	B	B
I-3693		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.56 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 9.41 (dd, J = 5.3, 1.3 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.02 (dd, J = 5.3, 2.3 Hz, 1H), 7.63-7.51 (m, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.91 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.13 (dd, J = 20.0, 6.8 Hz, 2H), 3.17 (s, 1H), 2.11-1.87 (m, 2H), 1.86-1.56 (m, 10H), 1.46 (d, J = 8.6 Hz, 2H).	523.15	B	B

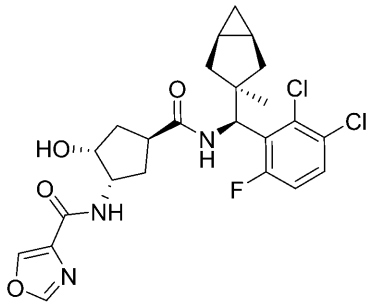
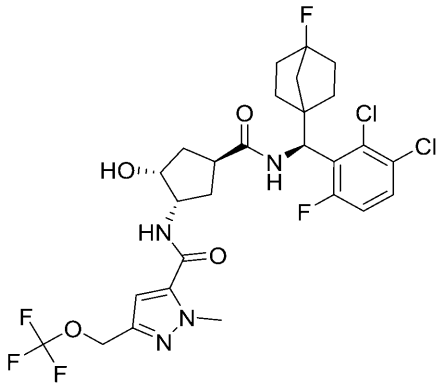
【表１－１１２４】

I-3694		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.21 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.89 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.77 - 8.71 (m, 1H), 8.33 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.43 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.27 (s, 1H), 4.25 - 4.13 (m, 1H), 4.10 (s, 1H), 3.23 - 3.15 (m, 1H), 2.01 (ddd, J = 13.0, 8.2, 5.1 Hz, 1H), 1.86 (dt, J = 12.8, 9.4 Hz, 1H), 1.74 (dd, J = 8.5, 3.3 Hz, 2H), 1.63 (dd, J = 12.7, 5.7 Hz, 1H), 1.56 - 1.48 (m, 1H), 1.38 (t, J = 13.7 Hz, 2H), 1.31 (s, 2H), 1.08 (s, 3H), 0.85 (td, J = 7.8, 4.0 Hz, 1H), 0.10 (q, J = 4.0 Hz, 1H).	521.15	A	A
I-3695		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.30 (d, J = 22.6 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 2H), 7.45 (s, 1H), 7.20-7.07 (m, 1H), 5.25 (dd, J = 22.1, 5.9 Hz, 2H), 4.15-4.02 (m, 2H), 3.15 (dt, J = 13.7, 7.0 Hz, 1H), 2.07-1.54 (m, 12H), 1.46 (d, J = 9.4 Hz, 2H).	512.15	B	A

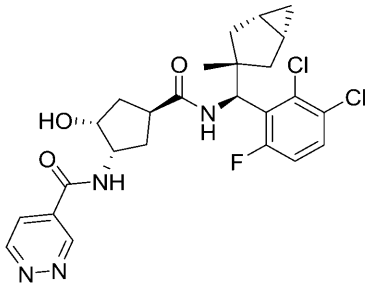
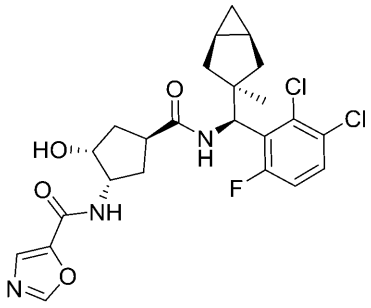
【表１－１１２５】

I-3696		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.92 (dd, J = 5.1, 1.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.38-7.19 (m, 2H), 6.59-6.38 (m, 2H), 6.07 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.82 (s, 1H), 4.08 (dd, J = 13.9, 5.4 Hz, 2H), 3.11 (td, J = 13.0, 8.5 Hz, 1H), 2.11-1.31 (m, 14H).	510.1	B	A
I-3697		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.29 (s, 1H), 9.17 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 8.43 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.55 (q, J = 7.7, 7.2 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.85 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.16 (s, 1H), 4.10 (s, 1H), 3.19 (s, 1H), 2.01 (q, J = 11.2 Hz, 1H), 1.89 (s, 1H), 1.77 (s, 1H), 1.68 (d, J = 13.3 Hz, 2H), 1.46 (s, 1H), 1.32 (q, J = 13.9, 13.3 Hz, 4H), 1.07 (s, 3H), 0.86 (s, 1H), 0.15 (s, 1H).	505.15	A	A

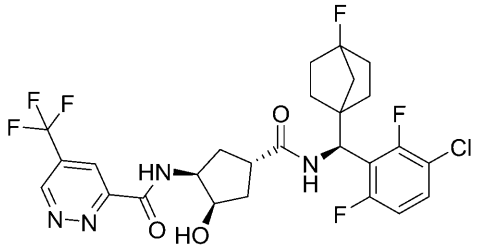
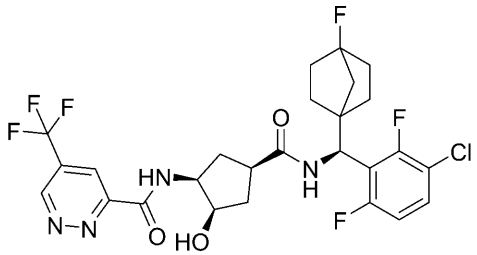
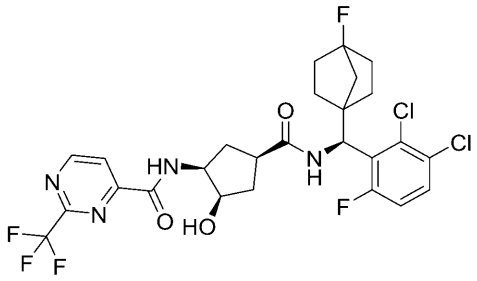
【表１－１１２６】

I-3698		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.66 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.63 - 7.52 (m, 2H), 7.25 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.42 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.18 - 3.98 (m, 2H), 3.17 (s, 1H), 1.95 (dt, J = 8.1, 4.9 Hz, 1H), 1.87 - 1.76 (m, 1H), 1.67 (dd, J = 30.5, 9.6 Hz, 3H), 1.52 (d, J = 12.7 Hz, 1H), 1.36 (dd, J = 27.5, 13.7 Hz, 4H), 1.07 (s, 3H), 0.90 - 0.78 (m, 1H), 0.10 (d, J = 4.1 Hz, 1H).	510.1	A	A
I-3699		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.25 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.11-8.02 (m, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.91 (s, 1H), 4.04 (s, 5H), 3.14 (s, 1H), 2.03-1.49 (m, 14H).	639.1	B	

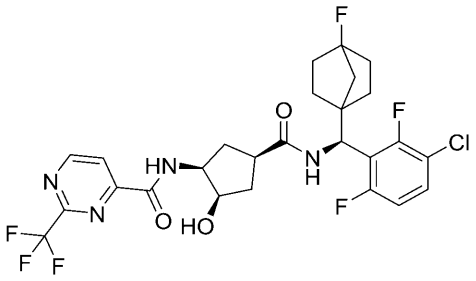
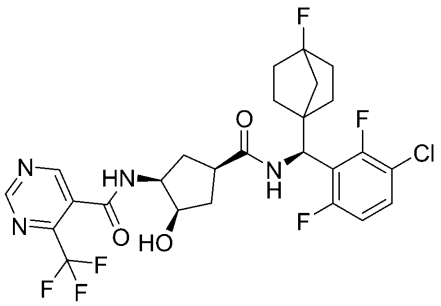
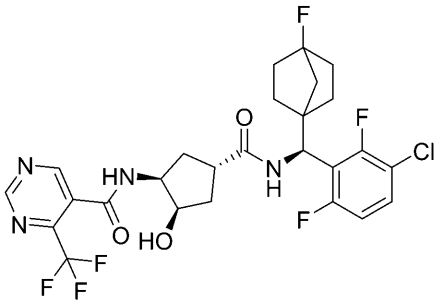
【表１－１１２７】

I-3700		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.55 (dd, J = 2.3, 1.3 Hz, 1H), 9.41 (dd, J = 5.3, 1.3 Hz, 1H), 8.55 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.07 - 7.97 (m, 2H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.43 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.86 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.21 - 4.06 (m, 2H), 3.23 - 3.15 (m, 1H), 2.19 - 1.84 (m, 2H), 1.80 - 1.59 (m, 3H), 1.53 (dd, J = 12.6, 5.8 Hz, 1H), 1.37 (dd, J = 26.1, 13.6 Hz, 4H), 1.08 (d, J = 2.4 Hz, 3H), 0.85 (td, J = 8.0, 4.1 Hz, 1H), 0.11 (q, J = 3.9 Hz, 1H).	521.25	A	A
I-3701		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.53 (s, 1H), 8.02 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.25 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.98 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.08 (d, J = 20.6 Hz, 2H), 3.16 (s, 1H), 1.91 (q, J = 8.9, 8.3 Hz, 2H), 1.79 - 1.56 (m, 3H), 1.51 (s, 1H), 1.36 (dd, J = 27.3, 14.0 Hz, 4H), 1.07 (s, 3H), 0.84 (s, 1H), 0.10 (s, 1H).	510.1	A	A

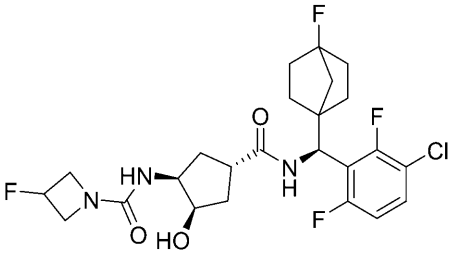
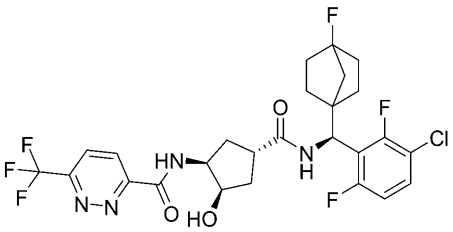
【表１－１１２８】

I-3702		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6)9.92 (dd, J = 2.3, 0.8 Hz, 1H), 8.76 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.50 (dt, J = 2.2, 0.9 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.26 - 7.05 (m, 1H), 5.31 (dd, J = 8.4, 6.0 Hz, 2H), 4.28 (td, J = 8.3, 4.4 Hz, 1H), 4.17 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 3.20 (dt, J = 13.4, 6.6 Hz, 1H), 2.10 (ddd, J = 13.0, 8.3, 4.9 Hz, 1H), 2.00 - 1.59 (m, 11H), 1.47 (s, 2H).	591.2	B	A
I-3703		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 9.91 (dd, J = 2.3, 0.7 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.48 (dd, J = 2.3, 0.9 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 5.33 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.28 - 4.16 (m, 2H), 3.30 - 3.12 (m, 1H), 1.90 (t, J = 8.1 Hz, 4H), 1.84 - 1.59 (m, 8H), 1.48 (s, 2H).	591.15	E	
I-3704		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.24 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.40 - 8.13 (m, 3H), 7.56 (dd, J = 8.8, 4.8 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 9.9 Hz, 1H), 5.48 - 5.25 (m, 2H), 4.09 (s, 2H), 3.12 (s, 1H), 1.95 - 1.19 (m, 14H).	606.12	E	

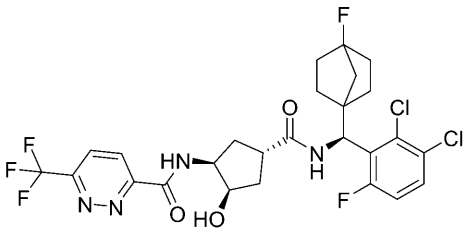
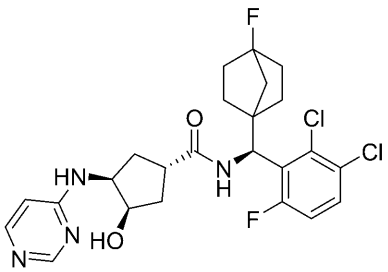
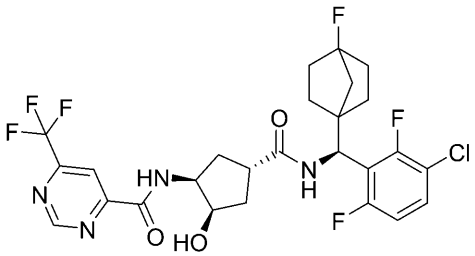
【表１－１１２９】

I-3705		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6 9.31 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.35 - 8.25 (m, 2H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 5.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.17 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 3.19 (dd, J = 9.3, 5.8 Hz, 1H), 1.96 - 1.68 (m, 11H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 9.1 Hz, 2H).	591.15	E	
I-3706		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 9.47 (s, 1H), 9.15 (s, 1H), 8.59 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.8, 5.6 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.98 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.11 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 3.21 - 3.06 (m, 1H), 1.91 - 1.40 (m, 14H).	589.1	E	
I-3707		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 9.48 (s, 1H), 9.17 (s, 1H), 8.61 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.97 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.12 (d, J = 17.9 Hz, 2H), 3.23 - 3.09 (m, 1H), 2.06 - 1.40 (m, 13H).	591.2	C	

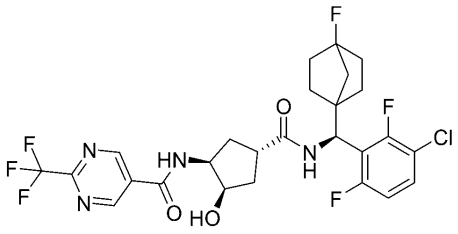
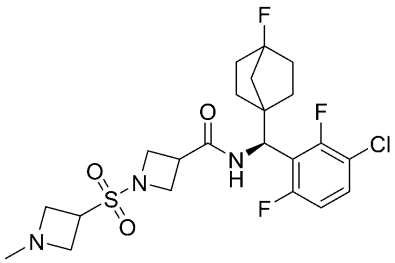
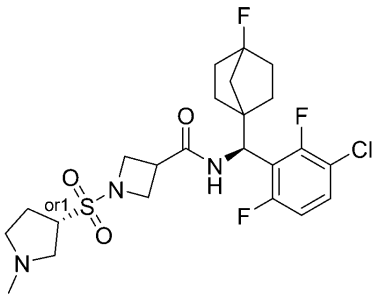
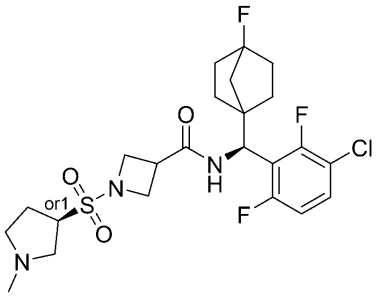
【表１－１１３０】

I-3708		19F NMR (377 MHz, DMSO) -111.40, -113.97, -173.55, -179.56. 1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.88 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.44-5.19 (m, 2H), 4.76 (dd, J = 3.3, 1.6 Hz, 1H), 4.12 (ddd, J = 21.6, 10.4, 6.0 Hz, 2H), 3.98-3.72 (m, 4H), 3.07 (dd, J = 9.7, 5.3 Hz, 1H), 1.88-1.66 (m, 10H), 1.64-1.53 (m, 2H), 1.45 (d, J = 9.7 Hz, 2H).	518.2	B	
I-3709		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.74 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 1.2 Hz, 2H), 8.30 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.34 (s, 1H), 5.32 (d, J = 10.9 Hz, 1H), 4.29 - 4.22 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.21 (dd, J = 9.3, 4.9 Hz, 1H), 1.96 - 1.91 (m, 1H), 1.77 (dq, J = 23.1, 14.0, 11.0 Hz, 10H), 1.61 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 1.50 - 1.44 (m, 2H).	589.05	B	

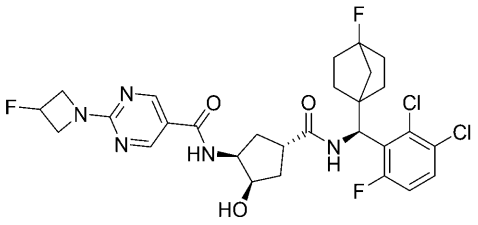
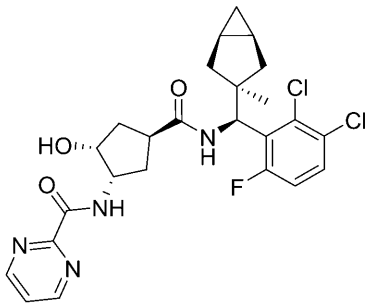
【表１－１１３１】

I-3710		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.74 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 1.3 Hz, 2H), 8.28 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.33 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 4.25 (dd, J = 8.3, 4.4 Hz, 1H), 4.15 (s, 1H), 3.20 (dd, J = 9.1, 4.8 Hz, 1H), 2.09 (tt, J = 9.3, 5.0 Hz, 1H), 1.94 (t, J = 9.5 Hz, 1H), 1.90 - 1.62 (m, 10H), 1.59 (d, J = 8.5 Hz, 2H).	607.1	B	A
I-3711		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.36 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 7.11 (s, 1H), 6.57 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.52 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.91 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 4.30-4.02 (m, 2H), 3.13 (dd, J = 10.1, 4.2 Hz, 1H), 2.02-1.46 (m, 14H).	511.15	A	A
I-3712		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 9.61 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.57 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.22 C 7.09 (m, 1H), 5.32 (dd, J = 17.4, 6.0 Hz, 2H), 4.19 (ddd, J = 20.3, 10.4, 6.3 Hz, 2H), 3.19 (dd, J = 9.3, 5.1 Hz, 1H), 2.08 (ddd, J = 13.0, 8.3, 4.9 Hz, 1H), 1.96 C 1.60 (m, J = 8.4 Hz, 11H), 1.46 (s, 2H).	591.2	B	

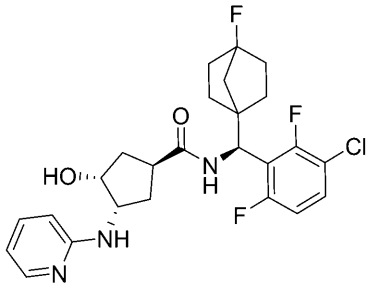
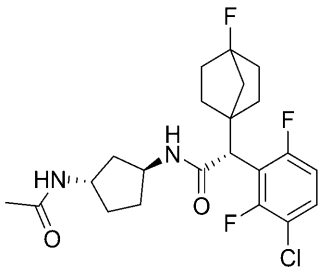
【表１－１１３２】

I-3713		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.39 (s, 2H), 8.67 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.29 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.93 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 4.15 (dd, J = 26.1, 6.6 Hz, 3H), 3.19 (dd, J = 9.1, 4.8 Hz, 1H), 2.06 C 1.91 (m, 2H), 1.77 (dq, J = 29.2, 10.0, 6.7 Hz, 7H), 1.61 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.47 (d, J = 8.3 Hz, 3H). 19F NMR (377 MHz, DMSO-d6) -69.04, -111.58, -113.94, -173.54.	591.15	B	
I-3714			506.05	B	
I-3715			520.15	B	
I-3716			520.05	B	

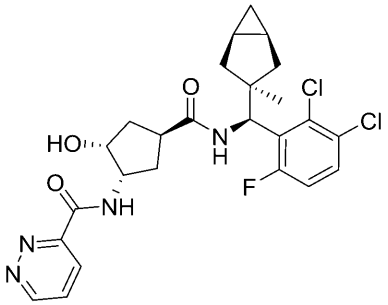
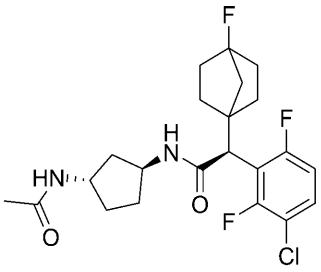
【表１－１１３３】

I-3717		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.80 (s, 2H), 8.23 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.65 - 5.36 (m, 2H), 4.85 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.44 (dddd, J = 21.7, 11.0, 5.9, 1.7 Hz, 2H), 4.22 - 4.08 (m, 3H), 4.04 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 3.15 (s, 1H), 2.10 - 1.38 (m, 14H)	612.15	B	A
I-3718		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.97 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 8.46 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.70 (t, J = 4.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 9.0 Hz, 1H), 5.43 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.26 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 4.22 - 4.06 (m, 2H), 3.19 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 2.01 (ddd, J = 12.9, 8.1, 5.0 Hz, 1H), 1.85 (dt, J = 12.8, 9.4 Hz, 1H), 1.73 (dd, J = 8.5, 3.3 Hz, 2H), 1.63 (dd, J = 12.5, 5.6 Hz, 1H), 1.53 (dd, J = 12.5, 5.7 Hz, 1H), 1.40 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 1.33 (d, J = 14.3 Hz, 2H), 1.24 (s, 1H), 1.08 (s, 3H), 0.85 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 0.10 (q, J = 4.0 Hz, 1H).	521.15	A	A

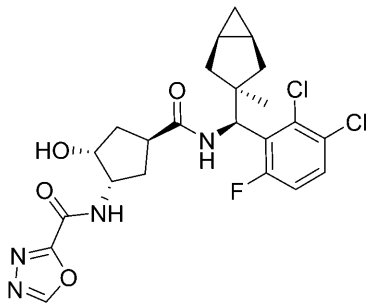
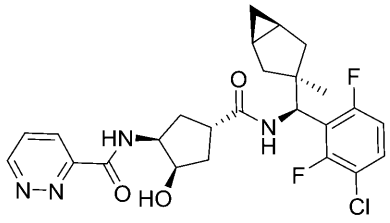
【表１－１１３４】

I-3719		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.92 (dd, J = 5.1, 1.9 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.34 (ddd, J = 8.7, 6.9, 2.0 Hz, 1H), 7.19 - 7.09 (m, 1H), 6.54 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.49 - 6.41 (m, 1H), 6.05 (s, 1H), 5.29 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.79 (s, 1H), 4.08 (q, J = 6.3, 5.3 Hz, 2H), 3.19 - 3.08 (m, 1H), 1.98 (ddd, J = 12.4, 7.8, 4.7 Hz, 1H), 1.83 - 1.70 (m, 10H), 1.60 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 1.45 (d, J = 6.8 Hz, 2H).	494.15	B	
I-3720		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.82 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.6 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.4, 1.6 Hz, 1H), 4.07 (ddq, J = 41.8, 13.8, 6.8 Hz, 2H), 3.86 (s, 1H), 1.92 - 1.73 (m, 4H), 1.74 (s, 4H), 1.65 (dd, J = 12.6, 4.9 Hz, 8H), 1.63 - 1.52 (m, 1H), 1.32 - 1.10 (m, 2H).	443.25	E	

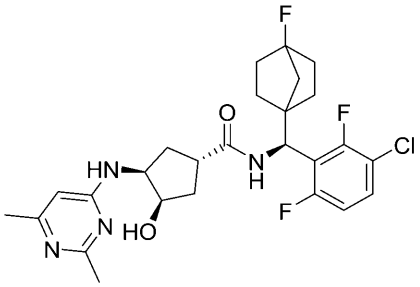
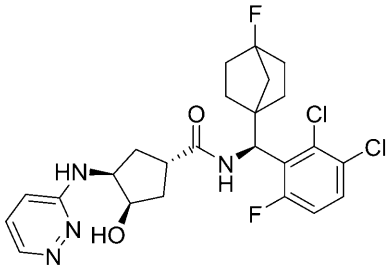
【表１－１１３５】

I-3721		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.42 (dd, J = 5.1, 1.7 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.24 (dd, J = 8.5, 1.7 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 8.4, 5.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.43 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.31 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 4.23 (dd, J = 8.2, 4.5 Hz, 1H), 4.12 (s, 1H), 3.26-3.17 (m, 1H), 2.09-1.98 (m, 1H), 1.96-1.84 (m, 1H), 1.74 (q, J = 5.3, 3.8 Hz, 2H), 1.68-1.60 (m, 1H), 1.52 (d, J = 12.3 Hz, 1H), 1.38 (t, J = 13.6 Hz, 2H), 1.31 (s, 2H), 1.10-1.05 (m, 3H), 0.85 (d, J = 4.6 Hz, 1H) ,0.13-0.07 (m, 1H).	521.15	A	A
I-3722		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 7.83 (s, 1H), 7.69 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.58 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.15 (td, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 4.13 (p, J = 7.1 Hz, 1H), 3.97 (p, J = 7.0 Hz, 1H), 3.86 (s, 1H), 1.94 - 1.76 (m, 5H), 1.70 (d, J = 28.3 Hz, 9H), 1.62 - 1.38 (m, 3H), 1.38 - 1.14 (m, 2H).	443.25	E	

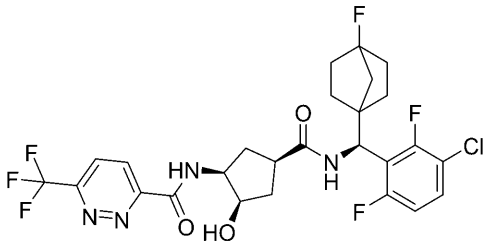
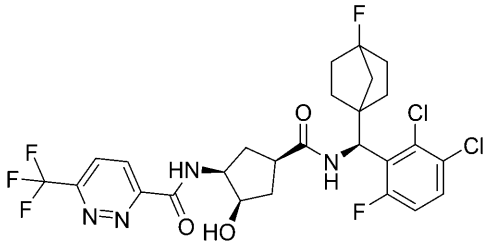
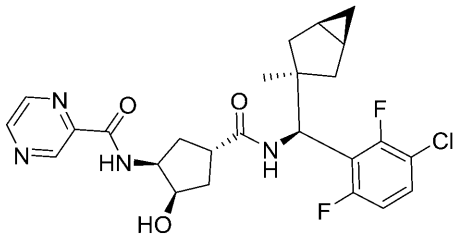
【表１－１１３６】

I-3723		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 9.44 (s, 1H), 8.48 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 8.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.09 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.11 (s, 2H), 3.18 (dd, J = 8.8, 5.4 Hz, 1H), 2.13 - 1.90 (m, 2H), 1.90 - 1.60 (m, 3H), 1.53 (dd, J = 12.3, 5.6 Hz, 1H), 1.50 - 1.23 (m, 4H), 1.08 (s, 3H), 0.85 (td, J = 7.9, 4.1 Hz, 1H), 0.11 (q, J = 3.9 Hz, 1H).	511.25	A	A
I-3724		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)9.41 (dd, J = 5.0, 1.7 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.23 (dd, J = 8.4, 1.7 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.92 (dd, J = 8.5, 5.0 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.28 (d, J = 4.1 Hz, 1H), 5.14 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.29-4.17 (m, 1H), 4.13 (t, J = 3.6 Hz, 1H), 3.21 (dd, J = 9.6, 5.2 Hz, 1H), 2.04 (ddd, J = 13.0, 8.2, 4.9 Hz, 1H), 1.90 (dt, J = 13.0, 9.4 Hz, 1H), 1.77 (dt, J = 7.7, 3.5 Hz, 2H), 1.66 (dd, J = 13.7, 6.4 Hz, 1H), 1.47 (dd, J = 12.5, 6.0 Hz, 1H), 1.32 (q, J = 12.8 Hz, 4H), 1.06 (s, 3H), 0.85 (td, J = 8.2, 4.2 Hz, 1H), 0.15 (t, J = 3.8 Hz, 1H).	505.15	B	A

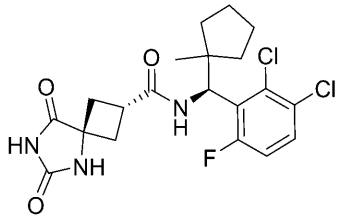
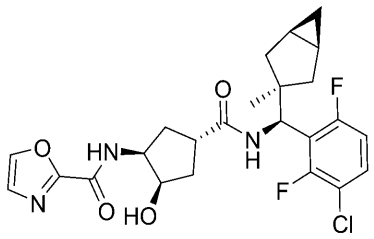
【表１－１１３７】

I-3725		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.22 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.56 (td, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 7.19-7.11 (m, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.19 (s, 1H), 5.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.84 (s, 1H), 4.20 (s,1H), 4.05 (s, 1H), 3.18-3.08 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.01-1.91 (m, 1H), 1.83-1.72 (m, 8H), 1.71-1.66 (m, 2H), 1.60 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 1.46 (d, J = 8.0 Hz, 2H).19F NMR (377 MHz, DMSO) ◆◆ -111.08, -158.02, -158.62, -164.92, -164.96, -165.01, -168.50, -173.40, -173.58, -173.61, -173.95.	523.2	B	A
I-3726		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6)8.38 (dd, J = 4.4, 1.4 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.28 (dd, J = 10.5, 9.0 Hz, 1H), 7.19 (dd, J = 9.0, 4.4 Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 9.1, 1.4 Hz, 1H), 6.48 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 4.88 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.29-4.08 (m, 2H), 3.23-3.08 (m, 1H), 2.01 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 1.74 (dd, J = 23.1, 16.9 Hz, 10H), 1.59 (d, J = 8.5 Hz, 3H).	511.05	A	A

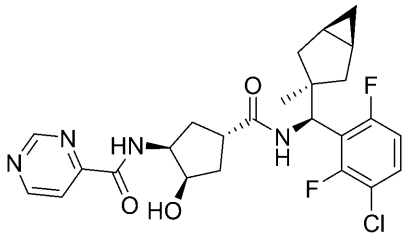
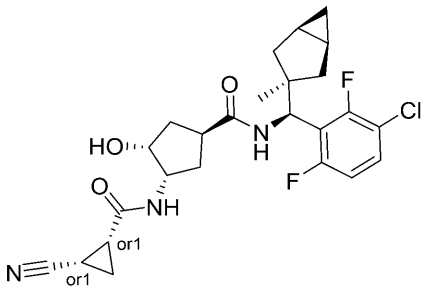
【表１－１１３８】

I-3727		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.73 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.47 (s, 2H), 8.31 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.37 - 5.24 (m, 2H), 4.28 - 4.13 (m, 2H), 3.26 - 3.16 (m, 1H), 1.93 - 1.44 (m, 14H).	591.15	E	
I-3728		1H NMR (300 MHz, DMSO-d6) 8.72 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 8.48 (s, 2H), 8.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 7.32 - 7.22 (m, 1H), 5.51 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.33 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 4.19 (s, 2H), 3.19 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 1.94 - 1.48 (m, 14H).	607.15	D	
I-3729		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6)9.21 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.74 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.30 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.22-4.05 (m, 2H), 3.26-3.10 (m, 1H), 2.01 (ddd, J = 13.0, 8.2, 4.9 Hz, 1H), 1.86 (dt, J = 12.8, 9.4 Hz, 1H), 1.76 (dd, J = 7.5, 2.8 Hz, 2H), 1.66 (dd, J = 13.2, 6.3 Hz, 1H), 1.51-1.38 (m, 1H), 1.32 (t, J = 11.2 Hz, 4H), 1.06 (s, 3H), 0.84 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 0.14 (d, J = 3.6 Hz, 1H).	505.15	B	A

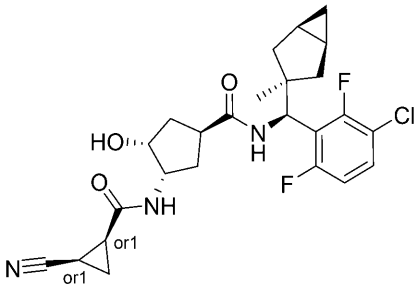
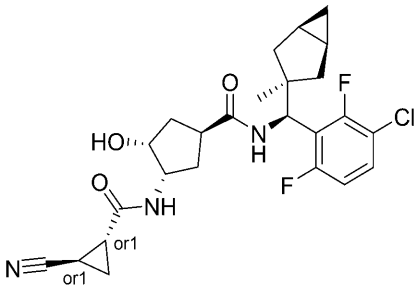
【表１－１１３９】

I-3730		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 10.57 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.23 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.8, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 3.30-3.26 (m, 0H), 2.71-2.53 (m, 2H), 2.21 (dd, J = 24.5, 11.2 Hz, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.37 (s, 1H), 1.27 (s, 1H), 0.96 (d, J = 2.8 Hz, 3H).	442.1	A	
I-3731		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.33 (s, 1H), 8.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.3 Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.19 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 5.12 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.15 - 4.03 (m, 2H), 3.17 (qd, J = 8.7, 4.9 Hz, 1H), 2.01 - 1.83 (m, 2H), 1.68 (dt, J = 25.7, 7.4 Hz, 3H), 1.46 (dd, J = 13.0, 5.5 Hz, 1H), 1.31 (q, J = 13.2, 12.5 Hz, 4H), 1.06 (s, 3H), 0.85 (dq, J = 8.5, 4.2 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 3.8 Hz, 1H).	494.15	B	A

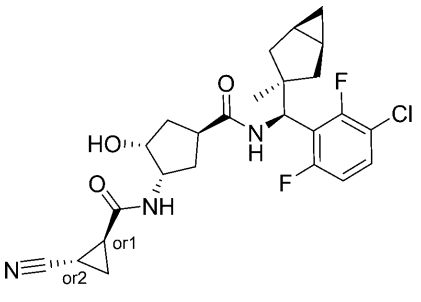
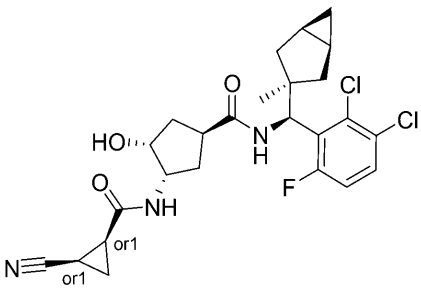
【表１－１１４０】

I-3732		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) - 9.34 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 9.09 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.11 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.05 (dd, J = 5.1, 1.5 Hz, 1H), 7.55 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.18 - 7.08 (m, 1H), 5.32 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.18 (qd, J = 8.2, 4.3 Hz, 1H), 4.15 - 4.07 (m, 1H), 3.19 (dt, J = 13.4, 6.9 Hz, 1H), 2.10 - 1.96 (m, 1H), 1.85 (dt, J = 12.8, 9.4 Hz, 1H), 1.75 (dt, J = 7.9, 3.6 Hz, 2H), 1.70 - 1.61 (m, 1H), 1.51 - 1.42 (m, 1H), 1.31 (q, J = 12.7 Hz, 4H), 1.06 (s, 3H), 0.85 (td, J = 8.2, 4.2 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 3.7 Hz, 1H).	505.15	B	A
I-3733		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.10 (dd, J = 15.9, 8.4 Hz, 2H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.18-7.08 (m, 1H), 5.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.98 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.08-3.97 (m, 1H), 3.96 (s, 1H), 3.20-3.07 (m, 1H), 2.26 (td, J = 8.0, 6.3 Hz, 1H), 2.04 (td, J = 8.7, 6.6 Hz, 1H), 1.88-1.61 (m, 5H), 1.46 (dd, J = 12.8, 5.8 Hz, 1H), 1.31 (ddd, J = 12.0, 10.4, 6.5 Hz, 5H), 1.24 (dd, J = 8.6, 4.2 Hz, 1H), 1.06 (s, 3H), 0.86 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 3.8 Hz, 1H).	492.15	A	A

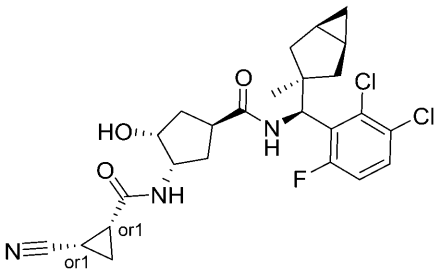
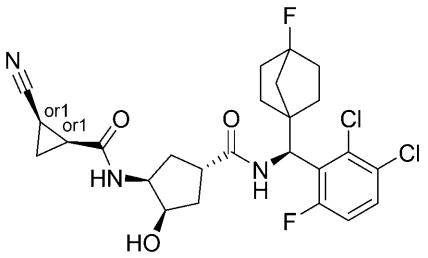
【表１－１１４１】

I-3734		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.14 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.13 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.90 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 4.06-3.94 (m, 2H), 3.12 (td, J = 8.9, 5.1 Hz, 1H), 2.23 (td, J = 7.9, 6.2 Hz, 1H), 2.02 (td, J = 8.6, 6.6 Hz, 1H), 1.82 (t, J = 4.1 Hz, 1H), 1.81-1.72 (m, 1H), 1.68 (dt, J = 23.5, 6.0 Hz, 3H), 1.50-1.41 (m, 1H), 1.29 (dddd, J = 23.0, 12.1, 8.7, 5.2 Hz, 6H), 1.06 (s, 3H), 0.89-0.81 (m, 1H), 0.15 (q, J = 3.8 Hz, 1H).	492.15	A	A
I-3735		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.6, 5.4 Hz, 1H), 7.18 - 7.07 (m, 1H), 5.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.94 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 3.95 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 3.13 (dd, J = 8.9, 5.5 Hz, 1H), 2.44 (ddd, J = 8.6, 6.0, 4.3 Hz, 1H), 1.90 (ddd, J = 9.0, 5.9, 4.3 Hz, 1H), 1.77 (ddd, J = 12.4, 8.5, 3.7 Hz, 2H), 1.73 - 1.57 (m, 3H), 1.50 - 1.41 (m, 1H), 1.41 - 1.21 (m, 6H), 1.05 (s, 3H), 0.85 (td, J = 8.0, 3.6 Hz, 1H), 0.13 (t, J = 3.9 Hz, 1H).	492.3	B	A

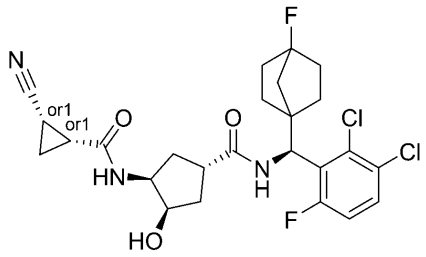
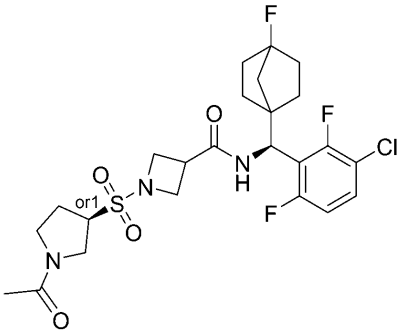
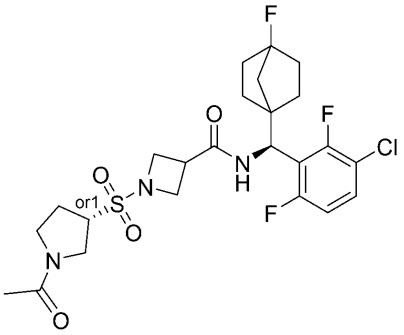
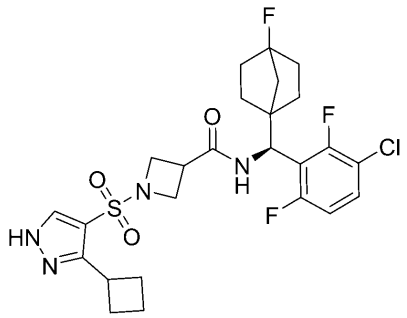
【表１－１１４２】

I-3736		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.19 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.54 (td, J = 8.7, 5.4 Hz, 1H), 7.18 - 7.05 (m, 1H), 5.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 4.93 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.02 - 3.88 (m, 2H), 3.13 (qd, J = 8.7, 5.5 Hz, 1H), 2.44 (ddd, J = 8.7, 6.0, 4.3 Hz, 1H), 1.96 - 1.88 (m, 1H), 1.87 - 1.75 (m, 2H), 1.75 - 1.57 (m, 3H), 1.55 - 1.30 (m, 5H), 1.30 - 1.19 (m, 2H), 1.06 (s, 3H), 0.85 (td, J = 7.8, 3.9 Hz, 1H), 0.14 (q, J = 3.7 Hz, 1H).	492.3	B	A
I-3737		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.12 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.25 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.88 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 3.98 (dt, J = 14.8, 4.6 Hz, 2H), 3.13 (dt, J = 14.0, 6.9 Hz, 1H), 2.23 (td, J = 7.9, 6.3 Hz, 1H), 2.02 (td, J = 8.6, 6.6 Hz, 1H), 1.86 - 1.59 (m, 5H), 1.52 (dd, J = 12.8, 5.8 Hz, 1H), 1.44 - 1.21 (m, 6H), 1.14 - 1.02 (m, 3H), 0.85 (td, J = 7.9, 4.0 Hz, 1H), 0.11 (q, J = 3.9 Hz, 1H).	508.15	A	A

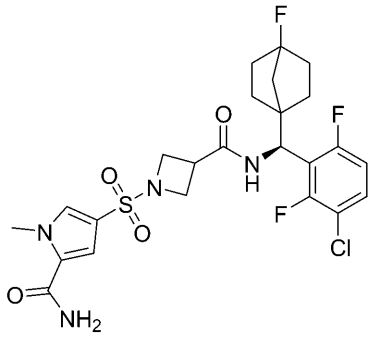
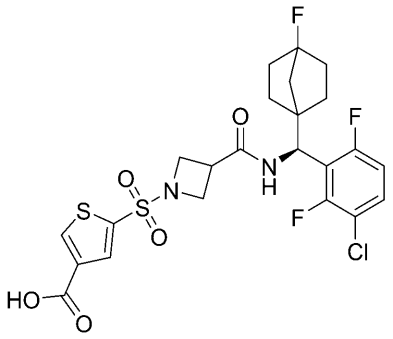
【表１－１１４３】

I-3738		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.07 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 5.0 Hz, 1H), 7.24 (t, J = 9.8 Hz, 1H), 5.41 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.93 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 4.10 - 3.91 (m, 2H), 3.14 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 2.26 (q, J = 7.5 Hz, 1H), 2.03 (q, J = 7.9 Hz, 1H), 1.80 (q, J = 10.6, 7.9 Hz, 2H), 1.74 - 1.58 (m, 3H), 1.57 - 1.45 (m, 1H), 1.44 - 1.18 (m, 6H), 1.07 (s, 3H), 0.85 (s, 1H), 0.10 (d, J = 4.1 Hz, 1H).	508.1	A	A
I-3739		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.99 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.15 - 3.88 (m, 2H), 3.11 (dd, J = 10.0, 4.6 Hz, 1H), 2.26 (td, J = 7.9, 6.3 Hz, 1H), 2.04 (td, J = 8.4, 6.5 Hz, 1H), 1.94 - 1.48 (m, 14H), 1.35 - 1.20 (m, 2H).	526.15	B	A

【表１－１１４４】

I-3740		1H NMR (400 MHz, DMSO-d6) 8.17 (dd, J = 28.7, 8.0 Hz, 2H), 7.62 (dd, J = 9.0, 5.1 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 10.6, 9.0 Hz, 1H), 5.51 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.91 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.11 - 3.88 (m, 2H), 3.12 (s, 1H), 2.23 (td, J = 7.9, 6.3 Hz, 1H), 2.02 (td, J = 8.7, 6.7 Hz, 1H), 1.96 - 1.42 (m, 14H), 1.28 (dtd, J = 20.2, 8.0, 7.2, 3.6 Hz, 2H).	526.15	B	A
I-3741			548.15	B	
I-3742			548.1	C	
I-3743			558	B	

【表１－１１４５】

I-3744			560	B	
I-3745			564	B	

【０５７５】
上の表１及び以下の実施例の化学構造において、立体中心は、Ｅｎｈａｎｃｅｄ Ｓｔｅｒｅｏ Ｒｅｐｒｅｓｅｎｔａｔｉｏｎの形式に従って記載される（ＭＤＬ／Ｂｉｏｖｉａ、例えば、「ｏｒ１」、「ｏｒ２」、「ａｂｓ」、「ａｎｄ１」のラベルが使用される）。（例えば、化合物Ｉ－２１、Ｉ－２３、Ｉ－２９、Ｉ－３０などの構造を参照されたい。）

【０５７６】
いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１の化合物を提供し、化合物は、「Ａ」のＡＤＰ－Ｇｌｏ ＩＣ$_{50}$を有すると記載される。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１の化合物を提供し、化合物は、「Ａ」または「Ｂ」のＡＤＰ－Ｇｌｏ ＩＣ$_{50}$を有すると記載される。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１の化合物を提供し、化合物は、「Ａ」または「Ｂ」または「Ｃ」のＡＤＰ－Ｇｌｏ ＩＣ$_{50}$を有すると記載される。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１の化合物を提供し、化合物は、「Ａ」または「Ｂ」または「Ｃ」または「Ｄ」のＡＤＰ－Ｇｌｏ ＩＣ$_{50}$を有すると記載される。

【０５７７】
いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１の化合物を提供し、化合物は、「Ａ」のＭＣＦ１０Ａ ＩＣ$_{50}$を有すると記載される。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１の化合物を提供し、化合物は、「Ａ」または「Ｂ」のＭＣＦ１０Ａ ＩＣ$_{50}$を有すると記載される。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１の化合物を提供し、化合物は、「Ａ」または「Ｂ」または「Ｃ」のＭＣＦ１０Ａ ＩＣ$_{50}$を有すると記載される。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１の化合物を提供し、化合物は、「Ａ」または「Ｂ」または「Ｃ」または「Ｄ」のＭＣＦ１０Ａ ＩＣ$_{50}$を有すると記載される。

【０５７８】
いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１に示されるものから選択される式Ｉの化合物、またはその薬学的に許容される塩、立体異性体、もしくは立体異性体の混合物

を含む。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１に示されるものから選択される式Ｉの化合物、またはその薬学的に許容される塩を提供する。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１に示されるものから選択される式Ｉの化合物を提供する。

【０５７９】

いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１に示されるものから選択される式ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、Ｘ、ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、ＸＩＸ、ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、ＸＸＶ、ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、もしくはＸＸＸＶＩの化合物、またはその薬学的に許容される塩、立体異性体、もしくは立体異性体の混合物を含む。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１に示されるものから選択される式ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、Ｘ、ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、ＸＩＸ、ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、ＸＸＶ、ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、もしくはＸＸＸＶＩの化合物、またはその薬学的に許容される塩を提供する。いくつかの実施形態において、本開示は、上の表１に示されるものから選択される式ＩＩ、ＩＩＩ、ＩＶ、Ｖ、ＶＩ、ＶＩＩ、ＶＩＩＩ、ＩＸ、Ｘ、ＸＩ、ＸＩＩ、ＸＩＩＩ、ＸＩＶ、ＸＶ、ＸＶＩ、ＸＶＩＩ、ＸＶＩＩＩ、ＸＩＸ、ＸＸ、ＸＸＩ、ＸＸＩＩ、ＸＸＩＩＩ、ＸＸＩＶ、ＸＸＶ、ＸＸＶＩ、ＸＸＶＩＩ、ＸＸＶＩＩＩ、ＸＸＩＸ、ＸＸＸ、ＸＸＸＩ、ＸＸＸＩＩ、ＸＸＸＩＩＩ、ＸＸＸＩＶ、ＸＸＸＶ、またはＸＸＸＶＩの化合物を提供する。

【０５８０】

４．使用、製剤、及び投与

薬学的に許容される組成物

別の実施形態によれば、本開示は、本開示の化合物またはその薬学的に許容される誘導体と、薬学的に許容される担体、アジュバント、またはビヒクルとを含む、組成物を提供する。いくつかの実施形態において、本開示は、本開示の化合物と、薬学的に許容される担体とを含む、医薬組成物を提供する。本開示の組成物中の化合物の量は、生体試料または患者において、ＰＩ３Ｋαプロテインキナーゼまたはその変異体を測定可能に阻害するのに有効な量である。ある特定の実施形態において、本開示の組成物中の化合物の量は、生体試料または患者において、ＰＩ３Ｋαプロテインキナーゼまたはその変異体を測定可能に阻害するのに有効な量である。ある特定の実施形態において、本開示の組成物は、そのような組成物を必要とする患者への投与用に製剤化される。いくつかの実施形態において、本開示の組成物は、患者への経口投与用に製剤化される。

【０５８１】

「対象」及び「患者」という用語は、本明細書で使用される場合、動物（すなわち、動物界の一員）、好ましくは哺乳動物、最も好ましくはヒトを意味する。いくつかの実施形態において、対象は、ヒト、マウス、ラット、ネコ、サル、イヌ、ウマ、またはブタである。いくつかの実施形態において、対象は、ヒトである。いくつかの実施形態において、対象は、マウス、ラット、ネコ、サル、イヌ、ウマ、またはブタである。

【０５８２】

「薬学的に許容される担体、アジュバント、またはビヒクル」という用語は、一緒に製剤化される化合物の薬理活性を破壊しない非毒性の担体、アジュバント、またはビヒクルを指す。本開示の組成物に使用され得る薬学的に許容される担体、アジュバントまたはビヒクルには、イオン交換体、アルミナ、ステアリン酸アルミニウム、レシチン、ヒト血清アルブミンなどの血清タンパク質、リン酸塩などの緩衝物質、グリシン、ソルビン酸、ソルビン酸カリウム、飽和植物性脂肪酸の部分グリセリド混合物、水、塩または電解質、例えば、硫酸プロタミン、リン酸水素二ナトリウム、リン酸水素カリウム、塩化ナトリウム、亜鉛塩、コロイダルシリカ、三ケイ酸マグネシウム、ポリビニルピロリドン、セルロース系物質、ポリエチレングリコール、ナトリウムカルボキシメチルセルロース、ポリアク

リレート、ロウ、ポリエチレン－ポリオキシプロピレン－ブロックポリマー、ポリエチレングリコール及び羊毛脂が含まれるが、これらに限定されない。

【０５８３】

「薬学的に許容される誘導体」とは、レシピエントに投与したとき、本開示の化合物または阻害活性のあるその代謝産物もしくは残留物を直接的または間接的のいずれかで提供することが可能な本開示の化合物の任意の非毒性の塩、エステル、エステルの塩または他の誘導体を意味する。

【０５８４】

本明細書で使用される場合、「阻害活性のあるその代謝産物または残留物」という用語は、その代謝産物または残留物がＰＩ３Ｋαプロテインキナーゼまたはその変異体の阻害剤であることも意味する。

【０５８５】

本開示の組成物は、経口、非経口、吸入スプレー、局所、経直腸、経鼻、頬側、経膣または埋込型リザーバーにより投与することができる。本明細書で使用される「非経口」という用語は、皮下、静脈内、筋肉内、関節内、滑液嚢内、胸骨内、髄腔内、肝臓内、病巣内及び頭蓋内注射または注入技術を含む。好ましくは、組成物は、経口、腹腔内または静脈内投与される。

【０５８６】

本開示の組成物の無菌注射形態は、水性懸濁液または油性懸濁液であり得る。これらの懸濁液は、好適な分散剤または湿潤剤及び懸濁化剤を使用して、当該技術分野において知られている技術に従って製剤化され得る。無菌注射用調製物は、非経口的に許容される非毒性の希釈剤または溶媒中の無菌注射用溶液または懸濁液、例えば、１，３－ブタンジオール溶液であり得る。利用されてもよい許容されるビヒクル及び溶媒の中には、水、リンゲル液、及び等張塩化ナトリウム溶液がある。加えて、溶媒または懸濁媒としては、無菌固定油が慣習的に利用されている。

【０５８７】

この目的で、合成モノまたはジグリセリドを含めた任意の無刺激性固定油が用いられてもよい。オレイン酸及びそのグリセリド誘導体等の脂肪酸が、注射剤の調製に有用であり、同様に、オリーブ油またはヒマシ油等の天然の薬学的に許容される油も、とりわけそれらのポリオキシエチル化バージョンにおいて有用である。これらの油溶液または懸濁液はまた、乳剤及び懸濁液を含む薬学的に許容される剤形の製剤化に一般的に使用されるカルボキシメチルセルロースまたは類似の分散剤等の、長鎖アルコール希釈剤または分散剤を含有してもよい。他の一般的に使用される界面活性剤、例えば、Ｔｗｅｅｎｓ（登録商標）、Ｓｐａｎｓ（登録商標）及び他の乳化剤または薬学的に許容される固体、液体、もしくは他の剤形の製造に一般的に使用されるバイオアベイラビリティ向上剤も、製剤化の目的で使用することができる。

【０５８８】

本開示の薬学的に許容される組成物は、限定するものではないが、カプセル剤、錠剤、水性懸濁剤または液剤を含む、任意の経口的に許容される剤形で経口投与され得る。経口用錠剤の場合、一般的に使用される担体には、ラクトース及びトウモロコシデンプンが含まれる。ステアリン酸マグネシウム等の滑沢剤もまた典型的に添加される。カプセル形態での経口投与については、有用な希釈剤には、ラクトース及び乾燥トウモロコシデンプンが含まれる。水性懸濁液が経口使用に必要とされる場合、活性成分は、乳化剤及び懸濁化剤と組み合わされる。所望される場合、いくつかの甘味剤、矯味矯臭剤、または着色剤が添加されてもよい。

【０５８９】

あるいは、本開示の薬学的に許容される組成物は、直腸投与用または膣投与用の坐剤の形態で投与され得る。これらは、室温では固体であるが、直腸温度または膣温度では液体であり、それにより、直腸または膣内で溶けて薬物を放出する好適な非刺激性賦形剤と薬剤を混合することによって、調製することができる。そのような材料には、カカオ脂、ミ

ツロウ及びポリエチレングリコールが含まれる。

【０５９０】

本開示の薬学的に許容される組成物はまた、特に、治療標的が局所適用によって容易に到達可能な領域または器官を含む場合、例えば、眼、皮膚、または下部腸管の疾患の場合、局所投与されてもよい。これらの領域または器官のそれぞれに好適な局所製剤は、容易に調製される。

【０５９１】

下部腸管に対する局所適用は、直腸坐剤製剤（上記を参照されたい）または好適な浣腸製剤で達成され得る。局所的な経皮吸収型貼付剤もまた使用されてもよい。

【０５９２】

局所適用の場合、提供される薬学的に許容される組成物は、１つ以上の担体中に懸濁または溶解した活性成分を含有する好適な軟膏に製剤化され得る。本開示の化合物の局所投与のための担体には、鉱油、流動ワセリン、白色ワセリン、プロピレングリコール、ポリオキシエチレン、ポリオキシプロピレン化合物、乳化ワックス及び水が含まれるが、これらに限定されない。あるいは、提供される薬学的に許容される組成物は、１つ以上の薬学的に許容される担体中に懸濁または溶解した活性成分を含有する好適なローション剤またはクリーム剤に製剤化することができる。好適な担体には、鉱油、モノステアリン酸ソルビタン、ポリソルベート６０、セチルエステルワックス、セテアリルアルコール、２－オクチルドデカノール、ベンジルアルコール、及び水が含まれるが、これらに限定されない。

【０５９３】

眼科的用途の場合、提供される薬学的に許容される組成物は、塩化ベンジルアルコニウム（ｂｅｎｚｙｌａｌｋｏｎｉｕｍ　ｃｈｌｏｒｉｄｅ）等の防腐剤の有無にかかわらず、等張性のｐＨ調整済みの滅菌食塩水中の微細化した懸濁液として、または好ましくは、等張性のｐＨ調整済みの滅菌食塩水中の溶液として製剤化されてもよい。あるいは、眼科用途の場合、薬学的に許容される組成物は、ワセリンなどの軟膏に製剤化されてもよい。

【０５９４】

本開示の薬学的に許容される組成物は、鼻腔エアゾールまたは吸入によって投与されてもよい。そのような組成物は、医薬製剤の技術分野においてよく知られている技術に従って調製され、ベンジルアルコールもしくは他の好適な保存剤、バイオアベイラビリティを高めるための吸収促進剤、フルオロカーボン、及び／または他の従来の可溶化剤もしくは分散剤を利用して、生理食塩水中の溶液として調製され得る。

【０５９５】

好ましくは、本開示の薬学的に許容される組成物は、経口投与用に製剤化される。そのような製剤は、食物とともにまたは食物なしで投与され得る。いくつかの実施形態において、本開示の薬学的に許容される組成物は、食物なしで投与される。他の実施形態において、本開示の薬学的に許容される組成物は、食物とともに投与される。

【０５９６】

組成物の単一剤形を製造するために担体材料と組み合わせることができる本開示の化合物の量は、治療される患者及び特定の投与様式に応じて変わり得る。好ましくは、提供される組成物は、これらの組成物を投与する患者に、０．０１～１００ｍｇ／ｋｇ体重／日の投与量の阻害剤が投与され得るように製剤化されるべきである。

【０５９７】

また、任意の特定の患者に対する具体的な投与量及び治療レジメンは、採用される特定の化合物の活性、年齢、体重、全般的な健康状態、性別、食生活、投与時間、排泄速度、薬物の組み合わせ、及び治療担当医師の判断及び治療される特定の疾患の重症度を含む、さまざまな因子に応じて変化することも理解されたい。組成物中の本開示の化合物の量もまた、組成物中の特定の化合物に依存する。

【０５９８】

組成物に採用される正確な用量もまた、投与経路に依存し、施術者の判断及び各対象の

状況に応じて決定されるべきである。本開示の特定の実施形態において、本開示の化合物の経口投与に好適な用量範囲は、一般に、約１ｍｇ／日～約１０００ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約１ｍｇ／日～約８００ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約１ｍｇ／日～約５００ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約１ｍｇ／日～約２５０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約１ｍｇ／日～約１００ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約５ｍｇ／日～約５０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約５ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約１０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約２０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約３０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約４０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約５０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約６０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約７０ｍｇ／日である。いくつかの実施形態において、経口用量は、約１００ｍｇ／日である。本明細書に列挙される投与量のいずれも上限または下限の投与量範囲を構成し得、任意の他の投与量と組み合わせて上限及び下限を含む投与量範囲を構成し得ることが認識されよう。

【０５９９】

いくつかの実施形態において、薬学的に許容される組成物は、提供される化合物及び／またはその薬学的に許容される塩を約０．０１～約９０重量％、約０．０１～約８０重量％、約０．０１～約７０重量％、約０．０１～約６０重量％、約０．０１～約５０重量％、約０．０１～約４０重量％、約０．０１～約３０重量％、約０．０１～約２０重量％、約０．０１～約２．０重量％、約０．０１～約１重量％、約０．０５～約０．５重量％、約１～約３０重量％、または約１～約２０重量％の範囲の濃度で含有し得る。組成物は、液剤、懸濁剤、軟膏、またはカプセル剤などとして製剤化することができる。医薬組成物は、水溶液として調製することができ、保存剤、緩衝剤、等張化剤、抗酸化剤、安定剤、粘性調整成分などの追加の成分を含有し得る。

【０６００】

薬学的に許容される担体は、当業者によく知られており、例えば、アジュバント、希釈剤、賦形剤、充填剤、滑沢剤及びビヒクルが含まれる。いくつかの実施形態では、担体は、希釈剤、アジュバント、賦形剤、またはビヒクルである。いくつかの実施形態では、担体は、希釈剤、アジュバント、または賦形剤である。いくつかの実施形態では、担体は、希釈剤またはアジュバントである。いくつかの実施形態において、担体は、賦形剤である。

【０６０１】

薬学的に許容される担体の例としては、例えば、水または生理食塩水、ポリエチレングリコールなどのポリマー、炭水化物及びその誘導体、油、脂肪酸、またはアルコールを挙げることができる。医薬担体としての油の非限定的な例は、石油、動物、植物または合成起源の油、例えば落花生油、大豆油、鉱油、ゴマ油などを含む。医薬担体はまた、生理食塩水、アカシアゴム、ゼラチン、デンプンペースト、タルク、ケラチン、コロイダルシリカ、尿素などであり得る。加えて、補助剤、安定化剤、粘稠化剤、滑沢化剤、及び着色剤も使用され得る。好適な薬学的担体の他の例は、例えば、Ｒｅｍｉｎｇｔｏｎ’ｓ：Ｔｈｅ Ｓｃｉｅｎｃｅ ａｎｄ Ｐｒａｃｔｉｃｅ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｙ，２２ｎｄ Ｅｄ．（Ａｌｌｅｎ，Ｌｏｙｄ Ｖ．，Ｊｒ ｅｄ．，Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｐｒｅｓｓ（２０１２））；Ｍｏｄｅｒｎ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃｓ，５th Ｅｄ．（Ａｌｅ^{ＹＡ}ｎｄｅｒ Ｔ．Ｆｌｏｒｅｎｃｅ，Ｊｕｅｒｇｅｎ Ｓｉｅｐｍａｎｎ，ＣＲＣ Ｐｒｅｓｓ（２００９））；Ｈａｎｄｂｏｏｋ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｅｘｃｉｐｉｅｎｔｓ，７th Ｅｄ．（Ｒｏｗｅ，Ｒａｙｍｏｎｄ Ｃ．；Ｓｈｅｓｋｅｙ，Ｐａｕｌ Ｊ．；Ｃｏｏｋ，Ｗａｌｔｅｒ Ｇ．；Ｆｅｎｔｏｎ，Ｍａｒｉａｎ Ｅ．ｅｄｓ．，Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｐｒｅｓｓ（２０１２））（そのそれぞれは、その全体が参照により本明細書に援用される）に記載されている。

【０６０２】
本明細書に採用される薬学的に許容される担体は、医薬製剤の材料として使用され、鎮痛剤、緩衝剤、結合剤、崩壊剤、希釈剤、乳化剤、賦形剤、増量剤、流動促進剤、可溶化剤、安定剤、懸濁化剤、等張化剤、ビヒクル及び粘性増加剤として組み込まれるさまざまな有機または無機材料から選択され得る。抗酸化剤、芳香剤、着色料、風味改善剤、保存剤、及び甘味料などの医薬品添加物も添加され得る。許容される医薬担体の例は、とりわけ、カルボキシメチルセルロース、結晶セルロース、グリセリン、アラビアゴム、ラクトース、ステアリン酸マグネシウム、メチルセルロース、散剤、生理食塩水、アルギン酸ナトリウム、スクロース、デンプン、タルク及び水を含む。いくつかの実施形態では、「薬学的に許容される」という用語は、連邦政府または州政府の規制当局によって承認されているか、動物、特にヒトでの使用が米国薬局方またはその他の一般に認められている薬局方に収載されていることを意味する。
【０６０３】
例えば、洗剤などの界面活性剤も製剤での使用に好適である。界面活性剤の具体例としては、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ビニルアセテートとビニルピロリドンのコポリマー、ポリエチレングリコール、ベンジルアルコール、マンニトール、グリセロール、ソルビトールもしくはポリオキシエチレン化されたソルビタンのエステル；レシチンもしくはナトリウムカルボキシメチルセルロース；またはメタクリレートなどのアクリル誘導体、ステアリン酸アルカリ、特にステアリン酸ナトリウム、ステアリン酸カリウムもしくはステアリン酸アンモニウムなどのアニオン性界面活性剤；ステアリン酸カルシウムもしくはステアリン酸トリエタノールアミン；アルキル硫酸塩、特にラウリル硫酸ナトリウム及びセチル硫酸ナトリウム；ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウムもしくはジオクチルスルホコハク酸ナトリウム；または脂肪酸、特にヤシ油由来のもの、カチオン性界面活性剤、例えば、式$N^+R'R''R'''R^-$の水溶性四級アンモニウム塩（式中、Ｒラジカルは、同一または異なる任意にヒドロキシル化された炭化水素ラジカルであり、Y^-は、強酸のアニオン、例えば、ハロゲン化物、硫酸及びスルホン酸のアニオンである）；臭化セチルトリメチルアンモニアなどのカチオン界面活性剤；式$N^+R'R''R'''$のアミン塩（式中、Ｒラジカルは、同一または異なる任意にヒドロキシル化された炭化水素ラジカルである）；カチオン界面活性剤、例えば、オクタデシルアミン塩酸塩；非イオン性界面活性剤、例えば、任意にポリオキシエチレン化されたソルビタンのエステル、特にポリソルベート８０、もしくはポリオキシエチレン化されたアルキルエーテル；ステアリン酸ポリエチレングリコール、ヒマシ油のポリオキシエチレン化誘導体、ポリグリセロールエステル、ポリオキシエチレン化脂肪アルコール、ポリオキシエチレン化脂肪酸もしくはエチレンオキシドとプロピレンオキシドのコポリマー；ならびにベタインの置換ラウリル化合物などの両性界面活性剤が挙げられる。
【０６０４】
好適な薬学的担体には、デンプン、グルコース、ラクトース、スクロース、ゼラチン、麦芽、米、小麦粉、チョーク、シリカゲル、ステアリン酸ナトリウム、モノステアリン酸グリセロール、タルク、塩化ナトリウム、脱脂粉乳、グリセロール、プロピレン、グリコール、ポリエチレングリコール３００、水、エタノール、ポリソルベート２０なども含まれる。本組成物は、所望により、湿潤剤または乳化剤、またはｐＨ緩衝剤も含有し得る。
【０６０５】
錠剤及びカプセル剤は、１つ以上のアジュバント、結合剤、希釈剤、崩壊剤、賦形剤、充填剤、または滑沢剤をさらに含有し得、そのそれぞれは、当該技術分野において知られている。そのような例としては、ラクトースまたはスクロースなどの炭水化物、無水二塩基性リン酸カルシウム、トウモロコシデンプン、マンニトール、キシリトール、セルロースまたはその誘導体、微結晶セルロース、ゼラチン、ステアレート、二酸化ケイ素、タルク、デンプングリコール酸ナトリウム、アラビアゴム、矯味矯臭剤、保存剤、緩衝剤、崩壊剤、及び着色料が挙げられる。経口投与される組成物は、薬学的に嗜好性の高い調製物を提供するために、例えば、フルクトース、アスパルテームまたはサッカリンなどの甘味

剤；ペパーミント、ウィンターグリーン油、またはチェリーなどの矯味矯臭剤；着色剤；及び保存剤などの１つ以上の任意選択の剤を含有し得る。

【０６０６】

化合物及び薬学的に許容される組成物の使用

本明細書に記載される化合物及び組成物は、概して、キナーゼまたはその変異体の阻害に有用である。いくつかの実施形態では、本明細書に記載の化合物及び組成物によって阻害されるキナーゼは、ホスファチジルイノシトール３－キナーゼ（ＰＩ３Ｋ）である。いくつかの実施形態では、本明細書に記載の化合物及び組成物によって阻害されるキナーゼは、ＰＩ３Ｋα、ＰＩ３Ｋδ、及びＰＩ３Ｋγのうちの１つ以上である。いくつかの実施形態において、本明細書に記載される化合物及び組成物によって阻害されるキナーゼは、ＰＩ３Ｋαである。いくつかの実施形態において、本明細書に記載される化合物及び組成物によって阻害されるキナーゼは、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαである。

【０６０７】

本開示の化合物及び組成物は、ＰＩ３Ｋ酵素の阻害から利益を得る用途において有用であり得る。例えば、本開示のＰＩ３Ｋ阻害剤は、概して、細胞増殖性疾患の治療に有用である。本開示の化合物及び組成物は、ＰＩ３Ｋα酵素の阻害から利益を得る用途において有用であり得る。例えば、本開示のＰＩ３Ｋα阻害剤は、概して、細胞増殖性疾患の治療に有用である。

【０６０８】

ＰＩ３Ｋの異常調節は、多くの場合、Ａｉｄの活性化によって生存率を高めるが、これはヒトのがんで最も一般的な事象の１つであり、複数のレベルで発生することが示される。イノシトール環の３’位のホスホイノシチドを脱リン酸化し、それによってＰＩ３Ｋの活性に拮抗する腫瘍抑制遺伝子ＰＴＥＮは、さまざまな腫瘍で機能的に欠失する。他の腫瘍では、ｐ１１０アルファアイソフォーム、ＰＩＫ３ＣＡの遺伝子、及びＡｋｔの遺伝子が増幅され、それらの遺伝子産物のタンパク質発現の増加がいくつかのヒトのがんで実証されている。さらに、ｐ８５－ｐ１１０複合体の上方制御に役立つｐ８５アルファの変異と転座がヒトのがんで報告されている。最後に、下流シグナル伝達経路を活性化するＰＩＫ３ＣＡの体細胞ミスセンス変異は、さまざまなヒトのがんにおいてかなりの頻度で報告されている（Ｋａｎｇ ｅｔ ｅｌ．，Ｐｒｏｃ．Ｎａｔｌ．Ａｃａｄ．Ｓｃｉ．ＵＳＡ １０２：８０２（２００５）；Ｓａｍｕｅｌｓ ｅｔ ａｌ．，Ｓｃｉｅｎｃｅ ３０４：５５４（２００４）；Ｓａｍｕｅｌｓ ｅｔ ａｌ．，Ｃａｎｃｅｒ Ｃｅｌｌ ７：５６１－５７３（２００５））。これらの観察結果は、ホスホイノシトール－３キナーゼ及びこのシグナル伝達経路の上流及び下流成分の調節不全が、ヒトのがん及び増殖性疾患に関連する最も一般的な調節不全の１つであることを示す（Ｐａｒｓｏｎｓ ｅｔ ａｌ．，Ｎａｔｕｒｅ ４３６：７９２（２００５）；Ｈｅｎｎｅｓｓｅｙ ａｔ ｅｌ．，Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖ．Ｄｒｕｇ Ｄｉｓｃ．４：９８８－１００４（２００５））。

【０６０９】

ＰＩ３Ｋキナーゼ、例えば、ＰＩ３Ｋαまたはその変異体の阻害剤として本開示で利用される化合物の活性は、ｉｎｖ ｉｔｒｏ、ｉｎ ｖｉｖｏまたは細胞株でアッセイされ得る。ｉｎ ｖｉｔｒｏアッセイには、活性化したＰＩ３Ｋαまたはその変異体のリン酸化活性及び／またはその後の機能的な結果もしくはＡＴＰａｓｅ活性のいずれかの阻害を決定するアッセイが含まれる。別のｉｎ ｖｉｔｒｏアッセイは、阻害剤がＰＩ３Ｋαに結合する能力を定量する。阻害剤の結合は、阻害剤を放射線標識してから結合させ、阻害剤／ＰＩ３Ｋα複合体を単離し、放射性標識結合の量を決定することによって測定することができる。あるいは、阻害剤の結合は、新規阻害剤を既知の放射性リガンドに結合するＰＩ３Ｋαとともにインキュベートする競合実験を実施することによって決定することもできる。ＰＩ３Ｋα阻害剤のアッセイに有用な代表的なｉｎ ｖｉｔｒｏ及びｉｎ ｖｉｖｏアッセイとしては、本明細書に記載される特許及び科学刊行物に記載及び開示されているものが挙げられる。ＰＩ３Ｋαまたはその変異体の阻害剤として本開示で利用される

化合物をアッセイするための詳細は条件は、以下の実施例に記載される。

【０６１０】

障害の治療

提供される化合物は、ＰＩ３Ｋαの阻害剤であり、したがって、ＰＩ３Ｋαまたはその変異体の活性に関連する１つ以上の障害の治療に有用である。したがって、ある特定の実施形態において、本開示は、対象におけるＰＩ３Ｋα媒介性障害を治療する方法であって、治療上有効な量の本開示の化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前述のいずれかの薬学的に許容される組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、方法を提供する。ある特定の実施形態において、本開示は、対象におけるＰＩ３Ｋα媒介性障害を治療する方法であって、治療上有効な量の本開示の化合物またはその薬学的に許容される組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、方法を提供する。いくつかの実施形態において、対象は、変異型ＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、対象は、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、対象は、表Ａの変異のうちの少なくとも１つを含有するＰＩ３Ｋαを有する：

【０６１１】

表Ａ．

【０６１２】

【表１４－１】

M1*
M1I
M1L
M1R
M1T
M1V
P2H
P2L
P2S
P3A
P3L
P3S
P3T
R4*

R4G
R4L
R4P
R4Q
R4_P17del
R4_P18del
P5T
P5_R19del
S6L
S6_I13del
S7*
S7L
S7_P18del
S7_R19del
S7fs*3

G8C
G8D
G8R
G8S
G8V
G8_P17del
G8_P18del
G8_R19del
E9*
E9A
E9G
E9K
E9Q
E9_I20>V
E9_L15>G

E9_M16>V
E9_M16del
E9_P17>A
E9_P17del
E9_P18>CPT
E9_P18>GCPT
E9_P18del
E9_R19>G
E9_R19del
E9fs*6
L10P
L10Q
L10R
L10V
L10_L15>R

【表１４－２】

L10_L15del	L15W	V32L	E52*
L10_L21del	M16I	V32M	E52K
L10_M16del	M16K	T33A	E52Q
L10_P17>T	M16L	T33I	A53S
L10_P17del	M16R	T33S	A53V
L10_P18>Q	M16T	E35*	A53fs*19
L10_P18del	M16V	E35K	R54I
W11*	P17A	E35Q	R54K
W11C	P17L	C36*	K55I
W11G	P17R	L37F	K55Q
W11L	P17S	L37I	Y56*
W11R	P18L	R38C	Y56H
W11S	P18Q	R38G	P57H
W11_H14del	P18S	R38H	P57L
W11_L15del	P18T	R38L	P57S
W11_L21del	P18fs*4	R38S	L58F
W11_M16del	R19*	R38_I43>L	L58R
W11_P17>S	R19I	E39*	L58V
W11_P18>S	R19K	E39A	L58fs*13
W11_P18>CG	I20M	E39D	L58fs*14
W11_P18del	I20T	E39K	H59L
W11_R19del	I20fs*3	E39Q	H59N
W11_V22del	L21I	A40V	H59R
W11del	L21R	T41I	H59Y
G12C	L21V	L42*	Q60*
G12D	V22G	L42F	Q60E
G12S	V22I	I43L	Q60L
G12V	V22L	I43M	Q60P
G12_L21del	E23K	T44F	L61F
G12_P17>A	E23Q	T44I	L61I
G12_P18>I	C24F	I45L	L61R
I13F	C24Y	I45T	L62F
I13M	L25*	I45V	L62I
I13N	L25F	K46M	L62del
I13V	L25S	H47L	Q63*
I13_P18del	P27S	H47Q	Q63E
I13del	G29K	H47Y	Q63H
H14D	G29R	E48*	Q63L
H14N	M30I	E48K	Q63fs*9
H14Y	M30V	E48Q	D64G
H14_I20del	M30fs*9	E48V	D64H
H14_L21del	I31M	F50L	D64N
L15S	I31V	F50fs*22	D64V
L15V	V32A	K51R	D64Y

【表１４－３】

D64_S72>VL
E65*
E65A
E65G
E65K
E65V
S66C
S66F
S66Y
S67A
S67C
S67F
S67Y
S67del
Y68C
Y68H
I69F
I69L
I69N
I69S
I69V
F70V
V71G
V71I
V71L
S72G
S72R
S72T
S72fs*27
V73A
V73I
T74A
T74I
T74S
Q75*
Q75E
Q75H
Q75L
Q75P
E76Q
E76del
A77G
A77P
E78*

E78G
E78K
E78Q
E78_R79insVSK NTYLSKCYS
R79M
R79W
R79_E80>K
E80K
E80_E81>KK
E81*
E81A
E81D
E81G
E81K
E81Q
E81V
E81_F82>V
E81del
F82I
F82L
F83C
F83I
F83K
F83L
F83S
F83V
F83Y
F83del
F83fs*17
D84H
D84N
D84Y
D84fs*1
E85*
E85K
E85Q
T86I
T86S
R87G
R87I
R87S
R87T
R88*
R88G

R88L
R88P
R88Q
L89F
L89H
C90F
C90G
C90S
C90W
C90Y
C90fs*1
L92F
L92I
R93G
R93L
R93L
R93P
R93Q
R93W
L94F
F95C
F95S
F95fs*2
Q96*
Q96E
Q96H
Q96K
Q96R
Q96fs*4
P97F
P97H
P97L
P97S
F98C
F98L
F98V
L99*
L99F
L99V
L99fs*1
K100*
K100N
K100del
V101A

V101I
V101L
V101del
I102F
I102M
I102T
I102V
I102_E103>K
I102_E103ins16
I102_P104>K
I102_P104>T
I102_P104del
I102_V105del
I102del
I102fs*6
E103*
E103D
E103G
E103K
E103Q
E103_E110del
E103_G106>D
E103_N107del
E103_P104>A
E103_P104>S
E103_P104del
E103_R108>YC
E103_V105>A
E103_V105>D
E103del
P104A
P104K
P104L
P104Q
P104R
P104S
P104T
P104_E110>Q
P104_E110del
P104_G106>R
P104_G106>S
P104_G106del
P104_N107>H
P104_N107del

【表１４－４】

P104_V105>I
P104_V105>L
P104_V105del
P104_V105insVGNREEKILNREIGMIQY
P104del
V105A
V105I
V105L
V105_E109>A
V105_E109>K
V105_E109>EE
V105_E109del
V105_E110del
V105_G106del
V105_N107>D
V105_N107>Y
V105_N107>AT
V105_N107>GD
V105_N107del
V105_N107del
V105_R108del
V105del
V105del
G106A
G106C
G106D
G106E
G106F
G106L
G106R
G106S
G106V
G106_E109>A
G106_E109>E
G106_E109del
G106_E110>K
G106_I112>F
G106_K111>E
G106_N107>T
G106_N107del
G106_R108>I
G106_R108>V
G106_R108del

G106del
N107H
N107I
N107K
N107S
N107T
N107Y
N107_E109>K
N107_E109del
N107_E109del
N107_E110del
N107_K111>YRE
N107_R108>S
N107_R108del
N107del
R108C
R108G
R108H
R108L
R108P
R108S
R108_E109>C
R108_E109>Q
R108_E109del
R108_E109insLKVIEPVGNR
R108_E110del
R108_I112>L
R108_I112>V
R108_I112del
R108_K111>Q
R108_K111>EA
R108_K111del
R108del
E109*
E109A
E109G
E109K
E109_E110>A
E109_I112>D
E109_I112>V
E109_L113>D
E109_L113>V
E109_N114del
E109_R115>G

E109fs*11
E110*
E110K
E110Q
E110_E116del
E110_I112>D
E110_I112del
E110_K111>D
E110_K111>G
E110_K111>M
E110_K111>V
E110_K111del
E110_K111insE
E110_N114>D
E110_R115>G
E110del
K111E
K111M
K111N
K111Q
K111R
K111T
K111_E116del
K111_I112>D
K111_I112>F
K111_I112>N
K111_I112del
K111_I112insK
K111_I112insEK
K111_L113>I
K111_L113del
K111_N114>D
K111_N114del
K111_R115del
K111del
I112D
I112F
I112L
I112N
I112S
I112T
I112V
I112_L113del
I112_L113insI

I112_L113insQI
I112>MSM
I112del
L113F
L113H
L113I
L113R
L113V
L113_I117del
L113_N114>H
L113_N114del
L113_N114insL
L113del
N114D
N114H
N114I
N114S
N114Y
N114_I117del
N114_R115>K
N114_R115insLN
N114del
R115*
R115E
R115G
R115L
R115P
R115Q
R115_E116insDEEKILNR
R115del
E116*
E116G
E116K
E116Q
E116_I117insRE
I117F
I117V
I117_G118insEI
G118D
G118E
G118V

【表１４－５】

G118_F119insMIEPVGNREEKILNREIG
G118_F119insMIQEILNREIG
G118_F119insMIQYPQSILNREIG
F119I
F119L
A120S
A120T
I121L
I121N
G122A
G122C
G122D
G122S
G122V
M123I
M123K
M123L
M123V
P124A
P124L
P124Q
P124S
P124_V125>Q
V125A
V125E
V125G
V125L
V125M
C126S
C126W
C126Y
C126fs*19
E127*
E127D
E127K
E127Q
F128Y
D129H
D129N
D129Y
M130I

M130T
V131F
V131I
K132T
D133G
D133H
D133Y
D133fs*12
P134L
P134S
E135*
E135K
E135Q
E135fs*3
Q137*
Q137H
Q137L
D138G
D138N
D138Y
F139I
F139L
F139S
F139Y
F139_R140>S*
R140*
R140Q
R141I
R141K
R141T
R141fs*4
N142D
I143T
L144P
L144V
N145K
N145S
N145T
N145Y
N145_V146>KI
V146A
V146G
V146I
C147F

C147S
C147Y
K148E
E149*
E149A
E149D
E149G
E149K
E149Q
E149V
A150G
A150S
A150V
V151A
V151L
V151M
D152H
D152N
L153F
R154K
R154M
R154S
R154W
D155H
D155V
D155Y
L156I
L156V
N157K
S158*
S158A
S158L
S158P
P159S
P159T
H160N
H160R
H160Y
H160fs*12
S161C
S161I
S161T
R162G
R162I

R162K
R162T
A163G
A163T
A163V
M164I
M164L
M164T
M164V
Y165C
Y165F
YV165_166*F
V166A
V166G
V166I
Y167*
Y167C
Y167H
P168F
P168H
P168L
P168R
P168S
P168T
P169A
P169L
P169Q
P169R
P169S
P169T
N170fs*2
V171E
V171L
E172D
E172G
E172Q
S173C
S173Y
S174L
P175L
P175Q
P175S
E176D
E176K

【表１４－６】

E176Q
L177*
L177F
P178S
K179N
K179Q
H180N
H180P
H180R
I181V
Y182F
Y182H
N183H
N183T
K184E
K184N
K184Q
K184R
K184T
L185*
L185F
L185S
D186A
D186E
D186G
D186N
D186Y
K187E
K187Q
K187R
G188R
Q189*
Q189fs*14
I190L
I190V
V192L
V192M
V193L
I194M
W195*
W195C
W195R
V196L
I197M

I197T
I197V
V198D
V198F
V198I
S199F
S199P
S199Y
P200A
P200L
P200R
P200S
N201D
N201S
N202D
N202fs*9
D203G
D203H
D203N
D203Y
K204T
Q205*
Q205H
Q205K
Q205P
Q205R
K206E
Y207S
T208A
L209V
K210R
I211M
I211V
N212S
H213P
H213Y
D214E
D214G
D214Y
D214_C215>ER
C215S
C215T
C215Y
V216A

V216I
V216L
P217L
P217R
P217S
E218D
E218K
E218Q
E218fs*4
Q219H
Q219K
V220L
I221N
I221V
E223D
E223G
E223K
E223Q
A224G
A224S
A224T
A224V
I225M
I225S
I225T
I225V
R226G
R226S
R226T
K227*
K228N
T229A
T229P
T229S
T229fs*9
T229fs*11
R230*
R230G
R230L
R230Q
R230fs*7
S231R
M232I
M232L

M232V
L233F
L233S
L233V
L234fs*8
S235C
S235F
S235P
S235T
S236C
S236F
S236T
S236Y
E237K
E237Q
Q238K
Q238L
L239I
L239Q
L239R
L239V
K240N
K240Q
K240T
V243D
V243G
V243I
V243L
V243fs*15
E245K
Y246C
Q247*
Q247H
Q247L
Q247R
G248C
G248V
K249*
K249N
K249T
Y250C
Y250F
Y250H
Y250N

【表１４－７】

I251N
K253I
K253N
K253T
V254G
V254L
V254M
V254_C255>LW
C255F
C255Y
C255fs*3
G256*
G256A
G256E
G256R
G256V
C257R
D258E
D258G
D258H
D258N
E259Q
Y260C
Y260H
F261L
F261V
F261Y
E263*
E263D
E263K
E263Q
E263fs*5
K264Q
K264T
K264fs*4
Y265*
Y265C
P266H
P266L
P266R
P266S
L267M
L267P
L267V

S268N
S268T
Q269*
Q269H
Q269L
Q269R
Q269fs*4
Y270F
Y270N
K271N
K271R
Y272C
Y272F
Y272H
I273L
I273M
I273T
R274G
R274I
R274K
R274T
S275C
S275I
S275N
C276*
C276F
C276G
I277L
I277T
I277V
I277fs*7
M278I
M278K
M278L
M278T
M278fs*23
L279F
L279H
L279I
L279R
L279V
G280A
G280E
G280K

G280R
G280V
G280W
R281M
R281S
R281fs*5
M282I
P283L
P283S
N284H
N284K
N284S
N284Y
L285F
L285M
M286I
L287F
M288I
M288T
A289T
A289V
K290N
E291*
E291K
E291Q
S292C
S292I
S292N
S292R
L293F
Y294*
Y294H
Y294fs*25
S295A
S295C
S295F
S295Y
Q296*
Q296E
Q296K
Q296R
L297P
L297R
P298A

P298Q
P298R
P298S
M299I
M299L
M299T
D300A
D300E
D300H
D300N
C301*
C301F
C301G
C301S
C301W
C301Y
F302C
F302Y
T303A
T303K
T303R
M304I
M304L
M304T
M304V
P305S
P305_N319>H
S306A
S306C
S306F
S306P
S306Y
S306fs*13
Y307F
Y307H
S308A
S308C
S308F
S308Y
R309G
R309_R310>S
R310C
R310H
R310L

【表１４－８】

I311F
I311N
S312C
S312F
S312fs*18
T313I
T313K
T315I
P316L
P316Q
P316S
P316T
Y317C
Y317F
Y317H
M318I
M318T
M318V
M318fs*15
N319S
N319T
G320*
G320A
G320E
G320R
G320V
E321A
E321K
E321Q
E321V
S323A
S323C
S323F
S323P
S323Y
T324I
K325E
K325Q
K325R
K325_I330del
K325fs*6
S326A
S326C
S326F

S326P
S326Y
L327F
L327H
L327I
L327fs*4
W328*
W328C
W328L
W328R
W328S
V329F
V329G
V329I
I330L
I330V
N331H
S332I
S332T
A333S
A333T
A333V
L334F
R335I
R335K
R335S
R335T
R335_I336ins18
R335fs*2
R335fs*17
R335fs*33
I336M
I336fs*8
K337Q
K337T
I338F
I338N
I338S
I338T
I338fs*7
L339F
L339I
L339R
L339V

C340F
C340R
C340_A341insVKILC
A341S
A341V
A341_T342insIKILCA
A341_T342insLRIKILCA
A341_T342insYKILCA
T342A
T342I
T342S
T342_N345>H
T342_Y343ins37
T342_Y343insRIKILCAT
Y343C
Y343F
Y343I
Y343L
Y343S
Y343_N345del
Y343_V344>L
Y343_V344insATY
Y343_V344insERIKILCATY
Y343_V344insLCATY
V344A
V344E
V344F
V344G
V344L
V344M
V344R
V344_N345>RFSAFWLRSS
V344_N345insK
V344_N345insM
V344_N345insV
V344_N345insILCATYV

V344_N345insKV
V344_N345insKILCATYV
V344_N345insTTYV
V344_N345insTYV
V344_N347del
N345D
N345H
N345I
N345K
N345S
N345T
N345Y
N345_I348>K
N345_I348del
N345_K353del
N345_V346>K
N345_V346>KL
N345_V346>KATYVNV
N345_V346insATYVN
V346A
V346E
V346G
V346L
V346L
V346Q
V346_N347>ERTYVNVN
V346_N347insK
V346_N347insV
V346_N347insEKIKKKKKK
V346_N347insKNV
V346_N347insMNV
V346_N347insVNV
V346>GK
N347D
N347I
N347K

【表１４－９】

N347T
N347Y
N347_I348insR
N347_I348insVN
I348M
I348S
I348V
I348_R349insLN I
R349*
R349Q
R349_D350insIR
R349_D350insV R
D350G
D350H
D350K
D350N
D350Y
D350_I351insKK ILCATYVNVNIRD
D350_I351insRI KILCATYVNVNIR D
D350del
I351F
I351S
I351_D352>E
I351_D352>KYL Q
I351_D352insGI KILCATYVNVNIR DI
I351_D352insVN VNIRDI
D352H
D352N
D352Y
D352>RDIN
K353M
K353N
K353_I354insVV NVNIRDIDK
I354D
I354F
I354L
I354N

I354S
I354T
I354V
Y355C
Y355_V356insY
V356A
V356F
V356I
V356L
R357*
R357G
R357L
R357Q
R357fs*10
T358A
T358K
T358S
T358_G359insA
G359A
G359C
G359R
G359V
I360F
I360T
I360V
Y361C
Y361F
Y361H
Y361_H362insQI YVRTGIY
H362N
H362R
H362Y
G363A
G363E
G363V
G363_G364insY VRTGIYHG
G363>YHR
G364E
G364K
G364R
G364_E365insV RTGIYHGG
E365D

E365K
E365Q
E365V
P366F
P366H
P366L
P366R
P366S
P366T
P366fs*5
C368Y
D369G
D369N
D369Y
N370D
N370K
N370S
N372S
T373I
T373P
T373S
Q374*
Q374E
Q374H
R375G
R375I
R375K
R375S
V376I
P377L
P377S
C378F
C378L
C378R
C378W
C378Y
S379C
S379F
N380K
N380Y
P381A
P381S
R382K
R382W

R382fs*6
W383*
W383C
W383L
E385K
W386R
L387Q
L387V
N388D
N388I
N388T
Y389C
Y389F
Y389S
D390A
D390H
D390N
D390Y
I391V
I391fs*36
Y392*
Y392H
P394S
P394_D395ins2 3
D395H
D395N
D395V
D395Y
L396F
L396I
L396P
L396V
P397A
P397R
P397S
P397T
R398C
R398H
R398L
A399D
A399G
A399S
A399T
A399V

【表１４－１０】

R401*
R401L
R401Q
R401S
L402V
C403R
L404F
L404I
L404V
S405F
S405T
S405Y
I406F
I406M
I406V
C407F
C407R
C407W
C407Y
C407fs*21
S408C
S408P
V409F
V409I
K410_G411insGRKGAKEVKYFRRK
K410fs*6
G411D
G411R
G411S
G411V
R412*
R412L
R412Q
K413N
K413_G414insRK
G414A
G414D
G414R
G414S
G414V
G414fs*13
A415D

K416E
K416I
E417D
E417G
E417K
E417Q
E417V
E418*
E418A
E418K
E418Q
E418_C420>D
E418_P421>A
H419L
H419P
H419Q
H419R
H419Y
H419_C420>R
H419_C420del
H419_L422>T
H419_L422>LM
H419_L422>PW
H419_L422del
H419_L422del
H419_P421>L
H419_P421>P
H419_P421>Q
H419_P421>R
H419_P421>T
H419_P421del
H419fs*11
C420R
C420S
C420Y
C420_P421del
C420_L422>W
C420_A423>W
C420_A423>Y
C420_A423del
C420_I427>WHGNV
P421A
P421L
P421R

P421S
P421T
P421_A423>H
P421_A423>H
P421_A423del
P421_L422del
P421>RR
L422E
L422F
L422S
L422W
L422_A423>F
A423E
A423S
A423T
A423V
W424*
W424C
W424G
W424L
W424R
W424_G425insF
W424_I427del
G425E
G425R
G425V
N426D
N426S
N426fs*6
I427K
I427M
I427T
I427V
N428K
N428S
N428Y
L429F
L429V
L429fs*2
F430C
F430L
Y432F
Y432H
Y432fs*5

T433A
T433R
T433_D434>NTD
T433_D434insTLVSGKMALNLWPVPHGLE
D434E
D434H
D434fs*2
T435I
T435N
T435S
L436P
L436V
L436fs*1
L436fs*32
V437E
V437G
V437I
S438A
S438C
S438fs*30
G439A
G439E
G439K
G439R
G439fs*5
K440E
K440N
K440fs*45
M441I
M441V
E441fs*3
M441fs*3
M441fs*28
A442T
A442V
L443F
N444H
N444K
N444_G451>K
N444_L455>H
L445F
L445I

【表１４－１１】

L445_W446insL
W446*
W446S
W446_D454del
W446_E453del
W446_G451del
W446_G460>C
W446_H450>R
W446_H450del
W446_I459del
W446_L456del
W446_P447insW
W446_P458del
W446_V461del
P447A
P447L
P447S
P447_L452del
P447_L455del
P447_V448ins24
P447_V448insLFDYTDTLVSGKMALNLWP
V448A
V448E
V448G
V448L
V448_D454del
V448_E453>K
V448_E453>P
V448_E453>YK
V448_E453del
V448_G451del
V448_L452del
V448_L455del
V448_P449insSGKMALNLWPV
V448_P449insVSGKMALNLWPV
V448fs*14
P449A
P449H
P449L
P449R

P449S
P449T
P449_D454>R
P449_D454del
P449_E453>Q
P449_E453del
P449_H450insLVSGKMALNLWPVP
P449_H450insPVP
P449_H450insPVP
P449_I459del
P449_L452del
P449_L455del
P449_L456del
P449_P458del
H450D
H450N
H450Q
H450R
H450Y
H450_D454del
H450_E453del
H450_G451>PRG
H450_G460>R
H450_I459>L
H450_I459del
H450_L452del
H450_L455>P
H450_L455>Q
H450_L455>KM
H450_L455del
H450_L455del
H450_L455del
H450_L456>P
H450_L456del
H450_N457del
H450_P458>LIH
H450_P458del
H450_V461>GS
G451A
G451E

G451K
G451R
G451V
G451_D454>RR
G451_D454del
G451_E453del
G451_G460del
G451_I459>A
G451_I459>V
G451_L452>KKKKK
G451_L452insFGKMALNLWPVPHG
G451_L455>A
G451_L455>V
G451_L455>GTM
G451_L455del
G451_L456>K
G451_L456>V
G451_N457del
G451_P458>V
G451_P458del
L452S
L452_E453del
L452_E453ins21
L452_E453insAGKMALNLWPVPHGL
L452_E453insVSGKMALNLWPVPHGL
L452_G460>F
L452_G460del
L452_I459>FRRF
L452_I459>PLWARL
L452_I459del
L452_I459del
L452_L455>W
L452_N457>T
L452_N457>Y
L452_P458>F
L452_T462>QKT
L452_V461>F

E453*
E453A
E453D
E453G
E453K
E453Q
E453V
E453_D454>KN
E453_D454del
E453_D454insGKMALNLWPVPHGLE
E453_D454insVSGKMALNLWPVPHGLE
E453_D454insVVSGKMALNLWPVPHGLE
E453_G460>C
E453_G460del
E453_G463del
E453_I459>G
E453_I459>V
E453_I459del
E453_L455>G
E453_L455>V
E453_L455del
E453_L455del
E453_L456>M
E453_L456>V
E453_L456del
E453_P458del
E453_T462del
E453_T462del
E453>GLK
E453del
D454E
D454G
D454H
D454K
D454N
D454Y
D454_I459del
D454_K468del
D454_L455>V
D454_L455del

【表１４－１２】

D454_N467>VS
D454_P458>Y
D454del
L455F
L455_G460>C
L455_G460del
L455_I459>C
L455_I459>C
L455_I459>F
L455_I459del
L455_L456>FM
L455_L456insPGKMALNLWPVPHGLEDL
L455_N467>SD
L455_N467del
L455_P458del
L455_T462del
L455_V461>F
L456M
L456P
L456R
L456V
L456_I459del
L456_N457insKKKKKREDLL
N457D
N457K
N457S
N457_G460>S
N457_G463>R
N457_I459>K
N457_I459>K
N457_P458>TR
N457_T462del
N457_V461del
P458A
P458L
P458R
P458S
P458_G463>R
P458_I459insMNLWPVPHGLEDLLNP
P458_K468del

P458_V461>L
I459M
I459N
I459S
I459T
I459V
I459_T462del
G460A
G460C
G460D
G460R
G460V
V461A
V461_N465del
T462I
T462_N465del
T462_S464del
T462fs*12
G463*
G463A
G463E
G463R
G463V
G463_K468del
S464*
S464L
N465I
N465K
N465S
N465T
N465Y
N465_P466ins27
P466L
P466Q
P466S
P466_N467insKLLNPIGVTGSNP
N467H
N467K
N467T
K468*
K468R
K468T
K468_E469ins31

K468_E469ins35
K468_E469insVERLLNPIGVTGSNPNK
K468_E469insVLLNPIGVTGSNPNK
E469*
E469A
E469D
E469G
E469K
E469V
E469_T470>D
E469>DK
T470I
T470N
T470P
T470S
T470fs*4
P471A
P471I
P471L
P471Q
P471S
P471T
P471>QTL
C472S
C472W
C472>FF
L473I
L473V
L473_E474insL
L473_E474insACL
L473_L475>FGVWSLEL
E474A
E474K
E474Q
E474V
L475*
L475F
E476G
E476K
E476Q

E476_F477insLE
D478A
D478E
D478G
D478H
D478N
D478Y
W479C
W479S
F480L
S481G
S481N
S481R
S481T
S482C
S482N
V483A
V483L
V483M
V484A
V484I
V484L
K485E
K485R
K485T
F486L
F486Y
P487L
P487Q
P487R
P487S
D488G
D488H
D488N
D488_S490del
M489I
M489V
S490P
V491G
V491L
V491M
I492F
I492M
I492T

【表１４－１３】

E493K
E493Q
E494*
E494D
E494K
E494Q
E494V
H495L
H495N
H495Q
A496D
A496S
A496T
A496V
N497S
W498*
W498C
W498L
W498R
W498S
S499F
S499Y
V500L
V500fs*9
S501F
S501T
S501Y
R502*
R502G
R502Q
E503G
E503K
E503Q
E503del
G505A
G505E
G505R
F506C
F506L
F506V
S507G
S507I
S507R
S507T

Y508C
Y508H
Y508N
S509C
S509F
H510Q
H510R
H510Y
A511P
A511S
G512*
G512A
G512E
G512R
G512V
L513P
L513V
L513fs*5
S514C
S514N
S514R
N515Y
R516I
R516K
R516T
L517I
L517P
L517R
L517V
A518G
A518P
A518S
A518T
R519K
R519T
D520E
D520H
D520N
N521D
N521K
N521S
E522*
E522K
E522Q

L523F
L523V
L523fs*1
R524K
R524M
R524S
R524fs*36
E525*
E525A
E525G
E525K
E525fs*35
N526S
N526fs*34
D527E
D527G
D527H
D527N
K528E
E529K
E529Q
Q530*
Q530H
Q530K
Q530R
L531R
A533T
I534N
I534V
S535C
S535F
S535Y
T536A
T536K
T536S
R537*
R537L
R537Q
D538A
D538E
D538G
D538H
D538N
D538Y

D538_S541>A
D538del
P539A
P539H
P539L
P539R
P539S
P539T
P539del
L540F
L540H
L540I
L540P
L540R
L540V
S541A
S541C
S541F
S541L
S541P
S541T
S541_E542insAISTRDRLS
S541fs*1
E542A
E542D
E542G
E542I
E542K
E542L
E542Q
E542R
E542V
I543V
I543_E545del
T544N
T544S
E545A
E545D
E545G
E545K
E545L
E545N
E545P
E545Q

【表１４－１４】

E545R
E545S
E545T
E545V
E545W
E545_Q546>DK
E545_Q546>DL
Q546E
Q546H
Q546K
Q546L
Q546P
Q546R
E547*
E547D
E547G
E547K
E547Q
K548N
K548Q
K548R
D549G
D549H
D549N
D549Y
D549fs*21
F550C
F550L
F550V
L551I
L551P
L551V
L551fs*8
L551fs*9
W552*
W552C
W552G
W552R
S553C
S553G
S553N
S553R
S553T
H554D

H554Q
H554R
H554Y
R555G
R555K
R555T
H556D
Y557C
Y557S
C558F
C558S
V559I
V559L
T560I
T560P
T560S
I561M
I561V
P562L
P562S
E563D
E563K
I564S
P566L
P566S
K567Q
L569I
L570M
L570P
S571C
V572A
V572I
V572fs*9
K573R
W574L
N575I
N575K
S576F
S576T
S576Y
R577G
R577I
R577K
R577S

R577T
D578E
D578H
D578N
D578V
D578Y
E579*
E579D
E579K
E579Q
V580A
V580E
V580L
A581T
A581V
Q582*
Q582L
Q582R
M583I
Y584H
C585F
C585G
L586F
L586M
V587I
V587fs*10
K588N
K588fs*8
D589E
D589H
D589Y
W590*
P591T
P592A
P592L
P592S
P592T
P592fs*32
I593M
I593N
I593V
P595L
P595T
E596K

E596Q
E596V
E596fs*28
Q597H
Q597K
Q597R
Q597_A598>HT
A598D
A598T
M599L
M599_E600>IK
E600*
E600A
E600K
L602M
L602R
L602_D603insT
D603N
D603Y
C604R
C604Y
N605H
N605K
N605S
N605Y
P607A
P607L
D608Y
P609G
P609H
P609L
P609S
M610I
M610L
M610T
V611I
R612*
R612G
R612L
R612P
R612Q
R612fs*1
G613D
G613V

【表１４－１５】

A615V
V616A
V616L
R617Q
R617W
C618R
C618W
L619S
L619V
K621*
K621I
K621N
K621Q
Y622*
L623F
L623I
L623V
T624I
T624P
T624S
D625F
D625H
D625V
D625Y
D626E
D626G
D626N
D626Y
K627N
K627Q
K627R
L628I
L628P
L628R
L628V
S629C
S629F
S629P
S629Y
Q630*
Q630E
Q630H
Q630P
Q630R

Y631C
L632*
L632F
I633L
Q634*
Q634E
Q634H
V636A
V636L
V636R
Q637*
Q637K
Q637L
V638A
V638I
K640Q
K640R
Y641*
E642K
E642Q
Q643H
Q643L
Q643R
Y644*
Y644C
L645F
D646E
D646H
N647K
N647S
N647T
L648F
L648V
L649F
V650A
R651K
R651S
L653*
L653fs*2
L653fs*8
L654V
K655N
K656N
K656T

A657P
A657S
A657V
L658F
T659A
T659N
T659S
N660D
N660S
Q661E
Q661K
Q661fs*11
R662K
R662M
R662S
I663S
I663del
G664E
G664W
H665fs*7
F666C
F666L
F667L
W669*
W669C
W669G
W669R
W669fs*6
H670N
H670Q
H670R
L671F
L671I
L671V
L671fs*1
K672I
K672N
S673C
S673F
S673T
E674A
E674D
E674G
E674K

E674Q
E674V
M675I
M675T
M675V
H676R
H676Y
H676fs*24
N677H
N677K
N677S
K678*
K678E
K678T
T679R
V680A
V680D
V680I
V680fs*19
S681C
S681I
S681N
S681R
S681T
Q682*
Q682H
Q682R
R683K
R683M
R683S
R683T
F684Y
G685S
G685V
L687F
L687I
L688M
E689K
E689Q
S690F
S690Y
Y691C
C692*
C692R

【表１４－１６】

R693C
R693G
R693H
R693L
R693P
R693S
A694T
A694V
G696R
G696W
M697fs*3
Y698*
Y698C
Y698H
L699F
L699V
H701Q
L702V
R704S
R704T
R704W
Q705H
Q705L
V706F
V706I
E707*
E707D
E707K
E707Q
A708T
M709I
M709V
E710K
K711E
K711N
K711Q
K711R
K711T
L712F
L712H
L712I
L712V
N714D
N714H

N714I
N714K
N714Y
L715V
T716A
T716I
T716N
T716S
D717E
D717H
D717N
D717V
D717_D725del
I718L
I718V
I718_L719del
L719F
L719I
L719R
L719V
K720E
K720I
Q721E
Q721H
Q721K
Q721P
E722D
E722K
E722Q
E722del
K723N
K723R
K723T
K724T
K724del
D725A
D725E
D725G
D725H
D725V
D725Y
D725_E726del
D725_K729del
D725_Q728>L

D725_Q728del
D725_T727del
D725del
E726*
E726A
E726D
E726G
E726K
E726Q
E726V
T727A
T727K
T727R
T727S
T727del
Q728K
Q728R
K729N
V730A
V730I
V730L
Q731E
Q731H
Q731K
Q731R
M732I
K733N
K733T
F734I
F734L
F734V
L735I
L735S
L735V
V736A
V736F
V736I
V736L
E737*
E737D
E737K
E737Q
Q738E
Q738R

Q738fs*2
M739I
R741*
R741Q
P742A
P742R
P742S
P742T
D743E
D743G
D743H
D743N
D743V
F744I
F744L
F744V
M745I
M745L
M745T
D746A
D746G
D746H
D746N
D746V
D746Y
L748V
L748fs*5
Q749*
Q749H
Q749K
G750A
G750C
G750D
G750E
G750S
F751S
F751V
L752R
L752V
S753F
S753T
S753Y
P754A
P754S

【表１４－１７】

P754T
P754del
L755I
L755Q
L755V
L755_N756>P
N756K
N756S
N756Y
P757L
P757S
P757fs*5
A758S
A758T
A758V
H759D
H759N
H759Q
H759Y
Q760*
Q760E
Q760L
Q760R
L761R
G762E
G762R
N763T
L764F
L764I
L764P
L764V
R765G
R765S
L766P
L766fs*10
E767G
E767K
E767Q
E768*
E768D
E768K
E768Q
C769W
R770*

R770L
R770Q
I771L
I771N
I771S
I771T
M772I
M772V
S773F
S773P
S774C
S774F
A775V
K776R
R777K
R777S
R777fs*5
R777fs*22
P778S
L779V
W780S
L781F
L781S
L781W
N782D
W783*
W783S
E784D
N785I
N785S
P786A
P786Q
P786S
P786T
D787G
D787V
I788F
I788V
I788del
M789I
M789S
M789T
M789V
S790*

S790A
S790P
E791*
E791D
E791Q
L792*
L792F
L793V
L793fs*5
Q795*
Q795E
Q795H
Q795R
N796H
N796I
E798D
E798K
E798Q
I799L
I799M
I799V
I800F
I800M
F801L
F801N
F801V
N803H
N803Y
G804R
D805G
D805N
D805Y
D806G
D806Y
L807S
L807V
R808L
R808W
Q809*
Q809H
Q809K
D810H
D810Y
M811I

T813A
L814V
Q815*
Q815R
I816N
I816S
I816T
I816V
I817F
I817V
I817_I819del
I817fs*14
R818C
R818G
R818H
R818L
I819N
I819V
M820I
M820L
E821G
E821K
N822D
N822I
I823F
I823M
I823T
I823V
W824*
W824F
W824G
Q825*
Q827E
Q827K
G828D
L829F
L829I
L829P
D830G
D830N
D830V
L831F
L831I
L831V

【表１４－１８】

R832*
R832L
R832Q
M833I
M833V
M833fs*1
L834S
L834V
P835A
P835L
P835T
Y836C
G837C
G837D
G837N
G837S
G837fs*30
C838F
C838Y
L839V
S840*
S840L
S840fs*27
I841V
I841fs*3
G842C
G842S
D843G
D843N
C844F
C844R
C844S
C844Y
V845L
V845W
V845_G846insCV
V845fs*4
G846*
L847F
L847H
L847R
L847V
I848L
I848M

I848T
E849*
E849D
E849K
E849Q
V850A
V850G
V850M
V851E
R852*
R852G
R852Q
N853K
N853S
S854A
S854C
S854F
S854P
H855L
H855R
H855S
H855T
H855Y
T856S
I857L
I857V
I860M
I860V
Q861*
Q861E
Q861H
Q861K
C862W
K863I
G864S
G865D
G865S
L866F
L866V
L866W
K867I
K867N
K867R
G868A

G868C
G868S
A869T
A869V
Q871L
F872L
F872V
N873D
N873H
N873K
N873S
S874N
H875N
H875R
H875Y
T876A
T876I
T876K
L877I
L877V
H878Y
Q879*
Q879H
Q879K
Q879L
Q879R
L881I
L881V
K882T
D883E
D883G
D883H
D883N
D883V
D883Y
K884*
K884N
N885S
K886E
K886N
K886R
G887A
G887E
G887R

E888D
E888G
E888K
E888Q
I889L
I889M
I889T
Y890C
Y890N
A892V
A893S
A893T
A893V
A893fs*3
I894L
I894V
D895E
D895H
D895N
D895Y
L896M
L896P
F897L
F897fs*18
T898I
T898P
T898fs*19
R899C
R899G
R899H
C901F
C901S
C901W
C901fs*19
A902P
A902T
A902V
G903*
G903A
G903E
Y904*
C905S
V906I
V906L

【表１４－１９】

A907V
T908fs*15
F909C
F909L
I910L
I910V
L911F
L911M
L911fs*9
G912R
G914E
G914R
D915N
R916C
R916H
S919G
S919T
N920S
I921N
I921V
I921del
M922I
V923L
V923M
K924R
D925E
D926N
G927R
G927V
Q928R
L929F
L929M
F930S
H931N
H931Y
I932L
D933N
F934C
F934fs*23
H936R
F937fs*1
L938M
L938fs*19
D939G

D939N
H940R
H940Y
K941N
K941R
K942M
K942N
K943N
K944I
K944R
K944del
F945C
F945I
F945L
F945fs*4
F945fs*12
G946C
G946D
G946V
Y947*
Y947F
R949*
R949Q
E950*
E950D
E950Q
R951C
R951H
R951L
V952A
V952L
F954Y
F954fs*7
F954fs*11
V955F
L956F
T957I
T957P
Q958*
Q958H
Q958K
Q958L
Q958R
D959Y

F960L
L961F
I962M
I962T
V963M
I964N
I964fs*2
I964fs*22
S965N
S965T
K966I
K966R
G967A
G967E
G967R
A968S
A968T
A968V
Q969*
Q969H
Q969K
Q969R
E970*
E970A
E970G
E970K
E970Q
C971G
T972R
K973N
T974K
T974R
T974fs*3
R975K
R975T
E976*
E976D
E976G
E976K
E976Q
F977C
F977L
E978D
E978K

E978Q
R979M
R979S
F980V
Q981*
Q981E
Q981H
Q981K
Q981L
Q981R
E982D
E982K
E982Q
M983I
M983L
C984R
C984S
Y985C
Y985D
Y985H
Y985N
Y985S
K986fs*5
A987T
A987V
Y988H
Y988N
Y988S
L989Q
L989R
L989V
A990G
A990_I991>V*
I991V
I991fs*26
R992*
R992Q
A995V
N996I
N996K
L997F
L997H
L997I
L997V

【表１４－２０】

F998L
F998fs*14
I999M
I999R
I999V
N1000H
N1000K
N1000S
L1001F
L1001I
L1001V
L1001fs*4
L1001fs*17
F1002C
F1002I
F1002L
F1002V
S1003K
S1003L
S1003fs*15
M1004I
M1004L
M1004R
M1004V
M1004del
M1005I
M1005V
L1006F
L1006H
L1006R
G1007C
G1007D
G1007R
S1008C
G1009A
G1009E
G1009R
M1010I
M1010I
M1010V
P1011A
P1011L
P1011S
E1012D

E1012Q
Q1014K
Q1014R
S1015C
S1015F
S1015Y
F1016I
F1016L
F1016S
F1016V
F1016Y
D1017G
D1017H
D1017V
D1017Y
D1018N
I1019M
I1019S
I1019T
A1020K
A1020S
A1020T
A1020V
Y1021C
Y1021F
Y1021H
Y1021N
Y1021S
I1022M
I1022T
I1022_R1023ins FLYVCTIAYI
R1023*
R1023L
R1023P
R1023Q
K1024N
K1024T
T1025A
T1025I
T1025N
T1025S
L1026P
A1027T
A1027V

L1028F
L1028I
L1028S
L1028V
D1029E
D1029G
D1029H
D1029N
D1029Y
K1030*
K1030E
K1030R
T1031A
T1031N
T1031P
E1032*
E1032A
E1032D
E1032K
Q1033E
Q1033K
Q1033P
Q1033R
E1034G
E1034K
E1034Q
A1035T
A1035V
L1036F
L1036K
L1036S
E1037D
E1037K
E1037Q
Y1038C
Y1038F
Y1038H
Y1038N
Y1038S
F1039I
F1039S
M1040I
M1040K
M1040L

K1041*
Q1042R
Q1042fs*25
1043_1044MN>IY
M1043I
M1043L
M1043T
M1043V
M1043_N1044>IK
M1043_N1044>IR
N1044D
N1044H
N1044I
N1044K
N1044R
N1044S
N1044T
N1044Y
D1045A
D1045G
D1045H
D1045N
D1045V
D1045Y
A1046T
H1047A
H1047D
H1047I
H1047L
H1047N
H1047Q
H1047R
H1047Y
H1047_H1048>RR
H1048L
H1048N
H1048R
G1049A
G1049C
G1049D
G1049R

【表１４－２１】

G1049S
G1049W
G1050A
G1050D
G1050S
W1051C
W1051L
W1051fs*16
T1052A
T1052I
T1052K
T1052R
T1053fs*15
K1054T
K1054_M1055>NGLDLPHN*TACIEM
M1055I
M1055L
M1055V
D1056H
D1056N
W1057*

W1057C
I1058F
I1058L
I1058M
H1060L
T1061I
T1061K
I1062L
I1062V
K1063*
Q1064H
Q1064_H1065insQWTTKMDWIFHTIKQ
Q1064fs*6
Q1064fs*7
Q1064fs*9
Q1064fs*24
Q1064fs*5+
H1065L
H1065Q
H1065R
H1065Y

H1065_*1069>?
H1065_A1066>LKLK
H1065fs*?
H1065fs*4
H1065fs*5
H1065fs*8
H1065fs*8
H1065fs*1+
H1065fs*15
H1065fs*6+
A1066_*1069>?
A1066_L1067insCV
A1066fs*2+
A1066fs*4
A1066fs*5
A1066fs*5+
A1066fs*8
A1066I
A1066L
A1066L
L1067F

L1067V
L1067W
L1067_*1069>FKLKKN*
L1067fs*4
L1067fs*5
L1067fs*6
L1067fs*7
L1067fs*7
L1067fs*11+
L1067fs*20
L1067fs*5+
N1068K
N1068fs*1
N1068fs*3
N1068fs*4
N1068fs*5
N1068fs*5
N1068fs*7
N1068fs*1+
N1068fs*10
N1068fs*11
N1068fs*21

【０６１３】

本明細書で使用される場合、「ＰＩ３Ｋα媒介性」障害、疾患、及び／または状態という用語は、ＰＩ３Ｋαまたはその変異体が役割を果たすことが知られている任意の疾患または他の有害な状態を意味する。したがって、本開示の別の実施形態は、ＰＩ３Ｋαまたはその変異体が役割を果たすことが知られている１つ以上の疾患の治療またはその重症度の軽減に関する。そのようなＰＩ３Ｋα媒介性障害には、細胞増殖性障害（例えば、がん）が含まれるが、これらに限定されない。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋα媒介性障害は、変異型ＰＩ３Ｋαによって媒介される障害である。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋα媒介性障害は、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαによって媒介される障害である。

【０６１４】

いくつかの実施形態において、本開示は、細胞増殖性疾患を治療する方法を提供し、当該方法は、それを必要とする患者に、治療上有効な量の本開示の化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前述のいずれかの薬学的に許容される組成物を投与することを含む。いくつかの実施形態において、本開示は、細胞増殖性疾患を治療するための方法を提供し、当該方法は、それを必要とする患者に、治療上有効な量の本開示の化合物またはその薬学的に許容される組成物を投与することを含む。

【０６１５】

いくつかの実施形態において、治療方法は、（ｉ）かかる治療を必要とする対象を特定するステップと、（ｉｉ）開示される化合物またはその薬学的に許容される塩を提供するステップと、（ｉｉｉ）当該提供される化合物を、かかる治療を必要とする対象における病状または状態を治療、抑制及び／または予防するのに治療上有効な量で投与するステップとを含む。いくつかの実施形態において、対象は、変異型ＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、対象は、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少

なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する。
【０６１６】
いくつかの実施形態において、治療方法は、（ｉ）かかる治療を必要とする対象を特定するステップと、（ｉｉ）開示される化合物またはその薬学的に許容される塩を含む組成物を提供するステップと、（ｉｉｉ）当該組成物を、かかる治療を必要とする対象における病状または状態を治療、抑制及び／または予防するのに治療上有効な量で投与するステップとを含む。いくつかの実施形態において、対象は、変異型ＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、対象は、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する。
【０６１７】
本開示の別の態様は、本明細書に記載される障害の治療における使用のための、本明細書の定義に従う化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前述のいずれかの医薬組成物を提供する。本開示の別の態様は、本明細書に記載される障害の治療のための、本明細書の定義に従う化合物もしくはその薬学的に許容される塩、または前述のいずれかの医薬組成物の使用を提供する。同様に、本開示は、本明細書に記載される障害を治療する医薬を調製するための、本明細書の定義に従う化合物またはその薬学的に許容される塩の使用を提供する。
【０６１８】
細胞増殖性疾患
いくつかの実施形態では、障害は、細胞増殖性疾患である。いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、がんである。いくつかの実施形態では、がんは、腫瘍である。いくつかの実施形態では、がんは、固形腫瘍である。いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、腫瘍及び／または癌性細胞の増殖である。いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、腫瘍である。いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、固形腫瘍である。いくつかの実施形態において、細胞増殖性疾患は、がん性細胞の増殖である。
【０６１９】
いくつかの実施形態において、がんは、肉腫、肺、気管支、前立腺、乳房（散発性乳癌及びカウデン病の患者を含む）、膵臓、結腸、直腸、癌腫、結腸癌、腺腫、結腸直腸腺腫、甲状腺、肝臓、肝内胆管、肝細胞、副腎、腹、胃、神経膠腫、膠芽腫、子宮内膜、黒色腫、腎臓、腎盂、膀胱、子宮体部、子宮頸部、膣、卵巣（明細胞卵巣癌を含む）、多発性骨髄腫、食道、白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、リンパ球性白血病、骨髄性白血病、脳、脳の癌、口腔及び咽頭、喉頭、小腸、非ホジキンリンパ腫、絨毛結腸腺腫、腫瘍、上皮性の腫瘍、リンパ腫、乳癌、基底細胞癌、扁平上皮癌、光線性角化症、頸、頭、真性赤血球増加症、本態性血小板血症、骨髄性化生を伴う骨髄線維症、ならびにヴァルデンストロームマクログロブリン血症から選択される。
【０６２０】
いくつかの実施形態では、がんは、肺、気管支、前立腺、乳房（散発性乳癌及びカウデン病を含む）、膵臓、胃腸、結腸、直腸、甲状腺、肝臓、肝内胆管、肝細胞、副腎、腹、胃、子宮内膜、腎臓、腎盂、膀胱、子宮体部、子宮頸部、膣、卵巣（明細胞卵巣癌を含む）、食道、白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、リンパ性白血病、骨髄性白血病、脳、口腔及び咽頭、喉頭、小腸、頸、及び頭から選択される。いくつかの実施形態では、がんは、肉腫、癌腫、結腸癌、腺腫、結腸直腸腺腫、神経膠腫、膠芽腫、黒色腫、多発性骨髄腫、脳の癌、非ホジキンリンパ腫、絨毛結腸腺腫、腫瘍、上皮性の腫瘍、リンパ腫、乳癌、基底細胞癌、扁平上皮癌、光線性角化症、真性赤血球増加症、本態性血小板血症、骨髄性化生を伴う骨髄線維症、及びヴァルデンストロームマクログロブリン血症から選択される。
【０６２１】
いくつかの実施形態において、がんは、肺、気管支、前立腺、乳房（散発性乳癌及びカウデン病を含む）、膵臓、胃腸、結腸、直腸、甲状腺、肝臓、肝内胆管、肝細胞、副腎、腹、胃、子宮内膜、腎臓、腎盂、膀胱、子宮体部、子宮頸部、膣、卵巣（明細胞卵巣癌を

含む）、食道、脳、口腔及び咽頭、喉頭、小腸、頸、及び頭から選択される。いくつかの実施形態において、がんは、白血病である。いくつかの実施形態では、がんは、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、リンパ性白血病、または骨髄性白血病である。

【０６２２】

いくつかの実施形態では、がんは、乳癌（散発性乳癌及びカウデン病を含む）である。いくつかの実施形態において、がんは、乳癌である。いくつかの実施形態において、がんは、ＥＲ＋／ＨＥＲ２－乳癌である。いくつかの実施形態では、がんは、ＥＲ＋／ＨＥＲ２－乳癌であり、対象は、アルペリシブによる治療に不耐容であるか、または不適格である。いくつかの実施形態では、がんは、散発性乳癌である。いくつかの実施形態において、がんは、カウデン病である。

【０６２３】

いくつかの実施形態では、がんは、卵巣癌である。いくつかの実施形態において、卵巣癌は、明細胞卵巣癌である。

【０６２４】

いくつかの実施形態において、細胞増殖性疾患は、変異型ＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態では、がんは、変異型ＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態では、乳癌は、変異型ＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、卵巣癌は、変異型ＰＩ３Ｋαを有する。

【０６２５】

いくつかの実施形態において、細胞増殖性疾患は、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、がんは、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、乳癌は、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、卵巣癌は、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する。

【０６２６】

いくつかの実施形態において、がんは、腺腫；癌腫；肉腫；膠芽腫；膠芽腫；黒色腫；多発性骨髄腫；またはリンパ腫である。いくつかの実施形態では、がんは、結腸直腸腺腫または絨毛結腸腺腫である。いくつかの実施形態では、がんは、結腸がん、脳のがん、乳癌、基底細胞がん；または扁平上皮癌である。いくつかの実施形態では、がんは、腫瘍または上皮性の腫瘍である。いくつかの実施形態では、がんは、非ホジキンリンパ腫である。いくつかの実施形態では、がんは、光線性角化症、真性赤血球増加症、本態性血小板血症、骨髄性化生を伴う骨髄線維症、またはヴァルデンストロームマクログロブリン血症である。

【０６２７】

いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、ＰＩ３Ｋαの過剰発現または増幅、ＰＩＫ３ＣＡの体細胞変異、ＰＴＥＮの生殖系列変異または体細胞変異、またはｐ８５－ｐ１１０複合体を上方制御する役割を果たすｐ８５αの変異及び転座を示す。いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、ＰＩ３Ｋαの過剰発現または増幅を示す。いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、ＰＩＫ３ＣＡの体細胞変異を示す。いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、ＰＴＥＮの生殖細胞系列変異または体細胞変異を示す。いくつかの実施形態では、細胞増殖性疾患は、ｐ８５－ｐ１１０複合体を上方制御する役割を果たすｐ８５αの変異と転座を示す。

【０６２８】

追加の障害

いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋα媒介性障害は、真性赤血球増加症、本態性血小板血症、骨髄性化生を伴う骨髄線維症、喘息、ＣＯＰＤ、ＡＲＤＳ、ＰＲＯＳ（ＰＩ３Ｋ関連過成長症候群）、静脈奇形、ロフラー症候群、好酸球性肺炎、寄生虫（特に後生動物）の感染（熱帯性好酸球増加症を含む）、気管支肺アスペルギルス症、結節性多発動脈

炎（チャーグ・ストラウス症候群を含む）、好酸球性肉芽腫、薬物反応によって引き起こされる気道に影響を与える好酸球関連障害、乾癬、接触皮膚炎、アトピー性皮膚炎、多発性脱毛症、多形紅斑、疱疹状皮膚炎、強皮症、白斑、過敏性血管炎、蕁麻疹、水疱性類天疱瘡、紅斑性狼瘡、天疱瘡、後天性表皮水疱症、または自己免疫性血液障害（例えば、溶血性貧血、再生不良性貧血、真性赤血球性貧血及び特発性血小板減少症）、全身性エリテマトーデス、多発性軟骨炎、ウェゲナー肉芽腫症、皮膚筋炎、慢性活動性肝炎、重症筋無力症、スティーブン・ジョンソン症候群、特発性スプルー、自己免疫性炎症性腸疾患（例えば、潰瘍性大腸炎及びクローン病）、内分泌性眼症、グレーヴス病、サルコイドーシス、肺胞炎、慢性過敏性肺炎、多発性硬化症、原発性胆汁性肝硬変、ブドウ膜炎（前部及び後部）、間質性肺線維症、乾癬性関節炎、糸球体腎炎、心血管疾患、アテローム性動脈硬化症、高血圧、深部静脈血栓症、脳卒中、心筋梗塞、不安定狭心症、血栓塞栓症、肺塞栓症、血栓溶解性疾患、急性動脈虚血、末梢血栓性閉塞、冠動脈疾患、再灌流傷害、糖尿病性網膜症や高気圧酸素誘発性網膜症などの網膜症、及び緑内障などの眼内圧の上昇や眼房水の分泌を特徴とする病気からなる群から選択される。

【０６２９】

いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋα媒介性障害は、真性赤血球増加症、本態性血小板血症、または骨髄性化生を伴う骨髄線維症である。いくつかの実施形態では、ＰＩ３Ｋα媒介障害は、喘息、ＣＯＰＤ、ＡＲＤＳ、ＰＲＯＳ（ＰＩ３Ｋ関連過成長症候群）、静脈奇形、ロフラー症候群、好酸球性肺炎、寄生虫（特に後生動物）の感染（熱帯性好酸球増加症を含む）、または気管支肺アスペルギルス症である。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋα媒介性障害は、結節性多発動脈炎（チャーグ・ストラウス症候群を含む）、好酸球性肉芽腫、薬物反応によって引き起こされる気道に影響を与える好酸球関連障害、乾癬、接触皮膚炎、アトピー性皮膚炎、多発性脱毛症、多形紅斑、疱疹状皮膚炎、または強皮症である。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋα媒介性障害は、白斑、過敏性血管炎、蕁麻疹、水疱性類天疱瘡、紅斑性狼瘡、天疱瘡、後天性表皮水疱症、または自己免疫性血液障害（例えば、溶血性貧血、再生不良性貧血、真性赤血球性貧血及び特発性血小板減少症）である。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋα媒介性障害は、全身性エリテマトーデス、多発性軟骨炎、強皮症、ウェゲナー肉芽腫症、皮膚筋炎、慢性活動性肝炎、重症筋無力症、スティーブン・ジョンソン症候群、特発性スプルー、または自己免疫性炎症性腸疾患（例えば、潰瘍性大腸炎及びクローン病）である。

【０６３０】

いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋα媒介性障害は、内分泌性眼症、グレーヴス病、サルコイドーシス、肺胞炎、慢性過敏性肺炎、多発性硬化症、原発性胆汁性肝硬変、ブドウ膜炎（前部及び後部）、間質性肺線維症、または乾癬性関節炎である。いくつかの実施形態では、ＰＩ３Ｋα媒介障害は、糸球体腎炎、心血管疾患、アテローム性動脈硬化症、高血圧、深部静脈血栓症、脳卒中、心筋梗塞、不安定狭心症、血栓塞栓症、肺塞栓症、血栓溶解性疾患、急性動脈虚血、末梢血栓性閉塞、冠動脈疾患、または再灌流傷害である。いくつかの実施形態では、ＰＩ３Ｋα媒介障害は、糖尿病性網膜症や高気圧酸素誘発性網膜症などの網膜症、及び緑内障などの眼内圧の上昇や眼房水の分泌を特徴とする病気である。

【０６３１】

投与経路及び剤形

本開示の方法による化合物及び組成物は、疾患（例えば、増殖性障害）の治療または重症度の軽減に有効な任意の量及び任意の投与経路を使用して、投与され得る。必要とされる正確な量は、対象の種、年齢、及び全身状態、感染症の重症度、特定の剤、その投与様式などに応じて、対象ごとに変わり得る。本開示の化合物は、好ましくは、投与の容易性及び投与量の均一性のために、単位剤形で製剤化される。本明細書で使用される「単位剤形」という表現は、治療される患者に適した、物理的に別個の剤の単位を指す。しかしながら、本開示の化合物及び組成物の１日の総使用量は、適切な医学的判断の範囲内で、主治医によって決定され得ることが理解されるであろう。任意の特定の患者または生物に対

する具体的な有効用量レベルは、治療される障害及び障害の重症度、採用される具体的な化合物の活性；採用される具体的な組成物；患者の年齢、体重、全般的な健康状態、性別、及び食生活；採用される具体的な化合物の投与時間、投与経路、及び排泄速度；治療の期間；採用される具体的な化合物と組み合わせてまたは同時に使用される薬物；ならびに医学分野で周知の同様の因子を含むさまざまな因子に応じて決定される。

【０６３２】

本開示の薬学的に許容される組成物は、ヒト及び他の動物に、経口、経直腸、非経口、槽内、経膣、腹腔内、局所（散剤、軟膏剤、または滴剤による）、頬側、経口スプレーまたは鼻腔スプレーなどとして投与することができる。ある特定の実施形態において、本開示の化合物は、所望の治療効果を得るために、対象の体重に対して１日あたり約０．０１ｍｇ／ｋｇ～約５０ｍｇ／ｋｇ、好ましくは約１ｍｇ／ｋｇ～約２５ｍｇ／ｋｇの投与量レベルで、１日１回以上、経口または非経口で投与され得る。

【０６３３】

経口投与用の液体製剤には、薬学的に許容されるエマルジョン、マイクロエマルジョン、液剤、懸濁剤、シロップ剤、及びエリキシル剤が含まれるが、これらに限定されない。活性化合物に加えて、液体剤形は、例えば、水または他の溶媒等の当該技術分野で一般的に使用される不活性希釈剤、エチルアルコール、イソプロピルアルコール、炭酸エチル、酢酸エチル、ベンジルアルコール、安息香酸ベンジル、プロピレングリコール、１，３－ブチレングリコール、ジメチルホルムアミド、油（特に、綿実油、ピーナッツ油、トウモロコシ油、胚芽油、オリーブ油、ヒマシ油、及びゴマ油）、グリセロール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ポリエチレングリコール、及びソルビタンの脂肪酸エステル、ならびにそれらの混合物等の可溶化剤及び乳化剤を含有してもよい。不活性希釈剤の他に、経口組成物はまた、湿潤剤、乳化剤及び懸濁化剤、甘味剤、香味剤、ならびに芳香剤等のアジュバントも含むことができる。

【０６３４】

注射用調製物、例えば、滅菌された注射用の水性または油性懸濁液が、好適な分散剤または湿潤剤及び懸濁化剤を使用して、公知技術に従って製剤化されてもよい。滅菌注射用調製物はまた、例えば、１，３－ブタンジオール中の溶液としての、無毒の非経口で許容される希釈剤または溶媒中の滅菌注射液、懸濁液または乳剤であり得る。使用され得る許容されるビヒクル及び溶媒の中には、水、リンゲル液（Ｕ．Ｓ．Ｐ．）、及び等張塩化ナトリウム液がある。加えて、溶媒または懸濁媒としては、無菌固定油が慣習的に利用されている。この目的で、合成モノまたはジグリセリドを含めた任意の無刺激性固定油が用いられてもよい。加えて、オレイン酸などの脂肪酸も注射剤の調製に使用される。

【０６３５】

注射製剤は、例えば、細菌保持フィルターに通して濾過することによって、または使用前に滅菌水もしくは他の無菌注射用媒体中に溶解もしくは分散することができる無菌固形組成物の形態で無菌剤を組み込むことによって無菌化することができる。

【０６３６】

本開示の化合物の効果を延長するために、多くの場合、皮下注射または筋肉注射からの化合物の吸収を遅くすることが望ましい。これは、水溶性の低い結晶性または非晶質物質の液体懸濁液を使用することによって達成することができる。すると、化合物の吸収速度はその溶解速度に依存し、溶解速度が今度は結晶サイズ及び結晶形態に依存し得る。代替として、非経口投与された化合物形態の吸収遅延は、化合物を油性ビヒクル中に溶解または懸濁させることによって遂行される。注射用デポー形態は、ポリラクチド－ポリグリコリド等の生分解性ポリマー中で化合物のマイクロカプセル化マトリックスを形成させることによって作製される。化合物対ポリマーの比、及び用いられる特定のポリマーの性質に応じて、化合物の放出速度が制御され得る。他の生分解性ポリマーの例としては、ポリ（オルトエステル）及びポリ（無水物）が挙げられる。注射用デポー製剤は、体内組織に適合するリポソームまたはマイクロエマルジョン中に薬物を封入することによっても調製される。

【０６３７】
直腸投与用または膣投与用の組成物は、好ましくは、坐剤であり、本開示の化合物を、カカオ脂、ポリエチレングリコールまたは坐剤ワックスなどの好適な非刺激性の賦形剤または担体と混合することによって調製することができ、これは、周囲温度では固体であるが、体温では液体であり、したがって、直腸腔内または膣腔内で溶融して活性化合物を放出するものである。
【０６３８】
経口投与用の固形剤形には、カプセル剤、錠剤、丸剤、散剤、及び顆粒剤が含まれる。そのような固体剤形では、活性化合物は、クエン酸ナトリウムまたはリン酸二カルシウムなどの少なくとも１つの不活性な薬学的に許容される賦形剤または担体、及び／またはａ）デンプン、ラクトース、スクロース、グルコース、マンニトール、及びケイ酸などの充填剤または増量剤、ｂ）例えば、カルボキシメチルセルロース、アルギン酸塩、ゼラチン、ポリビニルピロリドン、スクロース、及びアカシアなどの結合剤、ｃ）グリセロールなどの湿潤剤、ｄ）寒天、炭酸カルシウム、ジャガイモデンプンまたはタピオカデンプンなどの崩壊剤、ｅ）パラフィンなどの溶液遅延剤、ｆ）第４級アンモニウム化合物などの吸収促進剤、ｇ）例えば、セチルアルコール及びモノステアリン酸グリセロールなどの湿潤剤、ｈ）カオリン及びベントナイト粘土などの吸収剤、ならびにｉ）タルク、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム、固形ポリエチレングリコール、ラウリル硫酸ナトリウム、及びこれらの混合物などの滑沢剤、と混合される。カプセル剤、錠剤、及び丸剤の場合、剤形はまた、緩衝剤を含み得る。
【０６３９】
類似の種類の固体組成物がまた、ラクトースすなわち乳糖等の賦形剤、ならびに高分子量ポリエチレングリコール等を使用した、軟質充填及び硬質充填ゼラチンカプセルにおける充填剤として用いられてもよい。錠剤、糖衣錠、カプセル剤、丸剤、及び顆粒剤の固体剤形は、腸溶性コーティング及び医薬製剤学分野で周知の他のコーティング等のコーティング及び外殻により調製され得る。それらは、任意選択で、乳白剤を含有してもよく、また、それらが活性成分（複数可）を腸管のある特定の部分でのみ、またはその部分で優先的に、任意選択で遅延した様態で、放出する組成物のものであり得る。使用され得る埋め込み用組成物の例としては、ポリマー物質及びワックスが挙げられる。類似の種類の固体組成物がまた、ラクトースすなわち乳糖等の賦形剤、ならびに高分子量ポリエチレングリコール等を使用した、軟質充填及び硬質充填ゼラチンカプセルにおける充填剤として用いられてもよい。
【０６４０】
活性化合物は、上述のように、１つ以上の賦形剤とともにマイクロカプセル化された形態とすることもできる。錠剤、糖衣剤、カプセル剤、丸剤、及び顆粒剤の固形剤形は、腸溶性コーティング、放出制御コーティング及び製剤分野でよく知られている他のコーティングなどのコーティング及びシェルを用いて調製することができる。そのような固形剤形において、活性化合物は、スクロース、ラクトース、デンプンなどの少なくとも１つの不活性希釈剤と混和され得る。そのような剤形は、通常行われているように、不活性希釈剤以外の追加の物質、例えば、ステアリン酸マグネシウム及び微結晶セルロースなどの打錠用滑沢剤及び他の打錠補助剤も含み得る。カプセル剤、錠剤、及び丸剤の場合、剤形はまた、緩衝剤を含んでもよい。それらは、任意選択で、乳白剤を含有してもよく、また、それらが活性成分（複数可）を腸管のある特定の部分でのみ、またはその部分で優先的に、任意選択で遅延した様態で、放出する組成物のものであり得る。使用され得る埋め込み用組成物の例としては、ポリマー物質及びワックスが挙げられる。
【０６４１】
本開示の化合物の局所投与用または経皮投与用の剤形には、軟膏剤、パスタ剤、クリーム剤、ローション剤、ゲル剤、散剤、液剤、スプレー剤、吸入剤または貼付剤が含まれる。活性成分は、無菌条件下で、薬学的に許容される担体及び必要とされ得る任意の必要な保存剤または緩衝剤と混和される。眼科用製剤、点耳薬、及び点眼薬もまた本開示の範囲

内であることが企図される。したがって、本開示は、身体への化合物の制御送達を提供するさらなる利点を有する経皮パッチの使用を企図する。そのような剤形は、化合物を適切な媒体に溶解または分散させることによって作製することができる。皮膚を横断した化合物の流れを増加させるために吸収向上剤もまた使用することができる。速度は、速度制御膜を提供することによって、またはポリマーマトリックスもしくはゲル中に化合物を分散させることによって制御することができる。

【０６４２】

投与量及びレジメン

本開示の方法によれば、本開示の化合物は、例えば、対象における障害の症状を軽減または改善するために、治療有効量で対象に投与される。この量は、インビボで確立された滴定曲線の分析及び本明細書に開示された方法及びアッセイを含む既知の手順に基づいて、当業者によって容易に決定される。

【０６４３】

いくつかの実施形態では、この方法は、治療有効量の本開示の化合物の投与を含む。いくつかの実施形態において、治療有効量は、少なくとも約０．０００１ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約０．００１ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約０．０１ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約０．０５ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約０．１ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約０．２５ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約０．３ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約０．５ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約０．７５ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約１ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約２ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約３ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約４ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約５ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約６ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約７ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約８ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約９ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約１０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約１５ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約２０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約２５ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約３０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約４０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約５０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約７５ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約１００ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約２００ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約２５０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約３００ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約３５０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約４００ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約４５０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約５００ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約５５０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約６００ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約６５０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約７００ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約７５０ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約８００ｍｇ／ｋｇ体重、少なくとも約９００ｍｇ／ｋｇ体重、または少なくとも約１０００ｍｇ／ｋｇ体重である。本明細書に列挙される投与量のいずれも上限または下限の投与量範囲を構成し得、任意の他の投与量と組み合わせて上限及び下限を含む投与量範囲を構成し得ることが認識されよう。

【０６４４】

いくつかの実施形態において、治療有効量は、約０．１ｍｇ～約１０ｍｇ／ｋｇ体重、約０．１ｍｇ～約６ｍｇ／ｋｇ体重、約０．１ｍｇ～約４ｍｇ／ｋｇ体重、または約０．１ｍｇ～約２ｍｇ／ｋｇ体重の範囲である。

【０６４５】

いくつかの実施形態において、治療有効量は、約１～５００ｍｇ、約２～１５０ｍｇ、約２～１２０ｍｇ、約２～８０ｍｇ、約２～４０ｍｇ、約５～１５０ｍｇ、約５～１２０ｍｇ、約５～８０ｍｇ、約１０～１５０ｍｇ、約１０～１２０ｍｇ、約１０～８０ｍｇ、約１０～４０ｍｇ、約２０～１５０ｍｇ、約２０～１２０ｍｇ、約２０～８０ｍｇ、約２０～４０ｍｇ、約４０～１５０ｍｇ、約４０～１２０ｍｇまたは約４０～８０ｍｇの範囲である。

【０６４６】

いくつかの実施形態において、方法は、単回の投与量または投与（例えば、単回の注射または沈殿として）を含む。あるいは、いくつかの実施形態では、この方法は、治療を必要とする対象に、約２～約２８日間、または約７～約１０日間、または約７～約１５日間

、またはそれ以上の期間、１日１回、１日２回、１日３回、または１日４回投与することを含む。いくつかの実施形態において、方法は、慢性投与を含む。さらに他の実施形態において、方法は、数週間、数ヶ月、数年、または数十年にわたる投与を含む。さらに他の実施形態において、方法は、数週間にわたる投与を含む。さらに別の実施形態では、この方法は、数ヶ月にわたる投与を含む。さらに別の実施形態では、この方法は、数年間にわたる投与を含む。さらに別の実施形態では、この方法は、数十年にわたる投与を含む。

【０６４７】

投与量は、有効成分の薬力学的特性とその投与方法及び投与経路、有効成分の投与時間、レシピエントの年齢、性別、健康状態、体重、症状の性質と程度、同時治療の種類、治療の頻度及び所望の効果、排泄率などの既知の要因に応じて変わり得る。これらは全て容易に決定され、当業者であれば、投与量及び／または投与レジメンを調整または滴定するために使用され得る。

【０６４８】

プロテインキナーゼの阻害

一実施形態によれば、本開示は、生体試料におけるプロテインキナーゼ活性を阻害する方法であって、当該生体試料を本開示の化合物または当該化合物を含む組成物と接触させるステップを含む、方法に関する。別の実施形態によれば、本開示は、生体試料におけるＰＩ３Ｋまたはその変異体の活性を阻害する方法であって、当該生体試料を本開示の化合物または当該化合物を含む組成物と接触させるステップを含む、方法に関する。別の実施形態によれば、本開示は、生体試料におけるＰＩ３Ｋαまたはその変異体の活性を阻害する方法であって、当該生体試料を本開示の化合物または当該化合物を含む組成物と接触させるステップを含む、方法に関する。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、変異型ＰＩ３Ｋαである。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有する。

【０６４９】

別の実施形態において、本開示は、ＰＩ３Ｋδ及びＰＩ３Ｋγの一方または両方よりもＰＩ３Ｋαを選択的に阻害する方法を提供する。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、ＰＩ３Ｋδ及びＰＩ３Ｋγよりも５倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、ＰＩ３Ｋδ及びＰＩ３Ｋγよりも１０倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、ＰＩ３Ｋδ及びＰＩ３Ｋγよりも５０倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、ＰＩ３Ｋδ及びＰＩ３Ｋγよりも１００倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、ＰＩ３Ｋδ及びＰＩ３Ｋγよりも２００倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、変異型ＰＩ３Ｋαである。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有する。

【０６５０】

別の実施形態において、本開示は、野生型ＰＩ３Ｋａよりも変異型ＰＩ３Ｋαを選択的に阻害する方法を提供する。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、野生型ＰＩ３Ｋａよりも変異型ＰＩ３Ｋαに対して５倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、野生型ＰＩ３Ｋａよりも変異型ＰＩ３Ｋαに対して１０倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、野生型ＰＩ３Ｋａよりも変異型ＰＩ３Ｋαに対して５０倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、野生型ＰＩ３Ｋａよりも変異型ＰＩ３Ｋαに対して１００倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、本開示の化合物は、野生型ＰＩ３Ｋａよりも変異型ＰＩ３Ｋαに対して２００倍を超えて選択的である。いくつかの実施形態において、変異型ＰＩ３Ｋαは、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有する。

【０６５１】

「生体試料」という用語は、本明細書で使用される場合、限定するものではないが、細

胞培養物またはその抽出物；哺乳動物またはその抽出物から得られた生検材料；及び血液、唾液、尿、糞便、精液、涙液、もしくは他の体液またはその抽出物を含む。

【０６５２】

生体試料におけるＰＩ３Ｋ（例えば、ＰＩ３Ｋαまたはその変異体）の活性の阻害は、当業者に知られているさまざまな目的に有用である。そのような目的の例としては、輸血、臓器移植、生物学的検体の保存、及び生物学的アッセイが挙げられるが、これらに限定されない。

【０６５３】

本開示の別の実施形態は、患者におけるプロテインキナーゼ活性を阻害する方法であって、当該患者に本開示の化合物または当該化合物を含む組成物を投与するステップを含む、方法に関する。

【０６５４】

別の実施形態によれば、本開示は、患者におけるＰＩ３Ｋまたはその変異体の活性を阻害する方法であって、当該患者に本開示の化合物または当該化合物を含む組成物を投与するステップを含む、方法に関する。いくつかの実施形態において、本開示は、患者におけるＰＩ３Ｋαまたはその変異体の活性を阻害する方法であって、当該患者に本開示の化合物または当該化合物を含む組成物を投与するステップを含む、方法に関する。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、変異型ＰＩ３Ｋαである。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有する。

【０６５５】

別の実施形態によれば、本開示は、ＰＩ３Ｋまたはその変異体によって媒介される障害を治療することを、それを必要とする患者において行うための方法であって、当該患者に本開示による化合物またはその薬学的に許容される組成物を投与するステップを含む、方法を提供する。いくつかの実施形態において、本開示は、ＰＩ３Ｋαまたはその変異体によって媒介される障害を治療することを、それを必要とする患者において行うための方法であって、当該患者に本開示による化合物またはその薬学的に許容される組成物を投与するステップを含む、方法を提供する。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、変異型ＰＩ３Ｋαである。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有する。

【０６５６】

別の実施形態によれば、本開示は、対象におけるＰＩ３Ｋαまたはその変異体のシグナル伝達活性を阻害する方法であって、治療上有効な量の本開示による化合物またはその薬学的に許容される組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、方法を提供する。いくつかの実施形態において、本開示は、対象におけるＰＩ３Ｋαシグナル伝達活性を阻害する方法であって、治療上有効な量の本開示による化合物またはその薬学的に許容される組成物を、それを必要とする対象に投与することを含む、方法を提供する。いくつかの実施形態において、ＰＩ３Ｋαは、変異型ＰＩ３Ｋαである。いくつかの実施形態では、ＰＩ３Ｋαは、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋの変異のうちの少なくとも１つを含有する。いくつかの実施形態では、対象は、変異型ＰＩ３Ｋαを有する。いくつかの実施形態において、対象は、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋのうちの少なくとも１つの変異を含有するＰＩ３Ｋαを有する。

【０６５７】

本明細書に記載される化合物はまた、ＰＩ３Ｋαの破壊を触媒する剤に組み込むことによってＰＩ３Ｋαの機能を阻害することができる。例えば、化合物は、タンパク質分解ターゲティングキメラ（ＰＲＯＴＡＣ）に組み込むことができる。ＰＲＯＴＡＣは、二機能性分子であり、一部は、Ｅ３ユビキチンリガーゼに結合することができ、もう一方の部分は、細胞タンパク質の品質管理機構による分解を目的としたターゲットタンパク質に結合する能力を持っている。標的タンパク質が特定のＥ３リガーゼに動員されると、破壊のためのタグ付け（すなわち、ユビキチン化）が行われ、その後、プロテアソームによって分

解される。任意のＥ３リガーゼが使用され得る。Ｅ３リガーゼに結合するＰＲＯＴＡＣの一部は、原子の可変鎖からなるリンカーを介して、ターゲットタンパク質に結合するＰＲＯＴＡＣの一部に接続される。したがって、Ｅ３リガーゼへのＰＩ３Ｋαのリクルートは、ＰＩ３Ｋαタンパク質の破壊をもたらす。可変原子鎖は、例えば、環、ヘテロ原子、及び／または繰り返しポリマー単位を含み得る。柔軟性のないものでも柔軟のあるものでもよい。それは、有機合成の分野における標準的な技術を使用して、上記の２つの部分に結合することができる。

【０６５８】

併用療法

治療される特定の障害、状態、または疾患に応じて、その状態を治療するために通常投与される追加の治療剤を本開示の化合物及び組成物と組み合わせて投与することができる。本明細書で使用される場合、特定の疾患または状態を治療するために通常投与される追加の治療剤は、「治療される疾患または状態に適切である」ことが知られている。

【０６５９】

さらに、ＰＩ３Ｋは、並行するシグナル伝達経路を統合するセカンドメッセンジャーノードとして機能しており、ＰＩ３Ｋ阻害剤と他の経路の阻害剤の組み合わせががん及び細胞増殖性疾患の治療に有用であるという証拠も出てきている。

【０６６０】

したがって、ある特定の実施形態において、治療方法は、本開示の化合物または組成物を１つ以上の追加の治療剤と組み合わせて投与することを含む。ある特定の他の実施形態において、治療方法は、本開示の化合物または組成物を唯一の治療剤として投与することを含む。

【０６６１】

およそ２０～３０％のヒト乳癌が、トラスツズマブ薬物の標的であるＨｅｒ－２／ｎｅｕ－ＥｒｂＢ２を過剰発現している。トラスツズマブは、Ｈｅｒ２／ｎｅｕ－ＥｒｂＢ２を発現する一部の患者において持続的な反応を示すが、これらの患者のサブセットのみが反応する。最近の研究では、この限られた奏効率は、トラスツズマブとＰＩ３ＫまたはＰＩ１３Ｋ／ＡＫＴ経路の阻害剤との組み合わせによって大幅に改善できることが示されている（Ｃｈａｎ ｅｔ ａｌ．，Ｂｒｅａｓｔ Ｃａｎ．Ｒｅｓ．Ｔｒｅａｔ．９１：１８７（２００５），Ｗｏｏｄｓ Ｉｇｎａｔｏｓｋｉ ｅｔ ａｌ．，Ｂｒｉｔ．Ｊ．Ｃａｎｃｅｒ ８２：６６６（２０００），Ｎａｇａｔａ ｅｔ ａｌ．，Ｃａｎｃｅｒ Ｃｅｌｌ ６：１１７（２００４））。したがって、ある特定の実施形態において、治療方法は、本開示の化合物または組成物をトラスツズマブと組み合わせて投与することを含む。ある特定の実施形態において、がんは、Ｈｅｒ－２／ｎｅｕ－ＥｒｂＢ２を過剰発現するヒト乳癌である。

【０６６２】

さまざまなヒト悪性腫瘍は、Ｈｅｒ１／ＥＧＦＲの活性化変異またはレベルの増加を発現しており、この受容体チロシンキナーゼに対して、タルセバ、ゲフィチニブ、アービタックスなどの多くの抗体及び小分子阻害剤が開発されている。しかしながら、ＥＧＦＲ阻害剤は、特定のヒト腫瘍（例えば、ＮＳＣＬＣ）において抗腫瘍活性を示すものの、ＥＧＦＲ発現腫瘍を有する全ての患者において、患者の全生存期間を延ばすことはできない。これは、ＰＩ３Ｋ／Ａｋｔ経路を含むさまざまな悪性腫瘍において、Ｈｅｒ１／ＥＧＦＲの多くの下流ターゲットが高頻度で変異または調節解除されるという事実によって正当化される可能性がある。

【０６６３】

例えば、ゲフィチニブは、ｉｎ ｖｉｔｒｏアッセイで腺癌細胞株の増殖を阻害する。それにもかかわらず、ＰＩ３／Ａｋｔ経路の活性化の増加を示すゲフィチニブに耐性のあるこれらの細胞株のサブクローンを選択することができる。この経路の下方制御または阻害により、耐性サブクローンがゲフィチニブに対して感受性になる（Ｋｏｋｕｂｏ ｅｔ ａｌ．，Ｂｒｉｔ．Ｊ．Ｃａｎｃｅｒ ９２：１７１１（２００５））。さらに、ＰＴＥ

Ｎ変異を有し、ＥＧＦＲを過剰発現する細胞株を用いた乳癌のｉｎ　ｖｉｔｒｏモデルでは、ＰＩ３Ｋ／Ａｋｔ経路及びＥＧＦＲの両方を阻害することにより、相乗効果が得られた（Ｓｈｅ　ｅｔ　ａｌ．，Ｃａｎｃｅｒ　Ｃｅｌｌ　８：２８７－２９７（２００５））。これらの結果は、ゲフィチニブとＰＩ３Ｋ／Ａｋｔ経路阻害剤の組み合わせが、がんにおける魅力的な治療戦略となることを示している。

【０６６４】

したがって、ある特定の実施形態において、治療方法は、本開示の化合物または組成物をＨｅｒ１／ＥＧＦＲの阻害物と組み合わせて投与することを含む。ある特定の実施形態において、治療方法は、本開示の化合物または組成物をタルセバ、ゲフィチニブ、及びアービタックスのうちの１つ以上と組み合わせて投与することを含む。ある特定の実施形態において、治療方法は、本開示の化合物または組成物をゲフィチニブと組み合わせて投与することを含む。ある特定の実施形態において、がんは、Ｈｅｒ１／ＥＧＦＲの活性化変異またはレベルの増加を発現する。

【０６６５】

ＡＥＥ７７８（Ｈｅｒ－２／ｎｅｕ／ＥｒｂＢ２、ＶＥＧＦＲ、ＥＧＦＲ　の阻害剤）とＲＡＤ００１（Ａｋｔ　の下流ターゲットであるｍＴＯＲの阻害剤）の組み合わせは、神経膠芽腫異種移植モデルにおいていずれかの薬剤を単独で使用した場合よりも優れた複合効果を生み出した（Ｇｏｕｄａｒ　ｅｔ　ａｌ．，Ｍｏｌ．Ｃａｎｃｅｒ．Ｔｈｅｒ．４：１０１－１１２（２００５））。

【０６６６】

タモキシフェンなどの抗エストロゲンは、細胞周期阻害剤ｐ２７Ｋｉｐの作用を必要とする細胞周期停止の誘導を通じて乳癌の増殖を阻害する。最近、Ｒａｓ－Ｒａｆ－ＭＡＰキナーゼ経路の活性化によってｐ２７Ｋｉｐのリン酸化状態が変化し、細胞周期の停止における阻害活性が弱められ、それによって抗エストロゲン耐性に寄与することが示された（Ｄｏｎｏｖａｎ，　ｅｔ　ａｌ，Ｊ．Ｂｉｏｌ．Ｃｈｅｍ．２７６：４０８８８，（２００１））。Ｄｏｎｏｖａｎ　ｅｔ　ａｌ．によって報告されているように、ＭＥＫ阻害剤による治療によってＭＡＰＫシグナル伝達を阻害すると、ホルモン不応性乳癌細胞株におけるｐ２７の異常なリン酸化状態が逆転し、ホルモン感受性が回復した。同様に、Ａｉｄによるｐ２７Ｋｉｐのリン酸化も、細胞周期を停止させるその役割を無効とする（Ｖｉｇｌｉｅｔｔｏ　ｅｔ　ａｌ．，Ｎａｔ．Ｍｅｄ．８：１１４５（２００２））。

【０６６７】

したがって、ある特定の実施形態において、治療方法は、本開示の化合物または組成物をホルモン依存性癌の治療と組み合わせて投与することを含む。ある特定の実施形態において、治療方法は、本開示の化合物または組成物をタモキシフェンと組み合わせて投与することを含む。ある特定の実施形態において、がんは、乳癌及び前立腺癌などのホルモン依存性癌である。この使用により、従来の抗がん剤でこれらのがんによく見られるホルモン抵抗性を逆転させることを目的としている。

【０６６８】

慢性骨髄性白血病（ＣＭＬ）などの血液癌では、構成的に活性化されたＢＣＲ－Ａｂｌチロシンキナーゼの染色体転座が原因となる。罹患患者は、Ａｂｌキナーゼ活性の阻害の結果として、小分子チロシンキナーゼ阻害剤であるイマチニブに反応する。しかし、進行期の疾患を有する多くの患者は、最初はイマチニブに反応するが、Ａｂｌキナーゼドメインの耐性を与える変異により、後に再発する。ｉｎ　ｖｉｔｒｏ研究では、ＢＣＲ－Ａｂ１がＲａｓ－Ｒａｆキナーゼ経路を利用してその作用を引き出すことが示されている。加えて、同じ経路の複数のキナーゼを阻害することで、耐性を与える変異に対するさらなる保護がもたらされる。

【０６６９】

したがって、別の態様において、本開示の化合物及び組成物は、慢性骨髄性白血病（ＣＭＬ）などの血液癌の治療において、イマチニブなどのキナーゼ阻害剤の群から選択される少なくとも１つの追加の剤と組み合わせて使用される。この使用により、当該少なくと

も１つの追加の剤に対する耐性を逆転または予防することを目的とする。
【０６７０】
ＰＩ３Ｋ／Ａｋｔ経路の活性化は細胞の生存を促進するため、放射線療法や化学療法など、癌細胞のアポトーシスを促進する治療法と組み合わせてこの経路を阻害すると、反応が改善される（Ｇｈｏｂｒｉａｌ ｅｔ ａｌ．，ＣＡ Ｃａｎｃｅｒ Ｊ．Ｃｌｉｎ ５５：１７８－１９４（２００５））。一例として、ＰＩ３キナーゼ阻害剤とカルボプラチンの組み合わせは、ｉｎ ｖｉｔｒｏ増殖とアポトーシスアッセイの両方において、また卵巣癌の異種移植モデルにおけるｉｎ ｖｉｖｏ腫瘍有効性において、相乗効果を示した（Ｗｅｓｔｆａｌｌ ａｎｄ Ｓｋｉｎｎｅｒ，Ｍｏｌ．Ｃａｎｃｅｒ Ｔｈｅｒ．４：１７６４－１７７１（２００５））。
【０６７１】
いくつかの実施形態では、１つ以上の追加の治療剤は、抗体、抗体薬物複合体、キナーゼ阻害剤、免疫調節剤及びヒストンデアセチラーゼ阻害剤から選択される。ＰＩＫ３ＣＡ阻害剤と他の治療剤の相乗的な組み合わせは、例えば、Ｃａｓｔｅｌ ｅｔ ａｌ．，Ｍｏｌ．Ｃｅｌｌ Ｏｎｃｏｌ．（２０１４）１（３） ｅ９６３４４７に記載されている。
【０６７２】
いくつかの実施形態において、１つ以上の追加の治療剤は、次の剤またはその薬学的に許容される塩から選択される：ＢＣＲ－ＡＢＬ阻害剤（例えば、Ｕｌｔｉｍｏ ｅｔ ａｌ．Ｏｎｃｏｔａｒｇｅｔ（２０１７）８（１４）２３２１３－２３２２７参照）：例えば、イマチニブ、イニロチニブ、ニロチニブ、ダサチニブ、ボスチニブ、ポナチニブ、バフェチニブ、ダヌセルチブ、サラカチニブ、ＰＦ０３８１４７３５；ＡＬＫ阻害剤（例えば、Ｙａｎｇ ｅｔ ａｌ．Ｔｕｍｏｕｒ Ｂｉｏｌ．（２０１４）３５（１０）９７５９－６７参照）：例えば、クリゾチニブ、ＮＶＰ－ＴＡＥ６８４、セリチニブ、アレクチニブ、ブリガチニブ、エントレチニブ、ロルラチニブ；ＢＲＡＦ阻害剤（例えば、Ｓｉｌｖａ ｅｔ ａｌ．Ｍｏｌ．Ｃａｎｃｅｒ Ｒｅｓ．（２０１４）１２，４４７－４６３参照）：例えば、ベムラフェニブ、ダブラフェニブ；ＦＧＦＲ阻害剤（例えば、Ｐａｃｋｅｒ ｅｔ ａｌ．Ｍｏｌ．Ｃａｎｃｅｒ Ｔｈｅｒ．（２０１７）１６（４）６３７－６４８参照）：例えば、インフィグラチニブ、ドビチニブ、エルダフィチニブ、ＴＡＳ－１２０、ペミガチニブ、ＢＬＵ－５５４、ＡＺＤ４５４７；ＦＬＴ３阻害剤：例えば、スニチニブ、ミドスタウリン、タヌチニブ、ソラフェニブ、レスタウルチニブ、キザルチニブ、及びクレノラニブ；ＭＥＫ阻害剤（例えば、Ｊｏｋｉｎｅｎ ｅｔ ａｌ．Ｔｈｅｒ．Ａｄｖ．Ｍｅｄ．Ｏｎｃｏｌ．（２０１５）７（３）１７０－１８０参照）：例えば、トラメチニブ、コビメチニブ、ビニメチニブ、セルメチニブ；ＥＲＫ阻害剤：例えば、ウリキセルチニブ、ＭＫ ８３５３、ＬＹ ３２１４９９６；ＫＲＡＳ阻害剤：例えば、ＡＭＧ－５１０、ＭＲＴＸ８４９、ＡＲＳ－３２４８；チロシンキナーゼ阻害剤（例えば、Ｍａｋｈｏｖ ｅｔ ａｌ．Ｍｏｌ．Ｃａｎｃｅｒ．Ｔｈｅｒ．（２０１２）１１（７）１５１０－１５１７参照）：例えば、エルロチニブ、リニファニブ、スニチニブ、パゾパニブ；上皮成長因子受容体（ＥＧＦＲ）阻害剤（例えば、Ｓｈｅ ｅｔ ａｌ．ＢＭＣ Ｃａｎｃｅｒ（２０１６）１６，５８７参照）：ゲフィチニブ、オシメルチニブ、セツキシマブ、パニツムマブ；ＨＥＲ２受容体阻害剤（例えば、Ｌｏｐｅｚ ｅｔ ａｌ．Ｍｏｌ．Ｃａｎｃｅｒ Ｔｈｅｒ．（２０１５）１４（１１）２５１９－２５２６参照）：例えば、トラスツズマブ、ペルツズマブ、ネラチニブ、ラパチニブ、ラパチニブ；ＭＥＴ阻害剤（例えば、Ｈｅｒｖｉｅｕ ｅｔ ａｌ．Ｆｒｏｎｔ．Ｍｏｌ．Ｂｉｏｓｃｉ．（２０１８）５，８６）：例えば、クリゾチニブ、カボザンチニブ；ＣＤ２０抗体：例えば、リツキシマブ、トシツモマブ、オファツムマブ；ＤＮＡ合成阻害剤：例えば、カペシタビン、ゲムシタビン、ネララビン、ヒドロキシカルバミド；抗腫瘍剤（例えば、Ｗａｎｇ ｅｔ ａｌ．Ｃｅｌｌ Ｄｅａｔｈ＆Ｄｉｓｅａｓｅ（２０１８）９，７３９参照）：例えば、オキサリプラチン、カルボプラチン、シスプラチン；免疫調節剤：例えば、アフツズマブ、レナリドミド、サリドマイド、ポマリドミド；ＣＤ４０阻害剤：例えば、ダセツズマブ；アポトーシス促進性受容体アゴニスト（ＰＡＲＡ）：例えば、デュラネルミン；

熱ショックタンパク質（ＨＳＰ）阻害剤（例えば、Ｃｈｅｎ　ｅｔ　ａｌ．Ｏｎｃｏｔａｒｇｅｔ（２０１４）５（９）．２３７２－２３８９参照）：例えば、タネスピマイシン；ヘッジホッグアンタゴニスト（例えば、Ｃｈａｔｕｒｖｅｄｉ　ｅｔ　ａｌ．Ｏｎｃｏｔａｒｇｅｔ（２０１８）９（２４），１６６１９－１６６３３参照）：例えば、ビスモデギブ；プロテアソーム阻害剤（例えば、Ｌｉｎ　ｅｔ　ａｌ．Ｉｎｔ．Ｊ．Ｏｎｃｏｌ．（２０１４）４４（２），５５７－５６２参照）：例えば、ボルテゾミブ；ＰＩ３Ｋ阻害剤：例えば、ピクチリシブ、ダクトリシブ、アルペリシブ、ブパルリシブ、タセリシブ、イデラリシブ、デュベリシブ、ウムブラリシブ；ＳＨＰ２阻害剤（例えば、Ｓｕｎ　ｅｔ　ａｌ．Ａｍ．Ｊ．Ｃａｎｃｅｒ　Ｒｅｓ．（２０１９）９（１），１４９－１５９：例えば、ＳＨＰ０９９、ＲＭＣ－４５５０、ＲＭＣ－４６３０参照）；ＢＣＬ－２阻害剤（例えば、Ｂｏｊａｒｃｚｕｋ　ｅｔ　ａｌ．Ｂｌｏｏｄ（２０１８）１３３（１），７０－８０参照）：例えば、ベネトクラクス；アロマターゼ阻害剤（例えば、Ｍａｙｅｒ　ｅｔ　ａｌ．Ｃｌｉｎ．Ｃａｎｃｅｒ　Ｒｅｓ．（２０１９）２５（１０），２９７５－２９８７参照）：エキセメスタン、レトロゾール、アナストロゾール、フルベストラント、タモキシフェン；ｍＴＯＲ阻害剤（例えば、Ｗｏｏ　ｅｔ　ａｌ．Ｏｎｃｏｇｅｎｅｓｉｓ（２０１７）６，ｅ３８５参照）：例えば、テムシロリムス、リダホロリムス、エベロリムス、シロリムス；ＣＴＬＡ－４阻害剤（例えば、Ｏ’Ｄｏｎｎｅｌｌ　ｅｔ　ａｌ．（２０１８）４８，９１－１０３参照）：例えば、トレメリムマブ、イピリムマブ；ＰＤ１阻害剤（Ｏ’Ｄｏｎｎｅｌｌ、上掲参照）：例えば、ニボルマブ、ペムブロリズマブ；イムノアドヘシン；他の免疫チェックポイント阻害剤（例えば、Ｚａｐｐａｓｏｄｉ　ｅｔ　ａｌ．Ｃａｎｃｅｒ　Ｃｅｌｌ（２０１８）３３，５８１－５９８参照（ここで、「免疫チェックポイント」という用語は、ＣＤ４及びＣＤ８　Ｔ細胞の細胞表面上の分子群を指す）。免疫チェックポイント分子には、プログラム死１（ＰＤ－１）、細胞傷害性Ｔリンパ球抗原４（ＣＴＬＡ－４）、Ｂ７Ｈ１、Ｂ７Ｈ４、ＯＸ－４０、ＣＤ１３７、ＣＤ４０、及びＬＡＧ３が含まれるが、これらに限定されない。本開示の方法に有用な免疫チェックポイント阻害剤として作用することができる免疫療法剤には、ＰＤ－Ｌ１、ＰＤ－Ｌ２、ＣＴＬＡ４、ＴＩＭ３、ＬＡＧ３、ＶＩＳＴＡ、ＢＴＬＡ、ＴＩＧＩＴ、ＬＡＩＲ１、ＣＤ　１６０、２Ｂ４及び／またはＴＧＦＲベータの阻害剤）：例えば、ピジリズマブ、ＡＭＰ－２２４；ＰＤＬ１阻害剤（例えば、Ｏ’Ｄｏｎｎｅｌｌ上掲参照）：例えば、ＭＳＢ００１０７１８Ｃ；ＹＷ２４３．５５．Ｓ７０、ＭＰＤＬ３２８０Ａ；ＭＥＤＩ－４７３６、ＭＳＢ－００１０７１８Ｃ、またはＭＤＸ－１１０５；ヒストン脱アセチル化酵素阻害剤（ＨＤＩ、例えば、Ｒａｈｍａｎｉ　ｅｔ　ａｌ．Ｃｌｉｎ．Ｃａｎｃｅｒ　Ｒｅｓ．（２０１４）２０（１８），４８４９－４８６０参照）：例えば、ボリノスタット；アンドロゲン受容体阻害剤（例えば、Ｔｈｏｍａｓ　ｅｔ　ａｌ．Ｍｏｌ．Ｃａｎｃｅｒ　Ｔｈｅｒ．（２０１３）１２（１１），２３４２－２３５５参照）：例えば、エンザルタミド、アビラテロン酢酸エステル、オルテロネル、ガレテロン、セビトロネル、ビカルタミド、フルタミド；アンドロゲン：例えば、フルオキシメステロン；ＣＤＫ４／６阻害剤（例えば、Ｇｕｌ　ｅｔ　ａｌ．Ａｍ．Ｊ．Ｃａｎｃｅｒ　Ｒｅｓ．（２０１８）８（１２），２３５９－２３７６参照）：例えば、アルボシジブ、パルボシクリブ、リボシクリブ、トリラシクリブ、アベマシクリブが含まれるが、これらに限定されない。

【０６７３】

いくつかの実施形態において、１つ以上の追加の治療剤は、次の剤：抗ＦＧＦＲ抗体；ＦＧＦＲ阻害剤、細胞傷害性剤；エストロゲン受容体標的療法または他の内分泌療法、免疫チェックポイント阻害剤、ＣＤＫ阻害剤、受容体型チロシンキナーゼ阻害剤、ＢＲＡＦ阻害剤、ＭＥＫ阻害剤、他のＰＩ３Ｋ阻害剤、ＳＨＰ２阻害剤、及びＳＲＣ阻害剤から選択される。（Ｋａｔｏｈ，Ｎａｔ．Ｒｅｖ．Ｃｌｉｎ．Ｏｎｃｏｌ．（２０１９），１６：１０５－１２２；Ｃｈａｅ，ｅｔ　ａｌ．Ｏｎｃｏｔａｒｇｅｔ（２０１７），８：１６０５２－１６０７４；Ｆｏｒｍｉｓａｎｏ　ｅｔ　ａｌ．，Ｎａｔ．Ｃｏｍｍ．（２０１９），１０：１３７３－１３８６；及び当該文献中で引用されている参考文献を参照されたい。）

【０６７４】
コード番号、一般名または商品名によって特定される活性化合物の構造は、標準的な要覧であるＴｈｅ　Ｍｅｒｃｋ　Ｉｎｄｅｘの現行版またはデータベース、例えば、Ｐａｔｅｎｔｓ　Ｉｎｔｅｒｎａｔｉｏｎａｌ（例えば、ＩＭＳ　Ｗｏｒｌｄ　Ｐｕｂｌｉｃａｔｉｏｎｓ）から得ることができる。
【０６７５】
本開示の化合物は、周知の治療プロセス、例えば、ホルモンの投与または放射線の実施と組み合わせて使用されてもよい。ある特定の実施形態において、提供される化合物は、放射線増感剤として使用され、特に、放射線療法に対する感受性が低い腫瘍の治療に使用される。
【０６７６】
本開示の化合物は、単独で投与することも、１つ以上の他の治療用化合物と組み合わせて投与することもでき、可能な併用療法は、本開示の化合物と１つ以上の他の治療用化合物との固定の組み合わせ、または互いに時間をずらすかもしくは独立して与えられる投与、あるいは固定の組み合わせと１つ以上の他の治療用化合物との組み合わせ投与の形態を取る。本開示の化合物は、その他にまたは加えて、特に、腫瘍療法のために、化学療法、放射線療法、免疫療法、光線療法、外科的介入、またはこれらの組み合わせと組み合わせて、投与され得る。上記のように、他の治療戦略における補助療法と同様に、長期療法も可能である。他の可能な治療は、腫瘍退縮後に患者の状態を維持するための療法、またはさらには、例えば、リスクがある患者における化学予防療法である。
【０６７７】
これらの追加の剤は、複数の投与レジメンの一部として、本発明の化合物を含有する組成物とは別に投与され得る。あるいは、これらの剤は、本開示の化合物とともに混合して単一の組成物にした単一剤形の一部であってもよい。複数の投与計画の一部として投与される場合、２つの活性剤は、同時、逐次、または互いに一定の期間内に、通常は互いに５時間以内に投与され得る。
【０６７８】
本明細書で使用される場合、「組み合わせ」、「組み合わせた」という用語及び関連する用語は、本開示による治療剤の同時投与または逐次投与を指す。例えば、本開示の化合物は、別の治療剤と、別個の単位剤形でまたは単一の単位剤形で一緒に、同時投与または逐次投与され得る。したがって、本開示は、本開示の化合物、追加の治療剤、及び薬学的に許容される担体、アジュバント、またはビヒクルを含む、単一単位剤形を提供する。
【０６７９】
単一剤形をもたらすために担体材料と組み合わせることができる本開示の化合物と追加の治療剤の両方の量（上記のような追加の治療剤を含む組成物中）は、治療される宿主及び特定の投与様式に応じて変わり得る。いくつかの実施形態において、本開示の組成物は、０．０１～１００ｍｇ／ｋｇ体重／日の投与量の本発明の化合物が投与され得るように製剤化されるべきである。
【０６８０】
追加の治療剤を含むこれらの組成物では、追加の治療剤及び本開示の化合物が相乗的に作用し得る。したがって、そのような組成物中の追加の治療剤の量は、その治療剤のみを利用する単剤療法で必要とされる量よりも少なくなる。そのような組成物において、０．０１～１，０００μｇ／ｋｇ体重／日の投与量の追加の治療剤が投与され得る。
【０６８１】
本開示の組成物中に存在する追加の治療剤の量は、その治療剤を唯一の活性剤として含む組成物で通常投与される量以下となる。いくつかの実施形態において、本開示の組成物中の追加の治療剤の量は、その剤を唯一の治療活性剤として含む組成物中に通常存在する量の約５０％～１００％の範囲となる。
【０６８２】
本開示の化合物またはその医薬組成物はまた、人工器官、人工弁、人工血管、ステント

及びカテーテルなどの植込み型医療デバイスをコーティングするための組成物に組み込まれてもよい。例えば、血管ステントは、再狭窄（損傷後の血管壁の再狭窄）を克服するために使用されている。しかしながら、患者がステントまたは他の植込み型デバイスを使用することにより、血塊形成または血小板活性化のリスクが生じる。これらの望ましくない作用は、キナーゼ阻害剤を含む薬学的に許容される組成物でデバイスを予めコーティングすることによって、予防または軽減することができる。本開示の化合物でコーティングされた植込み型デバイスは、本開示の別の実施形態である。

【０６８３】

本開示の化合物及び／または組成物のいずれも、化合物及び／または組成物を含むキットで提供され得る。したがって、いくつかの実施形態では、本開示の化合物及び／または組成物はキットで提供される。

【０６８４】

本開示は、以下の非限定的な実施例によってさらに説明される。

【実施例】

【０６８５】

本開示のより完全な理解を促進するために、本明細書では例が提供される。以下の実施例は、本開示の主題を作成及び実施する例示的なモードを説明するために役立つ。しかしながら、本開示の範囲は、例示にすぎないこれらの実施例に開示される特定の実施形態に限定されるものとして解釈されるものではない。

【０６８６】

以下の実施例及び一般スキームに示されるように、ある特定の例示的な実施形態において、化合物は、以下の一般的手順に従って調製される。一般的方法は、本開示のある特定の化合物の合成について示しているが、本明細書に記載されるこれらの化合物のそれぞれの他のクラス及びサブクラスならびに種に対して以下の一般的方法及び当業者に知られている他の方法を適用することができることが理解されよう。本開示の追加の化合物は、本明細書の実施例に記載されるものと実質的に類似の方法及び当業者に知られている方法によって調製した。

【０６８７】

以下に記載される合成方法の説明において、特に記載のない限り、全ての反応条件（例えば、反応溶媒、雰囲気、温度、時間、及びワークアップ手順）は、特に指定のない限り、その反応の標準条件から選択されるものと理解されたい。実施例の出発物質は、市販されているか、または既知の物質から標準的な方法で容易に調製される。

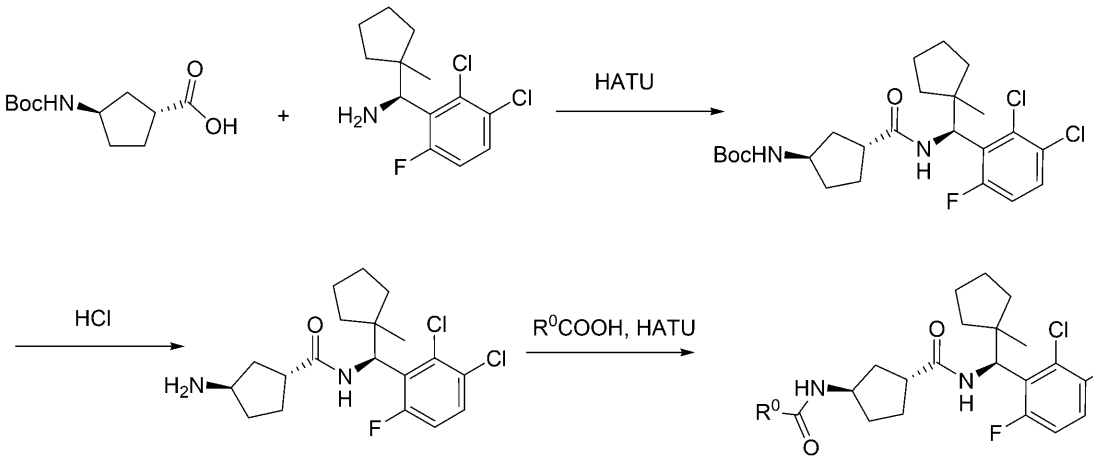
略語一覧

ａｑ：水溶液
Ａｃ：アセチル
ＡＣＮまたはＭｅＣＮ：アセトニトリル
ＡｍＦ：ギ酸アンモニウム
ａｎｈｙｄ．：無水
ＢＩＮＡＰ：（±）－２，２’－ビス（ジフェニルホスフィノ）－１，１’－ビナフタレン
Ｂｎ：ベンジル
ｃｏｎｃ．：濃縮
ＤＢＵ：１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン
ＤＣＥ：ジクロロエタン
ＤＣＭ：ジクロロメタン
ＤＩＰＥＡ：ジイソプロピルアミン
ＤＭＦ：Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド
ＤＭＰ：デス－マーチンペルヨージナン
ＤＭＰＵ：Ｎ，Ｎ’－ジメチルプロピレン尿素
ＤＭＳＯ：ジメチルスルホキシド
ＤＩＰＥＡ：ジイソプロピルエチルアミン

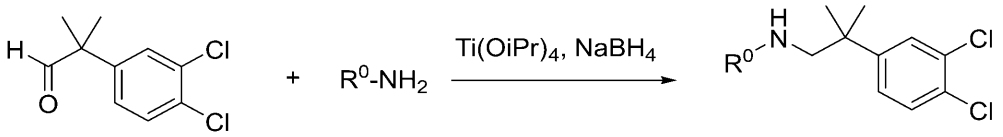
ＥＡまたはＥｔＯＡｃ：酢酸エチル
ＥＤＣＩ、ＥＤＣ、またはＥＤＡＣ：１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド
当量またはｅｑ：モル当量
Ｅｔ：エチル
ＨＡＴＵ：１－［ビス（ジメチルアミノ）メチレン］－１Ｈ－１，２，３－トリアゾロ［４，５－ｂ］ピリジニウム３－オキシドヘキサフルオロホスファート
ＨＰＬＣ：高速液体クロマトグラフィー
ＬＣＭＳまたはＬＣ－ＭＳ：液体クロマトグラフィー－質量分析
Ｍｓ：メタンスルホニル
ＮＢＳ：Ｎ－ブロモスクシンイミド
ＮＭＲ：核磁気共鳴
ＰＥ：石油エーテル
ＰＭＢ：ｐ－メトキシベンジル
ｒｔまたはＲＴ：室温
ｓａｔ：飽和
ＴＢＳ：ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル
ＴＥＡ：トリエチルアミン
Ｔｆ：トリフルオロメタンスルホナート
ＴＦＡ：トリフルオロ酢酸
ＴＨＦ：テトラヒドロフラン
ＴＬＣ：薄層クロマトグラフィー
Ｔｏｌ：トルエン
ＵＶ：紫外線
【０６８８】

【化７３８】

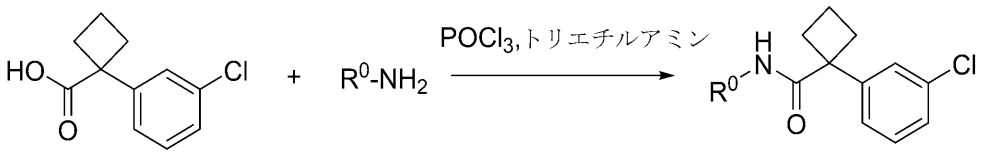
一般スキーム１



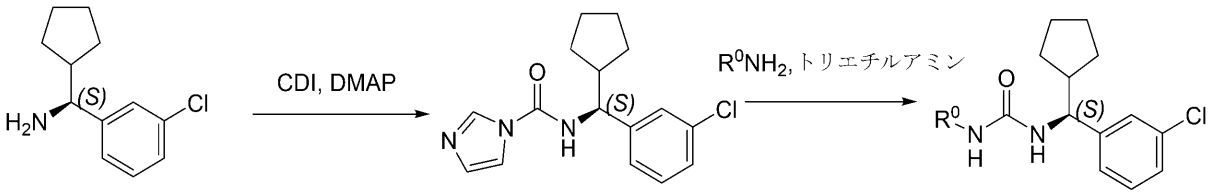
一般スキーム２



一般スキーム３



一般スキーム４



いくつかの実施例において、本開示の化合物は、一般スキーム１、２、３、または４に示される例示的な手順に従って合成した。これらのスキームの目的のために、R^0は、各場合において、その連続する原子と一緒になる場合、市販の化合物、本明細書で開示される化合物、または当業者によって容易に把握され、本開示の化合物をもたらす他の出発物質を表す、例示的な変数である。当業者であれば、一般スキームに示される特定の試薬を、同等または実質的に類似の反応を達成するのに適切な試薬と置き換えることができることを理解するであろう。

【０６８９】

ＬＣ－ＭＳ及びＧＣ－ＭＳの方法：

方法Ａ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２５４ｎｍで操作）、ＥＬＳＤ検出器、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、ＨＡＬＯ　Ｃ１８　３０＊３．０ｍｍ、２μｍであり、水＋０．１％ギ酸（Ａ）及びアセトニトリル＋０．１％ギ酸（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．５ｍＬ／分、４０℃で操作。保持時間は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。

グラジエント：０．０１分　５％Ｂ

１．００分　１００％Ｂ

１．４０分　１００％Ｂ
１．４２分　５％Ｂ
合計実行時間：１．５分
【０６９０】
方法Ｂ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２５４ｎｍで操作）、ＥＬＳＤ検出器、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｃｋ　Ｓｃｅｐｔｅｒ　Ｃ１８－１２０、３３＊３．０ｍｍ、３μｍであり、水＋５ｍＭ　NH_4HCO_3（Ａ）及びアセトニトリル（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．５ｍＬ／分、３０℃で操作。保持時間は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分　１０％Ｂ
１．２０分　９５％Ｂ
１．８０分　９５％Ｂ
１．８２分　１０％Ｂ
合計実行時間：２．０分
【０６９１】
方法Ｃ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２５４ｎｍで操作）、ＥＬＳＤ検出器、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、ＨＡＬＯ　Ｃ１８　３０＊３．０ｍｍ、２μｍであり、水＋０．０５％トリフルオロ酢酸（Ａ）及びアセトニトリル＋０．０５％トリフルオロ酢酸（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．５ｍＬ／分、４０℃で操作。保持時間は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分　５％Ｂ
１．２０分　１００％Ｂ
１．８０分　１００％Ｂ
１．８２分　５％Ｂ
合計実行時間：２．０分
【０６９２】
方法Ｄ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２５４ｎｍで操作）、ＥＬＳＤ検出器、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｃｋ　ＳｃｅｐｔｅｒＣ１８－１２０、３３＊３．０ｍｍ、３μｍであり、水＋６．５ｍＭ　NH_4HCO_3＋アンモニア（ｐＨ＝１０）（Ａ）及びアセトニトリル（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．５ｍＬ／分、３０℃で操作。保持時間は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分　１０％Ｂ
１．２０分　９５％Ｂ
１．８０分　９５％Ｂ
１．８２分　１０％Ｂ
合計実行時間：２．０分
【０６９３】
方法Ｅ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２５４ｎｍで操作）、ＥＬＳＤ検出器、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８　５０＊３．０ｍｍ、２．６μｍであり、水＋０．０４％NH_4OH（Ａ）及びアセトニトリル（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．２ｍＬ／分、４０℃で操作。保持時間は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分　１０％Ｂ
１．２０分　９５％Ｂ
１．８０分　９５％Ｂ

１．８２分　１０％Ｂ
合計実行時間：２．０分
【０６９４】
方法Ｆ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２５４ｎｍで操作）、ＥＬＳＤ検出器、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８　５０＊３．０ｍｍ、２．６μｍであり、水＋０．０４％NH_4OH（Ａ）及びアセトニトリル（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．２ｍＬ／分、４０℃で操作。保持時間は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分　１０％Ｂ
２．００分　９５％Ｂ
２．６０分　９５％Ｂ
２．７０分　１０％Ｂ
合計実行時間：２．８０分
【０６９５】
方法Ｇ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２５４ｎｍで操作）、ＥＬＳＤ検出器、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、Ｐｏｒｏｓｈｅｌｌ　ＨＰＨ－Ｃ１８　５０＊３．０ｍｍ、４μｍであり、水＋５ｍＭ　NH_4HCO_3（Ａ）及びアセトニトリル（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．５ｍＬ／分、４０℃で操作。保持時間は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分　１０％Ｂ
１．２０分　９５％Ｂ
１．８０分　９５％Ｂ
１．８５分　１０％Ｂ
合計実行時間：２．０分
【０６９６】
方法Ｈ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２５４ｎｍで操作）、ＥＬＳＤ検出器、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、Ｓｈｉｍ－Ｐａｃｋ－Ｓｃｅｐｔｅｒ　Ｃ１８　３３＊３．０ｍｍ、３．０μｍであり、水＋０．１％ギ酸（Ａ）及びアセトニトリル＋０．０７％ギ酸（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．２ｍＬ／分、４０℃で操作。保持時間は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分　５％Ｂ
１．３０分　９５％Ｂ
１．７５分　９５％Ｂ
１．８０分　５％Ｂ
合計実行時間：１．８５分
【０６９７】
方法Ｉ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ　ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２２０／２５４ｎｍで操作）、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８　３０＊２．１ｍｍ、５μｍであり、水＋０．０３７５％ＴＦＡ（Ａ）及びアセトニトリル＋０．０１８７５％ＴＦＡ（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで１．５ｍＬ／分、５０℃で操作。保持時間（t_R）は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分　５％Ｂ
０．８０分　９５％Ｂ
１．２０分　９５％Ｂ
１．２１分　５％Ｂ
１．５５分　５％Ｂ

合計実行時間：１．５５分
【０６９８】
方法Ｊ：分析用ＬＣ－ＭＳシステムは、Ｓｈｉｍａｄｚｕ ＬＣＭＳ－２０２０、ＰＤＡ検出器（２２０／２５４ｎｍで操作）、及びポジティブイオンモードで操作するＥＳＩ源を備える。ＬＣ条件：カラムは、ＨＡＬＯ Ｃ１８ ３０＊３．０ｍｍ、５μｍであり、水＋０．０３７５％ＴＦＡ（Ａ）及びアセトニトリル＋０．０１８７５％ＴＦＡ（Ｂ）からなるバイナリーグラジエントで２．０ｍＬ／分、５０℃で操作。保持時間（t_R）は、２５４ｎｍでのＵＶトレースに基づいて、分単位で表される。
グラジエント：０．０１分 ５％Ｂ
０．４０分 ９５％Ｂ
０．７５分 ９５％Ｂ
０．７６分 ５％Ｂ
１．０５分 ５％Ｂ
合計実行時間：１．０５分
【０６９９】
方法Ｋ：カラム：Ｗａｔｅｒｓ Ａｃｑｕｉｔｙ ＵＰＬＣ ＣＳＨ Ｃ１８、１．８μｍ、２．１×３０ｍｍ、４０℃；グラジエント：５％から１００％Ｂで２．０分；１００％Ｂを０．７分間保持；実行時間：２．７分；流量０．９ｍＬ／分；溶離液：Ａ＝Ｍｉｌｌｉ－Ｑ H_2O＋１０ｍＭギ酸アンモニウム；ｐＨ：３．８；溶離液Ｂ：アセトニトリル（添加物なし）；Ｗａｔｅｒｓ ＵＰＬＣ システムはＵＶ検出器＝Ｗａｔｅｒｓ Ａｃｑｕｉｔｙ ＰＤＡ（１９８～３６０ｎｍ）、２０ｐｔｓ／ｓｅｃ、２２０及び２５４ｎｍを備える。ＭＳ検出器Ｗａｔｅｒｓ ＳＱＤ、ＥＳＩ（ＥＳ＋／ＥＳ－、１２０～１２００ａｍｕ）。
【０７００】
方法Ｌ：ＨＰＬＣ－ＭＳ法：Ｗａｔｅｒｓ Ａｌｌｉａｎｃｅ ＵＰＬＣ ＣＳＨ Ｃ１８、３．５μｍ、４．６×３０ｍｍ、４０℃；５％Ｂを０．２分間、５％から１００％Ｂで１．８分；１００％Ｂを１分間保持、実行時間＝３．０分、流量３ｍＬ／分；溶離液：Ａ＝Ｍｉｌｌｉ－Ｑ H_2O＋１０ｍＭギ酸アンモニウムｐＨ＝３．８；Ｂ＝アセトニトリル。Ｗａｔｅｒｓ Ａｌｌｉａｎｃｅ ＨＰＬＣシステム。ＵＶ検出器＝Ｗａｔｅｒｓ ２９９６ ＰＤＡ、１９８～３６０ｎｍ。ＭＳ検出器＝Ｗａｔｅｒｓ ＺＱ ２０００。
【０７０１】
方法Ｍ：ＨＰＬＣ－ＭＳ法：Ｗａｔｅｒｓ Ａｌｌｉａｎｃｅ ＵＰＬＣ ＣＳＨ Ｃ１８、３．５μｍ、４．６×３０ｍｍ、４０℃；５％Ｂを０．５分間、５％から１００％Ｂで５．０分；１００％Ｂを０．７分間、１００％Ｂを１．５分間保持、実行時間＝７．０分、流量３ｍＬ／分；溶離液：Ａ＝Ｍｉｌｌｉ－Ｑ H_2O＋１０ｍＭギ酸アンモニウム、ｐＨ３．８；Ｂ＝ＭｅＣＮ。Ｗａｔｅｒｓ Ａｌｌｉａｎｃｅ ＨＰＬＣシステム。ＵＶ検出器＝Ｗａｔｅｒｓ ２９９６ ＰＤＡ、１９８～３６０ｎｍ。ＭＳ検出器＝Ｗａｔｅｒｓ ＺＱ ２０００。
【０７０２】
ＧＣＭＳ方法（方法Ｚ）：ＧＣ－ＭＳシステムは、Ａｇｉｌｅｎｔ ＧＣＭＳ ７８９０Ｂ及び検出器Ｃｈａｎｎｅｌ ＦＩＤから構成される。
ＭＳ検出器の取り込みモード：
開始時間：２．００分；終了時間：１１．７５分；取り込みモード：スキャン；インターフェースタイプ：ＥＩ
閾値：１５０；スキャン速度：１５６２；開始ｍ／ｚ：５０．００；終了ｍ／ｚ：６００．００；ＭＳ源：２３０．００℃；ＭＳ Ｑｕａｄ：１５０．００℃；溶媒カット時間：２．００分。
ＧＣパラメーター：
カラム：ＨＰ－５ＭＳ、３０ｍ×０．２５ｍｍ×０．２５μｍ；カラムオーブン温度：５０．０℃；注入量：１μＬ；

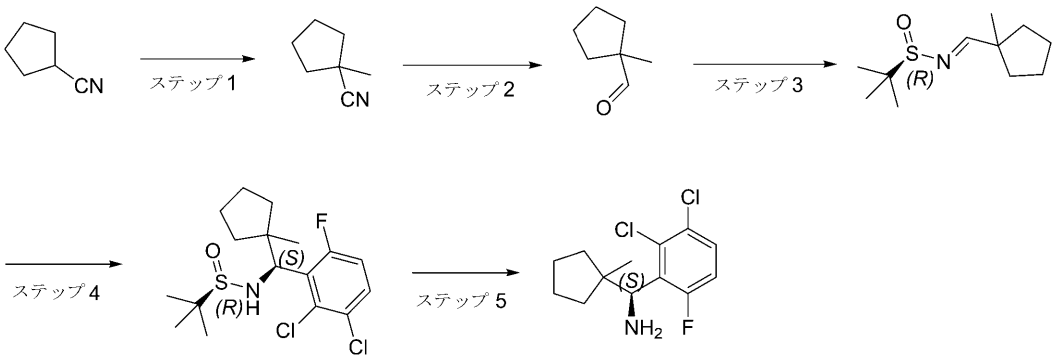
カラム流量：１．０ｍｌ／分；注入温度：３００℃；注入モード：スプリット；スプリット比：２０：１；
検出器温度：３００℃；初期温度：５０℃で０．５分間、次いで、４０℃／分で３００℃まで１１．７５分間。
メイクアップガス：Ｈｅ；メイクアップ流量：２５．０ｍＬ／分；H_2；流量：３０．０ｍＬ／分；空気流量：４００．０ｍＬ／分；
最終温度：３２５℃。

【０７０３】

実施例１

（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メタンアミン

【化７３９】



ステップ１．１－メチルシクロペンタン－１－カルボニトリルの合成

ＬｉＨＭＤＳの溶液（１．００Ｍ、１．５０Ｌ）に、ＴＨＦ（６５０ｍＬ）中のシクロペンタンカルボニトリル（１３０ｇ、１．３７ｍｏｌ）の溶液をN_2下にて－６０℃で滴下した。添加後、反応混合物を－６０℃で１時間撹拌した。次いで、ＭｅＩ（１１１ｍＬ、１．７８ｍｏｌ）を－６０℃で滴下した。反応混合物を２０℃まで温め、２０℃で１２時間撹拌した。混合物を飽和NH_4Cl水溶液（２．００Ｌ）中に注ぎ、酢酸エチル（１．５０Ｌ＊２）で抽出した。合わせた有機層を１Ｎ　ＨＣｌ（１．００Ｌ）及びブライン（１．５０Ｌ＊２）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、１－メチルシクロペンタン－１－カルボニトリル（１５０ｇ、粗製）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００　ＭＨｚ，　ＣＤＣｌ$_3$）　δ　２．１６　－　２．１４（ｍ，　２Ｈ），　１．８５　－　１．７７　（ｍ，　４Ｈ），　１．６３　－　１．５９（ｍ，　２Ｈ），　１．４１　（ｓ，　３Ｈ）．

【０７０４】

ステップ２．１－メチルシクロペンタン－１－カルバルデヒドの合成

ＤＩＢＡＬ－Ｈの溶液（ＴＨＦ中１．００Ｍ、１．５１Ｌ）に、ＤＣＭ（１５０ｍＬ）中の１－メチルシクロペンタン－１－カルボニトリル（１５０ｇ、１．３７ｍｏｌ）の溶液をN_2下にて－６５℃で滴下した。混合物を－６５℃で１時間撹拌し、撹拌しながら飽和NH_4Cl水溶液（５．００Ｌ）中に注いだ。ｐＨをＨＣｌ（６Ｎ、１．２０Ｌ）で約３に調整し、次いで、ＤＣＭ（２．００Ｌ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１．５０Ｌ＊２）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して（１５℃）、１－メチルシクロペンタン－１－カルバルデヒド（１３０ｇ、粗製）を無色の液体として得た。この粗生成物をさらに精製することなく次のステップに使用した。

【０７０５】

ステップ３．（Ｒ）－２－メチル－Ｎ－（（１－メチルシクロペンチル）メチレン）プロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（６００ｍＬ）中の１－メチルシクロペンタン－１－カルバルデヒド（１２０ｇ、１．０７ｍｏｌ）の混合物に、（Ｒ）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（

１５６ｇ、１．２８ｍｏｌ）、Ｔｉ（Ｏ^{i}Ｐｒ）$_{4}$（６０８ｇ、２．１４ｍｏｌ）を２０℃で加えた。混合物を７５℃まで加熱し、７５℃で２時間撹拌した。混合物をブライン（４．００Ｌ）中に注いだ。混合物を濾過し、濾液を酢酸エチル（１．５０Ｌ＊３）で洗浄した。濾液をブライン（２．００Ｌ）で洗浄し、濃縮して、残渣を得た。残渣をカラムクロマトグラフィー（ＳｉＯ$_{2}$、石油エーテル／酢酸エチル＝１０／１から５／１）によって精製して、（Ｒ）－２－メチル－Ｎ－（（１－メチルシクロペンチル）メチレン）プロパン－２－スルフィンアミド（１２０ｇ、５５７ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_{3}$）δ ７．９５（ｓ，１Ｈ），１．９４ － １．９２（ｍ，２Ｈ），１．７５ － １．６８（ｍ，４Ｈ），１．５０ － １．４６（ｍ，２Ｈ），１．２２（ｓ，３Ｈ），１．１９（ｓ，９Ｈ）．

【０７０６】

ステップ４．（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（１．００Ｌ）中の１，２－ジクロロ－４－フルオロベンゼン（９９．６ｇ、６０４ｍｍｏｌ）の混合物に、ｎ－ＢｕＬｉ（ヘキサン中２．５０Ｍ、２４１ｍＬ）をＮ$_{2}$下にて－６５℃で滴下し、次いで、混合物を－６５℃で０．５時間撹拌した。混合物にＴＨＦ（１００ｍＬ）中の（Ｒ）－２－メチル－Ｎ－（（１－メチルシクロペンチル）メチレン）プロパン－２－スルフィンアミド（１００ｇ、４６４ｍｍｏｌ）を加えた。－６５℃で１時間撹拌した。混合物を飽和ＮＨ$_{4}$Ｃｌ水溶液（１０％、２．００Ｌ）中に注ぎ、酢酸エチル（１．００Ｌ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１．００Ｌ＊２）で洗浄し、減圧下で濃縮して、残渣を得た。残渣を分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｐｈｅｎｏｍｅｎｅｘ ｌｕｎａ Ｃ１８ ２５０ ｍｍ＊１００ｍｍ、１０μｍ；移動相Ａ：水（ギ酸）Ｂ：アセトニトリル；２５分かけてＢ：６０％から８０％）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１２０ｇ、３１６ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ ７．６６ － ７．６２（ｍ，１Ｈ），７．３２ －７．２７（ｍ，１Ｈ），５．１３（ｄ，Ｊ ＝ ８．４ Ｈｚ，１Ｈ），４．９１（ｄ，Ｊ ＝ ８．４ Ｈｚ，１Ｈ），１．７４ － １．６２（ｍ，６Ｈ），１．３９ － １．３６（ｍ，１Ｈ），１．２６ － １．２２（ｍ，１Ｈ），０．９７ － ０．９５（ｍ，１２Ｈ）．

【０７０７】

ステップ５．（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メタンアミンの合成

【０７０８】

酢酸エチル（１．１０Ｌ）中の（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１１０ｇ、２８９ｍｍｏｌ）の混合物に、ＥｔＯＡｃ中ＨＣｌ（４Ｍ、２７５ｍＬ）を加えた。混合物を２０℃で１時間撹拌した。混合物を濃縮した。残渣にＨ$_{2}$Ｏ（１．５０Ｌ）を加え、酢酸エチル（１．００Ｌ＊２）で洗浄した。水層に飽和ＮａＨＣＯ$_{3}$水溶液（８００ｍＬ）をｐＨ＝９まで加えた。混合物を酢酸エチル（１．００Ｌ＊２）で抽出し、合わせた有機層をブライン（５００ｍＬ＊２）で洗浄し、Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メタンアミン（５２．２３ｇ、１８８ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ ７．５９ － ７．５６（ｍ，１Ｈ），７．２７ － ７．２２（ｍ，１Ｈ），４．３２（ｓ，１Ｈ），２．１０（ｓ，２Ｈ），１．７９ － １．５９（ｍ，６Ｈ），１．２９ － １．２６（ｍ，１Ｈ），１．１４ － １．１１

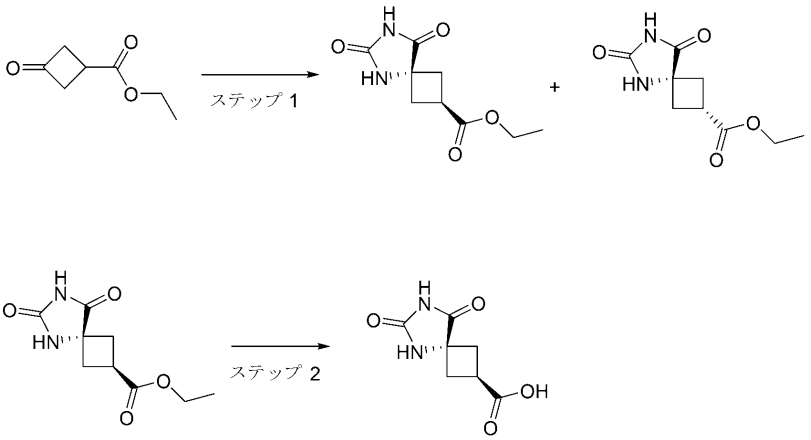
（ｍ，　１Ｈ），　０．８６　（ｄ，　Ｊ　＝　２．４　Ｈｚ，　３Ｈ）．

【０７０９】

実施例２

（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸

【化７４０】



ステップ１．６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸エチルの合成

ＥｔＯＨ（１．５０Ｌ）及びH_2O（５００ｍＬ）中の３－オキソシクロブタン－１－カルボン酸エチル（１１３ｇ、７９１ｍｍｏｌ）、$(NH_4)_2CO_3$（１１４ｇ、１．１９ｍｏｌ）の混合物に、ＮａＣＮ（３８．８ｇ、７９１ｍｍｏｌ）を２０℃で加えた。混合物を３５℃まで加熱し、３５℃で１２時間撹拌した。そのようなバッチを４つ合わせた。反応混合物を酢酸エチル（２．００Ｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層を無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、白色の固体を得た。分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｐｈｅｎｏｍｅｎｅｘ　ｌｕｎａ　Ｃ１８　２５０＊５０ｍｍ＊１０μｍ；移動相Ａ：水（０．１％ＴＦＡ）Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：２１分かけてＢ％１０％～３５％）によって精製した。溶離液を濃縮してアセトニトリルの大部分を除去し、酢酸エチル（５．００Ｌ＊６）で抽出した。合わせた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮した。（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸エチル（９０．０ｇ、４１１ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　１０．６　（ｓ，１Ｈ），　８．４８　（ｓ，　１Ｈ），　８．４６　（ｓ，　１Ｈ），　４．１２　－　４．０５　（ｍ，　２Ｈ），　３．２５　－　３．１８　（ｍ，　１Ｈ），　２．６９　－　２．６５　（ｍ，　２Ｈ），　２．４１　－　２．３４　（ｍ，　２Ｈ），　１．１９　（ｔ，　Ｊ　＝　６．８　Ｈｚ，　３Ｈ）．

【０７１０】

（２ｓ，４ｓ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸エチル（１５０ｇ、純度６６％、（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸エチル３０％含有）を得た。

【０７１１】

ステップ２．（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸の合成

ＭｅＯＨ（４５０ｍＬ）及びH_2O（２００ｍＬ）中の（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸エチル（９０．０ｇ、４２４ｍｍｏｌ）の溶液に、ＬｉＯＨ　・H_2O（４４．５ｇ、１．０６ｍｏｌ）を２０℃で加えた。混合物を２０℃で１時間撹拌した。混合物を３Ｎ　ＨＣｌでｐＨ＝１～２に調整した。沈殿物を濾過により集めた。濾過ケーキを酢酸エチル（３００ｍＬ）により２

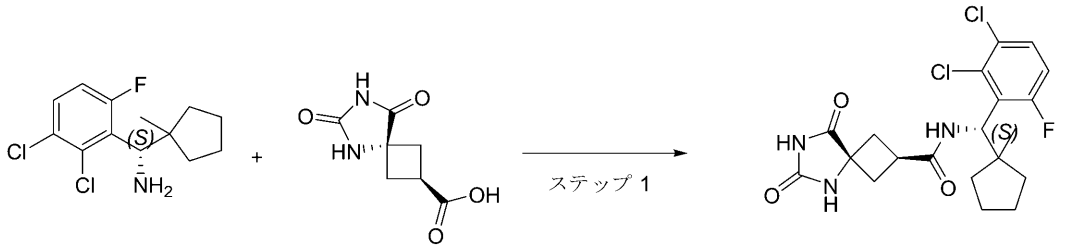
５℃で２時間トリチュレートし、濾過した。濾過ケーキを真空で乾燥させて、（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（５２．０ｇ、２７９ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）　δ　１２．３３　（ｓ，　１Ｈ），　１０．６０　（ｓ，　１Ｈ），　８．４８　（ｓ，　１Ｈ），　３．１６　－　３．１３　（ｍ，　１Ｈ），　２．７０　－　２．６４　（ｍ，　２Ｈ），　２．３５　－　２．２９　（ｍ，　２Ｈ）．

【０７１２】

実施例３

（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド

【化７４１】



ステップ１．（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

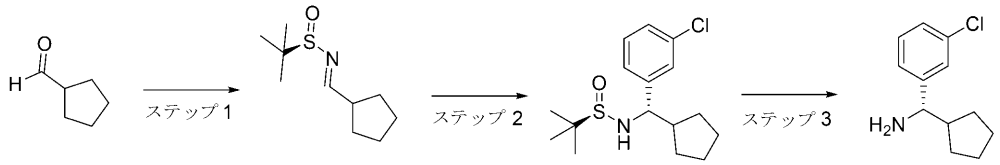
ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メタンアミン（４０ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）、（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（２７ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）、ＴＥＡ（４４ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）及びＴ$_{3}$Ｐ（０．１４ｇ、５０重量％、０．２２ｍｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応物を水（５ｍｌ）でクエンチし、酢酸エチル（１０ｍｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５ｍｌ）で洗浄した混合物をＮａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濃縮した。残渣をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（ＣＨ$_{3}$ＣＮ／水、２０分かけて２５％～６０％ＣＨ$_{3}$ＣＮ）によって精製して、（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（４３．１ｍｇ、９７．４μｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　１０．５７　（ｓ，　１Ｈ），　８．６２　（ｓ，　１Ｈ），　８．２３　（ｄ，　Ｊ　＝　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６１　（ｄｄ，　Ｊ　＝　８．９，　５．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２５　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．８，　９．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．５０　（ｄ，　Ｊ　＝　８．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．３０－３．２６　（ｍ，　１Ｈ），　２．７１－２．５３　（ｍ，　２Ｈ），　２．２１　（ｄｄ，　Ｊ　＝　２４．５，　１１．２　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．５９　（ｓ，　６Ｈ），　１．３７　（ｓ，　１Ｈ），　１．２７　（ｓ，　１Ｈ），　０．９６　（ｄ，　Ｊ　＝　２．８　Ｈｚ，　３Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９２８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４４２、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７１３】

実施例４

（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン

【化７４２】



ステップ１．（Ｒ）－Ｎ－（シクロペンチルメチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（５６０ｍＬ）中のシクロペンタンカルバルデヒド（１１２ｇ、１．１５ｍｏｌ）及び（Ｒ）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１６７ｇ、１．３８ｍｏｌ）の溶液に、Ｔｉ（Ｏ^{i}－Ｐｒ）$_4$（６５１ｇ、２．２９ｍｏｌ）をN_2雰囲気下にて２５℃で加えた。混合物を７５℃まで加熱し、７５℃で２時間撹拌した。２つのバッチを並行して実施し、ワークアップで合わせた。室温まで冷却した後、混合物にブライン（３．００Ｌ）を加えた。懸濁液を濾過した。濾過ケーキを酢酸エチル（５．００Ｌ＊２）で洗浄した。有機相を分離し、水相を酢酸エチル（３．００Ｌ）で抽出した。合わせた有機相をブライン（３．００Ｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（SiO_2、石油エーテル：酢酸エチル１：０から１０：１）によって精製した。（Ｒ）－Ｎ－（シクロペンチルメチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（３５７ｇ、１．７７ｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}ＨＮＭＲ：（４００ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ８．００（ｄ，Ｊ＝５．６Ｈｚ，１Ｈ），２．９８－２．９４（ｍ，１Ｈ），１．９４－１．８３（ｍ，２Ｈ），１．７７－１．６２（ｍ，６Ｈ），１．１９（ｓ，９Ｈ）

【０７１４】

ステップ２．（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

２つのバッチを並行して実施し、ワークアップで合わせた。ＴＨＦ（８００ｍＬ）中の（Ｒ）－Ｎ－（シクロペンチルメチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１６０ｇ、７９５ｍｍｏｌ）及び１－ブロモ－３－クロロベンゼン（２２８ｇ、１．１９ｍｏｌ）の溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ（ヘキサン中２．５０Ｍ、４７７ｍＬ）をN_2下にて－７０～－６０℃で滴下した。反応物を－７０～－６０℃で２時間撹拌した。

【０７１５】

混合物を飽和NH_4Cl溶液（５．００Ｌ）中に注ぎ、酢酸エチル（２．００Ｌ＊３）で抽出した。合わせた有機相をブライン（２．００Ｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、黄色の油状物を得た（５６３ｇ）。この粗生成物をさらに精製することなく次のステップに使用した。ＬＣＭＳ：ＲＴ　１．０３０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３１４．１、ＬＣＭＳ方法Ｉ。

【０７１６】

ステップ３．（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミンの合成

２つの同等のバッチを並行して実施した。酢酸エチル（２．６０Ｌ）中の（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２６４ｇ、７５７ｍｍｏｌ）の溶液に、ＥｔＯＡｃ中ＨＣｌ（４．００Ｍ、４７３ｍＬ）を２５℃で加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。多量の白色の固体が形成された。２つのバッチの反応混合物を合わせた。懸濁液を４．０Ｌまで濃縮し、懸濁液を濾過した。濾過ケーキを酢酸エチル（２００ｍＬ＊２）で洗浄した。濾過ケーキを酢酸エチル（２．００Ｌ）と飽和$NaHCO_3$溶液（２．５０Ｌ）に分配した。懸濁液を固体がなくなるまで１０分間撹拌した。有機相を分離し、水相を酢酸エチル（１．００Ｌ＊２）で抽出した。合わせた有機相をブライン（２．００Ｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（２２０ｇ、粗製）を黄色の油状物として得た。ＭｅＯＨ（１．３０Ｌ

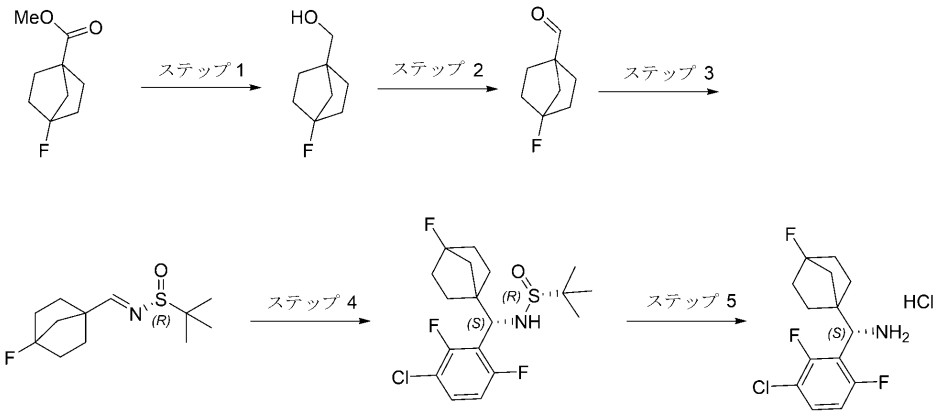
）中の（２Ｒ，３Ｒ）－２，３－ジヒドロキシコハク酸（８０．０ｇ、５３５ｍｍｏｌ）の溶液に、粗製（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（１１０ｇ、５２５ｍｍｏｌ）を２５℃で加えた。反応物を２５℃で１０分間撹拌すると、白色の固体が形成された。反応混合物を３時間静置した。懸濁液を濾過した。濾過ケーキをメタノール（１００ｍＬ＊２）で洗浄し、真空下で乾燥させて、固体を得た（２６０ｇ、ｅｅ％＝９８．０％）。生成物をメタノール（１．００Ｌ）で希釈し、固体が完全に融解するまで８０℃で１．０時間加熱した。反応物を７２時間静置した。白色の固体が沈殿した。反応混合物を濾過し、濾過ケーキをメタノール（１００ｍＬ＊２）で洗浄した。濾過ケーキを飽和$NaHCO_3$（２．５０Ｌ）と酢酸エチル（２．００Ｌ）に分配した。有機相を分離した。水相を酢酸エチル：メタノール＝１０：１（２．００Ｌ＊２）で抽出した。合わせた有機層をNa_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（９４．０ｇ、ｅｅ％＝１００％）を得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ ＤＭＳＯ－d_6）δ ７．４０（ｓ，１Ｈ），７．３２ － ７．２２（ｍ，３Ｈ），３．５４（ｄ Ｊ ＝ ８．４ Ｈｚ，１Ｈ），２．１８（ｓ，２Ｈ），２．００ － １．９０（ｍ，１Ｈ），１．７９ － １．７１（ｍ，１Ｈ），１．６０ － １．４５（ｍ，３Ｈ），１．４２ － １．３０（ｍ，２Ｈ），１．２５ － １．１７（ｍ，１Ｈ），１．１１ － １．０２（ｍ，１Ｈ）．

【０７１７】

実施例５

（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタンアミン塩酸塩

【化７４３】



ステップ１．（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタノールの合成

ＴＨＦ（１．６５Ｌ）中の４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－カルボン酸メチル（１６５ｇ、９５８ｍｍｏｌ）の溶液に、ＬｉＡｌＨ$_4$（ＴＨＦ中２．５Ｍ、４６０ｍＬ）を０～１０℃で滴下した。混合物を２０℃まで温め、２０℃で２時間撹拌した。反応混合物を１Ｍ ＨＣｌ水溶液（５．００Ｌ）中にゆっくりと注ぎ、酢酸エチル（５．００Ｌ＊２）で抽出した。有機相をブライン（５．００Ｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮して、（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタノール（１４６ｇ、粗製）を薄黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ ３．６１（ｓ，２Ｈ），２．０５ － １．９３（ｍ，２Ｈ），１．８５ － １．７２（ｍ，４Ｈ），１．５２ － １．３９（ｍ，４Ｈ）．

【０７１８】

ステップ２．４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－カルバルデヒドの合成

ＤＣＭ（１．１３Ｌ）中の（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタノール（１５０ｇ、１．０４ｍｏｌ）の溶液に、ＤＭＳＯ（２４４ｍＬ、３．１２ｍｏｌ）、ＴＥＡ（７２４ｍＬ、５．２０ｍｏｌ）を２０℃で加えた。混合物を０～５℃まで冷却した。SO_3・Ｐｙ（７４５ｇ、４．６８ｍｏｌ）を混合物に０～５℃で加えた。混合物を２０℃まで温め、２０℃で２時間撹拌した。混合物を水（５．００Ｌ）中に注ぎ、ＤＣＭ（５．００Ｌ＊２）で抽出した。有機相を無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下２５℃で濃縮した。残渣を酢酸エチル（２．００Ｌ）中に溶解した。有機相を１Ｎ　ＨＣｌ水溶液（１．５０Ｌ＊２）、ブライン（１．５０Ｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮して、４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－カルバルデヒド（１１２ｇ、粗製）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ９．７２（ｓ，１Ｈ），２．２１－２．１０（ｍ，２Ｈ），２．０４－１．９５（ｍ，２Ｈ），１．９０－１．８２（ｍ，４Ｈ），１．６５－１．５８（ｍ，２Ｈ）．

【０７１９】

ステップ３．（Ｒ）－Ｎ－（（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－カルバルデヒド（１１０ｇ、７７４ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＨＦ（１．１０Ｌ）中の（Ｒ）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（９３．８ｇ、７７４ｍｍｏｌ）、続いて、Ｔｉ（O^{i}Ｐｒ）$_4$（４４０ｇ、１．５５ｍｏｌ）を２５℃で加えた。混合物を７５℃まで加熱し、７５℃で２時間撹拌した。混合物を２５℃まで冷却し、酢酸エチル（４．００Ｌ）で希釈し、水（４．００Ｌ）中に注いだ。混合物を濾過した。濾液を分離し、有機相をブライン（３．００Ｌ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮した。残渣を別のバッチ（２０．０ｇのアルデヒドから開始）と合わせ、カラムクロマトグラフィー（SiO_2、石油エーテル：酢酸エチル　１：０から１０：１）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１５０ｇ、５９９ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ８．０９（ｓ，１Ｈ），２．１３－１．９４（ｍ，４Ｈ），１．９１－１．８０（ｍ，４Ｈ），１．７２－１．６３（ｍ，２Ｈ），１．１９（ｓ，９Ｈ）；^{19}Ｆ　ＮＭＲ（３７６ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ－１７６．８１

【０７２０】

ステップ４．（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（１１４ｍＬ）中の１－クロロ－２，４－ジフルオロベンゼン（８．９７ｇ、６０．４ｍｍｏｌ）の溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ（ヘキサン中２．５０Ｍ、２４．１ｍＬ）を－６５℃で加えた。混合物を－６５℃で０．５時間撹拌し、次いで、ＴＨＦ（１１４ｍＬ）中の（Ｒ）－Ｎ－（（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１１．４ｇ、４６．４ｍｍｏｌ）の溶液を－６５℃で加えた。混合物をｔ－６５℃で２時間撹拌した。反応混合物を飽和NH_4Cl溶液（５００ｍＬ）中に注いだ。水相を酢酸エチル（３００ｍＬ＊２）で抽出した。合わせた有機相を飽和ブライン（５００ｍＬ＊２）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、真空下で濃縮して、（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２０．０ｇ、粗製）を黄色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．５９８分、$[M+H]^+$　３９４．１、ＬＣＭＳ方法Ｊ。

【０７２１】

ステップ５．（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビ

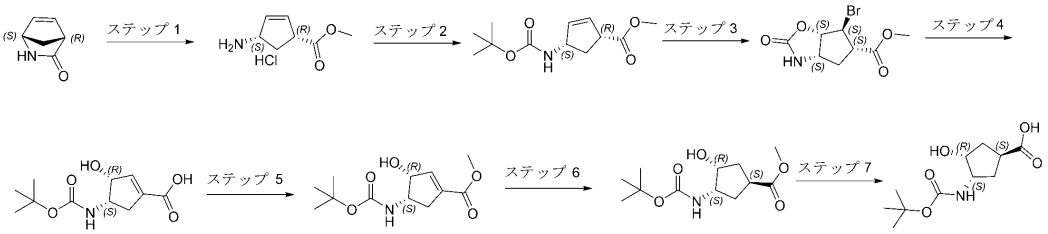
シクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタンアミン塩酸塩の合成
ＭｅＯＨ（１００ｍＬ）中の（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２０．０ｇ、５０．７ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＣｌ（ＭｅＯＨ中４．００Ｎ、１００ｍＬ）を２５℃で加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を真空下で濃縮して、粗生成物を得た。残渣を酢酸エチル（１００ｍＬ）により２０℃で３０分間トリチュレートし、濾過し、濾過ケーキを真空下５０℃で乾燥させて、（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタンアミン塩酸塩（１０．０ｇ、３０．６ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ：　ＲＴ　０．４２３分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２９０．１、ＬＣＭＳ方法Ｊ；^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＭｅＯＨ－ｄ４）　δ　７．６９　－　７．６４　（ｍ，　１Ｈ），　７．２２　－　７．１７　（ｍ，　１Ｈ），　３．３２　－　３．３１　（ｍ，　１Ｈ），　１．９９　－　１．８１　（ｍ，　８Ｈ），　１．７７　－　１．５７　（ｍ，　２Ｈ）．

【０７２２】

実施例６

（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸

【化７４４】



ステップ１．（１Ｒ，４Ｓ）－４－アミノシクロペンター２－エン－１－カルボン酸メチル塩酸塩の合成
ＭｅＯＨ（１６０５ｍＬ）中の（１Ｓ，４Ｒ）－２－アザビシクロ［２．２．１］ヘプター５－エン－３－オン（５３５ｇ、４．９０ｍｏｌ）の溶液に、$SOCl_2$（２１３ｍＬ、２．９４ｍｏｌ）を０℃で加え、溶液を０℃で２時間撹拌した。溶液を真空下で濃縮した。粗生成物をＭＴＢＥ（１０００ｍＬ）により２０℃で３０分間トリチュレートして、（１Ｒ，４Ｓ）－４－アミノシクロペンター２－エン－１－カルボン酸メチル塩酸塩（８６０ｇ、４．８４ｍｏｌ）を得た。^{1}ＨＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．３７　（ｓ，　３Ｈ），　６．０５－６．０７　（ｍ，　１Ｈ），　５．８７－５．８９　（ｍ，　１Ｈ），　４．１６　（ｓ，　１Ｈ），　３．６８－３．７０　（ｍ，　１Ｈ），　３．６４　（ｍ，　３Ｈ），　２．５３－２．５９　（ｍ，　１Ｈ），　１．９０－１．９７　（ｍ，　１Ｈ）．

【０７２３】

ステップ２．（１Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）シクロペンター２－エン－１－カルボン酸メチルの合成
ＤＣＭ（４．５Ｌ）中の（１Ｒ，４Ｓ）－４－アミノシクロペンター２－エン－１－カルボン酸メチル塩酸塩（７５０ｇ、４．２２ｍｏｌ）及びBoc_2O（９１９ｇ、４．２２ｍｏｌ）の溶液に、ＴＥＡ（７２８ｍＬ、４．２２ｍｏｌ）を０℃で加え、溶液を２５℃で１２時間撹拌した。反応反応物を水（１０００ｍＬ）によりクエンチし、ジクロロメタン（５００ｍＬ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５００ｍＬ）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、（１Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）シクロペンター２－エン－１－カルボン酸メチル（１．００ｋｇ、４．１３ｍｏｌ）を得た。^{1}ＨＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ　ＣＤＣｌ$_3$）　δ　５．８３－５．８７　（ｍ，　１Ｈ），　４．８８　（ｓ，　１Ｈ），　４．７

７（ｓ，１Ｈ），３．６９（ｓ，３Ｈ），３．４５－３．４７（ｍ，１Ｈ），２．４５－２．５３（ｍ，１Ｈ），１．８３－１．８７（ｍ，１Ｈ），１．２５（ｓ，９Ｈ）．

【０７２４】

ステップ３．（３ａＳ，５Ｓ，６Ｓ，６ａＳ）－６－ブロモ－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸メチルの合成

ＴＨＦ（２．０Ｌ）及びH_2O（１８９ｍＬ）中の（１Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）シクロペンタ－２－エン－１－カルボン酸メチル（６３０ｇ、２．６１ｍｏｌ）の溶液にＮＢＳ（５１１ｇ、２．８７ｍｏｌ）を０℃で加え、溶液を２５℃で１２時間撹拌した。反応物を減圧下で濃縮した。残渣をジクロロメタン（２０００ｍＬ）中に溶解し、ＨＣｌ（５００ｍＬ、１Ｍ）、飽和Na_2SO_3（水溶液、１０００ｍＬ）及びブライン（５００ｍＬ）で順次洗浄した後、$MgSO_4$で乾燥させた。有機相を減圧下で濃縮して、（３ａＳ，５Ｓ，６Ｓ，６ａＳ）－６－ブロモ－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸メチル（８５４ｇ、３．２３ｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{1}ＨＮＭＲ：（４００ＭＨｚ $CDCl_3$）δ ６．２７（ｓ，１Ｈ），５．１３－５．１５（ｄ，Ｊ＝８Ｈｚ，１Ｈ），４．７６（ｓ，１Ｈ），４．４０－４．４３（ｍ，１Ｈ），３．７４（ｓ，１Ｈ），３．１９－３．２３（ｍ，１Ｈ），２．２３－２．５４（ｍ，２Ｈ）．

【０７２５】

ステップ４．（３Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３－ヒドロキシシクロペンタ－１－エン－１－カルボン酸の合成

２つの反応を並行して行った。H_2O（１．６Ｌ）及びＭｅＯＨ（１．６Ｌ）中の（３ａＳ，５Ｓ，６Ｓ，６ａＳ）－６－ブロモ－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸メチル（３７５ｇ、１．４２ｍｏｌ）の溶液に、ＫＯＨ（３１８ｇ、５．６８ｍｏｌ）を０℃で加え、溶液を９０℃で１２時間撹拌した。上記溶液を濃縮し、ＴＨＦ（７００ｍＬ）中に溶解し、Boc_2O（３０９ｇ、１．４２ｍｏｌ）を加えた。溶液を２０℃で４時間撹拌した。２つの反応物をワークアップのために合わせた。得られた混合物を真空下で濃縮し、次いで、酢酸エチル（５００ｍＬ）及びH_2O（４００ｍＬ）を加えた。水相を分離し、ｐＨをＨＣｌ（１Ｍ）で３に調整した。溶液を酢酸エチル（１０００ｍＬ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５００ｍＬ）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、（３Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３－ヒドロキシシクロペンタ－１－エン－１－カルボン酸（６００ｇ、２．４７ｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{1}ＨＮＭＲ（４００ＭＨｚ ＤＭＳＯ－ｄ６）δ １２．４９（ｓ，１Ｈ），６．５１（ｓ，１Ｈ），６．３１－６．３３（ｍ，１Ｈ），５．０３（ｓ，１Ｈ），４．５０（ｓ，１Ｈ），３．９７－４．００（ｍ，１Ｈ），２．５５－２．６１（ｍ，１Ｈ），２．３１－２．３７（ｍ，１Ｈ），１．４５ ９ｓ，９Ｈ）．

【０７２６】

ステップ５．（３Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３－ヒドロキシシクロペンタ－１－エン－１－カルボン酸メチルの合成

ＭｅＯＨ（２．８Ｌ）中の（３Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３－ヒドロキシシクロペンタ－１－エン－１－カルボン酸（４００ｇ、１．６４ｍｏｌ）の溶液に、ＴＥＡ（３８９ｍＬ、２．８０ｍｏｌ）を加えた。混合物を０℃まで冷却し、クロロギ酸メチル（２１６ｍＬ、２．８０ｍｏｌ）を滴下した。混合物を０℃で１時間撹拌し、次いで、１５℃で１２時間撹拌した。反応混合物を減圧下で濃縮した。残渣をＤＣＭ（１０００ｍＬ）で希釈した。有機層を１Ｍ硫酸水素カリウム（水溶液）（５００ｍｌ＊２）、飽和$NaHCO_3$溶液（５００ｍｌ＊２）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、（３Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカ

ルボニル）アミノ）－３－ヒドロキシシクロペンター１－エン－１－カルボン酸メチル（３００ｇ、１．１０ｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{1}ＨＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ ＣＤＣｌ$_{3}$）δ ６．６９（ｓ，１Ｈ），５．１３４（ｄ，Ｊ＝８Ｈｚ，１Ｈ），４．７６（ｓ，１Ｈ），４．２４（ｓ，１Ｈ），３．７５（ｓ，３Ｈ），２．８８－２．９４（ｍ，１Ｈ），２．０３－２．５１（ｍ，２Ｈ），１．２６（ｓ，９Ｈ）．

【０７２７】

ステップ６．（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸メチルの合成

３つの反応を並行して行った。[（Ｓ，Ｓ）－（Ｍｅ－ＤｕＰＨＯＳ）－Ｒｈ（ＣＯＤ）]ＢＦ$_{4}$（２．３６ｇ、３．８９ｍｍｏｌ）を、ＭｅＯＨ（２５０ｍＬ）中の（３Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３－ヒドロキシシクロペンター１－エン－１－カルボン酸メチル（５０ｇ、１９４ｍｍｏｌ）の脱気溶液に加えた。反応混合物を水素化ボンベ（ｂｏｍｂ）に移し、Ｎ$_{2}$、次いで、Ｈ$_{2}$でパージした後、２ＭＰａの水素圧を加え、反応物を２５℃で１４時間攪拌した。圧力を解放し、ボンベをＮ$_{2}$でパージした。反応混合物の濃縮により残渣を得、ＤＣＭ（５００ｍＬ）中に溶解した。攪拌しながらシリカ（１５０ｇ）を加えて反応から触媒を除去し、有機溶液を濾過し、濃縮して、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸メチル（１５０ｇ、５０１ｍｍｏｌ）を得た。ＨＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ ＣＤＣｌ$_{3}$）δ ４．８１（ｓ，１Ｈ），４．２８（ｓ，１Ｈ），３．６７（ｓ，３Ｈ），３．０８－３．１５（ｍ，１Ｈ），２．０７－２．２７（ｍ，１Ｈ），２．０２－２．０５（ｍ，２Ｈ），１．８４－１．８６（ｍ，２Ｈ），１．４４（ｓ，９Ｈ）．

【０７２８】

ステップ７．（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

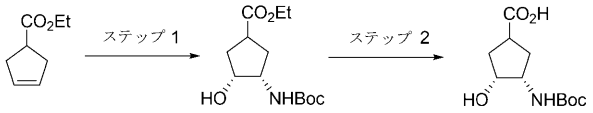
ＭｅＯＨ（２００ｍＬ）及びＨ$_{2}$Ｏ（２００ｍＬ）中の（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸メチル（１７０ｇ、６５５ｍｍｏｌ）の溶液に、ＬｉＯＨ．Ｈ$_{2}$Ｏ（３３．０ｇ、７８６ｍｍｏｌ）を２０℃で加え、懸濁液を２０℃で１２時間攪拌した。真空濃縮した後、溶液のｐＨをクエン酸で４に調整し、酢酸エチル（１００．０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１０．０ｍＬ）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を石油エーテル：ＭＴＢＥ ３：１（２００ｍＬ）により２０℃で３０分間トリチュレートして、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸（９３．５ｇ、３７９ｍｍｏｌ）を得た。母液をカラムクロマトグラフィー（ＳｉＯ$_{2}$、石油エーテル／酢酸エチル ５／１から０／１）によって精製して、さらに（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸（１８．０ｇ、７２．９ｍｍｏｌ）を得た。^{1}ＨＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ ＣＤＣｌ$_{3}$）δ ５．１１（ｓ，１Ｈ），４．２５（ｓ，１Ｈ），４．００（ｓ，１Ｈ），３．１１（ｓ，１Ｈ），２．２４－２．３２（ｍ，１Ｈ），１．９１－２．０９（ｍ，２Ｈ），１．８２－１．８８（ｓ，１Ｈ），１．４３（ｓ，９Ｈ）．

【０７２９】

実施例７

（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸

【化７４５】



ステップ１．（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

ｎ－プロパノール（６９０ｍＬ）中のＢｏｃＮＨ$_2$（９８．４ｇ、８４０ｍｍｏｌ）の混合物に、ＮａＯＨ（０．５Ｍｉｎ水、９４９ｍＬ）、次亜塩素酸ｔｅｒｔ－ブチル（８８．２３ｇ、８１３ｍｍｏｌ）を２５℃で加えた。混合物を２５℃で３０分間撹拌した。ｎ－プロパノール（４５０ｍＬ）中のシクロペンター３－エン－１－カルボン酸エチル（３８．０ｇ、２７１ｍｍｏｌ）及び（ＤＨＱＤ）$_2$ＡＱＮ（４．４５ｇ、５．４２ｍｍｏｌ）の溶液、続いて、ＮａＯＨ水溶液（０．５Ｍ、１５２ｍＬ）中のＫ$_2$［ＯｓＯ$_2$（ＯＨ）$_4$］（２．００ｇ、５．４２ｍｍｏｌ）を２５℃で加えた。混合物を２５℃で１２時間撹拌した。混合物をＨ$_2$Ｏ（２．００Ｌ）中に撹拌しながら注いだ。水相を酢酸エチル（１．００Ｌ＊３）で抽出した。合わせた有機相をＮａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（ＳｉＯ$_2$、石油エーテル：酢酸エチル　３０：１から０：１）によって精製し、フラクションを減圧下で濃縮した。粗生成物を分取ＨＰＬＣによって精製した。合わせたフラクションを濃縮し、ｐＨを飽和ＮａＨＣＯ$_3$水溶液で７に調整した。溶液を酢酸エチル（１．００Ｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５００ｍＬ＊２）で洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（４２．０ｇ、１５２ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＣＤＣｌ$_3$）　δ　４．８９　（ｄ，　Ｊ　＝　６．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２８　（ｓ，　１Ｈ），　４．２０　－　４．０８　（ｍ，　２Ｈ），　４．０５　－　３．９０　（ｍ，　１Ｈ），　３．１４　－　３．０１　（ｍ，　１Ｈ），　２．２７　－　２．２０　（ｍ，　１Ｈ），　２．１５　－　１．９８　（ｍ，　２Ｈ），　１．８９　－　１．８１　（ｍ，　１Ｈ），　１．４５（ｓ，　９Ｈ），　１．３２　－　１．２１　（ｍ，　３Ｈ）．

【０７３０】

ステップ２．（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

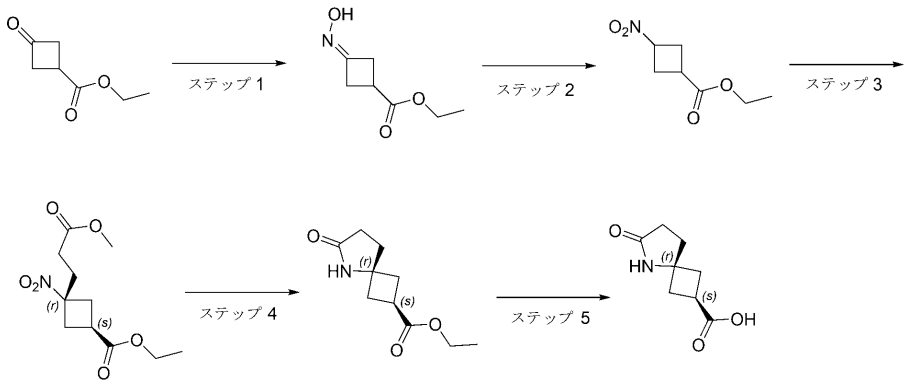
このステップは、実施例６のステップ７と同様に行った。

【０７３１】

実施例８

（２ｓ，４ｒ）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸及び（２ｒ，４ｓ）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸

【化７４６】



ステップ１．３－（ヒドロキシイミノ）シクロブタン－１－カルボン酸エチルの合成
ＥｔＯＨ（１．５０Ｌ）中の３－オキソシクロブタン－１－カルボン酸エチル（１５０ｇ、１．０６ｍｏｌ）の溶液に、NH_2OH ・ＨＣｌ（９０．０ｇ、１．３０ｍｏｌ）及び$NaOAc$（１０６ｇ、１．２９ｍｏｌ）を２０℃で加えた。反応混合物を９０℃まで加熱し、９０℃で１５時間撹拌した。反応混合物を濾過し、濾液を減圧下で濃縮した。残渣をH_2O（１．００Ｌ）で希釈し、酢酸エチル（１．００Ｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５００ｍＬ＊３）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、石油エーテル：酢酸エチル３０：１から１：１）によって精製して、３－（ヒドロキシイミノ）シクロブタン－１－カルボン酸エチル（１５５ｇ、９８６ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。^1H ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ ８．３６（ｂｒ ｓ，１Ｈ），４．１８（ｑ，Ｊ＝７．２ Ｈｚ，２Ｈ），３．２１－３．１６（ｍ，５Ｈ），１．２８（ｔ，Ｊ＝７．２ Ｈｚ，３Ｈ）．

【０７３２】

ステップ２．３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸エチルの合成
２つのバッチを並行して実施した。アセトニトリル（６００ｍＬ）中の３－（ヒドロキシイミノ）シクロブタン－１－カルボン酸エチル（１００ｇ、６３６ｍｍｏｌ）の混合物に、Na_2HPO_4（４５２ｇ、３．１８ｍｏｌ）及び過酸化水素尿素（９１．５ｇ、９７３ｍｍｏｌ）を２０℃で加え、次いで、混合物にアセトニトリル（４００ｍＬ）中のＴＦＡＡ（２６６ｍＬ、１．９１ｍｏｌ）の溶液を３０～４０℃で滴下した。混合物を８０℃まで加熱し、８０℃で１時間撹拌した。２つのバッチを一緒にワークアップした。反応混合物をH_2O（３．００Ｌ）中に注ぎ、酢酸エチル（１．５０Ｌ＊２）で抽出した。合わせた有機層をNa_2SO_3溶液（１０％、１．５０Ｌ＊２）、ブライン（１．００Ｌ＊２）によって洗浄し、減圧下で濃縮して、３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸エチル（１３０ｇ、７５１ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^1H ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ ５．１１－４．８２（ｍ，１Ｈ），４．２２－４．１６（ｍ，２Ｈ），３．４４－３．２５（ｍ，１Ｈ），２．９７－２．８０（ｍ，４Ｈ），１．３２－１．２５（ｍ，３Ｈ）．

【０７３３】

ステップ３．（１ｓ，３ｒ）－３－（３－メトキシ－３－オキソプロピル）－３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸エチルの合成
アセトニトリル（１．２０Ｌ）中の３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸エチル（１２０ｇ、６９３ｍｍｏｌ）の混合物に、アクリル酸メチル（２４６ｍＬ、２．７３ｍｏｌ）及びＤＢＵ（１０４ｍＬ、６９３ｍｍｏｌ）を０～１０℃で滴下した。混合物を２０℃まで温め、２時間撹拌した。反応混合物をNH_4Cl水溶液（１０％、３．００Ｌ）でクエンチし、酢酸エチル（２．００Ｌ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１．５０Ｌ＊２）によって洗浄し、減圧下で濃縮し、残渣を分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｗｅｌｃｈ Ｕｌｔｉｍａｔｅ ＸＢ－ＣＮ ２５０＊５０ｍｍ、１０μｍ；移動相Ａ：ヘキサン、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；グラジエント：７％Ｂアイソクラティック）によって精製して、（１ｓ，３ｒ）－３－（３－メトキシ－３－オキソプロピル）－３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸エチル

【０７３４】

（３８．０ｇ）を黄色の油状物として得た。^1H ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ ４．２１－４．１２（ｍ，２Ｈ），３．６９（ｓ，３Ｈ），３．２６－３．１８（ｍ，１Ｈ），３．０９－３．０３（ｍ，２Ｈ），２．６４－２．５９（ｍ，２Ｈ），２．４８－２．４４（ｍ，２Ｈ），２．３１－２．２７（ｍ，２Ｈ），１．２８（ｔ，Ｊ＝７．２ Ｈｚ，３Ｈ）．

【０７３５】

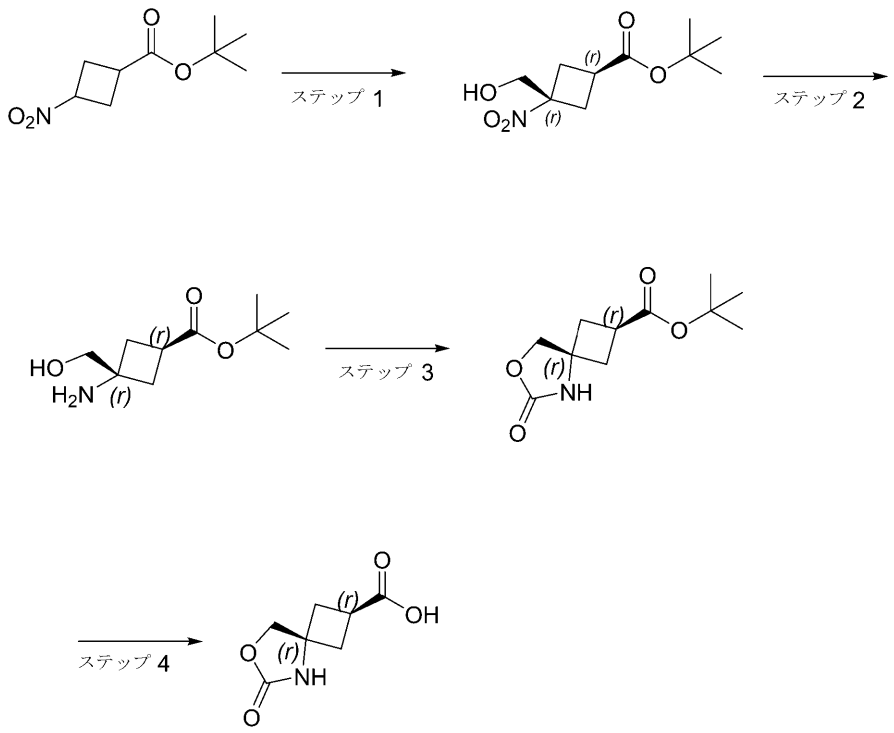
ステップ４．（２ｓ，４ｒ）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－

カルボン酸エチルの合成
ＥｔＯＨ（５７０ｍＬ）中の化合物（１ｓ，３ｒ）－３－（３－メトキシ－３－オキソプロピル）－３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸エチル（３８．０ｇ、１４７ｍｍｏｌ）の混合物に、酢酸（８３．８ｍＬ、１．４７ｍｏｌ）を２０℃で加え、次いで、鉄粉（４０．９ｇ、７３３ｍｍｏｌ）を混合物に５０℃で少しずつ加えた。混合物を５０℃で１２時間攪拌した。混合物を２５℃まで冷却した。混合物にH_2O（５００ｍＬ）を加え、濾過した。濾液を濃縮してＥｔＯＨを除去した。次いで、混合物を酢酸エチル（５００ｍＬ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５００ｍＬ＊２）、$NaHCO_3$水溶液（１０％、５００ｍＬ）、ブライン（５００ｍＬ＊２）で洗浄し、減圧下で濃縮して、（２ｓ，４ｒ）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸エチル（２５．０ｇ、１２７ｍｍｏｌ）を黄色の固体として得た。^1H ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ８．１５（ｓ，１Ｈ），４．１０ － ４．０２（ｍ，２Ｈ），３．０４ － ２．９９（ｍ，１Ｈ），２．４１ － ２．３２（ｍ，４Ｈ），２．１１ － ２．０９（ｍ，２Ｈ），２．０４ － １．９１（ｍ，２Ｈ），１．２０ － １．１６（ｍ，３Ｈ）．

【０７３６】
ステップ５．（２ｓ，４ｒ）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸の合成
ＭｅＯＨ（２２５ｍＬ）中の化合物（２ｓ，４ｒ）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸エチル（２５．０ｇ、１２７ｍｍｏｌ）の混合物に、H_2O（７５．０ｍＬ）中のＮａＯＨ（１５．２ｇ、３８０ｍｍｏｌ）の溶液を加えた。混合物を２０℃で１２時間攪拌した。混合物のｐＨをＨＣｌ（４Ｎ）で４に調整した。溶液を濃縮してＭｅＯＨを除去し、次いで、混合物を濾過し、濾過ケーキを真空で乾燥させた（部分１）。濾液を濃縮した。残渣にＭｅＯＨ（１００ｍＬ）を加え、懸濁液を濾過した。濾液を濃縮し、残渣を分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｐｈｅｎｏｍｅｎｅｘ Ｌｕｎａ Ｃ１８（２５０＊８０ｍｍ＊１５μｍ）；移動相Ａ：水；移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：２０分かけて１％－２０％Ｂ）によって精製して、さらなる生成物 （部分２）を得た。部分１及び部分２を合わせ、（２ｓ，４ｒ）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（１５．５ｇ、９１．４ｍｍｏｌ）を黄色の非晶質固体として得た。^1H ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ １２．１７（ｓ，１Ｈ），７．９８（ｓ，１Ｈ），２．７９ － ２．７０（ｍ，１Ｈ），２．２９ － ２．２０（ｍ，４Ｈ），２．１４ － ２．０８（ｍ，４Ｈ）．

【０７３７】
実施例９
（２ｒ，４ｒ）－６－オキソ－７－オキサ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸

【化７４７】



ステップ１．（１ｒ，３ｒ）－３－（ヒドロキシメチル）－３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

アセトニトリル（８１０ｍＬ）中の３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（８１．０ｇ、４０３ｍｍｏｌ）の溶液に、（ＨＣＨＯ）ｎ（４８．６ｇ）を２５℃で加えた。混合物に、ＴＥＡ（５７．２ｍＬ、４１１ｍｍｏｌ）を０℃で滴下した。混合物を２５℃で１２時間攪拌した。混合物を水（２．００Ｌ）中に注ぎ、酢酸エチル（１．００Ｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１．００Ｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、石油エーテル／酢酸エチル１／０から１０／１）によって精製して、（１ｒ，３ｒ）－３－（ヒドロキシメチル）－３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２２．４ｇ、９６．８ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。他方の異性体は、（１ｓ，３ｓ）－３－（ヒドロキシメチル）－３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（４９．２ｇ、２１３ｍｍｏｌ）である。

【０７３８】

（１ｒ，３ｒ）－３－（ヒドロキシメチル）－３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル ^{1}Ｈ ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ ４．１０（ｄ，Ｊ ＝ ６．４ Ｈｚ，２Ｈ），３．２７ － ３．１６（ｍ，１Ｈ），３．０３ － ２．９３（ｍ，２Ｈ），２．６８ － ２．５８（ｍ，２Ｈ），２．２６（ｔ，Ｊ ＝ ６．６ Ｈｚ，１Ｈ），１．４７（ｓ，９Ｈ）．

【０７３９】

（１ｓ，３ｓ）－３－（ヒドロキシメチル）－３－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル ^{1}Ｈ ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ ４．０３（ｄ，Ｊ ＝ ６．４ Ｈｚ，２Ｈ），３．００ － ２．９１（ｍ，２Ｈ），２．８８ － ２．７８（ｍ，１Ｈ），２．６４ － ２．５６（ｍ，２Ｈ），２．４１（ｔ，Ｊ ＝ ６．６ Ｈｚ，１Ｈ），１．４６（ｓ，９Ｈ）．

【０７４０】

ステップ２．（１ｒ，３ｒ）－３－アミノ－３－（ヒドロキシメチル）シクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

イソプロパノール（４００ｍＬ）中の（１ｒ，３ｒ）－３－（ヒドロキシメチル）－３

－ニトロシクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３８．５ｇ、１６６ｍｍｏｌ）の混合物に、ラネーニッケル（８．００ｇ）をN_2下にて２５℃で加えた。混合物を真空下で脱気し、H_2で３回パージした。混合物を７０℃まで加熱し、H_2（５０ｐｓｉ）下にて７０℃で１２時間撹拌した。混合物を濾過し、濾液を濃縮して、（１ｒ，３ｒ）－３－アミノ－３－（ヒドロキシメチル）シクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３３．０ｇ、粗製）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ　３．４７（ｓ，２Ｈ），３．１３－２．９８（ｍ，１Ｈ），２．３２－２．２７（ｍ，２Ｈ），２．０９－１．９６（ｍ，２Ｈ），１．４３（ｓ，９Ｈ）．

【０７４１】

ステップ３．（２ｒ，４ｒ）－６－オキソ－７－オキサ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＴＨＦ（３３０ｍＬ）中の化合物（１ｒ，３ｒ）－３－アミノ－３－（ヒドロキシメチル）シクロブタン－１－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３３．０ｇ、１６４ｍｍｏｌ）の溶液に、ＴＥＡ（４８．７ｍＬ、３５０ｍｍｏｌ）を２５℃で加えた。混合物に、ＴＨＦ（１２０ｍＬ）中のトリホスゲン（１７．３ｇ、５８．４ｍｍｏｌ）の溶液を－１０℃で滴下し、混合物を－１０℃で０．５時間撹拌した。反応混合物を２５℃まで温め、２時間撹拌した。混合物を冷水（１．５０Ｌ）中に注ぎ、酢酸エチル（１．００Ｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１．００Ｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、石油エーテル／酢酸エチル　１／０から５／１）によって精製して、（２ｒ，４ｒ）－６－オキソ－７－オキサ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２７．６ｇ、１２１ｍｍｏｌ）を薄黄色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ　６．７８（ｓ，１Ｈ），４．４７（ｓ，２Ｈ），２．９０－２．８４（ｍ，１Ｈ），２．６６－２．５６（ｍ，２Ｈ），２．５１－２．４４（ｍ，２Ｈ），１．４６（ｓ，９Ｈ）．

【０７４２】

ステップ４．（２ｒ，４ｒ）－６－オキソ－７－オキサ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸の合成

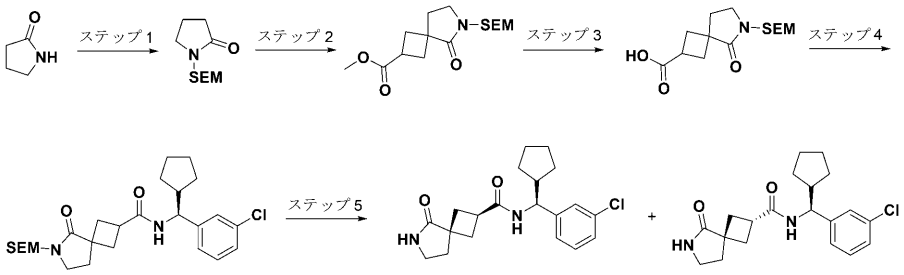
（２ｒ，４ｒ）－６－オキソ－７－オキサ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２５．６ｇ、１１３ｍｍｏｌ）にＴＦＡ（２５０ｍＬ、３．３８ｍｏｌ）を０℃で加えた。混合物を２５℃で６時間撹拌した。反応混合物を濃縮した。残渣を石油エーテル／酢酸エチル　１／１（１００ｍＬ）により２５℃で０．５時間トリチュレートした。混合物を濾過し、濾過ケーキを真空下で乾燥させた。固体に水（２５０ｍＬ）を加え、凍結乾燥して、（２ｒ，４ｒ）－６－オキソ－７－ｏｘａ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（１８．０ｇ、９９．６ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ　１２．２７（ｂｒ　ｓ，１Ｈ），８．２１（ｓ，１Ｈ），４．２８（ｓ，２Ｈ），２．９４－２．８０（ｍ，１Ｈ），２．４８－２．３６（ｍ，４Ｈ）．

【０７４３】

実施例１０

（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－オキソ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド及び（２ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－オキソ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド

【化７４８】



ステップ１．１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）ピロリジン－２－オンの合成

ＴＨＦ（１００ｍＬ）中のピロリジン－２－オン（５ｇ、０．０５９ｍｏｌ）の混合物に、ＮａＨ（１．６９ｇ、０．０７ｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で少しずつ加えた。混合物を０℃で１時間撹拌した後、（２－（クロロメトキシ）エチル）トリメチルシラン（１１．８ｇ、０．０７ｍｏｌ）を０℃で滴下した。混合物を室温で１時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液）でクエンチし、水相を酢酸エチル（１５０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をシリカゲルクロマトグラフィー（１００ｇカラム；石油エーテル：酢酸エチル　５：１による溶出）によって精製して、１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）ピロリジン－２－オン（４．０ｇ、０．０１９ｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　４．５９　（ｓ，　２Ｈ），　３．５０－３．３４　（ｍ，　４Ｈ），　２．２８　（ｔ，Ｊ　＝　８．０　Ｈｚ，　２Ｈ），　２．０４－１．８２　（ｍ，　２Ｈ），　０．９２－０．７９　（ｍ，　２Ｈ），　０．００　（ｓ，　９Ｈ）．

【０７４４】

ステップ２．５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチルの合成

ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）ピロリジン－２－オン（５．０ｇ、０．０２３ｍｏｌ）の混合物に、ＬＤＡ（２４．４ｍＬ、ＴＨＦ中２Ｍ、０．０４９ｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で１時間撹拌した後、３－ブロモ－２－（ブロモメチル）プロパン酸メチル（６．０ｇ、０．０２３ｍｏｌ）を－７８℃で滴下した。次いで、混合物を室温で１時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液）でクエンチし、水相を酢酸エチル（１００ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、Ｂ：Ａアセトニトリル；グラジエント：３０％から８０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍによって精製して、５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチル（２００ｍｇ、０．６４ｍｍｏｌ）を得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．２０２分、$[M+H]^+$　３１４．２、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７４５】

ステップ３．５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸の合成

ＭｅＯＨ／H_2O（１：１、３ｍＬ）中の５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチル（１９０ｍｇ、０．６１ｍｍｏｌ）及びＮａＯＨ（７２．７ｍｇ、１．８２ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間撹拌した。真空濃縮により、５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸のナトリウム塩（１６０ｍｇ、０．５０ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　Ｒ

Ｔ　０．６５５分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３００．２、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０７４６】

ステップ４．（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（３ｍＬ）中の５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（１５０ｍｇ、５０１μｍｏｌ）、（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（１０５ｍｇ、５０１μｍｏｌ）、ＤＩＥＡ（１９４ｍｇ、１．５０ｍｍｏｌ）及びＨＡＴＵ（３８１ｍｇ、１．００ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（３０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｘｓｅｌｅｃｔ　ＣＳＨ　Ｃ１８　ＯＢＤ　Ｃｏｌｕｍｎ　３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（０．０５％ＴＦＡ）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：６６％Ｂから７５％Ｂで９分、次いで、７５％Ｂ；波長：２５４／２２０ｎｍ；ＲＴ：７．１５分）によって精製して、（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（７０ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４０２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４９１．４０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０７４７】

ステップ５．（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－オキソ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド及び（２ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－オキソ－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

【０７４８】

ＴＦＡ（２ｍＬ）中の（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－オキソ－６－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－６－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１０ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間撹拌した。混合物を真空濃縮した。次いで、残渣をＭｅＯＨ（１ｍＬ）中に溶解した。エチレンジアミン（６１ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）を加え、溶液を８０℃で２時間撹拌した。真空濃縮した後、得られた粗製材料を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：２０％Ｂ；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：９．１５；ＲＴ２（分）：１４．２３；試料溶媒：ＥｔＯＨ；注入量：１．３５ｍＬ）によって精製し、キラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＤＺ－ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＤ－３、４．６＊５０ｍｍ、３．０μｍ；移動相：ヘキサン：ＥｔＯＨ　８０：２０；流量：１ｍＬ／分；グラジエント：アイソクラティック；注入量：５ｍＬ）によってさらに精製して、１つの異性体（１ｍｇ、３μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４９６分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３６１．２、ＬＣＭＳ方法Ｆ；１Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ）　δ　１．０８　（ｄｑ，　Ｊ　＝　１７．０，　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．２７　（ｄ，　Ｊ　＝　２４．３　Ｈｚ，　３Ｈ），　１．３７－１．６７　（ｍ，　５Ｈ），　１．８０　（ｓ，　１Ｈ），　１．９５－２．０７　（ｍ，２Ｈ），　２．３１　（ｐ，　Ｊ　＝　８．８　Ｈｚ，　２Ｈ），　２．５０　（ｓ，　１Ｈ），　２．５２　（ｓ，　１Ｈ），　２．７４　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１４．４，　３．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．０４－３．１７　（ｍ，　２Ｈ），　４．５８　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．５，　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．３６　（ｓ，　１Ｈ），　５．５９　（ｓ，　１Ｈ），　７．２４－７．３８　（ｍ，　３Ｈ），　７．４５　（ｄ，　Ｊ　＝　１．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６１　（ｓ，　１Ｈ），　８．４９　（ｄ，　Ｊ　＝　８．７　Ｈｚ，　１Ｈ）．　他方の異性体（１ｍｇ、３μｍｏｌ）もまたオフホワイト色の非晶質固

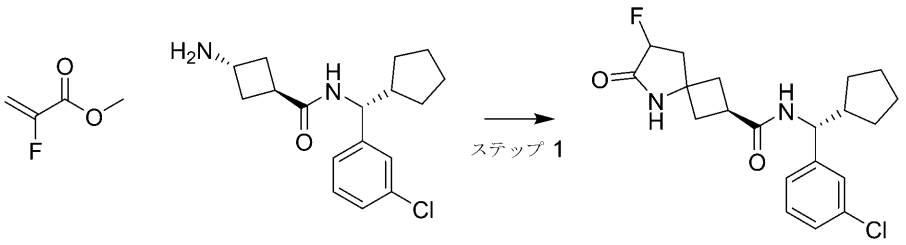
体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４９７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３６１．２、ＬＣＭＳ方法Ｆ；１Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ）　δ　１．１０　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１２．５，　８．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．２７　（ｄｔ，　Ｊ　＝　２０．７，　６．５　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．３７－１．７６　（ｍ，　５Ｈ），　１．８３　（ｓ，　１Ｈ），　２．０１　（ｔｄ，　Ｊ　＝　１５．５，　１４．９，　１０．７　Ｈｚ，　２Ｈ），　２．１３－２．４　（ｍ，　２Ｈ），　２．５０　（ｓ，　１Ｈ），　２．５２　（ｓ，　１Ｈ），　２．７３　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１４．４，　３．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．０１－３．１７　（ｍ，　２Ｈ），　４．５５　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．５，　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．３５　（ｓ，　１Ｈ），　５．６１　（ｓ，　１Ｈ），　７．２３－７．３８　（ｍ，　３Ｈ），　７．４４　（ｄ，　Ｊ　＝　１．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６０　（ｓ，　１Ｈ），　８．５０　（ｄ，　Ｊ　＝　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ）．

【０７４９】

実施例１１

Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－フルオロ－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド

【化７４９】



ステップ１．Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－フルオロ－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

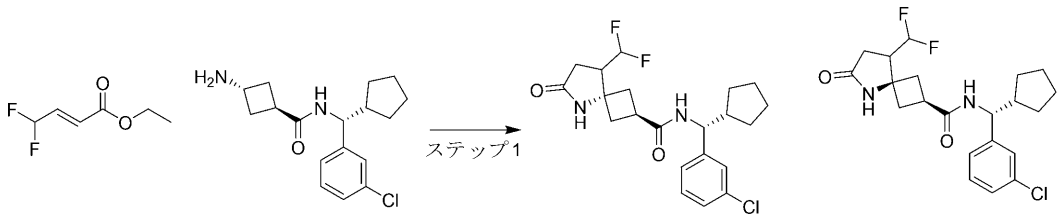
４ｍＬバイアルに、（１ｒ，３Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）シクロブタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）、テトラブチルアンモニウムアジド（４．６ｍｇ、１６μｍｏｌ）、４ＣｚＩＰＮ（１．３ｍｇ、１．６μｍｏｌ）、及びCs_2CO_3（５３ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）を加えた。バイアルに栓をし、窒素でパージした。アセトニトリル（１．１ｍＬ）を加えた。バイアルを窒素でパージし、パージしながら、２－フルオロアクリル酸メチル（１５μＬ、０．１６ｍｍｏｌ）をシリンジで加えた。次いで、反応物をＭｅｒｃｈ光反応器内に１００％の光強度で１６時間置いた。溶液を濃縮し、ＡｃｃＱ分取システムに入れ、３０～６０％水（０．１％ギ酸含有）で溶出して、Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－フルオロ－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（３．３ｍｇ、８．７μｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４４分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３７９．２３、ＬＣＭＳ方法Ｋ。

【０７５０】

実施例１２

（２ｒ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－８－（ジフルオロメチル）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド及び（２ｓ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－８－（ジフルオロメチル）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド

【化７５０】



ステップ１．（２ｒ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－８－（ジフルオロメチル）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド及び（２ｓ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－８－（ジフルオロメチル）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

８ｍＬバイアルに、（１ｒ，３Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）シクロブタン－１－カルボキサミド（１５０ｍｇ、４８９μｍｏｌ）を加え、ＭｅＯＨ中のCs_2CO_3（１５９ｍｇ、４８９μｍｏｌ）とともに１時間撹拌した後、Cs_2CO_3を濾去し、物質を遊離塩基に変換した。テトラブチルアンモニウムアジド（１３．９ｍｇ、４８．９μｍｏｌ）及び４ＣｚＩＰＮ（３．８６ｍｇ、４．８９μｍｏｌ）を加えた。バイアルに栓をし、窒素でパージし、アセトニトリル（２ｍＬ）中に溶解した。バイアルを窒素でパージし、パージしながら、（Ｅ）－４，４－ジフルオロブタ－２－エン酸エチル（６６．５μＬ、４８９μｍｏｌ）をシリンジで加えた。次いで、反応物をＭｅｒｃｈ光反応器内に１００％の光強度で８時間置いた。反応物を濃縮し、バイアルをＡｃｃＱ分取システムに入れ、２０～５０％水（０．１％ギ酸含有）で溶出して、（２ｒ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－８－（ジフルオロメチル）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド及び（２ｓ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－８－（ジフルオロメチル）－６－オキソ－５－アザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの両方をオフホワイト色の固体として得た。ピーク１：４．２ｍｇ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．５１分、$[M+H]^+$　４１１．３４、ＬＣＭＳ方法Ｋ。

【０７５１】

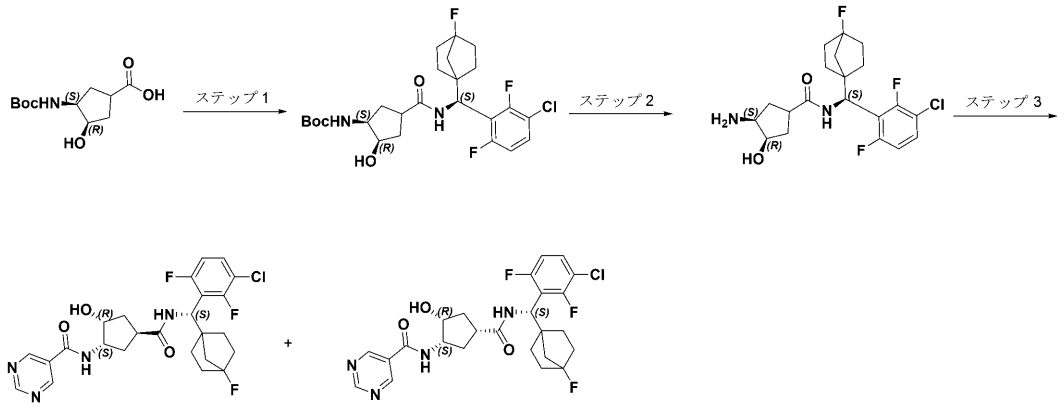
ピーク２：５ｍｇ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．５３分、$[M+H]^+$　４１１．３４、ＬＣＭＳ方法Ｋ。

【０７５２】

実施例１３

Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミド及びＮ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミド

【化７５１】



ステップ１．（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

丸底フラスコに、（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸（１１０ｍｇ、４４９μｍｏｌ）、（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタンアミン（１３０ｍｇ、４４９μｍｏｌ）、Ｔ３Ｐ（２５６ｍｇ、６７３μｍｏｌ）、ＴＥＡ（１１３ｍｇ、１．３５ｍｍｏｌ）及び攪拌子を入れた。ＤＭＦ（１ｍＬ）を加え、溶液を２５℃で１時間攪拌した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチルで３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を次の条件：カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍによる逆相フラッシュクロマトグラフィーによって精製した。凍結乾燥により、（（１Ｓ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１５０ｍｇ、２９０μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０９４分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５１７、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０７５３】

ステップ２．（３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

丸底フラスコに、（（１Ｓ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１．５ｇ、２．９ｍｍｏｌ）及び攪拌子を入れた。ＨＣｌ（１５ｍＬ、ＭｅＯＨ中４モル、６０ｍｍｏｌ）を加え、溶液を２５℃で３０分間攪拌した。真空濃縮により、（３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１．０ｇ、２ｍｍｏｌ、粗製）を白色の固体として得た。ワークアップは実施しなかった。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８９８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４１７．２５、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０７５４】

ステップ３．Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミド及びＮ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバ

モイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミドの合成
ＤＭＦ（５ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（３５０ｍｇ、８４０μｍｏｌ）、ピリミジン－５－カルボン酸（１０４ｍｇ、８４０μｍｏｌ）、$NaHCO_3$（２１２ｍｇ、２．５２ｍｍｏｌ）及びＨＡＴＵ（６３８ｍｇ、１．６８ｍｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間攪拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水；移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：４０％から６０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍによって精製して、Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミド（３３５ｍｇ、７６．３％）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８４２分、$[M+H]^+$　５２３、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７５５】

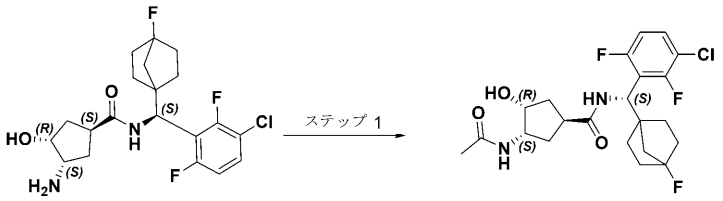
得られた物質をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫＩＦ３；移動相Ａ：ヘキサン（０．２％ＤＥＡ）；Ｂ：ＭｅＯＨ：ＤＣＭ　１：１）グラジエント：７５：２５アイソクラティック；流量：１ｍＬ／分；注入量：３ｍＬ）によって精製した。凍結乾燥により、一方の異性体（１２ｍｇ、２３μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として、他方の異性体（１５ｍｇ、２９μｍｏｌ、６０％）もまたオフホワイト色の非晶質固体として得た。ピーク１：^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　９．２９　（ｄ，　Ｊ　＝　１．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　９．１７　（ｄ，　Ｊ　＝　１．１　Ｈｚ，　２Ｈ），　８．４３　（ｄ，　Ｊ　＝　７．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．２６　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５７　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．７，　５．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１５　（ｔ，　Ｊ　＝　９．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．２９　（ｄ，　Ｊ　＝　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．８８　（ｄ，　Ｊ　＝　３．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２０　－　４．１２　（ｍ，　１Ｈ），　４．１０　（ｄ，　Ｊ　＝　３．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．１７　（ｄｔ，　Ｊ　＝　１３．０，　６．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．０６　－　１．８８　（ｍ，　２Ｈ），　１．８６　－　１．６１　（ｄ，　Ｊ　＝　８．４　Ｈｚ，　１０Ｈ），　１．４７　（ｄ，　Ｊ　＝　８．３　Ｈｚ，　２Ｈ）．ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．３９８分、$[M+H]^+$　５２３、ＬＣＭＳ方法Ｄ。ピーク２：^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　９．２８　（ｓ，　１Ｈ），　９．１５　（ｓ，　２Ｈ），　８．４２　（ｄ，　Ｊ　＝　７．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．２６　（ｄ，　Ｊ　＝　８．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５７　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．６，　５．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１５　（ｔｄ，　Ｊ　＝　９．５，　１．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．２８　（ｄ，　Ｊ　＝　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．８８　（ｄ，　Ｊ　＝　３．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１９　－　４．０８　（ｍ，　２Ｈ），　３．２１　－　３．１３　（ｍ，　１Ｈ），　１．９６　－　１．６８　（ｍ，　１１Ｈ），　１．６１　（ｄ，　Ｊ　＝　８．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．４７　（ｄ，　Ｊ　＝　８．９　Ｈｚ，　２Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４０４分、$[M+H]^+$　５２３、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０７５６】

実施例１４

（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７５２】



ステップ１．（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

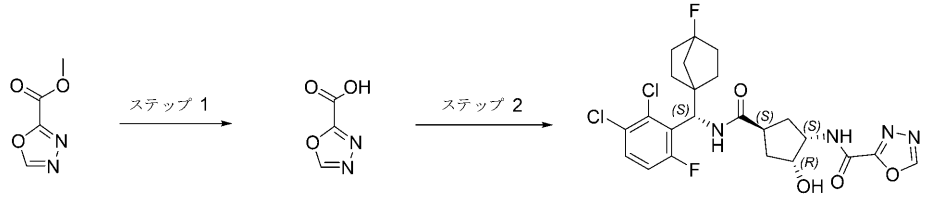
丸底フラスコに、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１．４５ｇ、３．４８ｍｍｏｌ）、酢酸（２０９ｍｇ、３．４８ｍｍｏｌ）、$NaHCO_3$（１．４６ｇ、１７．４ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（２．６４ｇ、６．９６ｍｍｏｌ）及び撹拌子を入れた。ＤＭＦ（１５ｍＬ）を加え、溶液を室温で１時間撹拌した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＬｕｘＣｅｌｌｕｌｏｓｅ－３４．６＊１００ｍｍ、３μｍ；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：ＭｅＯＨ（０．５％　２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）；流量：４ｍＬ／分；グラジエント：２０％Ｂアイソクラティック）によって精製して、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１．３４ｇ、２．９３ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　８．２２　（ｄ，Ｊ＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６１－７．４８　（ｍ，　２Ｈ），　７．１９－７．０９　（ｍ，　１Ｈ），　５．２６　（ｄ，Ｊ＝　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．７８　（ｄ，Ｊ＝　３．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９６－３．８５　（ｍ，　２Ｈ），　３．１５－３．０３　（ｍ，　１Ｈ），　１．８２　（ｄ，Ｊ＝　５．０　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．８１　（ｓ，　３Ｈ），　１．７５　（ｄｄｄ，Ｊ＝　２１．１，　１１．５，　８．１　Ｈｚ，　８Ｈ），　１．５９　（ｄ，Ｊ＝　８．８　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．４５　（ｄ，Ｊ＝　９．６　Ｈｚ，　２Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８３３分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４５９．０５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７５７】

実施例１５

Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）－１，３，４－オキサジアゾール－２－カルボキサミド

【化７５３】



ステップ１．１，３，４－オキサジアゾール－２－カルボン酸の合成　ＴＨＦ（１ｍＬ）及びH_2O（１ｍＬ）中の１，３，４－オキサジアゾール－２－カルボン酸メチル（２００ｍｇ、１．５６ｍｍｏｌ）の撹拌混合物に、ＬｉＯＨ（７４．８ｍｇ、３．１２ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を窒素下にて２５℃で１時間

撹拌した。混合物をＨＣｌ（水溶液、１Ｍ）でｐＨ７に酸性化した。得られた混合物を減圧下で濃縮して、１，３，４－オキサジアゾール－２－カルボン酸（２６０ｍｇ、２．２８ｍｍｏｌ、粗製）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．１７７分、［Ｍ－Ｈ］$^-$　１１３．０、ＬＣＭＳ方法Ｅ。

ステップ２．Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）－１，３，４－オキサジアゾール－２－カルボキサミドの合成

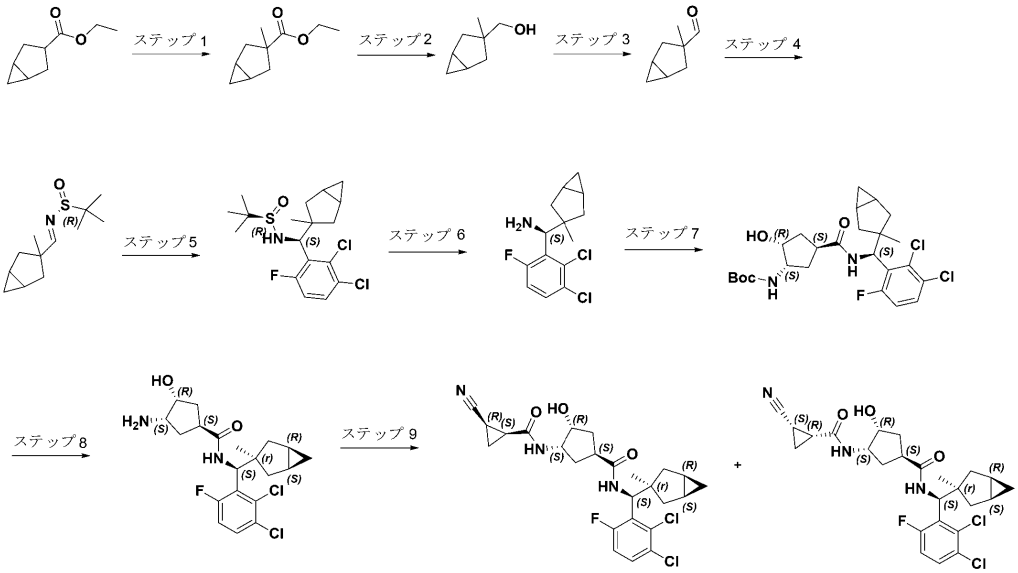
ＤＭＦ（２ｍＬ）中の（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１５０ｍｇ、３４６μｍｏｌ）及び１，３，４－オキサジアゾール－２－カルボン酸（４７．４ｍｇ、４１５μｍｏｌ）の撹拌混合物に、炭酸水素ナトリウム（１４５ｍｇ、１．７３ｍｍｏｌ）及びＨＡＴＵ（３９５ｍｇ、１．０４ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を２５℃で２時間撹拌した。得られた混合物を濾過し、分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｘｂｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、５０＊２５０ｍｍ、１０μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3＋０．０５％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：１００ｍＬ／分；グラジエント：２５％Ｂから５５％Ｂで８分；波長：２５４ｎｍ／２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：９．５８）によって精製して、白色の固体を得た。これを分取キラルＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＧ、３＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン：ＭＴＢＥ　１：１（０．５％　２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＭｅＯＨ；流量：４０ｍＬ／分；グラジエント：２０％Ｂアイソクラティック；波長：２１２／２３０ｎｍ；ＲＴ１（分）：４．６２；ＲＴ２（分）：６．９６；試料溶媒：ＭｅＯＨ；注入量：０．９ｍＬ）によってさらに精製して、Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）－１，３，４－オキサジアゾール－２－カルボキサミド（１４．６ｍｇ、２６．９μｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．８３８分、［Ｍ－Ｈ］$^-$　５２７．１０、ＬＣＭＳ方法Ｅ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（３００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　９．４４　（ｓ，　１Ｈ），　８．５０　（ｄ，　Ｊ　＝　６．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．２６　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６３　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．０，　５．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２８　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．６，　８．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．５２　（ｄ，　Ｊ　＝　８．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．１２　（ｄ，　Ｊ　＝　３．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１１　（ｓ，　２Ｈ），　３．１６　（ｔ，　Ｊ　＝　７．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．０３　－　１．４６　（ｍ，　１４Ｈ）．　^{19}Ｆ　ＮＭＲ　（２８２　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　－１０９．３０４，　－１７３．５４０．

【０７５８】

実施例１６

（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（１Ｒ，２Ｓ）－２－シアノシクロプロパン－１－カルボキサミド）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｒ，３ｒ，５Ｓ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（１Ｓ，２Ｒ）－２－シアノシクロプロパン－１－カルボキサミド）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｒ，３ｒ，５Ｓ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７５４】



ステップ１．３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－カルボン酸エチルの合成

ＴＨＦ（１２０ｍＬ）中の二環式［３．１．０］ヘキサン－３－カルボン酸エチル（９．０ｇ、０．０５８ｍｏｌ）の混合物に、ＬＤＡ（４５ｍｌ、ＴＨＦ中２Ｍ、０．０９ｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で１時間撹拌した後、ＭｅＩ（５ｍＬ、０．０９ｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液、３０ｍｌ）でクエンチした。反応混合物を水（１００ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１００ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮して、３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－カルボン酸エチル（９．０ｇ、０．０５３ｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＧＣＭＳ　ＲＴ　４．１４１分、［Ｍ］　１６８．１、ＧＣ方法Ｚ。

【０７５９】

ステップ２．（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メタノールの合成

ＴＨＦ（１２０ｍＬ）中の３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－カルボン酸エチル（１０ｇ、５９ｍｍｏｌ）の混合物に、$LiAlH_4$（２．３ｇ、５９ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で少しずつ加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。反応物を水（２．３ｍＬ）、ＮａＯＨ（１５％、４．６ｍＬ）及び水（２．３ｍＬ）でクエンチした。反応混合物をセライトパッドに通して濾過した。パッドをＴＨＦ（１００ｍＬ）で洗浄し、濾液を真空濃縮して、（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メタノール（７．０ｇ）を黄色の油状物として得た。ＧＣＭＳ　ＲＴ　３．７６０分、［Ｍ］　１２６．０、ＧＣ方法Ｚ。

【０７６０】

ステップ３．３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－カルバルデヒドの合成

【０７６１】

ＤＣＭ（９０ｍＬ）中の（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メタノール（７．０ｇ、５５．４７ｍｍｏｌ）の混合物に、ＰＣＣ（１３．１５ｇ、６１．０１ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で少しずつ加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。反応混合物を（シリカゲルのパッドを通して）濾過し、パッドをＤＣＭで洗浄した。濾液を減圧下で濃縮して、３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－カルバルデヒド（６．０ｇ）を茶色の油状物として得た。ＧＣＭＳ　ＲＴ　３．４８４分、［Ｍ］　１２４．１、ＧＣ方法Ｚ。

【０７６２】

ステップ４．（Ｒ）－２－メチル－Ｎ－（（Ｅ）－（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチレン）プロパン－２－スルフィンアミドの合成
ＴＨＦ（７５ｍＬ）中の（Ｒ）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（６０００ｍｇ、１当量、４９．５０ｍｍｏｌ）及び３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－カルバルデヒド（６．７６２ｇ、１．１当量、５４．４６ｍｍｏｌ）の溶液に、チタン（ＩＶ）イソプロポキシド（１５．４８ｇ、１６．５ｍＬ、１．１当量、５４．４６ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を５０℃で１６時間加熱した。反応物を水（１００ｍＬ）でクエンチした。反応混合物を（セライトパッドに通して）濾過し、パッドを酢酸エチル（１５０ｍＬ）で洗浄し、濾液を真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；１０％から５０％グラジエントで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍによって精製した。これにより、（Ｒ）－２－メチル－Ｎ－（（Ｅ）－（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチレン）プロパン－２－スルフィンアミド（９．２ｇ、４０ｍｍｏｌ、８２％）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９９７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２２８．１５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７６３】

ステップ５．（Ｒ）－Ｎ－（（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成
ＴＨＦ（２５ｍＬ）中の１，２－ジクロロ－４－フルオロベンゼン（１．７４２ｇ、１０．５６ｍｍｏｌ）の混合物に、ＬＤＡ（６．６ｍｌ、ＴＨＦ中２Ｍ、１３．２ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で１時間撹拌した後、（Ｒ）－２－メチル－Ｎ－（（Ｅ）－（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチレン）プロパン－２－スルフィンアミド（２．０ｇ、８．７９６ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液、１５ｍｌ）でクエンチした。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（５０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２．５ｇ、６．４ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１８３分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３９２、ＬＣＭＳ方法Ａ。

【０７６４】

ステップ６．（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メタンアミンの合成
（Ｒ）－Ｎ－（（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（５．５ｇ、１４ｍｍｏｌ）及びＨＣｌ（１４ｍＬ、ＭｅＯＨ中４モル、５６ｍｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。混合物のｐＨを飽和$NaHCO_3$溶液で７～８に調整した。混合物を酢酸エチル（７０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。これにより、（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メタンアミン（３．８ｇ、１３ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７３８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$２８８．０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７６５】

ステップ７．（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＤＭＦ（４０ｍＬ）中の（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メタンアミン（４ｇ、０．０１ｍｏｌ），（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸（３ｇ、０．０１ｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（８ｇ）及び$NaHCO_3$（３ｇ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（６０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（５．１ｇ、９．９ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０８０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５１５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７６６】

ステップ８．（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｒ，３ｒ，５Ｓ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＭｅＯＨ（２０ｍＬ）中の（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２．０ｇ、３．９ｍｍｏｌ）及びＨＣｌ（１９．４０ｍＬ、ＭｅＯＨ中４Ｎ、７７．６０ｍｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。混合物のｐＨを飽和$NaHCO_3$溶液で７～８に調整した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（７０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮して、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（１Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１．５ｇ、３．６ｍｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７８０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４１５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７６７】

ステップ９．（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（１Ｒ，２Ｓ）－２－シアノシクロプロパン－１－カルボキサミド）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｒ，３ｒ，５Ｓ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（１Ｓ，２Ｒ）－２－シアノシクロプロパン－１－カルボキサミド）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｒ，３ｒ，５Ｓ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｓ，３ｒ，５Ｒ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタンカルボキサミド（４５ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）、（±）－（１Ｓ，２Ｒ）－２－シアノシクロプロパン－１－カルボン酸（１２ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（６２ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（３６ｍｇ、０．４３ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4H

ＣＯ$_3$）＋０．０５％ＮＨ$_4$ＯＨ、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３５％Ｂから６２％Ｂで７分；波長：２５４ｎｍ／２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：７．６４）によって精製して、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（１Ｓ，２Ｒ）－２－シアノシクロプロパン－１－カルボキサミド）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｒ，３ｒ，５Ｓ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（５１ｍｇ、０．１０ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１１８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５０８、ＬＣＭＳ方法Ｂ。この物質をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＥ３；移動相Ａ：ヘキサン（０．２％ジエチルアミン）：（ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１）６０：４０；流量：１ｍＬ／分；グラジエント：アイソクラティック；注入量：８ｍＬ）によってさらに精製して、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（１Ｓ，２Ｒ）－２－シアノシクロプロパン－１－カルボキサミド）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｒ，３ｒ，５Ｓ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－（（１Ｒ，２Ｓ）－２－シアノシクロプロパン－１－カルボキサミド）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（（１Ｒ，３ｒ，５Ｓ）－３－メチルビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの両方をオフホワイト色の非晶質固体として得た。一方の異性体は、１０．５ｍｇ（２０．３μｍｏｌ）であり、他方は、１２．５ｍｇ（２４．０μｍｏｌ）である。異性体１：^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）　δ　８．１２　（ｄ，　Ｊ　＝　７．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．０１　（ｄ，　Ｊ　＝　８．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６０　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．０，　５．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２５　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．７，　８．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．４１　（ｄ，　Ｊ　＝　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．８８　（ｄ，　Ｊ　＝　３．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９８　（ｄｔ，　Ｊ　＝　１４．８，　４．６　Ｈｚ，　２Ｈ），　３．１３　（ｄｔ，　Ｊ　＝　１４．０，　６．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．２３　（ｔｄ，　Ｊ　＝　７．９，　６．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．０２　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．６，　６．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．８６　－　１．５９　（ｍ，　５Ｈ），　１．５２　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１２．８，　５．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．４４　－　１．２１　（ｍ，　６Ｈ），　１．１４　－　１．０２　（ｍ，　３Ｈ），　０．８５　（ｔｄ，　Ｊ　＝　７．９，　４．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　０．１１　（ｑ，　Ｊ　＝　３．９　Ｈｚ，　１Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０９６分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５０８、ＬＣＭＳ方法Ｂ；異性体２：^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）　８．０７　（ｄ，　Ｊ　＝　８．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．９８　（ｄ，　Ｊ　＝　８．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６０　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．０，　５．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２４　（ｔ，　Ｊ　＝　９．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．４１　（ｄ，　Ｊ　＝　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．９３　（ｄ，　Ｊ　＝　３．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１０　－　３．９１　（ｍ，　２Ｈ），　３．１４　（ｄ，　Ｊ　＝　９．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．２６　（ｑ，　Ｊ　＝　７．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．０３　（ｑ，　Ｊ　＝　７．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．８０　（ｑ，　Ｊ　＝　１０．６，　７．９　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．７４　－　１．５８　（ｍ，　３Ｈ），　１．５７　－　１．４５　（ｍ，　１Ｈ），　１．４４　－　１．１８　（ｍ，　６Ｈ），　１．０７　（ｓ，　３Ｈ），　０．８５　（ｓ，　１Ｈ），　０．１０　（ｄ，　Ｊ　＝　４．１　Ｈｚ，　１Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１１５分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５０８、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０７６８】

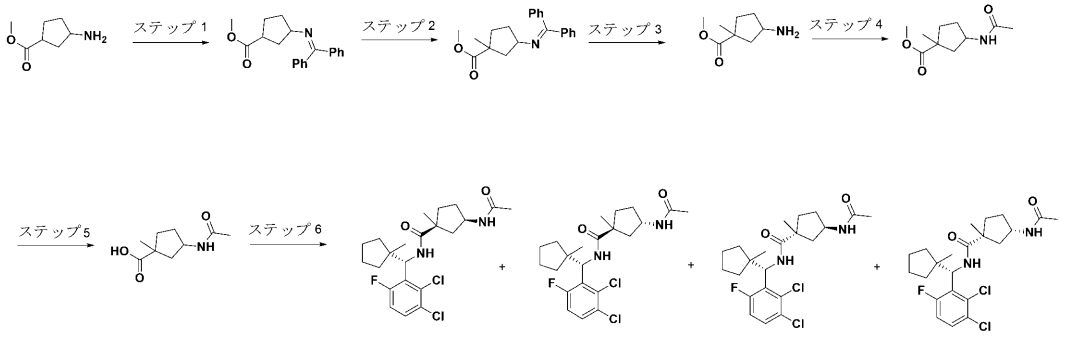
実施例１７

（１Ｓ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボキサミド、（１Ｒ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロ

ペンタン－１－カルボキサミド、（１Ｓ，３Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボキサミド

【０７６９】

【化７５５】



ステップ１．３－（（ジフェニルメチレン）アミノ）シクロペンタン－１－カルボン酸メチルの合成

【０７７０】

ＤＣＭ（５０ｍＬ）中の３－アミノシクロペンタン－１－カルボン酸メチル（４．６ｇ、３２ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（１８ｍＬ、０．１３ｍｏｌ）の混合物に、ジフェニルメタンイミン（５．８ｇ、３２ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物をセライトパッドに通して濾過し、パッドをＤＣＭ（２０ｍＬ＊３）で洗浄した。濾液を真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル、グラジエント：０％から１００％Ｂで２０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、３－（（ジフェニルメチレン）アミノ）シクロペンタン－１－カルボン酸メチル（６．０ｇ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．６７０分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３０８、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７７１】

ステップ２．３－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸メチルの合成

ＴＨＦ（３０ｍＬ）中の３－（（ジフェニルメチレン）アミノ）シクロペンタン－１－カルボン酸メチル（２．０ｇ、６．５１ｍｍｏｌ）の混合物に、リチウムジイソプロピルアミド（３．９ｍＬ、２モル、７．８ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で３０分間撹拌した後、ヨードメタン（１．０２ｇ、７．１６ｍｍｏｌ）を－７８℃で滴下した。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液、６ｍＬ）でクエンチした。反応混合物を水（４０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（５０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％で２０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、３－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸メチル（１．５ｇ、４．７ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７１２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３２２、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７７２】

ステップ３．３－アミノ－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸メチルの合成

ＨＣｌ（２０ｍｌ、４Ｎ）中の３－（（ジフェニルメチレン）アミノ）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸メチル（１．５ｇ、４．７ｍｍｏｌ）の混合物を８０℃で１時間撹拌した。混合物を減圧下で濃縮して、３－アミノ－１－メチルシクロペンタン－

１－カルボン酸メチル（０．７ｇ、４ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得、これを精製することなく次のステップに直接使用した。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．４７９分、［Ｍ＋Ｈ］＋　１５８、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７７３】

ステップ４．３－アセトアミド－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸メチルの合成

ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の３－アミノ－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸メチル（７００ｍｇ、４．４５ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（３．７２ｍＬ、２６．７ｍｍｏｌ）の混合物に、塩化アセチル（３１５ｍｇ、４．０１ｍｍｏｌ）を０℃で滴下した。混合物を室温で１時間撹拌した。反応物をＭｅＯＨ（３ｍＬ）でクエンチした。溶液を減圧下で濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１５分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、３－アセトアミド－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸メチル（５９０ｍｇ、２．９６ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．６１２分、［Ｍ＋Ｈ］＋　２００、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７７４】

ステップ５．３－アセトアミド－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

ＭｅＯＨ（５ｍＬ）中の３－アセトアミド－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸メチル（５９０ｍｇ、２．９６ｍｍｏｌ）及びＮａＯＨ（５ｍＬ、４Ｎ、水溶液）の混合物を室温で１時間撹拌した。溶液を減圧下で濃縮した。混合物をＨＣｌ（４Ｎ）でｐＨ４～６に酸性化した。溶液を減圧下で濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、３－アセトアミド－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸（５１０ｍｇ、２．７５ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．４９６分、［Ｍ＋Ｈ］＋　１８５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７７５】

ステップ６．（１Ｓ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボキサミド、（１Ｒ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボキサミド、（１Ｓ，３Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（５ｍＬ）中の（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メタンアミン（５００ｍｇ、１．８１ｍｍｏｌ）、３－アセトアミド－１－メチルシクロペンタン－１－カルボン酸（６７１ｍｇ、３．６２ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（１．３８ｇ、３．６２ｍｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（０．６１ｇ、７．２４ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（６ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで２０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－１－メチルシクロペンタン－１－カルボキサミド（５７０ｍｇ、１．２９ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１４６分、［Ｍ＋Ｈ］＋　４４３、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７７６】

物質をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：（Ｒ，Ｒ）－ＷＨＥＬＫ－Ｏ１－Ｋｒｏｍａｓｉ、５＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　ＮＨ３－ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：３５％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：５．４１；ＲＴ２（分）：７．５５；試料溶媒：ＥｔＯＨ；注入量：０．４ｍＬ）によってさらに精製して、３つのピークを得、次いで、まだ混合物のままであるピークを再びキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＨ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　ＮＨ３－ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：５０％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：３．６５；ＲＴ２（分）：３７．１２；試料溶媒：ＥｔＯＨ；注入量：２．６５ｍＬ）によって精製して、合計で４つの化合物を全て白色の非晶質固体として得た。生成物１：１５ｍｇ、３４μｍｏｌ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ７．７７（ｄ，Ｊ＝７．２Ｈｚ，１Ｈ），７．６３（ｄｄ，Ｊ＝９．０，５．１Ｈｚ，１Ｈ），７．２９（ｄｄ，Ｊ＝１１．０，８．９Ｈｚ，１Ｈ），７．１７（ｄ，Ｊ＝８．８Ｈｚ，１Ｈ），５．５３（ｄ，Ｊ＝８．６Ｈｚ，１Ｈ），４．０７（ｈ，Ｊ＝７．４Ｈｚ，１Ｈ），２．１１－２．００（ｍ，１Ｈ），１．８９（ｄｔ，Ｊ＝１６．１，７．１Ｈｚ，２Ｈ），１．８０（ｄｄ，Ｊ＝１３．１，８．３Ｈｚ，１Ｈ），１．７３（ｓ，３Ｈ），１．６１（ｓ，６Ｈ），１．６１－１．５１（ｍ，１Ｈ），１．４５－１．２６（ｍ，２Ｈ），１．２４（ｓ，２Ｈ），１．１８（ｓ，３Ｈ），０．９９（ｄ，Ｊ＝２．９Ｈｚ，３Ｈ）．ＬＣＭＳ　ＲＴ１．０４２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４４３、ＬＣ方法Ｃ。生成物２：４．９ｍｇ、１１μｍｏｌ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ７．７６（ｄ，Ｊ＝７．４Ｈｚ，１Ｈ），７．６３（ｄｄ，Ｊ＝９．０，５．１Ｈｚ，１Ｈ），７．３０（ｄｄ，Ｊ＝１１．０，９．０Ｈｚ，１Ｈ），７．１３（ｄ，Ｊ＝９．０Ｈｚ，１Ｈ），５．５７（ｄ，Ｊ＝８．８Ｈｚ，１Ｈ），４．０８（ｈ，Ｊ＝７．６Ｈｚ，１Ｈ），２．１１（ｄｄｄ，Ｊ＝１２．６，８．８，６．０Ｈｚ，１Ｈ），１．８８（ｄｄｄ，Ｊ＝２４．６，１２．７，６．９Ｈｚ，２Ｈ），１．７３（ｓ，３Ｈ），１．７６－１．６４（ｍ，１Ｈ），１．６１（ｓ，６Ｈ），１．３９（ｄｄｔ，Ｊ＝３６．１，２０．２，７．５Ｈｚ，２Ｈ），１．３１（ｓ，２Ｈ），１．２０（ｓ，３Ｈ），０．９９（ｄ，Ｊ＝２．９Ｈｚ，３Ｈ）．ＬＣＭＳ　ＲＴ１．０４２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４４３、ＬＣＭＳ方法Ｃ。生成物３：８０ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ７．８２（ｄ，Ｊ＝７．３Ｈｚ，１Ｈ），７．６２（ｄｄ，Ｊ＝９．０，５．１Ｈｚ，１Ｈ），７．３２－７．１９（ｍ，２Ｈ），５．５１（ｄ，Ｊ＝８．７Ｈｚ，１Ｈ），３．９２（ｈ，Ｊ＝７．７Ｈｚ，１Ｈ），２．３４（ｄｄ，Ｊ＝１３．２，８．１Ｈｚ，１Ｈ），２．００（ｄｔ，Ｊ＝１２．６，７．６Ｈｚ，１Ｈ），１．８４－１．７１（ｍ，１Ｈ），１．７５（ｓ，３Ｈ），１．６０（ｓ，６Ｈ），１．６１－１．４９（ｍ，１Ｈ），１．４２（ｄｑ，Ｊ＝１５．３，７．４Ｈｚ，２Ｈ），１．３０（ｓ，１Ｈ），１．２５（ｓ，３Ｈ），１．２１（ｄｄ，Ｊ＝１３．１，７．６Ｈｚ，１Ｈ），０．９９（ｄ，Ｊ＝２．９Ｈｚ，３Ｈ）．ＬＣＭＳ　ＲＴ１．４５２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４４３、ＬＣＭＳ方法Ｂ。生成物４：６４ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ７．８２（ｄ，Ｊ＝７．３Ｈｚ，１Ｈ），７．６２（ｄｄ，Ｊ＝８．９，５．０Ｈｚ，１Ｈ），７．３７－７．１９（ｍ，２Ｈ），５．５０（ｄ，Ｊ＝８．５Ｈｚ，１Ｈ），３．９２（ｐ，Ｊ＝７．６，７．０Ｈｚ，１Ｈ），２．４０（ｄｄ，Ｊ＝１３．２，８．０Ｈｚ，１Ｈ），１．９６（ｄｔ，Ｊ＝１２．４，７．４Ｈｚ，１

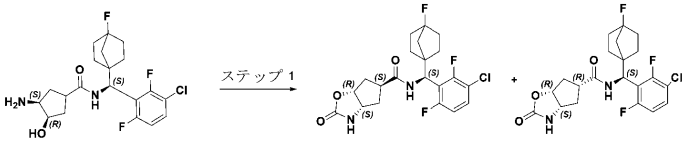
Ｈ），１．７５（ｓ，３Ｈ），１．７８－１．６７（ｍ，１Ｈ），１．６１（ｓ，６Ｈ），１．５６－１．３４（ｍ，３Ｈ），１．２５（ｓ，３Ｈ），１．３３－１．１８（ｍ，２Ｈ），０．９９（ｄ，Ｊ＝２．９Ｈｚ，３Ｈ）．ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４２５分、［Ｍ＋Ｈ］＋　４４３、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０７７７】

実施例１８

（３ａＳ，５Ｓ，６ａＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド及び（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

【化７５６】



ステップ１．（３ａＳ，５Ｓ，６ａＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド及び（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミドの合成

ＤＣＭ（５ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１２ｍｍｏｌ）及びピリジン（４７ｍｇ、０．６０ｍｍｏｌ）の混合物に、ＤＣＭ（０．５ｍＬ）中のトリホスゲン（１８ｍｇ、６０μｍｏｌ）の溶液を０℃で滴下した。混合物を２５℃で１２時間攪拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液）でクエンチした。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から８０％Ｂで２５分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（３ａＳ，６ａＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド（３５ｍｇ、７９μｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９５１分、［Ｍ＋Ｈ］＋　４４３．１、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７７８】

この物質を分取キラルＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ－ＩＧ３；移動相Ａ：ヘキサン（０．２％ジエチルアミン）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１、グラジエント：４０％Ｂアイソクラティック；流量：１ｍＬ／分；注入量：３ｍＬ）によって精製して、（３ａＳ，５Ｓ，６ａＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド及び（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－オキソヘキサヒドロ－２Ｈ－シクロペンタ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミドの両方を白色の非晶質固体として得た。一方の異性体は、５．３ｍｇ、１２μｍｏｌである。^{1}ＨＮＭＲ

（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ７．４９－７．２６（ｍ，１Ｈ），６．８８（ｔ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），６．７４（ｄ，Ｊ＝９．７Ｈｚ，１Ｈ），５．６４（ｄ，Ｊ＝９．８Ｈｚ，１Ｈ），５．４５（ｓ，１Ｈ），５．２６－４．９３（ｍ，１Ｈ），４．４２（ｓ，１Ｈ），３．００（ｄ，Ｊ＝１２．９Ｈｚ，１Ｈ），２．３８－２．１６（ｍ，１Ｈ），２．１０－１．３１（ｍ，１３Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ ０．８８２分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$ ４４３．１、ＬＣＭＳ方法Ｃ；他の異性体は、１１．５ｍｇ、２６．０μｍｏｌである。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）８．４８（ｄ，Ｊ＝８．５Ｈｚ，１Ｈ），７．５７（ｔｄ，Ｊ＝８．６，５．４Ｈｚ，２Ｈ），７．３２－７．００（ｍ，１Ｈ），５．２７（ｄ，Ｊ＝８．１Ｈｚ，１Ｈ），５．１４－４．８１（ｍ，１Ｈ），４．１９（ｔ，Ｊ＝６．５Ｈｚ，１Ｈ），３．１１（ｔｔ，Ｊ＝１２．０，６．１Ｈｚ，１Ｈ），２．０９－１．８７（ｍ，１Ｈ），１．８８－１．３１（ｍ，１３Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ ０．８７９分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$ ４４３．１、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

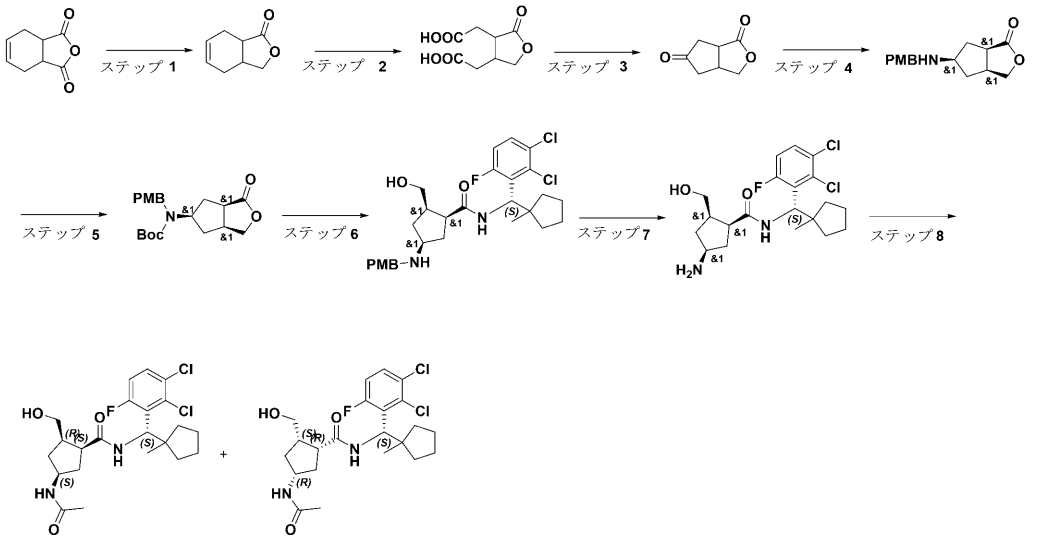
【０７７９】

実施例１９

（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，２Ｓ，４Ｒ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド

【０７８０】

【化７５７】



ステップ１．３ａ，４，７，７ａ－テトラヒドロイソベンゾフラン－１（３Ｈ）－オンの合成

【０７８１】

ＴＨＦ（２００ｍＬ）中の３ａ，４，７，７ａ－テトラヒドロイソベンゾフラン－１，３－ジオン（２０ｇ、０．１３ｍｏｌ）の混合物に、ＬｉＡｌＨ$_4$（５．０ｇ、０．１３ｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。混合物を室温で３時間攪拌した。得られた混合物を２５ｇの氷（５０ｍＬの水中６％ＨＣｌと混合したもの）中に注ぎ、酢酸エチルで３回抽出した（２００ｍｌ＊３）。合わせた有機層をブラインで洗浄し、無水ＭｇＳＯ$_4$で乾燥させた。粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（２００ｇカラム；石油エーテル／酢酸エチルによる溶出；比率：１０／１）によって精製して、３ａ，４，７，７ａ－テトラヒ

ドロイソベンゾフラン－１（３Ｈ）－オン（７ｇ、０．０５ｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）　δ　５．７７　－　５．６４　（ｍ，　２Ｈ），　４．２９　（ｄｄ，　Ｊ　＝　８．６，　４．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９８　（ｄｄ，　Ｊ　＝　８．６，　１．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．１７　（ｄ，　Ｊ　＝　５．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．９３　（ｔｄ，　Ｊ　＝　７．３，　３．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．６４　－　２．５２　（ｍ，　１Ｈ），　２．４４　－　２．０１　（ｍ，　３Ｈ）．

【０７８２】

ステップ２．２，２’－（２－オキソテトラヒドロフラン－３，４－ジイル）二酢酸の合成

Ｈ$_{2}$Ｏ（１８０ｍＬ）中のＫＭｎＯ$_{4}$（１５ｇ、９８ｍｍｏｌ）の混合物に、アセトン（３６ｍＬ）中の３ａ，４，７，７ａ－テトラヒドロイソベンゾフラン－１（３Ｈ）－オン（４．５ｇ、３３ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で滴下した。茶色のスラリーを０℃で１時間撹拌し、室温まで温め、一晩撹拌した。反応物をＮａＨＳＯ$_{3}$でクエンチした。得られたスラリーをセライトパッドに通して濾過し、セライトを水／ＴＨＦ（１／１、２５０ｍＬ）で洗浄した。合わせた濾液をｐＨ２に酸性化した。混合物を飽和ＮａＣｌ（水溶液）で希釈し、ｔｅｒｔ－ブチルメチルエーテル／ＴＨＦ（２／３、６×１２０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をＮａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して（浴温は３０℃以下）、２，２’－（２－オキソテトラヒドロフラン－３，４－ジイル）二酢酸（５．５ｇ、２７ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．２３８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２０３．０５．　ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０７８３】

ステップ３．テトラヒドロ－１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－１，５（３Ｈ）－ジオンの合成

無水酢酸（５０ｍＬ）中の２，２’－（２－オキソテトラヒドロフラン－３，４－ジイル）二酢酸（７．３ｇ、３６ｍｍｏｌ）の混合物を１３０℃で１時間撹拌した。室温まで冷却した後、混合物をＴＨＦ（１０ｍＬ）で希釈してから、Ｋ$_{2}$ＣＯ$_{3}$（５．０ｇ、３６ｍｍｏｌ）を加えた。得られた混合物を６０℃で一晩撹拌した。０℃まで冷却した後、反応物をＭｅＯＨ（５ｍＬ）でクエンチし、混合物を０℃で３０分間撹拌した。飽和ＮＨ$_{4}$Ｃｌ溶液（１０ｍｌ、水溶液）及びＤＣＭ（１０ｍＬ）を加え、０℃で２０分間撹拌し続けた。相分離し、続いて、水層をＤＣＭ（３×２００ｍＬ）で抽出して、混合有機相を得、これをＮａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させた。粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（１０ｇカラム；石油エーテル／酢酸エチルによる溶出；比率：１／１）によって精製して、テトラヒドロ－１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－１，５（３Ｈ）－ジオン（３．５ｇ、２５ｍｍｏｌ）を淡黄色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　クロロホルム－ｄ）　δ　４．５４　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．６，　５．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２５　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．６，　１．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．４４　－　３．２３　（ｍ，　２Ｈ），　２．８２　－　２．５４　（ｍ，　３Ｈ），　２．３５　－　２．１４　（ｍ，　１Ｈ）．

【０７８４】

ステップ４．（±）－（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－５－（（４－メトキシベンジル）アミノ）ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－１－オンの合成

ＭｅＯＨ（２０ｍＬ）中のテトラヒドロ－１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－１，５（３Ｈ）－ジオン（３．５ｇ、２５ｍｍｏｌ）及び（４－メトキシフェニル）メタンアミン（４．１ｇ、３０ｍｍｏｌ）の混合物に、ＮａＢＨ$_{3}$ＣＮ（２．４ｇ、３７ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。得られた混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（１２０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１５０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をフラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（±）－（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－５－（（４－メトキシベンジル）アミノ）ヘキサヒドロ－

１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－１－オン（８５０ｍｇ、３．２５ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．４５１分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２６２、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７８５】

ステップ５．（±）－（４－メトキシベンジル）（（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－１－オキソヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－５－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－５－（（４－メトキシベンジル）アミノ）ヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－１－オン（６３０ｍｇ、２．４１ｍｍｏｌ）及びトリエチルアミン（７３２ｍｇ、７．２３ｍｍｏｌ）の混合物に、二炭酸ジ－ｔｅｒｔ－ブチル（７８９ｍｇ、３．６２ｍｍｏｌ）を０℃で滴下した。混合物を室温で２時間撹拌した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（３０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をフラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（±）－（４－メトキシベンジル）（（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－１－オキソヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－５－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（５００ｍｇ、１．３８ｍｍｏｌ、５７．４％）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１７８分）、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$＝３６１、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７８６】

ステップ６．（±）－（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）－４－（（４－メトキシベンジル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＴＨＦ（５ｍＬ）中の（±）－（４－メトキシベンジル）（（３ａＳ，５Ｒ，６ａＲ）－１－オキソヘキサヒドロ－１Ｈ－シクロペンタ［ｃ］フラン－５－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（４５０ｍｇ、１．２５ｍｍｏｌ）の混合物に、トリメチルアルミニウム（３５９ｍｇ、４．９８ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。混合物を０℃で１５分間撹拌した後、（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メタンアミン（１．３８ｇ、４．９８ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１５ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（±）－（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）－４－（（４－メトキシベンジル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド（１５０ｍｇ、２７９μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９０９分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　５３７．２０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７８７】

ステップ７．（±）－（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

アセトニトリル（１０ｍＬ）中の（±）－（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）－４－（（４－メトキシベンジル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド（１２０ｍｇ、２２３μｍｏｌ）及び$Ce(NH_4)_2(NO_3)_6$（１．２２ｇ、２．２３ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１２時間撹拌した。混合物を濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュ（アセトニトリル／水）によって精製して、（±）

－（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１２ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７５０分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４１７、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７８８】

ステップ８．（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，２Ｓ，４Ｒ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（２ｍＬ）中の（±）－（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（４５ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）、ＴＥＡ（４５μＬ、０．３２ｍｍｏｌ）、酢酸（１３ｍｇ、０．２２ｍｍｏｌ）及びT_3P（５１ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（２０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｓｈｉｅｌｄ　ＲＰ１８　ＯＢＤ　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3＋０．１％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３１％Ｂから５１％Ｂで８分、次いで、５１％Ｂ；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：７．４０）によって精製して、（±）－（１Ｒ，２Ｓ，４Ｒ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（１７ｍｇ、３７μｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０７７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４５９、ＬＣＭＳ方法Ｃ。物質をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：１５％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：１５．９５；ＲＴ２（分）：２１．０１；試料溶媒：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；注入量：１ｍＬ）によってさらに精製して、（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，２Ｓ，４Ｒ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２－（ヒドロキシメチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの両方をオフホワイト色の非晶質固体として得た。異性体１は、１ｍｇ、２μｍｏｌである。^{1}ＨＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　８．０８　（ｄ，　Ｊ　＝　８．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．７９　（ｄ，　Ｊ　＝　７．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６１　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．０，　４．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２４　（ｔ，　Ｊ　＝　９．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．４９　（ｄ，　Ｊ　＝　８．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２２　（ｔ，　Ｊ　＝　５．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１７　（ｓ，　１Ｈ），　３．１０　（ｄ，　Ｊ　＝　７．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．０６　－　２．９９　（ｍ，　１Ｈ），　２．７７　（ｑ，　Ｊ　＝　６．７，　４．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．２９　（ｑ，　Ｊ　＝　９．５，　８．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．０７　（ｄｔ，　Ｊ　＝　１３．８，　６．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．７５　（ｓ，　３Ｈ），　１．７１　（ｔ，　Ｊ　＝　７．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．５９　（ｓ，　６Ｈ），　１．５４　－　１．４４　（ｍ，　２Ｈ），　１．３６　（ｓ，　１Ｈ），　１．２５　（ｓ，　１Ｈ），　０．９５　（ｓ，　３Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９１１分、［Ｍ＋Ｈ］　４５９、ＬＣＭＳ方法Ｃ。異性体２２は、２ｍｇ、４μｍｏｌである。^{1}ＨＮＭＲ　（４

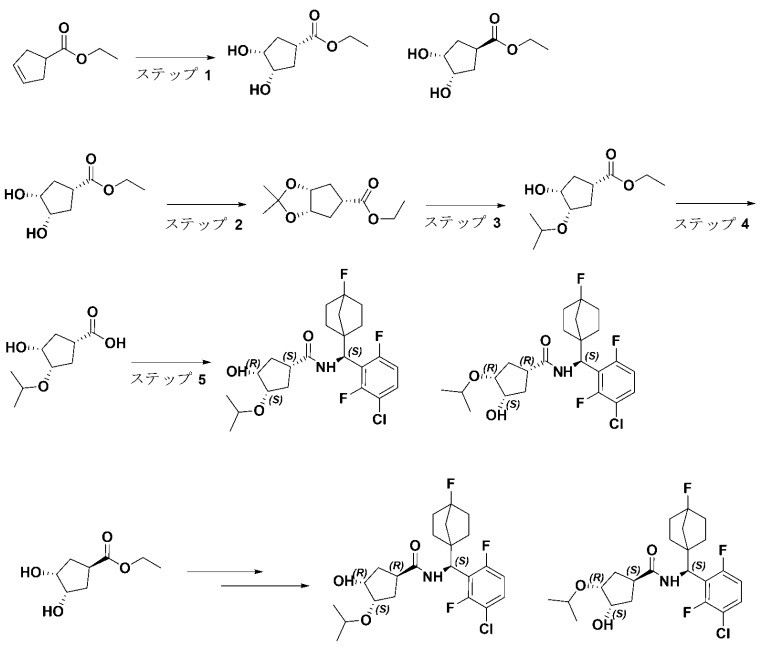
００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ ８．１１（ｄ，Ｊ＝８．５ Ｈｚ，１Ｈ），７．８０（ｄ，Ｊ＝７．０ Ｈｚ，１Ｈ），７．６１（ｄｄ，Ｊ＝９．０，５．０ Ｈｚ，１Ｈ），７．２５（ｔ，Ｊ＝９．９ Ｈｚ，１Ｈ），５．４６（ｄ，Ｊ＝８．４ Ｈｚ，１Ｈ），４．５０（ｔ，Ｊ＝５．２ Ｈｚ，１Ｈ），４．１４（ｓ，１Ｈ），３．４４－３．３６（ｍ，１Ｈ），３．２１（ｔｄ，Ｊ＝９．６，５．６ Ｈｚ，１Ｈ），３．０３（ｑ，Ｊ＝８．０，７．５ Ｈｚ，１Ｈ），２．４２－２．３２（ｍ，１Ｈ），１．９３（ｄｄ，Ｊ＝１３．１，６．９ Ｈｚ，１Ｈ），１．７４（ｓ，３Ｈ），１．６１（ｓ，６Ｈ），１．５３（ｄ，Ｊ＝８．９ Ｈｚ，２Ｈ），１．４０（ｔ，Ｊ＝６．８ Ｈｚ，２Ｈ），１．２４（ｓ，１Ｈ），１．００－０．９１（ｍ，３Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ ０．９３３分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$ ４５９、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０７８９】

実施例２０

（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミド、（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミド、（１Ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７５８】



ステップ１．（１ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－３，４－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル及び（１ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－３，４－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

アセトン（１０ｍＬ）及びH_2O（１０ｍＬ）中のシクロペンター３－エン－１－カルボン酸エチル（５ｇ、０．０４ｍｏｌ）及びＮＭＯ（５ｇ、０．０４ｍｏｌ）の撹拌混合物に、$K_2OsO_2(OH)_4$（３ｇ、７ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で加えた。

得られた混合物を一晩室温で撹拌した。混合物をＤＣＭ（３×２５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１×１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、石油エーテル：酢酸エチル（１：５）で溶出して、（３Ｒ，４Ｓ）－３，４－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（４．１４ｇ、２３．８ｍｍｏｌ、１．５ｇの異性体１、４２０ｍｇの異性体２、及び２．２ｇの２つの混合物を含む）を黄色の油状物として得た。異性体１：^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ４．４７ （ｄ， Ｊ ＝ ４．２ Ｈｚ， ２Ｈ）， ４．０４ （ｑ， Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ， ２Ｈ）， ３．８８ （ｈ， Ｊ ＝ ４．０ Ｈｚ， ２Ｈ）， ２．９５ （ｔｔ， Ｊ ＝ ９．６， ６．７ Ｈｚ， １Ｈ）， １．９０ － １．７０ （ｍ， ４Ｈ）， １．１７ （ｔ， Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ， ３Ｈ）．異性体２：^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ４．３７ （ｄ， Ｊ ＝ ４．３ Ｈｚ， ２Ｈ）， ４．０４ （ｄｄ， Ｊ ＝ ７．１， ３．２ Ｈｚ， ２Ｈ）， ３．７６ （ｄｐ， Ｊ ＝ ７．５， ４．５ Ｈｚ， ２Ｈ）， ２．６７ （ｔｔ， Ｊ ＝ ９．３， ８．０ Ｈｚ， １Ｈ）， １．９５ （ｔｄｄ， Ｊ ＝ ９．４， ４．８， １．７ Ｈｚ， ２Ｈ）， １．８３ － １．７６ （ｍ， ２Ｈ）， １．１７ （ｔ， Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ， ３Ｈ）．

【０７９０】

ステップ２．（３ａＲ，５ｒ，６ａＳ）－２，２－ジメチルテトラヒドロ－４Ｈ－シクロペンタ［ｄ］［１，３］ジオキソール－５－カルボン酸エチルの合成

【０７９１】

アセトン（１ｍＬ）中の（１ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－３，４－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（５００ｍｇ、２．８７ｍｍｏｌ、異性体２）及び２，２－ジメトキシプロパン（２９９ｍｇ、２．８７ｍｍｏｌ）の撹拌混合物に、４－メチルベンゼン－１－スルホン酸（９８．９ｍｇ、５７４μｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を窒素下にて２５℃で１６時間撹拌した。得られた混合物をＥｔＯＡｃ（３×２０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を水（１×２０ｍＬ）及びブライン（１ｘ２０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮して、（３ａＲ，５ｒ，６ａＳ）－２，２－ジメチルテトラヒドロ－４Ｈ－シクロペンタ［ｄ］［１，３］ジオキソール－５－カルボン酸エチル（６４９ｍｇ、３．０３ｍｍｏｌ、粗製）を無色の油状物として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ４．６２ （ｄｄ， Ｊ ＝ ３．７， １．６ Ｈｚ， ２Ｈ）， ４．０６ （ｑ， Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ， ２Ｈ）， ２．８９－２．８０ （ｍ， １Ｈ）， １．９８ － １．８７ （ｍ， ２Ｈ）， １．６７－１．５９ （ｍ， ２Ｈ）， １．３４ （ｓ， ３Ｈ）， １．２３ － １．１２ （ｍ， ６Ｈ）．

【０７９２】

ステップ３．（±）－（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

【０７９３】

ＤＣＭ（５ｍＬ）中の（３ａＲ，５ｒ，６ａＳ）－２，２－ジメチルテトラヒドロ－４Ｈ－シクロペンタ［ｄ］［１，３］ジオキソール－５－カルボン酸エチル（２００ｍｇ、０．９３ｍｍｏｌ）及びトリエチルシラン（１３９ｍｇ、１．２０ｍｍｏｌ）の撹拌混合物に、$TiCl_4$（１．０２ｍＬ、ＤＣＭ中１Ｍ、１．０２ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－４０℃で滴下した。得られた混合物を窒素下にて－４０℃で１時間撹拌した。反応物を水／氷により０℃でクエンチした。得られた混合物をＤＣＭ（３×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１×１００ｍＬ）及び$NaHCO_3$（１×１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、石油エーテル：酢酸エチル（５：１）で溶出して、（±）－（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（１２０ｍｇ、５５５μｍｏｌ）を無色の油状物と

して得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　４．１６　（ｄ，　Ｊ　＝　４．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．０５　（ｑ，　Ｊ　＝　７．１　Ｈｚ，　２Ｈ），　３．９８　（ｑ，　Ｊ　＝　４．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．７７　（ｔｄ，　Ｊ　＝　６．９，　３．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．７０－３．６４　（ｍ，　１Ｈ），　３．００　－　２．８７　（ｍ，　１Ｈ），　１．９４　－　１．７６　（ｍ，　４Ｈ），　１．１７　（ｔ，　Ｊ　＝　７．１　Ｈｚ，　３Ｈ），　１．０９　（ｔ，　Ｊ　＝　６．３　Ｈｚ，　６Ｈ）．

【０７９４】

ステップ４．（±）－（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

ＭｅＯＨ（２ｍＬ）及び$Ｈ_2Ｏ$（２ｍＬ）中の（±）－（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（１２０ｍｇ、５５５μｍｏｌ）の撹拌混合物に、ＮａＯＨ（４４．４ｍｇ、１．１１ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を窒素下にて２５℃で１時間撹拌した。混合物を濃塩酸でｐＨ４に酸性化した。得られた混合物をＤＣＭ（３×２５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１×１００ｍＬ）で洗浄し、無水$Ｎａ_2ＳＯ_4$で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮して、（±）－（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボン酸（１１０ｍｇ、５８４μｍｏｌ）を得た。１Ｈ　ＮＭＲ　（３００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　１２．０５　（ｓ，　１Ｈ），　４．１３　（ｄ，　Ｊ　＝　４．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９７　（ｐ，　Ｊ　＝　４．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．７６　（ｔｄ，　Ｊ　＝　７．０，　３．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．７０　－　３．６２　（ｍ，　１Ｈ），　２．８７　（ｑｄ，　Ｊ　＝　８．６，　５．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．９５　－　１．７４　（ｍ，　４Ｈ），　１．０９　（ｄｄ，　Ｊ　＝　６．１，　４．７　Ｈｚ，　６Ｈ）．

【０７９５】

ステップ５．（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（５ｍＬ）中の（±）－（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボン酸（１００ｍｇ、５３１μｍｏｌ）及び（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタンアミン（１６９ｍｇ、５８４μｍｏｌ）の撹拌混合物に、Ｔ３Ｐ（５０７ｍｇ、ＥｔＯＡｃ中５０重量％、７９７μｍｏｌ）及びＴＥＡ（６９．９ｍｇ、６９１μｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を窒素下にて２５℃で１時間撹拌した。得られた混合物を、次の条件（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　ＰｒｅｐＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、１０μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ$ＮＨ_4ＨＣＯ_3$＋０．０５％$ＮＨ_4ＯＨ$）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３５％Ｂから６５％Ｂで３０分；波長：２５４ｎｍ／２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：９．５８）による分取ＨＰＬＣによって精製して、所望の生成物（１４０ｍｇ、３０４μｍｏｌ）を白色の固体として得、これを分取キラルＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬ　ＡＲＴ　Ｃｅｌｌｕｌｏｓｅ－ＳＺ、３＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％の２Ｍ　$ＮＨ_3$／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：４０ｍＬ／分；グラジエント：１０％Ｂアイソクラティック；波長：２５４／２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：８．６３；ＲＴ２（分）：１０．５２５；試料溶媒：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１）によってさらに精製して、（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４

－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの両方を白色の固体として得た。異性体１：３４．６ｍｇ、７３．４μｍｏｌ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．７００分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４６０．２０、ＬＣＭＳ方法Ｆ、^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．２０　（ｄ，　Ｊ　＝　８．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５８　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．７，　５．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１６　（ｔｄ，　Ｊ　＝　９．４，　１．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．２７　（ｄ，　Ｊ　＝　８．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．４４　（ｄ，　Ｊ　＝　５．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．８９　（ｐ，　Ｊ　＝　４．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．７２　－　３．６２　（ｍ，　２Ｈ），　２．６６　（ｑｄ，　Ｊ　＝　８．９，　６．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．０５　－　１．３９　（ｍ，　１４Ｈ），　１．０９　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１２．０，　６．０　Ｈｚ，　６Ｈ）．異性体２：４６．０ｍｇ、９７．５μｍｏｌ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．６９６分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４６０．１５、ＬＣＭＳ方法Ｆ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（３００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．２０　（ｄ，　Ｊ　＝　８．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５８　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．７，　５．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１６　（ｔｄ，　Ｊ　＝　９．５，　１．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．２６　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．４５　（ｄ，　Ｊ　＝　５．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９０　（ｐ，　Ｊ　＝　４．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．７３　－　３．５９　（ｍ，　２Ｈ），　２．６８　（ｑｄ，　Ｊ　＝　８．９，　６．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．０６　－　１．５４　（ｍ，　１２Ｈ），　１．４６　（ｓ，　２Ｈ），　１．０８　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１３．２，　６．１　Ｈｚ，　６Ｈ）．

【０７９６】

同様に、（１Ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－イソプロポキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの両方は、白色の固体として、次の条件（カラム：Ｌｕｘ　Ｃｅｌｌｕｌｏｓｅ－４、２．１２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％の２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：３％Ｂアイソクラティック；波長：２１０／２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：５．４９；ＲＴ２（分）：７．８０；試料溶媒：ＥｔＯＨ；注入量：０．４ｍＬ）による分取キラルＨＰＬＣによって（１ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－３，４－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチルからキラル分離することで、調製することができる。異性体３：２２．２ｍｇ、４７．４μｍｏｌ。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．５３４分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４６０．２０、ＬＣＭＳ方法Ｆ、^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．２２　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５６　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．７，　５．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１５　（ｔｄ，　Ｊ　＝　９．５，　１．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．２４　（ｄ，　Ｊ　＝　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．０７　（ｄ，　Ｊ　＝　４．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９５　（ｐ，　Ｊ　＝　４．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．７２　－　３．５８　（ｍ，　２Ｈ），　３．０６　（ｄｄｄ，　Ｊ　＝　１５．８，　８．９，　６．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．８４　－　１．５４　（ｍ，　１２Ｈ），　１．４５　（ｄ，　Ｊ　＝　９．２　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．０６　（ｄｄ，　Ｊ　＝　８．９，　６．１　Ｈｚ，　６Ｈ）．異性体４：３４．２ｍｇ、７２．０μｍｏｌ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．６６２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４６０．２０、ＬＣＭＳ方法Ｆ、^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．２１　（ｄ，　Ｊ　＝　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５６　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．７，　５．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１９　－　７．０８　（ｍ，　１Ｈ），　５．２４　（ｄ，　Ｊ　＝　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．０６　（ｄ，　Ｊ　＝　４．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９２　（ｐ，　Ｊ　＝　４．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．７３　（ｔｄ，　Ｊ　＝　６．８，　３．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．６４　（ｈ，　Ｊ　＝　６．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．１４　－　３．０

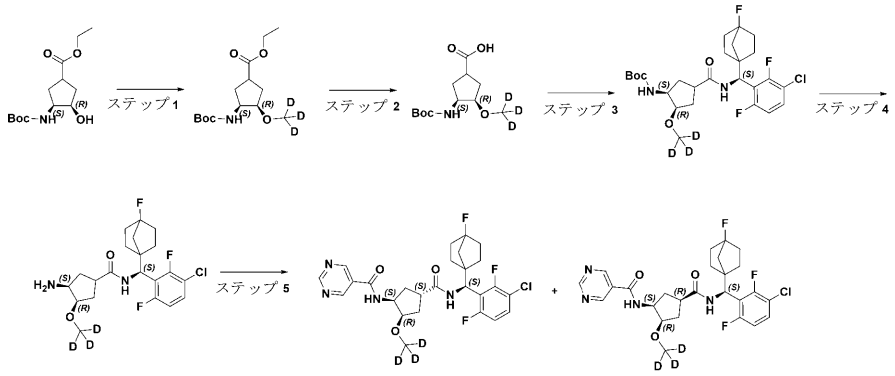
０（ｍ，１Ｈ），１．８７－１．６６（ｍ，１０Ｈ），１．５９（ｄ，Ｊ＝８．５Ｈｚ，１Ｈ），１．４８（ｄｄｄ，Ｊ＝２０．７，１０．３，６．７Ｈｚ，３Ｈ），１．０８（ｔ，Ｊ＝５．７Ｈｚ，６Ｈ）．

【０７９７】

実施例２１

Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミド及びＮ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミドの合成

【化７５９】



ステップ１．（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

ＤＣＥ（３０ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（６００ｍｇ、２．２０ｍｍｏｌ）及びAg_2O（５．０９ｇ、２２．００ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ヨードメタン－d_3（１．５９ｇ、１１．００ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で滴下した。得られた混合物を窒素下にて８０℃で１２時間撹拌した。混合物を室温まで冷却し、濾過した。濾過ケーキをCH_2Cl_2（３×１００ｍＬ）で洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、石油エーテル／ＥｔＯＡｃ（３０分かけて０％～５０％のＥｔＯＡｃ）で溶出して、（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボン酸エチル（４００ｍｇ、１．３０ｍｍｏｌ）を薄黄色の固体として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ ６．４９（ｄ，Ｊ＝８．２Ｈｚ，１Ｈ），４．０５（ｑ，Ｊ＝７．１Ｈｚ，２Ｈ），３．９１－３．８０（ｍ，１Ｈ），３．６８－３．６１（ｍ，１Ｈ），２．９０－２．７６（ｍ，１Ｈ），２．０４－１．９０（ｍ，２Ｈ），１．７９－１．７２（ｍ，２Ｈ），１．３８（ｓ，９Ｈ），１．１７（ｔ，Ｊ＝７．１Ｈｚ，３Ｈ）．

【０７９８】

ステップ２．（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボン酸の合成

ＴＨＦ（３ｍＬ）及びH_2O（１ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボン酸エチル（２９０ｍｇ、９９９μｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＬｉＯＨ（７１ｍｇ、３．００ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で加えた。得られた混合物を窒素下にて３０℃で４時間撹拌した。混合物をＨＣｌ（１Ｎ、水溶液）でｐＨ５に酸性化した。得られた混合物をＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（３×５０ｍＬ）で洗

浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。粗生成物（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボン酸（２００ｍｇ、７６２μｍｏｌ）を、精製することなく次のステップに直接使用した。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．５３９分、$[M+H]^+$＝２６３．１、ＬＣＭＳ方法Ｇ。

【０７９９】

ステップ３．（（１Ｓ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＤＭＦ（２ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボン酸（８０ｍｇ、０．３０ｍｍｏｌ）及び（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタンアミン（８８ｍｇ、０．３０ｍｍｏｌ）の攪拌溶液に、炭酸水素ナトリウム（７７ｍｇ、０．９１ｍｍｏｌ）及びＨＡＴＵ（１７０ｍｇ、０．４６ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で加えた。得られた混合物を窒素下にて３０℃で３時間攪拌した。真空濃縮した後、残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８ゲル；移動相Ａ：水（０．１％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から９０％Ｂで４０分；検出器：ＵＶ２５４／２２０ｎｍ）によって精製して、（（１Ｓ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（８０ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．２９１分、ｍ／ｚ　［Ｍ－Ｈ］$^-$　５３２．２、ＬＣＭＳ方法Ｇ。

【０８００】

ステップ４．（３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボキサミド塩酸塩の合成

１，４－ジオキサン（１ｍＬ）中の（（１Ｓ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（４０ｍｇ、７５．００μｍｏｌ）の攪拌溶液に、１，４－ジオキサン中ＨＣｌ（４Ｍ、１ｍＬ）を窒素雰囲気下にて室温で滴下した。得られた混合物を窒素下にて３０℃で２時間攪拌した。混合物を濃縮し、Et_2O（２ｍＬ）で２回トリチュレートした。粗生成物（３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボキサミド塩酸塩（４０ｍｇ、粗製）を、さらに精製することなく次のステップに直接使用した。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９８５分、$[M+H]^+$　４３４．２、ＬＣＭＳ方法Ｇ。

【０８０１】

ステップ５．Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミド及びＮ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メトキシ－ｄ３）シクロペンタン－１－カルボキサミド塩酸塩（３０

ｍｇ、６９μｍｏｌ）及びピリミジン－５－カルボン酸（９ｍｇ、６９μｍｏｌ）の撹拌溶液に、炭酸水素ナトリウム（１７ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）及びＨＡＴＵ（３９ｍｇ、０．１０ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で加えた。得られた混合物を窒素下にて３０℃で３時間撹拌した。減圧下で濃縮した後、残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８ゲル；移動相Ａ：水（０．１％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から９０％Ｂで４０分；検出器：ＵＶ２５４／２２０ｎｍ）によって精製して、Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミド（２０ｍｇ、５１％）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１７７分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５４０．２、ＬＣＭＳ方法。次の条件（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％の２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：５０％　Ｂアイソクラティック；波長：２００／２１５ｎｍ；ＲＴ１（分）：６．３；ＲＴ２（分）：１７．４８；試料溶媒：ＥｔＯＨ：CH_2Cl_2　１：１；注入量：１ｍＬ）による分取キラルＨＰＬＣによってさらに精製して、Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミド及びＮ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－（メトキシ－ｄ３）シクロペンチル）ピリミジン－５－カルボキサミドの両方を白色の固体として得た。異性体１：７．１ｍｇ、１３μｍｏｌ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．８７５分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５４０．２５、ＬＣＭＳ方法Ｆ、^{1}ＨＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ９．３０（ｄ，Ｊ＝３．２Ｈｚ，１Ｈ），９．１７－９．０８（ｍ，２Ｈ），８．５７（ｄ，Ｊ＝７．７Ｈｚ，１Ｈ），８．２８（ｄ，Ｊ＝８．１Ｈｚ，１Ｈ），７．５８（ｔｄ，Ｊ＝８．７，５．４Ｈｚ，１Ｈ），７．１６（ｔ，Ｊ＝９．５Ｈｚ，１Ｈ），５．３０（ｄ，Ｊ＝８．２Ｈｚ，１Ｈ），４．３０（ｄｔ，Ｊ＝１２．６，６．２Ｈｚ，１Ｈ），３．７７（ｓ，１Ｈ），３．１６－３．０２（ｍ，１Ｈ），２．０７－１．９３（ｍ，３Ｈ），１．８６－１．５６（ｍ，９Ｈ），１．４６（ｓ，２Ｈ）．^{19}Ｆ　ＮＭＲ（２８２ＭＨｚ，ＤＭＳＯ）δ－１１１．０４７、－１１３．５９７、－１７３．５６３．異性体２：３．０ｍｇ、５．５μｍｏｌ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．８７５分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５４０．２５、ＬＣＭＳ方法Ｆ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ９．３０（ｓ，１Ｈ），９．１４（ｄ，Ｊ＝１．４Ｈｚ，２Ｈ），８．５６（ｄ，Ｊ＝８．０Ｈｚ，１Ｈ），８．２８（ｄ，Ｊ＝８．３Ｈｚ，１Ｈ），７．５７（ｔｄ，Ｊ＝８．７，５．５Ｈｚ，１Ｈ），７．２３－７．０９（ｍ，１Ｈ），５．２９（ｄ，Ｊ＝８．２Ｈｚ，１Ｈ），４．３５－４．１８（ｍ，１Ｈ），３．８０（ｔｄ，Ｊ＝４．５，２．４Ｈｚ，１Ｈ），３．１０（ｄ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ，１Ｈ），２．１２（ｄｄｄ，Ｊ＝１３．６，８．８，２．５Ｈｚ，１Ｈ），１．９４（ｑ，Ｊ＝１０．５Ｈｚ，１Ｈ），１．８５－１．６８（ｍ，９Ｈ），１．６１（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ，１Ｈ），１．４７（ｄ，Ｊ＝８．０Ｈｚ，２Ｈ）．^{19}Ｆ　ＮＭＲ（２８２ＭＨｚ，ＤＭＳＯ）δ－１１１．６３５，－１１３．４０１，－１７３．５６５．

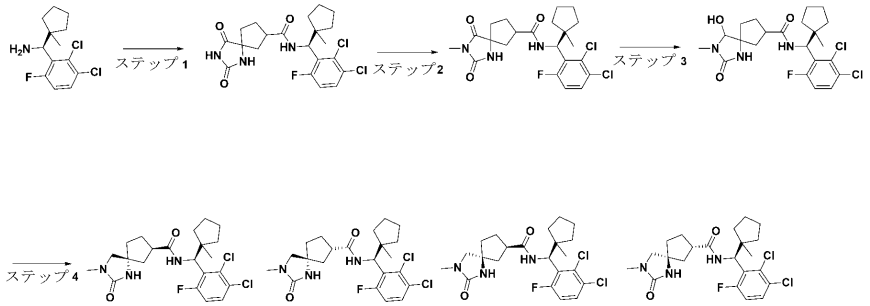
【０８０２】

実施例２２

（５Ｒ，７Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド、（５Ｒ，７Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロ

ロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド、（５Ｓ，７Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド及び（５Ｓ，７Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド

【化７６０】



ステップ１．Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（３ｍＬ）中の２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボン酸（３００ｍｇ、１．５１ｍｍｏｌ）、（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メタンアミン（４１８ｍｇ、１．５１ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（９１７ｍｇ、９．０８ｍｍｏｌ）の混合物に、T_3P（１．９３ｇ、５０重量％、３．０３ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（２０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで２５分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製した。真空濃縮により、Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド（０．２３ｇ、３３％）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９８１分、$[M+H]^+$　４５６、ＬＣ方法Ｃ。

【０８０３】

ステップ２．Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミドの合成

トルエン（２ｍＬ）中のＮ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド（２２０ｍｇ、４８２μｍｏｌ）及び１，１－ジメトキシ－Ｎ、Ｎ－ジメチルエタン－１－アミン（１９３ｍｇ、１．４５ｍｍｏｌ）の混合物を１１０℃で２時間撹拌した。反応混合物を真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで２５分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド（０．１９ｇ、０．４０ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９９４分、$[M+H]^+$　４７０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８０４】

ステップ３．Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチ

ルシクロペンチル）メチル）－４－ヒドロキシ－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミドの合成
　ＴＨＦ（３ｍＬ）中のＮ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド（１８０ｍｇ、３８３μｍｏｌ）の混合物に、ＬｉＡｌＨ$_4$（２２ｍｇ、５７４μｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で少しずつ加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。次いで、反応物を０℃まで冷却し、水（０．１８ｍＬ）、水酸化ナトリウム（０．３６ｍＬ、４Ｍ）、次いで、水（０．１８ｍＬ）でクエンチした。混合物をセライトパッドに通して濾過した。パッドを酢酸エチルで洗浄し、濾液を真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％で２５分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド（０．１５ｇ、０．３２ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９４１分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４７２、ＬＣＭＳ方法Ｃ。
【０８０５】
　ステップ４．（５Ｒ，７Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド、（５Ｒ，７Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド、（５Ｓ，７Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド及び（５Ｓ，７Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミドの合成
　ＴＨＦ（２ｍＬ）中のＮ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２，４－ジオキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド（１４０ｍｇ、３３５μｍｏｌ）の混合物に、Ｅｔ$_3$ＳｉＨ（７８．３ｍｇ、６６９μｍｏｌ）を室温で滴下し、次いで、ＴＦＡ（７６．３ｍｇ、６６９μｍｏｌ）を加えた。混合物を７０℃で２時間撹拌した。反応混合物を真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（移動相Ａ：水（０．１％ギ酸含有）、移動相Ｂ：アセトニトリル）によって精製して、Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド（０．１０ｇ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０２０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４５６、ＬＣＭＳ方法Ｃ。
【０８０６】
　生成物をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＧ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：１５％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：９．２５９；ＲＴ２（分）：１１．３５８；試料溶媒：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；注入量：１．５ｍＬ）によってさらに精製して、（５Ｒ，７Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド、（５Ｒ，７Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド、（５Ｓ，７Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザ

スピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミド及び（５Ｓ，７Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－メチル－２－オキソ－１，３－ジアザスピロ［４．４］ノナン－７－カルボキサミドの全てをオフホワイト色の非晶質固体として得た。

【０８０７】

異性体１：６．８ｍｇ、１５μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ８．１２ （ｄ，Ｊ ＝ ８．６ Ｈｚ，１Ｈ），７．６１ （ｄｄ，Ｊ ＝ ９．０，５．１ Ｈｚ，１Ｈ），７．２６ （ｄｄ，Ｊ ＝ １０．８，９．０ Ｈｚ，１Ｈ），６．６３ （ｓ，１Ｈ），５．４８ （ｄ，Ｊ ＝ ８．５ Ｈｚ，１Ｈ），３．１７ － ３．０６ （ｍ，２Ｈ），３．０６ － ２．９８ （ｍ，１Ｈ），２．５６ （ｓ，３Ｈ），１．９２ （ｔｄ，Ｊ ＝ ９．０，８．５，５．６ Ｈｚ，１Ｈ），１．８２ － １．５４ （ｍ，４Ｈ），１．６０ （ｓ，７Ｈ），１．３７ （ｓ，１Ｈ），１．２６ （ｔ，Ｊ ＝ ９．２ Ｈｚ，１Ｈ），０．９７ （ｄ，Ｊ ＝ ２．８ Ｈｚ，３Ｈ）、ＬＣＭＳ ＲＴ １．２０５分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４５６．１０、ＬＣ方法Ｂ。

【０８０８】

異性体２：７．４ｍｇ、１６μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ８．１１ （ｄ，Ｊ ＝ ８．６ Ｈｚ，１Ｈ），７．６１ （ｄｄ，Ｊ ＝ ８．９，５．１ Ｈｚ，１Ｈ），７．２６ （ｄｄ，Ｊ ＝ １０．７，９．０ Ｈｚ，１Ｈ），６．６５ （ｓ，１Ｈ），５．４８ （ｄ，Ｊ ＝ ８．５ Ｈｚ，１Ｈ），３．２２ （ｄ，Ｊ ＝ ８．８ Ｈｚ，１Ｈ），３．１２ （ｄ，Ｊ ＝ ８．８ Ｈｚ，１Ｈ），３．０２ （ｐ，Ｊ ＝ ７．７ Ｈｚ，１Ｈ），２．５８ （ｓ，３Ｈ），１．８９ （ｄｄ，Ｊ ＝ １３．２，９．３ Ｈｚ，１Ｈ），１．７８ （ｄｔ，Ｊ ＝ １３．０，５．９ Ｈｚ，２Ｈ），１．７２ － １．４４ （ｍ，９Ｈ），１．３８ （ｄ，Ｊ ＝ ６．７ Ｈｚ，１Ｈ），１．３１ － １．２２ （ｍ，１Ｈ），０．９７ （ｄ，Ｊ ＝ ２．８ Ｈｚ，３Ｈ）、ＬＣＭＳ ＲＴ １．１９５分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４５６．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ

【０８０９】

異性体３：２７．４ｍｇ、６０．０μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ８．０８ （ｄ，Ｊ ＝ ８．７ Ｈｚ，１Ｈ），７．６１ （ｄｄ，Ｊ ＝ ８．９，５．０ Ｈｚ，１Ｈ），７．３１ － ７．２１ （ｍ，１Ｈ），６．４５ （ｓ，１Ｈ），５．５０ （ｄ，Ｊ ＝ ８．５ Ｈｚ，１Ｈ），３．１４ （ｑ，Ｊ ＝ ８．５ Ｈｚ，２Ｈ），２．９４ （ｐ，Ｊ ＝ ８．２ Ｈｚ，１Ｈ），２．５１ （ｐ，Ｊ ＝ １．８ Ｈｚ，３Ｈ），１．８５ － １．７１ （ｍ，３Ｈ），１．７１ － １．５０ （ｍ，９Ｈ），１．４１ － １．３３ （ｍ，１Ｈ），１．２７ （ｄ，Ｊ ＝ ８．１ Ｈｚ，１Ｈ），０．９７ （ｄ，Ｊ ＝ ２．８ Ｈｚ，３Ｈ）、ＬＣＭＳ ＲＴ １．２１０分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$，４５６．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ

【０８１０】

異性体４：２７．４ｍｇ、６０．０μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ８．０９ （ｄ，Ｊ ＝ ８．７ Ｈｚ，１Ｈ），７．６２ （ｄｄ，Ｊ ＝ ８．９，５．１ Ｈｚ，１Ｈ），７．２６ （ｄｄ，Ｊ ＝ １０．７，８．９ Ｈｚ，１Ｈ），６．４９ （ｓ，１Ｈ），５．５２ （ｄ，Ｊ ＝ ８．６ Ｈｚ，１Ｈ），３．１９ （ｄ，Ｊ ＝ ８．６ Ｈｚ，１Ｈ），３．１３ （ｄ，Ｊ ＝ ８．５ Ｈｚ，１Ｈ），２．９８ － ２．９０ （ｍ，１Ｈ），２．６１ （ｓ，３Ｈ），１．８９ （ｄｄ，Ｊ ＝ １２．４，７．８ Ｈｚ，１Ｈ），１．７９ － １．４９ （ｍ，１０Ｈ），１．４０ － １．３３ （ｍ，１Ｈ），１．２７ （ｄ，Ｊ ＝ ８．１ Ｈｚ，１Ｈ），０．９６ （ｄ，Ｊ ＝ ２．８ Ｈｚ，３Ｈ）、ＬＣＭＳ ＲＴ １．１９８分、［Ｍ

＋Ｈ］＋　４５６．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

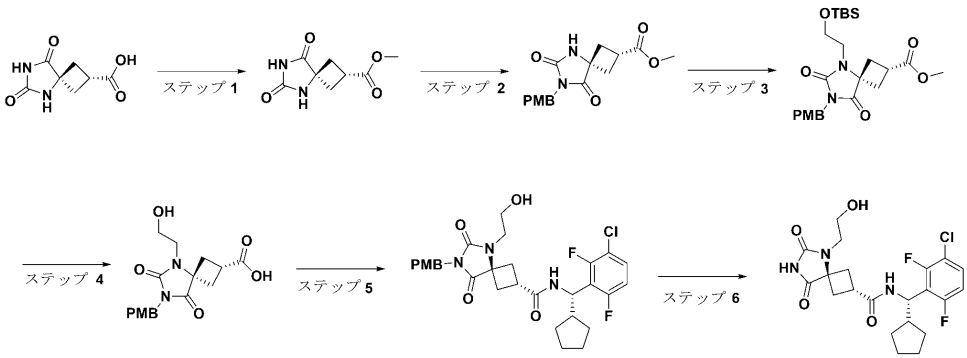
【０８１１】

実施例２３

（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－（２－ヒドロキシエチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド

【０８１２】

【化７６１】



ステップ１．（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチルの合成　ＤＣＭ／ＭｅＯＨ（２：１、１０ｍＬ）中の（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（１ｇ、５ｍｍｏｌ）の混合物に、ＴＭＳＣＨＮ$_2$（８ｍＬ、２Ｍ、１６ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。混合物を室温で２時間攪拌した。反応物を飽和ＮＨ$_4$Ｃｌ（水溶液）でクエンチし、水相をＤＣＭ（２０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：５％から４０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチル（５００ｍｇ、２．５２ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．５３５分、［Ｍ＋Ｈ］＋　１９９、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８１３】

ステップ２．（２ｓ，４ｓ）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチルの合成

ＤＭＦ（２０ｍＬ）中の（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチル（１．７ｇ、８．６ｍｍｏｌ）、Ｃｓ$_2$ＣＯ$_3$（５．６ｇ、１７ｍｍｏｌ）の混合物に、１－（クロロメチル）－４－メトキシベンゼン（１．５ｇ、９．４ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。混合物を０℃で１６時間攪拌した。反応混合物を水（１００ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１００ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで２５分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（２ｓ，４ｓ）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチル（１ｇ、３ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．６９６分、［Ｍ＋Ｈ］＋　３１９、ＬＣＭＳ方法Ａ。

【０８１４】

ステップ３．（２ｓ，４ｓ）－５－（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エチル）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチルの合成

ＤＭＦ（５ｍＬ）中の（２ｓ，４ｓ）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチル（２９０ｍｇ、９１１μｍｏｌ）及びCs_2CO_3（５９４ｍｇ、１．８２ｍｍｏｌ）の混合物に、（２－ブロモエトキシ）（ｔｅｒｔ－ブチル）ジメチルシラン（２６２ｍｇ、１．０９ｍｍｏｌ）を－７８℃で加えた。混合物を室温で２時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍｌ）で希釈し、酢酸エチル（５０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュ（アセトニトリル／水）によって精製して、（２ｓ，４ｓ）－５－（２－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）エチル）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチル（２７５ｍｇ、５７７μｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４５６分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４７７、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８１５】

ステップ４．（２ｓ，４ｓ）－５－（２－ヒドロキシエチル）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸の合成

ＭｅＯＨ（１０ｍＬ）中の（２ｓ，４ｓ）－５－｛２－［（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ］エチル｝－７－［（４－メトキシフェニル）メチル］－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸メチル（１ｇ、２．０９８ｍｍｏｌ）及びＮａＯＨ（０．２５ｇ、６．２９４ｍｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。混合物をＨＣｌ（１Ｎ）でｐＨ５に酸性化した。沈殿した固体を濾過により集め、ＭｅＯＨで洗浄して、（２ｓ，４ｓ）－５－（２－ヒドロキシエチル）－７－［（４－メトキシフェニル）メチル］－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（５３０ｍｇ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．６４０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３４９、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８１６】

ステップ５．（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－（２－ヒドロキシエチル）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

ＤＣＭ（８ｍＬ）中の（２ｓ，４ｓ）－５－（２－ヒドロキシエチル）－７－［（４－メトキシフェニル）メチル］－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（５３０ｍｇ、１．５２１ｍｍｏｌ）、（１Ｓ）－１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－１－シクロペンチルメタンアミン（３７３．８２ｍｇ、１．５２１ｍｍｏｌ）、T_3P（７２６．１４ｍｇ、２．２８１ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（４６１．８８ｍｇ、４．５６３ｍｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相をＤＣＭ（１０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－（２－ヒドロキシエチル）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（５４０ｍｇ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．２２７分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５７６、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８１７】

ステップ６．（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－（２－ヒドロキシエチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

アセトニトリル／H_2O（１０ｍＬ、４：１）中の（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（

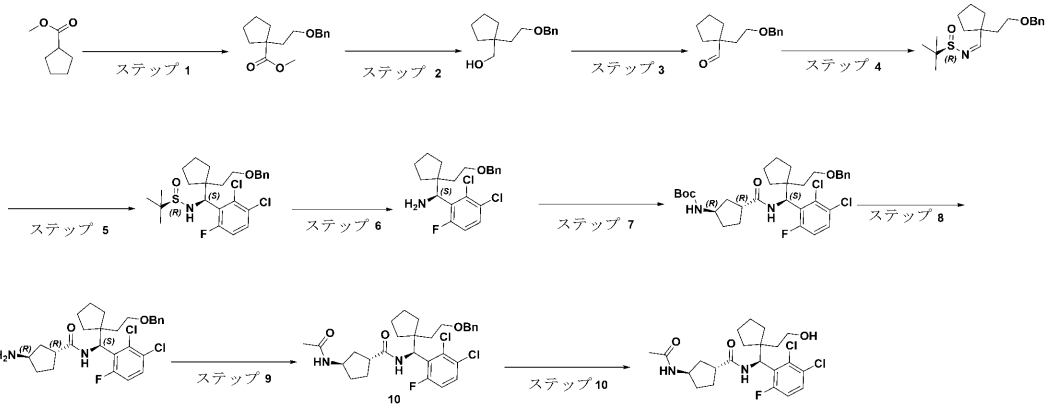
３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－（２－ヒドロキシエチル）－７－（４－メトキシベンジル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（５４０ｍｇ、０．９３７ｍｍｏｌ）及びＣｅ（ＮＨ$_4$）$_2$（ＮＯ$_3$）$_6$（５１５．８１ｍｇ、０．９３７ｍｍｏｌ）の混合物を７０℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（２０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－５－（２－ヒドロキシエチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（１０ｍｇ）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ １０．６２（ｓ，１Ｈ），８．３８（ｄ，Ｊ＝７．４ Ｈｚ，１Ｈ），７．５３（ｔｄ，Ｊ＝８．６，５．４ Ｈｚ，１Ｈ），７．２１－７．０３（ｍ，１Ｈ），４．９７－４．７２（ｍ，２Ｈ），３．６１（ｑ，Ｊ＝５．９ Ｈｚ，２Ｈ），３．４２（ｔ，Ｊ＝６．１ Ｈｚ，２Ｈ），３．１９（ｑ，Ｊ＝９．３ Ｈｚ，１Ｈ），２．６２（ｄｄｄ，Ｊ＝２１．６，１２．６，８．７ Ｈｚ，３Ｈ），２．４７－２．３３（ｍ，２Ｈ），１．８８（ｄｔ，Ｊ＝１２．４，５．１ Ｈｚ，１Ｈ），１．６９－１．４２（ｍ，４Ｈ），１．３２（ｄｄｄ，Ｊ＝２６．８，１２．２，６．２ Ｈｚ，２Ｈ），１．０２（ｄ，Ｊ＝９．８ Ｈｚ，１Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ １．０７８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$ ４５６．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８１８】

実施例２４

（１Ｒ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－（２－ヒドロキシエチル）シクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７６２】



ステップ１．１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンタン－１－カルボン酸メチルの合成

ＴＨＦ（７０ｍＬ）中のシクロペンタンカルボン酸メチル（５ｇ、０．０４ｍｏｌ）の混合物に、ＬＤＡ（３０ｍＬ、２モル、０．０６ｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で１時間撹拌した後、（（２－ブロモエトキシ）メチル）ベンゼン（１０ｇ、０．０５ｍｏｌ）を－７８℃で滴下した。混合物を室温で１６時間撹拌した。反応物を飽和ＮＨ$_4$Ｃｌ（水溶液）でクエンチし、水相を酢酸エチル（２５０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（移動相

Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル）によって精製して、１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンタン－１－カルボン酸メチル（７．２ｇ、２７ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１２３分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２６３、ＬＣＭＳ　方法Ｃ。

【０８１９】

ステップ２．（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）メタノールの合成

ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンタン－１－カルボン酸メチル（７．１ｇ、２７ｍｍｏｌ）の混合物に、ＬｉＡｌＨ$_{4}$（１．２ｇ、３２ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。混合物を室温で２時間撹拌した。反応物を０℃まで冷却し、水（１．５ｍＬ）、水酸化ナトリウム（３ｍＬ、４Ｎ）及び水（１．５ｍＬ）でクエンチした。混合物をセライトパッドに通して濾過した。パッドをＤＣＭで洗浄し、濾液を真空濃縮して、（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）メタノール（５ｇ、０．０２ｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９８８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２３５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２０】

ステップ３．１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンタン－１－カルバルデヒドの合成

ＤＣＭ（１００ｍＬ）中の（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）メタノール（４．９ｇ、２１ｍｍｏｌ）及び分子ふるい４Å活性化粉末（５００ｍｇ）の混合物に、ＰＣＣ（５．４ｇ、２５ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。混合物を０℃で２時間撹拌した。混合物をエーテル／ペンタン（１：１、５００ｍＬ）で希釈した。次いで、混合物をセライト（５０ｇ）に通して濾過した。パッドをエーテルで洗浄した。合わせた濾液を約２ｍＬまで濃縮して（水浴温度＜１５℃）、１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンタン－１－カルバルデヒド（５ｇ、０．０２ｍｏｌ、粗製）を得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１０７分、［Ｍ＋Ｎａ］$^{+}$　２５５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２１】

ステップ４．（Ｒ）－Ｎ－（（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）メチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンタン－１－カルバルデヒド（５．５ｇ、２４ｍｍｏｌ）、（Ｒ）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（３．２ｇ、２６ｍｍｏｌ）及びＴｉ（Ｏ^{i}Ｐｒ）$_{4}$（６．７ｇ、２４ｍｍｏｌ）の混合物を５０℃で２時間撹拌した。反応混合物を水（３００ｍＬ）で希釈し、濾過した。濾液を酢酸エチル（３５０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）メチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２．９ｇ、８．６ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ１．２１０分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３３６、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２２】

ステップ５．（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（５０ｍＬ）中の１，２－ジクロロ－４－フルオロベンゼン（１．７ｇ、１０ｍｍｏｌ）の混合物に、ＬＤＡ（６．３ｍＬ、２モル、１３ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で１時間撹拌した後、（Ｒ）－Ｎ－（（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）メチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２．８ｇ、８．３ｍｍｏｌ）を－７８℃で加えた。混合物を室温で１６時間撹拌した。反応物を飽和ＮＨ$_{4}$Ｃｌ（水溶液）でクエンチし、水相を酢酸エチル（３００ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで

乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２．５ｇ、５．０ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ１．３４２分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５００、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２３】

ステップ６．（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メタンアミンの合成

ＨＣｌ（３０ｍｌ、ジオキサン中４Ｎ）中の（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２．５ｇ、５．０ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間撹拌した。混合物を真空濃縮して、（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メタンアミン（１．９ｇ、４．８ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８９６分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３９６、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２４】

ステップ７．（（１Ｒ，３Ｒ）－３－（（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）カルバモイル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＤＭＦ（８ｍＬ）中の（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メタンアミン（４００ｍｇ、１．０１ｍｍｏｌ）、（１Ｒ，３Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボン酸（２３１ｍｇ、１．０１ｍｍｏｌ）、ＴＥＡ（３０６ｍｇ、３．０３ｍｍｏｌ）の混合物に、T_3P（６４２ｍｇ、２．０２ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（６０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（（１Ｒ，３Ｒ）－３－（（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）カルバモイル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３６０ｍｇ、５９３μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ１．４６９分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　６０７、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２５】

ステップ８．（１Ｒ，３Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＨＣｌ（５ｍｌ、ジオキサン中４Ｎ）中の（（１Ｒ，３Ｒ）－３－（（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）カルバモイル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３４０ｍｇ、５６０μｍｏｌ）の混合物を室温で１時間撹拌した。混合物を真空濃縮して、（１Ｒ，３Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（２３０ｍｇ、４５３μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９２１分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５０７、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２６】

ステップ９．（１Ｒ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＣＭ（５ｍＬ）中の（１Ｒ，３Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベ

ンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（２００ｍｇ、３９４μｍｏｌ）及びＴＥＡ（１１９ｍｇ、１．１８ｍｍｏｌ）の混合物に、塩化アセチル（３０．９ｍｇ、３９４μｍｏｌ）を０℃で滴下した。溶液を室温で１時間攪拌した。反応物を水でクエンチした。水相を酢酸エチル（５０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（１Ｒ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（１９０ｍｇ、３４６μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１２９分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　５４９、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２７】

ステップ１０．（１Ｒ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－（２－ヒドロキシエチル）シクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

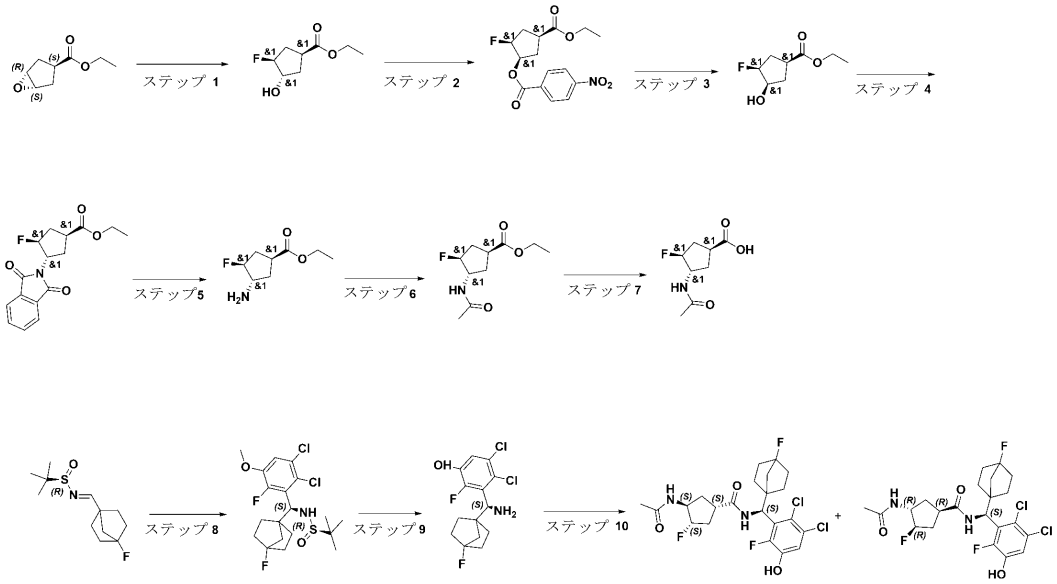
アセトニトリル／H_2O（２：１、１０ｍＬ）中の（１Ｒ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（１－（２－（ベンジルオキシ）エチル）シクロペンチル）（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（１００ｍｇ、１８２μｍｏｌ）及び$Ce(NH_4)_2(NO_3)_6$（９９７ｍｇ、１．８２ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１６時間攪拌した。混合物を水で希釈した。混合物を酢酸エチル（１００ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｘｓｅｌｅｃｔ　ＣＳＨ　Ｃ１８　ＯＢＤ　Ｃｏｌｕｍｎ　３０＊１５０ｍｍ　５μｍ；移動相Ａ：水（０．１％ギ酸）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３６％Ｂから４７％Ｂで７分、次いで、４７％Ｂ；波長：２５４／２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：６．２９）によって精製して、（１Ｒ，３Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－（２－ヒドロキシエチル）シクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（１６．３ｍｇ、３５．５μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．１５　（ｄ，Ｊ　＝　８．６　Ｈｚ，１Ｈ），７．７７　（ｄ，Ｊ　＝　７．０　Ｈｚ，１Ｈ），７．６１　（ｄｄ，Ｊ　＝　９．０，５．０　Ｈｚ，１Ｈ），７．２５　（ｄｄ，Ｊ　＝　１０．８，８．９　Ｈｚ，１Ｈ），５．５１　（ｄ，Ｊ　＝　８．５　Ｈｚ，１Ｈ），４．４０　（ｔ，Ｊ　＝　４．７　Ｈｚ，１Ｈ），４．００　（ｑ，Ｊ　＝　６．５　Ｈｚ，１Ｈ），３．４３　（ｓ，２Ｈ），２．９９　－　２．９１　（ｍ，１Ｈ），１．９４　－　１．７２　（ｍ，７Ｈ），１．６２　（ｄｔ，Ｊ　＝　１４．０，８．２　Ｈｚ，３Ｈ），１．５６　－　１．３０　（ｍ，８Ｈ），１．１５　（ｔ，Ｊ　＝　１０．６　Ｈｚ，１Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８１７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４５９、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８２８】

実施例２５

（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｒ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７６３】



ステップ１．（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

（１Ｒ，３ｓ，５Ｓ）－６－オキサビシクロ［３．１．０］ヘキサン－３－カルボン酸エチル（９．５ｇ、６１ｍｍｏｌ）及び$Et_3N-(HF)_3$（２０ｇ、０．１２ｍｏｌ）の混合物を１１０℃で５時間撹拌した。室温まで冷却した後、反応物を水（１００ｍＬ）の添加によりクエンチした。得られた混合物を酢酸エチル（３×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を水（１×１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（１２０ｇカラム；石油エーテル／酢酸エチルによる溶出；比率：１０／１）によって精製して、（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（８．０ｇ、０．０５ｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，クロロホルム－ｄ） δ ４．８５ （ｄｄｄｄ，Ｊ ＝ ５１．５，５．６，３．８，１．６ Ｈｚ，１Ｈ），４．３９ （ｄｄｔ，Ｊ ＝ １０．８，５．２，２．４ Ｈｚ，１Ｈ），４．１６ （ｑ，Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ，２Ｈ），３．０９ （ｄｔｄ，Ｊ ＝ １０．０，８．４，６．１ Ｈｚ，１Ｈ），２．４３ （ｄｄｄｄ，Ｊ ＝ ２９．４，１５．４，１０．０，５．６ Ｈｚ，１Ｈ），２．３４ － ２．０８ （ｍ，２Ｈ），１．９７ （ｄｄｄ，Ｊ ＝ １４．１，８．４，２．７ Ｈｚ，１Ｈ），１．２７ （ｔ，Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ，３Ｈ）．

【０８２９】

ステップ２．（±）－（１Ｒ，２Ｓ，４Ｓ）－４－（エトキシカルボニル）－２－フルオロシクロペンチル４－ニトロベンゾエートの合成

（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－フルオロ－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（７．５ｇ、４３ｍｍｏｌ）、４－ニトロ安息香酸（８．５ｇ、５１ｍｍｏｌ）及びトリフェニルホスフィン（２６ｇ、９８ｍｍｏｌ）の混合物に、ＤＩＡＤ（２０ｇ、９８ｍｍｏｌ）をN_2下にて０℃で滴下した。溶液を２５℃で１２時間撹拌した。反応物を水（１００ｍＬ）の添加により室温でクエンチした。得られた混合物を酢酸エチル（３×１５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を水（１×１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（１２０ｇカラム；石油エーテル／酢酸エチルによる溶出；比率：１５／１）によって精製して、（±）－（１Ｒ，２Ｓ，４Ｓ）－４－（エトキシカルボニル）－２－フルオロシクロペンチル４－ニトロベンゾエート（１１．５ｇ、３５．４ｍｍ

ｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．４４　－　８．３２　（ｍ，　２Ｈ），　８．２６　－　８．１３　（ｍ，　２Ｈ），　５．３７　－　５．０８　（ｍ，　２Ｈ），　４．１１　（ｑ，　Ｊ　＝　７．１　Ｈｚ，　２Ｈ），　３．０５　（ｄｔｄ，　Ｊ　＝　１０．３，　８．５，　６．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．４０　（ｔｄｄ，　Ｊ　＝　２２．３，　９．５，　５．７　Ｈｚ，　２Ｈ），　２．２２　（ｄｄｄｄ，　Ｊ　＝　２３．６，　１５．５，　６．９，　２．７　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．２２　（ｄｔ，　Ｊ　＝　１４．３，　６．３　Ｈｚ，　３Ｈ）．

【０８３０】

ステップ３．（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

ＴＨＦ／ＥｔＯＨ／$Ｈ_{2}Ｏ$（３０ｍｌ、４／１／１）中の（±）－（１Ｒ，２Ｓ，４Ｓ）－４－（エトキシカルボニル）－２－フルオロシクロペンチル４－ニトロベンゾエート（９．５ｇ、２９ｍｍｏｌ）及び水酸化リチウム（０．７７ｇ、３２ｍｍｏｌ）の混合物を２５℃で２時間撹拌した。混合物を濃縮し、水溶液のｐＨを６に調整した。反応混合物を酢酸エチル（１５０ｍＬ）で３回抽出した。有機層を合わせ、$Ｎａ_{2}ＳＯ_{4}$で乾燥させ、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーによって精製し、石油エーテル／酢酸エチル　３／１で溶出して、（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（４ｇ、０．０２ｍｏｌ）を無色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　クロロホルム－ｄ）　δ　４．８７　（ｄｑ，　Ｊ　＝　５４．３，　３．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１７　（ｑ，　Ｊ　＝　７．１　Ｈｚ，　２Ｈ），　４．１１　－　３．９７　（ｍ，　１Ｈ），　２．９０　－　２．７１　（ｍ，　１Ｈ），　２．５３　（ｓ，　１Ｈ），　２．３６　（ｄｔ，　Ｊ　＝　６．２，　３．１　Ｈｚ，　３Ｈ），　２．３１　－　２．１３　（ｍ，　１Ｈ），　１．２７　（ｔ，　Ｊ　＝　７．０　Ｈｚ，　３Ｈ）．

【０８３１】

ステップ４．（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－（１，３－ジオキソイソインドリン－２－イル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－フルオロ－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（５．７ｇ、３２ｍｍｏｌ）、ｔｒｉフェニルｐｈｏｓｐｈａｎｅ（１０ｇ、３９ｍｍｏｌ）及びイソインドリン－１，３－ジオン（５．７ｇ、３９ｍｍｏｌ）の混合物に、ＤＩＡＤ（７．９ｇ、３９ｍｍｏｌ）を滴下した。溶液を２５℃で１２時間撹拌した。反応物を水でクエンチし、酢酸エチル（２００ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から８０％Ｂで２５分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－（１，３－ジオキソイソインドリン－２－イル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（３ｇ、０．０１ｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－$ｄ_{6}$）　δ　７．９８　－　７．７５　（ｍ，　４Ｈ），　５．４５　（ｄｄｔ，　Ｊ　＝　５３．７，　６．６，　４．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．７０　（ｄｔｄ，　Ｊ　＝　２４．９，　８．６，　４．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１１　（ｑｄ，　Ｊ　＝　７．１，　１．４　Ｈｚ，　２Ｈ），　３．２３　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．５，　４．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．７１　－　２．５０　（ｍ，　１Ｈ），　２．３６　（ｄｄｄ，　Ｊ　＝　１４．１，　９．５，　４．８　Ｈｚ，１Ｈ），　２．２６　－　２．０４　（ｍ，　２Ｈ），　１．２１　（ｔ，　Ｊ　＝　７．１　Ｈｚ，　３Ｈ）．

【０８３２】

ステップ５．（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アミノ－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

ＥｔＯＨ（２０ｍＬ）中の（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－（１，３－ジオキソイソインドリン－２－イル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（５０

０ｍｇ、１．６４ｍｍｏｌ）及び$N_2H_4 . H_2O$（１６４ｍｇ、３．２８ｍｍｏｌ）の混合物を７０℃で２時間撹拌した。反応混合物を濾過し、パッドをＥｔＯＨで洗浄し、濾液を真空濃縮して、（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アミノ－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（２３５ｍｇ、１．１ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．４８１分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　１７６、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８３３】

ステップ６．（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

ＤＣＭ（５ｍＬ）中の（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アミノ－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（２３５ｍｇ、１．３４ｍｍｏｌ）及びトリエチルアミン（４０７ｍｇ、４．０２ｍｍｏｌ）の混合物に、塩化アセチル（１５８ｍｇ、２．０１ｍｍｏｌ）を滴下した。溶液を０℃で２時間撹拌した。反応物を水（１０ｍＬ）でクエンチし、酢酸エチル（５０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮して、（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（２００ｍｇ、９２１μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．５４２分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　２１８、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８３４】

ステップ７．（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（２４０ｍｇ、１．１０ｍｍｏｌ）及びＬｉＯＨ（７９．４ｍｇ、３．３１ｍｍｏｌ）の混合物をＭｅＯＨ／H_2O（４ｍｌ、３／１）中に溶解した。溶液を２５℃で３時間撹拌した。混合物を濃縮し、残渣のｐＨを６に調整した。溶液を真空濃縮して、（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸（２００ｍｇ、１．０６ｍｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得、これをさらに精製することなく次のステップに使用した。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．２７８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　１９０、ＬＣＭＳ方法Ａ。

【０８３５】

ステップ８．（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－メトキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（８０ｍＬ）中の１，２－ジクロロ－４－フルオロ－５－メトキシベンゼン（１ｇ、６ｍｍｏｌ）の溶液に、ＬＤＡ（ＴＨＦ中２Ｍ、５．５ｍＬ、１１ｍｍｏｌ）をN_2雰囲気下にて－７８℃で滴下した。反応混合物を－７８℃で１時間撹拌した後、ＴＨＦ（５ｍＬ）中の（Ｒ）－Ｎ－（（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１ｇ、４ｍｍｏｌ）の溶液をN_2下にて－７８℃で加えた。混合物を－７８℃で２時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl溶液（１００ｍＬ）でクエンチし、混合物をＥｔＯＡｃ（３＊１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機抽出物をブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。得られた粗製物質をフラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－メトキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（８８０ｍｇ、２．００ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４４０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８３６】

ステップ９．（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノールの合成

（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－メトキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロ

パン－２－スルフィンアミド（９４０ｍｇ、２．１３ｍｍｏｌ）にＨＢｒ（４０ｍｌ、ＡｃＯＨ中３３％）を加えた。溶液を１００℃で２４時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮した。混合物をＮａＯＨ（４Ｎ、水溶液）でｐＨ７に調整した。得られた混合物を酢酸エチル（３×５０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を水（５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。得られた粗製物質をフラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノール（６３０ｍｇ、１．９６ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．６６分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３２２、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０８３７】

ステップ１０．（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｒ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノール（５０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）、（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボン酸（２９ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（３９ｍｇ、０．４７ｍｍｏｌ）の混合物に、ＨＡＴＵ（８８ｍｇ、０．２３ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（５０ｍｌ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；０％から１００％グラジエントで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍによって精製した。得られた粗製物質をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｓｕｎｆｉｒｅ　ｐｒｅｐ　Ｃ１８　ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（０．１％ギ酸）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：４０％Ｂから５１％Ｂで７分、次いで、５１％Ｂ；波長：２５４／２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：６．５）によって精製して、（±）－（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド（４０ｍｇ、８１μｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。

【０８３８】

生成物をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＥ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　NH_3－ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：２０％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：６．１８；ＲＴ２（分）：７．６７；試料溶媒：ＥｔＯＨ；注入量：０．３５ｍＬ）によってさらに精製して、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｒ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－フルオロシクロペンタン－１－カルボキサミドの両方をオフホワイト色の非晶質固体として得た。

【０８３９】

異性体１：５．２ｍｇ、１０μｍｏｌ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．１４　（ｄ，　Ｊ　＝　８．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．９３　（ｄ，　Ｊ　＝　６．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．０８　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ）

，５．５１－５．３５（ｍ，１Ｈ），４．８３（ｄｑ，Ｊ＝５３．３，５．０Ｈｚ，１Ｈ），４．０７（ｄ，Ｊ＝１１．８Ｈｚ，１Ｈ），３．００（ｐ，Ｊ＝７．９Ｈｚ，１Ｈ），２．３４－２．１５（ｍ，１Ｈ），１．９９（ｄｔ，Ｊ＝１４．０，７．７Ｈｚ，１Ｈ），１．８０（ｄ，Ｊ＝４．６Ｈｚ，６Ｈ），１．７５－１．６１（ｍ，５Ｈ），１．６０－１．３５（ｍ，４Ｈ）．ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９５８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４９３．１５、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８４０】

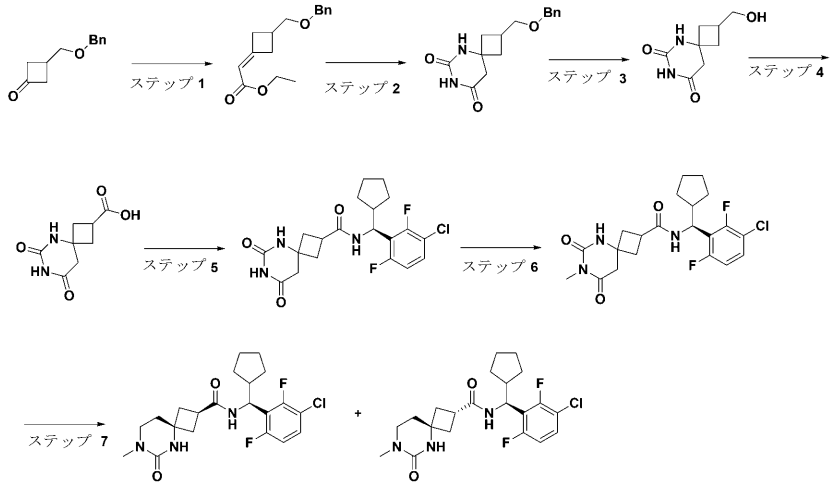
異性体２：５．７ｍｇ、１１μｍｏｌ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ　１０．６０（ｓ，１Ｈ），８．３６－８．１１（ｍ，１Ｈ），７．９３（ｄ，Ｊ＝６．７Ｈｚ，１Ｈ），７．１１（ｄ，Ｊ＝８．２Ｈｚ，１Ｈ），５．５１－５．２９（ｍ，１Ｈ），４．８６（ｄｑ，Ｊ＝５３．２，４．６Ｈｚ，１Ｈ），４．２８－３．９７（ｍ，１Ｈ），３．０８－２．８９（ｍ，１Ｈ），２．３９－２．２４（ｍ，１Ｈ），２．０４－１．８３（ｍ，４Ｈ），１．８０（ｓ，５Ｈ），１．７４－１．６０（ｍ，４Ｈ），１．５４（ｄｑ，Ｊ＝２１．６，１０．１，９．０Ｈｚ，３Ｈ）．ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．５２２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４９３．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８４１】

実施例２６

（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６－オキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド及び（２ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６－オキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド

【化７６４】



ステップ１．２－（３－（（ベンジルオキシ）メチル）シクロブチリデン）酢酸エチルの合成

ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の３－（（ベンジルオキシ）メチル）シクロブタン－１－オン（１０ｇ、５３ｍｍｏｌ）及び２－（ジエトキシホスホリル）酢酸エチル（１４ｇ、６３ｍｍｏｌ）の混合物に、ＮａＨ（１．３ｇ、５３ｍｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。混合物を室温で１時間攪拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液）（３０ｍｌ）でクエンチし、水相を酢酸エチル（１００ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をシリカゲルクロマトグラフィー（１００ｇカラム；石油エーテル：酢酸エチル　５：１による溶出）によって精製して、２－（３－（（ベンジルオキシ）メチル）シクロブチリデン）酢酸

エチル（１３．４６ｇ、５１．７０ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０８２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２６１、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８４２】

ステップ２．２－（（ベンジルオキシ）メチル）－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６，８－ジオンの合成

ＮＭＰ（１２０ｍＬ）中の２－（３－（（ベンジルオキシ）メチル）シクロブチリデン）酢酸エチル（１１ｇ、４２ｍｍｏｌ）及び尿素（１５ｇ、０．２ｍｏｌ）の混合物に、ＤＢＵ（２５ｍＬ、０．１７ｍｏｌ）を室温で加えた。混合物を１４０℃で１６時間撹拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を水（１５０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１５０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から６０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、２－（（ベンジルオキシ）メチル）－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６，８－ジオン（７．０７ｇ、２５．８ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９０２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２７５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８４３】

ステップ３．２－（ヒドロキシメチル）－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６，８－ジオンの合成

ＭｅＯＨ（６０ｍＬ）中の２－（（ベンジルオキシ）メチル）－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６，８－ジオン（５．５ｇ、２０ｍｍｏｌ）及びＰｄ／Ｃ（０．２１ｇ）の混合物をH_2（２０ａｔｍ）で処理し、室温で一晩撹拌した。反応混合物をセライトパッドに通して濾過し、ＭｅＯＨ（２００ｍＬ）で洗浄し、濾液を真空濃縮した。得られた粗製物質をシリカゲルクロマトグラフィー（１００ｇカラム；ＤＣＭ：ＭｅＯＨ　２５：１による溶出）によって精製して、２－（ヒドロキシメチル）－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６，８－ジオン（３．２２ｇ、１７．５ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．２０２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　１８５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８４４】

ステップ４．６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボン酸の合成

H_2O（５ｍＬ）中の２－（ヒドロキシメチル）－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－６，８－ジオン（４００ｍｇ、２．１７ｍｍｏｌ）の混合物に、H_2O（５ｍＬ）中の$KMnO_4$（３４３ｍｇ、２．１７ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で加えた。混合物を室温で３時間撹拌した。反応混合物をセライトパッドに通して濾過し、パッドをＭｅＯＨ（５０ｍＬ）で洗浄し、濾液を真空濃縮して、６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボン酸（４００ｍｇ、２．０２ｍｍｏｌ）を茶色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．１１９分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　１９９、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０８４５】

ステップ５．（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（４ｍＬ）中の６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボン酸（４００ｍｇ、２．０２ｍｍｏｌ）、（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（４９６ｍｇ、２．０２ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（６１２ｍｇ、６．０ｍｍｏｌ）の混合物に、T_3P（１．９３ｇ、６．０６ｍｍｏｌ）を室温で加えた。混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（２０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3）、移動相Ｂ：アセトニ

トリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：２５％Ｂから５５％Ｂで８分、次いで、５５％Ｂ；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：７．６８）によって精製して、（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド［３．５］ノナン－２－カルボキサミド（３８０ｍｇ、８９２μｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０６０分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３９０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８４６】

ステップ６．（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミドの合成

トルエン（２ｍＬ）中の（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド（１４０ｍｇ、３２９μｍｏｌ）の混合物に、１，１－ジメトキシ－Ｎ，Ｎ－ジメチルエタン－１－アミン（１３１ｍｇ、９８６μｍｏｌ）を加えた。混合物を１１０℃で２時間撹拌した。混合物を真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：４５％から６５％Ｂで１５分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド（１００ｍｇ、２２７μｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１３５分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４４０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８４７】

ステップ７．（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６－オキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド及び（２ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６－オキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミドの合成

ＴＨＦ（２ｍＬ）中の（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド（８０ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）の混合物に、BF_3－Et_2O（３１ｍｇ、０．２２ｍｍｏｌ）及び$NaBH_4$（６．９ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＹＭＣ－Ａｃｔｕｓ　Ｔｒｉａｒｔ　Ｃ１８　Ｅｘ　ＲＳ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3＋０．１％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３０％Ｂから５５％Ｂで９分、５５％Ｂから６０％Ｂで９．５分、次いで、６０％Ｂ；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：９．１３）によって精製して、（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６－オキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド（３５ｍｇ、８２μｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．５０３分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４２６、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０８４８】

生成物を分取キラルＨＰＬＣ（カラム：ＤＺ－ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ－３、４．６＊５０ｍｍ、３．０μｍ；移動相Ａ：ヘキサン：ＥｔＯＨ　７０：３０；流量：１ｍＬ／分；グラジエント：０％Ｂアイソクラティック；注入量：０．５ｍＬ）によって精製した。凍結乾燥により、（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６－オキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミド及び（２ｓ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－ク

ロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－７－メチル－６－オキソ－５，７－ジアザスピロ［３．５］ノナン－２－カルボキサミドの両方をオフホワイト色の非晶質固体として得た。

【０８４９】

異性体１：２．３ｍｇ、５．４μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－d_6） δ ８．３７ （ｄ， Ｊ ＝ ７．４ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．５３ （ｔｄ， Ｊ ＝ ８．７， ５．５ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．１２ （ｔ， Ｊ ＝ ９．６ Ｈｚ， １Ｈ）， ６．７０ （ｓ， １Ｈ）， ４．８２ （ｄｄ， Ｊ ＝ １１．１， ７．４ Ｈｚ， １Ｈ）， ３．０４ （ｔ， Ｊ ＝ ６．０ Ｈｚ， ２Ｈ）， ２．９４ （ｄｑ， Ｊ ＝ １０．０， ４．９ Ｈｚ， １Ｈ）， ２．７１ （ｓ， ３Ｈ）， ２．４１ （ｄ， Ｊ ＝ ９．１ Ｈｚ， １Ｈ）， ２．２５ （ｔ， Ｊ ＝ １１．０ Ｈｚ， １Ｈ）， ２．１５ （ｑ， Ｊ ＝ １４．３， １２．８ Ｈｚ， ２Ｈ）， ２．０３ （ｄ， Ｊ ＝ １２．６ Ｈｚ， １Ｈ）， １．９０ （ｄ， Ｊ ＝ ８．２ Ｈｚ， １Ｈ）， １．７４ （ｄｄ， Ｊ ＝ ７．４， ４．７ Ｈｚ， ２Ｈ）， １．５９ （ｓ， ３Ｈ）， １．５１ （ｄｔ， Ｊ ＝ １６．６， ９．３ Ｈｚ， １Ｈ）， １．３８－１．３０ （ｍ， １Ｈ）， １．２４ （ｓ， １Ｈ）， １．００ （ｓ， １Ｈ）． ＬＣＭＳ ＲＴ １．５３７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４２６、ＬＣＭＳ方法Ｄ；

【０８５０】

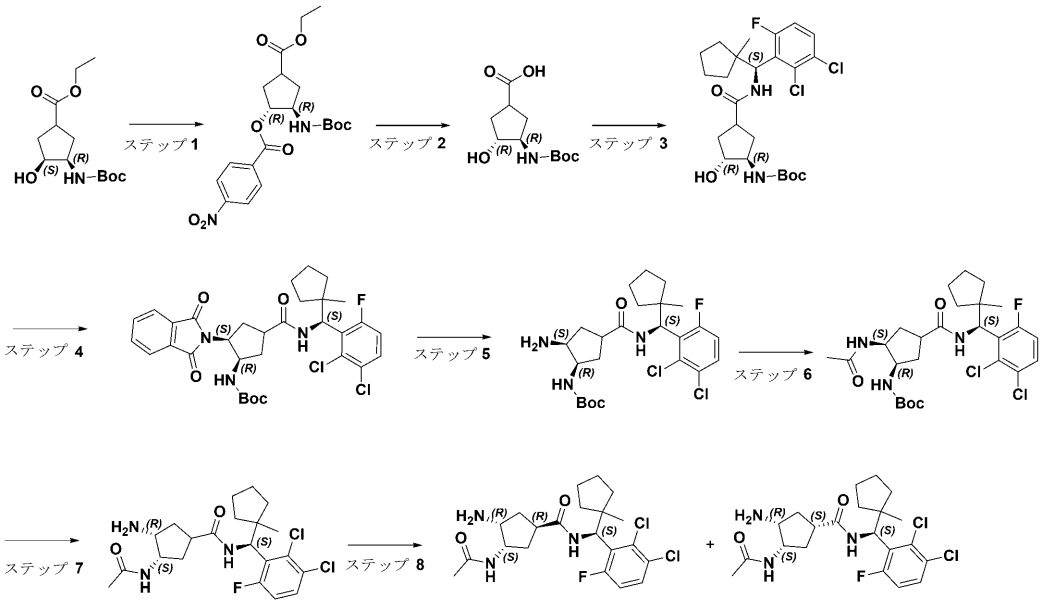
異性体２：３．１ｍｇ、７．３μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－d_6） δ ８．２７ （ｄ， Ｊ ＝ ７．５ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．５３ （ｔｄ， Ｊ ＝ ８．７， ５．５ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．１２ （ｔ， Ｊ ＝ ９．３ Ｈｚ， １Ｈ）， ６．５４ （ｓ， １Ｈ）， ４．８３ （ｄｄ， Ｊ ＝ １１．２， ７．５ Ｈｚ， １Ｈ）， ３．１４ （ｔ， Ｊ ＝ ５．９ Ｈｚ， ２Ｈ）， ２．７２ （ｓ， ３Ｈ）， ２．４１ （ｄ， Ｊ ＝ ９．０ Ｈｚ， １Ｈ）， ２．２６ （ｔ， Ｊ ＝ １１．０ Ｈｚ， １Ｈ）， ２．１６ （ｔ， Ｊ ＝ １０．１ Ｈｚ， １Ｈ）， ２．１１－２．０１ （ｍ， ２Ｈ）， ２．００ （ｓ， １Ｈ）， １．９４－１．８５ （ｍ， １Ｈ）， １．８０ （ｔ， Ｊ ＝ ５．９ Ｈｚ， ２Ｈ）， １．６４－１．５１ （ｍ， ４Ｈ）， １．４９ （ｄｄ， Ｊ ＝ １５．５， ７．５ Ｈｚ， １Ｈ）， １．３８－１．３０ （ｍ， １Ｈ）， １．００ （ｓ， １Ｈ）． ＬＣＭＳ ＲＴ １．５３７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４２６、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０８５１】

実施例２７

（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７６５】



ステップ１．（１Ｒ，２Ｒ）－２－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（エトキシカルボニル）シクロペンチル４－ニトロベンゾエートの合成

ＴＨＦ（２０ｍＬ）中の（３Ｒ，４Ｓ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（１．９１ｇ、７ｍｍｏｌ）、４－ニトロ安息香酸（１．１７ｇ、７ｍｍｏｌ）及びトリフェニルホスフィン（１．８３ｇ、７ｍｍｏｌ）の攪拌溶液に、ＤＩＡＤ（１．４１ｇ、７ｍｍｏｌ）を０℃で滴下した。得られた混合物を２５℃で２時間攪拌した。反応混合物を水（３０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（３０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から１００％Ｂで３０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（１Ｒ，２Ｒ）－２－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（エトキシカルボニル）シクロペンチル４－ニトロベンゾエート（１．２ｇ、２．８ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ＝１．２３分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４２３、ＬＣＭＳ方法Ａ。

【０８５２】

ステップ２．（３Ｒ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

ＭｅＯＨ（４ｍＬ）中の（１Ｒ，２Ｒ）－２－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－（エトキシカルボニル）シクロペンチル４－ニトロベンゾエート（５００ｍｇ、１．１８ｍｍｏｌ）の溶液に、H_2O（１ｍＬ）中の水酸化リチウム（１４２ｍｇ、５．９２ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１時間攪拌した。溶液を減圧下で濃縮して、ＭｅＯＨを除去した。残渣をＨＣｌ（２Ｎ）でｐＨ５～６に酸性化した。溶液を減圧下で濃縮乾固して、（３Ｒ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸（２７０ｍｇ、１．１０ｍｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．３８８分、［Ｍ－Ｈ］$^{-}$　２４４、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８５３】

ステップ３．（（１Ｒ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＤＭＦ（５ｍＬ）中の（３Ｒ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミ

ノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸（２７０ｍｇ、１．１０ｍｍｏｌ）、（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メタンアミン（３６５ｍｇ、１．３２ｍｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（３７０ｍｇ、４．４０ｍｍｏｌ）の混合物に、ＨＡＴＵ（８３７ｍｇ、２．２０ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を室温で１時間撹拌した。反応物を水（１０ｍｌ）でクエンチし、酢酸エチル（２０ｍｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（（１Ｒ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３００ｍｇ、５９６μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１２９分、ｍ／ｚ　[Ｍ－５６＋Ｈ]$^+$　４４６、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８５４】

ステップ４．（（１Ｒ，２Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）－２－（１，３－ジオキソイソインドリン－２－イル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＴＨＦ（６ｍＬ）中の（（１Ｒ，２Ｒ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１０５ｍｇ、７１５μｍｏｌ）及びトリフェニルホスフィン（２３４ｍｇ、８９４μｍｏｌ）の混合物に、ＤＩＡＤ（１７４μＬ、８９４μｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。混合物を２５℃で１６時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（４０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで２０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（（１Ｒ，２Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）－２－（１，３－ジオキソイソインドリン－２－イル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２４０ｍｇ、３７９μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．２７９分、[Ｍ－５６＋Ｈ]$^+$　５７６、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８５５】

ステップ５．（（１Ｒ，２Ｓ）－２－アミノ－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＥｔＯＨ（４ｍＬ）中の（（１Ｒ，２Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）－２－（１，３－ジオキソイソインドリン－２－イル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（２２０ｍｇ、３４８μｍｏｌ）の溶液に、ヒドラジン水化物（３４．８ｍｇ、６９６μｍｏｌ）を加えた。混合物を７０℃で２時間加熱した。反応混合物を濾過し、集めた固体をＥｔＯＨで洗浄し、濾液を真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（（１Ｒ，２Ｓ）－２－アミノ－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１３０ｍｇ、２５９μｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０３５分、[Ｍ＋Ｈ]$^+$　５０２、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８５６】

ステップ６．（（１Ｒ，２Ｓ）－２－アセトアミド－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）シ

クロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成
ＤＭＦ（４ｍＬ）中の（（１Ｒ，２Ｓ）－２－アミノ－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１２０ｍｇ、２３９μｍｏｌ）、酢酸（１７．２ｍｇ、２８７μｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（８０．２ｍｇ、９５５μｍｏｌ）の混合物に、ＨＡＴＵ（１８２ｍｇ、４７８μｍｏｌ）を加えた。混合物を室温で１時間撹拌した。反応物を水（１０ｍｌ）でクエンチし、酢酸エチル（２０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（（１Ｒ，２Ｓ）－２－アセトアミド－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１００ｍｇ、１８４μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．２３８分、［Ｍ－１００＋Ｈ］$^+$　４４４、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８５７】
ステップ７．（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成
ＨＣｌ（４ｍＬ、ＭｅＯＨ中４Ｎ）中の（（１Ｒ，２Ｓ）－２－アセトアミド－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）カルバモイル）シクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１００ｍｇ、１８４μｍｏｌ）の溶液を２５℃で１時間撹拌した。溶液を減圧下で濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９２７分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４４４、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８５８】
ステップ８．（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成
（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＨ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：１５％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：６．２３；ＲＴ２（分）：７．９４；試料溶媒：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；注入量：０．２５ｍＬ）によって精製して、（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの両方を白色の非晶質固体として得た。

【０８５９】

異性体１：５．７ｍｇ、１３μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$） δ ８．０８ （ｄ， Ｊ ＝ ８．９ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．５９ （ｓ， ２Ｈ）， ７．２５ （ｔ， Ｊ ＝ ９．９ Ｈｚ， １Ｈ）， ５．４７ （ｄ， Ｊ ＝ ８．５ Ｈｚ， １Ｈ）， ３．９０ （ｓ， １Ｈ）， ３．３１ （ｓ， １Ｈ）， ３．１２－３．０４ （ｍ， ２Ｈ）， ２．３１ （ｓ， １Ｈ）， １．８２ （ｄ， Ｊ ＝ ６．８ Ｈｚ， ３Ｈ）， １．５９ （ｓ， ９Ｈ）， １．３７ （ｓ， １Ｈ）， １．２３ （ｓ， ３Ｈ）， ０．９６ （ｓ， ３Ｈ）． ＬＣＭＳ ＲＴ １．２９８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４４４．１５、ＬＣＭＳ方法Ｃ

【０８６０】

異性体２：４．８ｍｇ、１１μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$） δ ８．１０ （ｓ， １Ｈ）， ７．６１ （ｄｄ， Ｊ ＝ ９．０， ４．９ Ｈｚ， ２Ｈ）， ７．２５ （ｔ， Ｊ ＝ ９．９ Ｈｚ， １Ｈ）， ５．４６ （ｄ， Ｊ ＝ ８．４ Ｈｚ， １Ｈ）， ３．８９ （ｓ， １Ｈ）， １．８２ （ｓ， ３Ｈ）， １．７０ （ｄ， Ｊ ＝ ９．６ Ｈｚ， ４Ｈ）， １．５９ （ｓ， ９Ｈ）， １．３６ （ｄ， Ｊ ＝ １０．６ Ｈｚ， １Ｈ）， １．２５ （ｄ， Ｊ ＝ １１．８ Ｈｚ， ２Ｈ）， ０．９９－０．９３ （ｍ， ３Ｈ）． ＬＣＭＳ ＲＴ ０．９３８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４４４、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

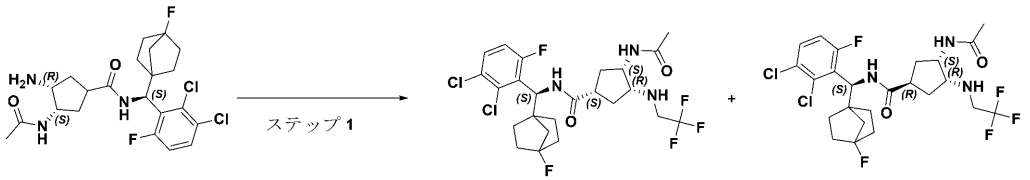
【０８６１】

実施例２８

（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（２，２，２－トリフルオロエチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（２，２，２－トリフルオロエチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド

【０８６２】

【化７６６】



ステップ１．（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（２，２，２－トリフルオロエチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（２，２，２－トリフルオロエチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＭｅＯＨ（４ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（７０ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）及び４Åモレキュラーシーブ（２００ｍｇ）の混合物に、２，２，２－トリフルオロアセトアルデヒド（２２ｍｇ、０．２２ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で３０分間攪拌した後、Ｎａ ＢＨ$_{3}$ＣＮ（２８ｍｇ、０．４４ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１６時間攪拌した。反応混合物を水（５ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウム

で乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、黄色の油状物を得、これをキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：（Ｒ，Ｒ）－ＷＨＥＬＫ－Ｏ１－Ｋｒｏｍａｓｉｌ、２．１１＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　ＮＨ$_3$／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：イソプロパノール：ＤＣＭ　１：１；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：４０％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：１４．６２；ＲＴ２（分）：２２．０８；試料溶媒：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；注入量：０．７ｍＬ）によってさらに精製して、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（２，２，２－トリフルオロエチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（２，２，２－トリフルオロエチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの両方を白色の非晶質固体として得た。

【０８６３】

異性体１：１０ｍｇ、０．０２２ｍｍｏｌ。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０７８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５５６、ＬＣＭＳ方法Ｄ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）　δ　８．１３　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６１　（ｄｄ，　Ｊ　＝　８．９，　５．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．４８　（ｄ，　Ｊ　＝　７．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２５　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．７，　９．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．４８　（ｄ，　Ｊ　＝　７．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１２－３．８４　（ｍ，　１Ｈ），　３．２８－３．１１　（ｍ，　３Ｈ），　２．９６　（ｄ，　Ｊ　＝　６．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．１１　（ｑ，　Ｊ　＝　７．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．９５　－１．４３　（ｍ，　１６Ｈ）．

【０８６４】

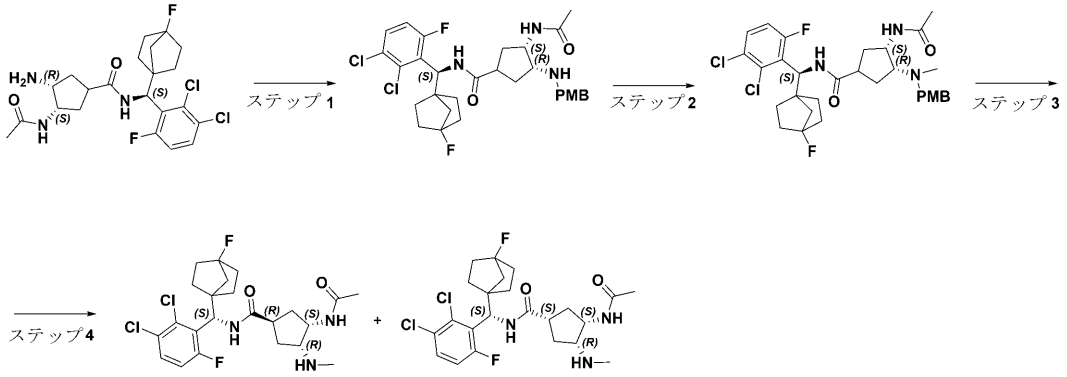
異性体２：７ｍｇ、０．０１６ｍｍｏｌ。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０７８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５５６、ＬＣＭＳ方法Ｄ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）　δ　８．１４　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６２　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．０，　５．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．４９　（ｄ，　Ｊ　＝　７．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２６　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．６，　９．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．５０　（ｄ，　Ｊ　＝　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．０６　（ｐ，　Ｊ　＝　６．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．２４－３．０４　（ｍ，　１Ｈ），　３．００　－２．９２　（ｍ，　３Ｈ），　２．０９　（ｑ，　Ｊ　＝　７．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．８４　（ｓ，　４Ｈ），　１．９１－１．７５　（ｍ，　４Ｈ），　１．６８　（ｑｄ，　Ｊ　＝　１８．８，　１７．１，　７．３　Ｈｚ，　５Ｈ），　１．５７　（ｄ，　Ｊ　＝　８．１　Ｈｚ，　２Ｈ），　０．０６　（ｓ，　２Ｈ）．

【０８６５】

実施例２９

（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７６７】



ステップ１．（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（４－メトキシベンジル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＭｅＯＨ（５ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（７０ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）の混合物に、４－メトキシベンズアルデヒド（３０ｍｇ、０．２２ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を室温で２時間撹拌した後、$NaBH_3CN$（２８ｍｇ、０．４４ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で少しずつ加えた。混合物を室温で１６時間撹拌した。混合物を水（５ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（４－メトキシベンジル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、８４μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８４７分、$[M+H]^+$　５９４、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８６６】

ステップ２．（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（４－メトキシベンジル）（メチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＭｅＯＨ（４ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（４－メトキシベンジル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、８４μｍｏｌ）及びパラホルムアルデヒド（３．８ｍｇ、０．１３ｍｍｏｌ）の混合物に、$NaBH_3CN$（１６ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で少しずつ加えた。混合物を室温で１６時間撹拌した。混合物を水（５ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（４－メトキシベンジル）（メチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド（４０ｍｇ、６６μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８

９６分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　６０８、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８６７】

ステップ３．（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

アセトニトリル／H_2O（２．２ｍｌ，１０：１）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（（４－メトキシベンジル）（メチル）アミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド（４０ｍｇ、６６μｍｏｌ）の混合物に、硝酸セリウムアンモニウム（０．３６ｇ、０．６６ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２０℃で３時間攪拌した。反応物を水でクエンチし、酢酸エチルで抽出した。有機層をブラインで洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、蒸発させた。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド（２４ｍｇ、４９μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７５５分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４８８、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８６８】

ステップ４．（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

（３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド（２４ｍｇ、４９μｍｏｌ）をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＥ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：３０％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：８．８６；ＲＴ２（分）：１０．３２；試料溶媒：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；注入量：０．５ｍＬ）によって精製して、（１Ｒ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－（メチルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの両方を白色の非晶質固体として得た。

【０８６９】

異性体１：２ｍｇ、４μｍｏｌ。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．７７２分）。^{1}ＨＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ８．０７（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ，１Ｈ），７．８２（ｄ，Ｊ＝７．２Ｈｚ，１Ｈ），７．６２（ｄｄ，Ｊ＝９．０，５．１Ｈｚ，１Ｈ），７．２６（ｔ，Ｊ＝９．８Ｈｚ，１Ｈ），５．５２（ｄ，Ｊ＝８．１Ｈｚ，１Ｈ），３．９２（ｔｄ，Ｊ＝７．４，３．６Ｈｚ，１Ｈ），３．５７（ｐ，Ｊ＝６．０Ｈｚ，１Ｈ），３．２１（ｄ，Ｊ＝１３．８Ｈｚ，３Ｈ），２．９０（ｐ，Ｊ＝８．４Ｈｚ，１Ｈ），２．２５－２．０５（ｍ，１Ｈ），１．９２（ｄｔ，Ｊ＝１３．６，８．２Ｈｚ，１Ｈ），１．７８（ｄ，Ｊ

＝３．５Ｈｚ，５Ｈ），１．７３（ｓ，４Ｈ），１．７１（ｄｄ，Ｊ＝１２．４，８．７Ｈｚ，１Ｈ），１．７０－１．５５（ｍ，３Ｈ），１．５０（ｓ，１Ｈ）．

【０８７０】

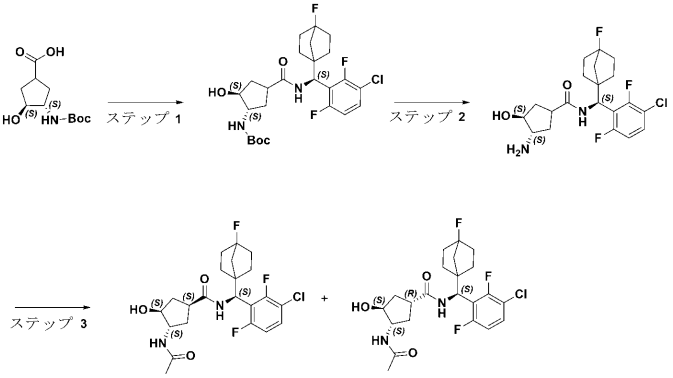
異性体２：２．９ｍｇ、５．９μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ ８．０７（ｄ，Ｊ＝８．３Ｈｚ，１Ｈ），７．８２（ｄ，Ｊ＝７．３Ｈｚ，１Ｈ），７．６２（ｄｄ，Ｊ＝９．０，５．１Ｈｚ，１Ｈ），７．２６（ｔ，Ｊ＝９．８Ｈｚ，１Ｈ），５．５２（ｄ，Ｊ＝８．２Ｈｚ，１Ｈ），３．９２（ｔｑ，Ｊ＝１０．６，５．４Ｈｚ，１Ｈ），３．５７（ｐ，Ｊ＝６．１Ｈｚ，１Ｈ），３．１９（ｓ，２Ｈ），２．９０（ｐ，Ｊ＝８．４Ｈｚ，１Ｈ），２．１５（ｄｄｔ，Ｊ＝２８．７，１４．６，７．６Ｈｚ，１Ｈ），１．９８－１．８２（ｍ，２Ｈ），１．７８（ｄ，Ｊ＝３．５Ｈｚ，５Ｈ），１．７２（ｓ，２Ｈ），１．７０－１．５６（ｍ，５Ｈ），１．５８－１．４０（ｍ，１Ｈ）．

【０８７１】

実施例３０

（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７６８】



ステップ１．ｔｅｒｔ－ブチル（（１Ｓ，２Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）の合成

実施例３１と同じ手順を使用して、（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチルから、（３Ｓ，４Ｓ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸を調製した。ＤＭＦ（１０ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｓ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸（０．９８ｇ、４．０ｍｍｏｌ）、（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタンアミン（１．１６ｇ、４ｍｍｏｌ）、ＮａＨＣＯ$_{3}$（０．８４ｇ、０．０１ｍｏｌ）の混合物に、ＨＡＴＵ（２．２８ｇ、６ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈した。水相を酢酸エチル（５０ｍｌ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動

相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（（１Ｓ，２Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１．０３ｇ、２ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９７２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　５１７．４０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８７２】

ステップ２．（３Ｓ，４Ｓ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＨＣｌ（５ｍＬ、ＭｅＯＨ中４Ｎ）中の（（１Ｓ，２Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（５００ｍｇ、９６７μｍｏｌ）の混合物を２５℃で３０分間撹拌した。真空濃縮により、（３Ｓ，４Ｓ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（４００ｍｇ、９６０μｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９１８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４１７．１５、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８７３】

ステップ３．（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｓ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（３９０ｍｇ、９３６μｍｏｌ）、酢酸（１６９ｍｇ、２．８１ｍｍｏｌ）、ＴＥＡ（２８３ｍｇ、２．８１ｍｍｏｌ）の混合物に、T_3P（４４６ｍｇ、１．４０ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（２０ｍｌ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、オフホワイト色の非晶質固体を得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７２１分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　５１７、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８７４】

生成物をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＤ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：１５％Ｂアイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：７．４１；ＲＴ２（分）：９．３４；試料溶媒：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；注入量：０．６ｍＬ）によってさらに精製して、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｓ，４Ｓ）－３－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの両方をオフホワイト色の非晶質固体として得た。

【０８７５】

異性体１：２７．０ｍｇ、５８．６μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ８．２４ （ｄ， Ｊ ＝ ８．３ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．７９ （ｄ， Ｊ ＝ ６．９ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．５７ （ｔｄ， Ｊ ＝ ８．６， ５．４ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．２０ － ７．１１ （ｍ， １Ｈ）， ５．２６ （ｄ， Ｊ ＝ ８．３ Ｈｚ， １Ｈ）， ５．１３ （ｄ， Ｊ ＝ ４．６ Ｈｚ， １Ｈ）， ３．８９ － ３．７０ （ｍ， ２Ｈ）， ２．８８ （ｐ， Ｊ ＝ ８．１ Ｈｚ， １Ｈ）， ２．１２ － ２．０１ （ｍ， １Ｈ）， １．８８ （ｄｔ， Ｊ ＝ １４．４， ７．６ Ｈｚ， １Ｈ）， １．７８ （ｓ， ６Ｈ）， １．７１ （ｄ， Ｊ ＝ １３．５ Ｈｚ， ４Ｈ）， １．５６ （ｄｄｄ， Ｊ ＝ １３．７， １１．１， ６．７ Ｈｚ， ３Ｈ）， １．４４ （ｑ， Ｊ ＝ ７．４， ５．２ Ｈｚ， ２Ｈ）． ＬＣＭＳ ＲＴ ０．８７８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４５９．３５、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０８７６】

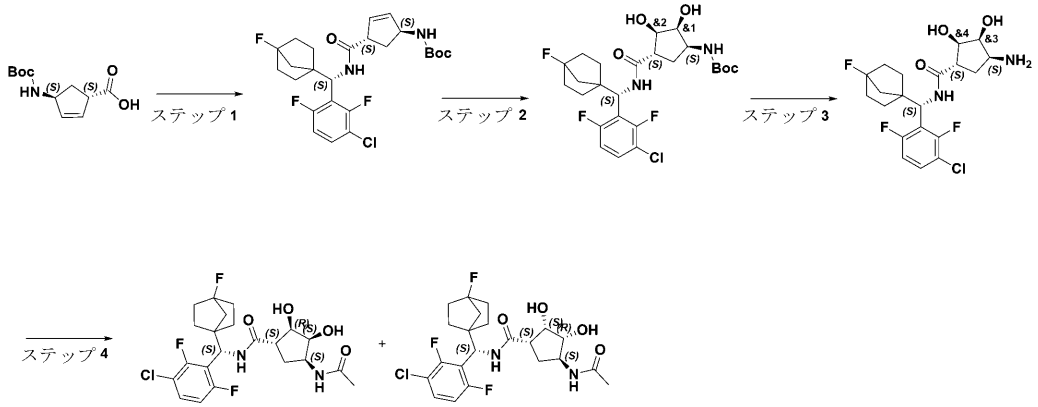
異性体２：１５．５ｍｇ、３３．４μｍｏｌ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ８．２３ （ｄ， Ｊ ＝ ８．３ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．７９ （ｄ， Ｊ ＝ ６．７ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．５７ （ｔｄ， Ｊ ＝ ８．７， ５．４ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．１６ （ｔ， Ｊ ＝ ９．４ Ｈｚ， １Ｈ）， ５．２６ （ｄ， Ｊ ＝ ８．２ Ｈｚ， １Ｈ）， ５．１０ （ｄ， Ｊ ＝ ４．７ Ｈｚ， １Ｈ）， ３．７９ （ｄｐ， Ｊ ＝ １９．７， ５．９ Ｈｚ， ２Ｈ）， ２．８８ （ｐ， Ｊ ＝ ８．３ Ｈｚ， １Ｈ）， ２．０６ － １．９５ （ｍ， ２Ｈ）， １．７９ （ｓ， ７Ｈ）， １．７１ （ｄ， Ｊ ＝ ９．３ Ｈｚ， ４Ｈ）， １．６３ － １．５４ （ｍ， ２Ｈ）， １．４５ （ｐ， Ｊ ＝ ６．６ Ｈｚ， ３Ｈ）． ＬＣＭＳ ＲＴ ０．８８８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４５９．３５、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０８７７】

実施例３１

（１Ｓ，２Ｒ，３Ｓ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，２Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７６９】



ステップ１．（（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）シクロペンター２－エン－１－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＤＭＦ（２ｍＬ）中の（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）シクロペンター２－エン－１－カルボン酸（１５０ｍｇ、６６０μｍｏｌ）、（Ｓ）

－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタンアミン（１９１ｍｇ、６６０μｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（２７７ｍｇ、３．３０ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（３１８ｍｇ、１．３２ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１５ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：５６％Ｂから７９％Ｂで８分、次いで、７９％Ｂ；波長：２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：７．６３；注入量：０．８ｍＬ）によって精製した。凍結乾燥により、（（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）シクロペンター２－エン－１－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１９０ｍｇ、３８１μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．２１７分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４９９．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８７８】

ステップ２．（（１Ｓ，２ＲＳ，３ＳＲ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＤＣＭ（２ｍＬ）中の（（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）シクロペンター２－エン－１－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１８０ｍｇ、３６１μｍｏｌ）、ＮＭＯ（１０．８ｍｇ、３６１μｍｏｌ）、$K_2OsO_4.2H_2O$（１１．１ｍｇ、３６．１μｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１５ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：５６％Ｂから７９％Ｂで８分、次いで、７９％Ｂ；波長：２５４ｎｍ；ＲＴ（分）：７．６３；注入量：０．８ｍＬ）によって精製して、（（１Ｓ，２ＲＳ，３ＳＲ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１４０ｍｇ、２６３μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１０５分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５３３．１０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８７９】

ステップ３．（１Ｓ，２ＲＳ，３ＳＲ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＨＣｌ（３ｍＬ、ＭｅＯＨ中４Ｎ）中の（（１Ｓ，２ＲＳ，３ＳＲ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１３０ｍｇ、２４４μｍｏｌ）の混合物を２５℃で２時間撹拌した。混合物を真空濃縮して、（１Ｓ，２ＲＳ，３ＳＲ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１５０ｍｇ）を白色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９１３分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４３３．３０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０８８０】
ステップ４．（１Ｓ，２Ｒ，３Ｓ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，２Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成
ＤＭＦ（２ｍＬ）中の（１Ｓ，２ＲＳ，３ＳＲ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１４０ｍｇ、３２３μｍｏｌ）、酢酸（２５．２ｍｇ、４２０μｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（１３６ｍｇ、１．６２ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＡＴＵ（１６０ｍｇ、４２０μｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１２時間攪拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（２０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から８０％Ｂで２５分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、白色の非晶質固体を得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．６８１分、$[M+H]^+$　４７５．１５、ＬＣＭＳ方法Ｂ。
【０８８１】
物質を分取キラルＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＨ３；移動相Ａ：ヘキサン（０．２％ジエチルアミン）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１）；グラジエント：Ａ：Ｂ　８０：２０アイソクラティック；流量：１ｍＬ／分；注入量：３ｍＬ）によってさらに精製して、（１Ｓ，２Ｒ，３Ｓ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，２Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２，３－ジヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの両方を白色の非晶質固体として得た。
【０８８２】
異性体１：２３．７ｍｇ、４９．９μｍｏｌ。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９５０分、$[M+H]^+$　４７５．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。^{1}ＨＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ８．１６（ｄ，Ｊ＝８．５Ｈｚ，１Ｈ），７．８７（ｄ，Ｊ＝７．７Ｈｚ，１Ｈ），７．６９－７．４８（ｍ，１Ｈ），７．１６（ｔ，Ｊ＝９．４Ｈｚ，１Ｈ），５．３１（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ，１Ｈ），４．９３－４．５２（ｍ，２Ｈ），３．８６（ｄｄ，Ｊ＝７．９，４．２Ｈｚ，２Ｈ），３．５６（ｄ，Ｊ＝４．９Ｈｚ，１Ｈ），２．９４－２．６３（ｍ，１Ｈ），２．０５（ｄｔ，Ｊ＝１３．２，８．６Ｈｚ，１Ｈ），１．９１－１．５３（ｍ，１１Ｈ），１．４４（ｄ，Ｊ＝１０．８Ｈｚ，２Ｈ），１．２７－１．０７（ｍ，１Ｈ）．
【０８８３】
異性体２：２．８ｍｇ、５．９μｍｏｌ。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８０６分、$[M+H]^+$　４７５．００、ＬＣＭＳ方法Ｃ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ８．５３（ｄ，Ｊ＝８．４Ｈｚ，１Ｈ），７．５８（ｔ，Ｊ＝５．８Ｈｚ，２Ｈ），７．１６（ｔ，Ｊ＝９．３Ｈｚ，１Ｈ），５．３２（ｄ，Ｊ＝８．３Ｈｚ，１Ｈ），５．１３（ｄ，Ｊ＝７．９Ｈｚ，１Ｈ），４．９７（ｄ，Ｊ＝５．３Ｈｚ，１Ｈ），４．１４（ｄ，Ｊ＝８．６Ｈｚ，１Ｈ），４．０４－３．８９（ｍ，１Ｈ），３．６７－３．５９（ｍ，１Ｈ），２．９６（ｑ，Ｊ＝８．４Ｈｚ，

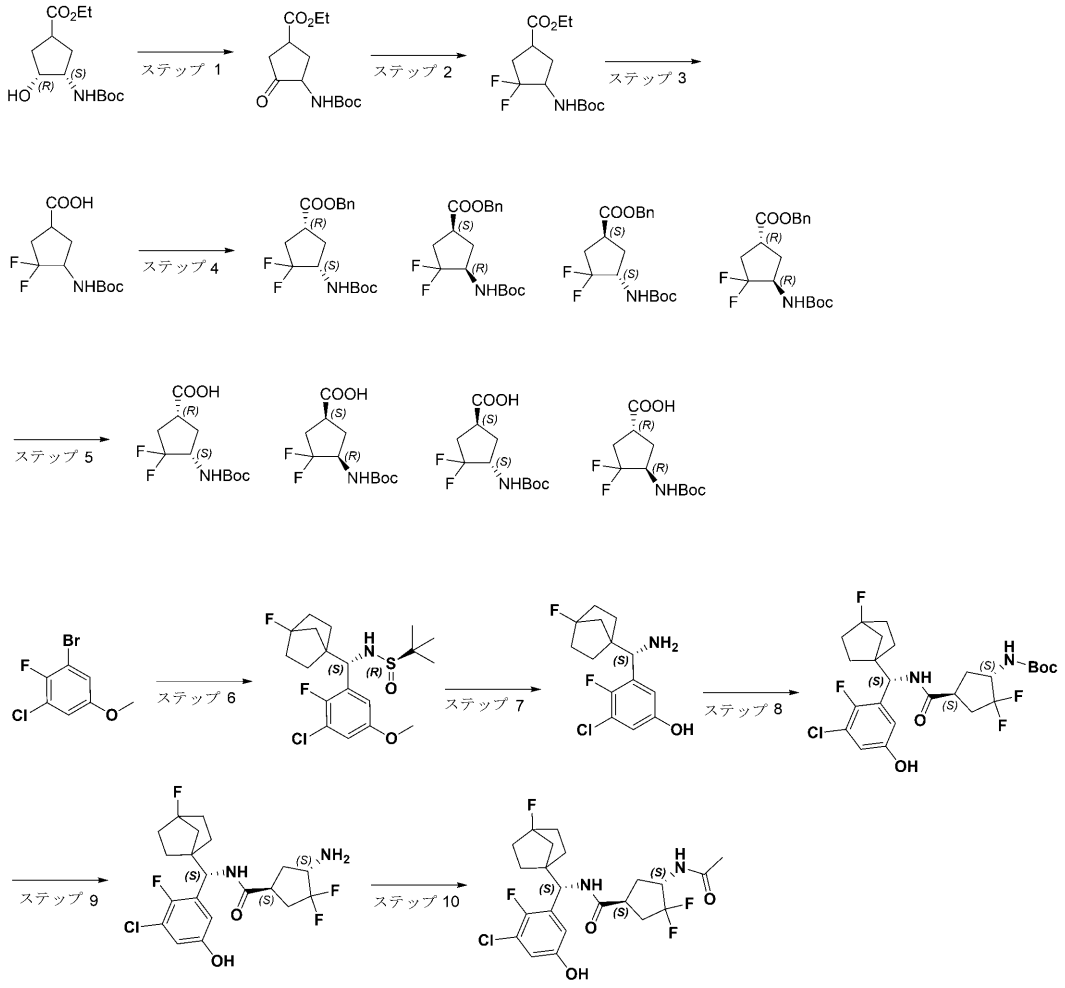
１Ｈ），１．７５（ｄ，Ｊ＝３１．７Ｈｚ，１３Ｈ），１．５１－１．３４（ｍ，１Ｈ）．

【０８８４】

実施例３２

（１Ｓ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド、（１Ｒ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド、（１Ｓ，４Ｒ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，４Ｒ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７７０】



ステップ１．３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－オキソシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

ＤＣＭ（１．３０Ｌ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（１３０ｇ、４７５ｍｍｏｌ）及び４Åモレキュラーシーブ（４０．０ｇ）の混合物に、ＰＣＣ（１３３ｇ、６１８ｍｍｏｌ）を２５℃で加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。混合物をＭＴＢＥ

（４．５０Ｌ）で希釈し、減圧下でセライトに通して濾過した。濾液を減圧下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（SiO_2、石油エーテル：酢酸エチル　２０：１から０：１）によって精製して、３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－オキソシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（７１．１ｇ、２６２ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　７．０９　（ｄｄ，　Ｊ　＝　８．０，　２０．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１０　（ｑ，　Ｊ　＝　６．８　Ｈｚ，　２Ｈ），　３．９９　－　３．７７　（ｍ，　１Ｈ），　３．２６　－　３．０１　（ｍ，　１Ｈ），　２．４８　－　２．４０　（ｍ，　１Ｈ），　２．３９　－　２．２０　（ｍ，　２Ｈ），　２．１２　－　１．８１　（ｍ，　１Ｈ），　１．３７　（ｓ，　９Ｈ），　１．１９　（ｔ，　Ｊ　＝　７．２　Ｈｚ，　３Ｈ）．

【０８８５】

ステップ２．４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチルの合成

ＤＣＭ（３１７ｍＬ）中の３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－４－オキソシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（３１．７ｇ、１１７ｍｍｏｌ）の混合物に、ＤＡＳＴ（７７．３ｍＬ、５８５ｍｍｏｌ）をN_2下にて０℃で加えた。混合物を２５℃まで温め、２５℃で２時間攪拌した。混合物を０℃まで冷却し、ＭｅＯＨ（１５０ｍＬ）でクエンチした。混合物を２５℃で１２時間攪拌し、減圧下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（SiO_2、石油エーテル：酢酸エチル　５０：１から３：１）によって精製して、４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（２７．５ｇ、９３．８ｍｍｏｌ）を茶色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　７．１９　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．２　Ｈｚ，　１２．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２０　－　３．９８　（ｍ，　３Ｈ），　３．１３　－　２．９５　（ｍ，　１Ｈ），　２．４５　－　２．０８　（ｍ，　３Ｈ），　１．９５　－　１．６９　（ｍ，　１Ｈ），　１．３９　（ｓ，　９Ｈ），　１．２１　－　１．１６　（ｍ，　３Ｈ）．

【０８８６】

ステップ３．４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

ＭｅＯＨ（４２７ｍＬ）及びH_2O（１４０ｍＬ）中の４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸エチル（２８．５ｇ、９７．２ｍｍｏｌ）の混合物に、ＬｉＯＨ　・H_2O（２０．４ｇ、４８６ｍｍｏｌ）を０℃で加えた。混合物を２５℃まで温め、２５℃で２時間攪拌した。混合物を減圧下で濃縮して、ＭｅＯＨの大部分を除去した。残渣をH_2O（３００ｍＬ）で希釈した。混合物のｐＨを飽和クエン酸水溶液で４に調整し、ＤＣＭ（３００ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１００ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸（２５．７ｇ、粗製）を茶色の油状物として得た。

【０８８７】

ステップ４．（１Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸ベンジル、（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸ベンジル、（１Ｓ，４Ｒ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸ベンジル及び（１Ｒ，４Ｒ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸ベンジルの合成

ＤＭＦ（２６０ｍＬ）中の４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸（２５．７ｇ、９６．９ｍｍｏｌ）の混合物に、K_2CO_3（２６．８ｇ、１９４ｍｍｏｌ）及びＢｎＢｒ（１９．９ｇ、１１６ｍ

ｍｏｌ）を２５℃で加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。混合物をH_2O（１．００Ｌ）中に撹拌下で注いだ。混合物を酢酸エチル（５００ｍＬ＊３）で抽出し、次いで、合わせた有機相をNa_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（SiO_2、石油エーテル：酢酸エチル　１０：１から０：１）によって精製して、生成物（３４．０ｇ、粗製）を白色の固体として得た。

【０８８８】

生成物（３３．０ｇ）を逆相ＨＰＬＣ（移動相Ａ：０．１％NH_4OH／水、移動相Ｂ：アセトニトリル）によって精製した。集めたフラクションを減圧下で濃縮して、アセトニトリルを除去した。残った水溶液を酢酸エチル（５００ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機相をNa_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮して、固体（３０．０ｇ）を得た。残渣をキラルＳＦＣ（カラム：Ｄａｉｃｅｌ　Ｃｈｉｒａｌｃｅｌ　ＯＪ　２５０ｍｍ＊５０ｍｍ、１０μｍ；移動相：ヘキサン中１２％イソプロパノール）によって精製して、ピーク１及びピーク２を得た。

【０８８９】

濃縮後のピーク１をキラルＳＦＣ（カラム：Ｄａｉｃｅｌ　Ｃｈｉｒａｌｐａｋ　ＩＧ　２５０ｍｍ＊５０ｍｍ、１０μｍ；移動相：２０％ＭｅＯＨ／０．１％NH_4OH］）によってさらに精製して、ピーク３及びピーク４を得た。

【０８９０】

ピーク３を減圧下で濃縮して、白色の固体（５．２０ｇ、１４．６ｍｍｏｌ）を得た。^{19}F　ＮＭＲ　（３７６　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　－１０１．２３　ｐｐｍ，　－１０１．８３　ｐｐｍ，　－１０７．０６　ｐｐｍ，　－１０７．６６　ｐｐｍ．^{1}H　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　７．４１　－　７．３１　（ｍ，５Ｈ），　７．２２　（ｄ，　Ｊ　＝　７．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．１２　（ｓ，　２Ｈ），　４．２６　－　４．０５　（ｍ，　１Ｈ），　３．２７　－　３．０９　（ｍ，１Ｈ），　２．４６　－　２．３２　（ｍ，　２Ｈ），　２．２６　－　２．１２　（ｍ，１Ｈ），　１．９８　－　１．８３　（ｍ，　１Ｈ），　１．３９　（ｓ，　９Ｈ）．

【０８９１】

ピーク４を減圧下で濃縮して、黄色の固体（９．００ｇ、２５．３ｍｍｏｌ）を得た。^{19}F　ＮＭＲ：　（３７６　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　－１０１．２３　ｐｐｍ，　－１０１．８３　ｐｐｍ，　－１０７．０７　ｐｐｍ，　－１０７．６７　ｐｐｍ．^{1}H　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　７．４１　－　７．３１　（ｍ，　５Ｈ），　７．２２　（ｄ，　Ｊ　＝　７．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．１２　（ｓ，　２Ｈ），　４．２６　－　４．０５　（ｍ，　１Ｈ），　３．２７　－　３．０９　（ｍ，　１Ｈ），　２．４６　－　２．３２　（ｍ，　２Ｈ），　２．２６　－　２．１２　（ｍ，　１Ｈ），　１．９８　－　１．８３　（ｍ，　１Ｈ），　１．３９　（ｓ，　９Ｈ）．

【０８９２】

濃縮後のピーク２をキラルＳＦＣ（カラム：Ｄａｉｃｅｌ　Ｃｈｉｒａｌｐａｋ　ＩＧ（２５０ｍｍ＊５０ｍｍ、１０μｍ）；移動相：１５％ＭｅＯＨ／０．１％NH_4OH）によってさらに精製して、ピーク５及びピーク６を得た。

【０８９３】

ピーク５を減圧下で濃縮して、白色の固体（４．３０ｇ、１２．１ｍｍｏｌ）を得た。^{19}F　ＮＭＲ：　（３７６　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　－１００．０３　ｐｐｍ，　－１００．６２　ｐｐｍ，　－１０３．２５　ｐｐｍ，　－１０３．８５　ｐｐｍ．^{1}H　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　７．４３　－　７．３０　（ｍ，　５Ｈ），　７．１９　（ｄ，　Ｊ　＝　８．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．１２　（ｓ，　２Ｈ），　４．２４　－　４．０６　（ｍ，　１Ｈ），　３．１１　（ｂｒ　ｓ，　１Ｈ），　２．４６　－　２．１６　（ｍ，　３Ｈ），　１．８５　－　７．３０　（ｍ，１Ｈ），　１．３８　（ｓ，　９Ｈ）．

【０８９４】

ピーク６を減圧下で濃縮して、黄色の固体（８．９０ｇ、２５．０ｍｍｏｌ）を得た。

^{19}Ｆ ＮＭＲ：（３７６ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_6$） δ －１００．０３ ｐｐｍ，－１００．６２ ｐｐｍ，－１０３．２５ ｐｐｍ，－１０３．８５ ｐｐｍ

【０８９５】

^{1}Ｈ ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_6$） δ ７．４３ － ７．３０（ｍ，５Ｈ），７．１９（ｄ，Ｊ ＝ ９．２ Ｈｚ，１Ｈ），５．１２（ｓ，２Ｈ），４．２５ － ４．０２（ｍ，１Ｈ），３．１０ － ３．００（ｍ，１Ｈ），２．４８ － ２．１７（ｍ，３Ｈ），１．８８ － １．７４（ｍ，１Ｈ），１．３８（ｓ，９Ｈ）．

【０８９６】

ステップ５．（１Ｒ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸、（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸、（１Ｓ，４Ｒ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸及び（１Ｒ，４Ｒ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸の合成

ＭｅＯＨ（１３５ｍＬ）中のステップ４のピーク４（９．００ｇ、２５．３ｍｍｏｌ）の溶液に、Ｐｄ／Ｃ（１．８０ｇ、１０％）をＮ$_2$下にて２５℃で加えた。混合物を脱気し、Ｈ$_2$で３回パージした。混合物をＨ$_2$（５０ｐｓｉ）下にて２５℃で４時間撹拌した。混合物を減圧下でセライトに通して濾過した。濾液を減圧下で濃縮して、白色の固体（６．３６ｇ、２５．６ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{19}Ｆ ＮＭＲ：（３７６ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_6$） δ －１０１．０９ ｐｐｍ，－１０１．６９ ｐｐｍ，－１０６．７０ ｐｐｍ，－１０７．３０ ｐｐｍ．^{1}Ｈ ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ$_6$） δ １２．５８（ｓ，１Ｈ），７．１９（ｄ，Ｊ ＝ ８．８ Ｈｚ，１Ｈ），４．３０ － ３．９６（ｍ，１Ｈ），３．０８ － ２．８８（ｍ，１Ｈ），２．３８ － ２．２８（ｍ，２Ｈ），２．１７ － ２．１１（ｍ，１Ｈ），１．９０ － １．８０（ｍ，１Ｈ），１．３９（ｓ，９Ｈ）．

【０８９７】

他の３つの異性体も同様に合成した。

【０８９８】

ステップ６．（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－メトキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（１２ｍＬ）中の１－ブロモ－３－クロロ－２－フルオロ－５－メトキシベンゼン（１．２ｇ、５．０ｍｍｏｌ）の混合物に、ｎ－ブチルリチウム（２．４ｍＬ、ＴＨＦ中２．５Ｍ、６．０ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で１時間撹拌した後、（Ｒ）－Ｎ－（（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（９８１ｍｇ、４．０ｍｍｏｌ）を－７８℃で加えた。混合物を７８℃で１時間撹拌した。反応物を飽和ＮＨ$_4$Ｃｌ（水溶液）でクエンチし、水相を酢酸エチル（３０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで２０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－メトキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１．２１ｇ、２．９８ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ ＲＴ １．１１８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ４０５．９０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０８９９】

ステップ７．（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－

１－イル）メチル）－５－クロロ－４－フルオロフェノール
ＨＢｒ（５ｍｌ、ＡｃＯＨ中３３％）中の（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－メトキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１．２ｇ、３．０ｍｍｏｌ）の混合物を１００℃で４時間撹拌した。混合物を濃縮した。得られた粗製物質を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－５－クロロ－４－フルオロフェノール（７００ｍｇ、２．４３ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９１７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２８８．０５、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０９００】

ステップ８．（（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２，２－ジフルオロシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成
ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－５－クロロ－４－フルオロフェノール（１００ｍｇ、３４８μｍｏｌ）、（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボン酸（１１１ｍｇ、４１７μｍｏｌ）、ＴＥＡ（１４５μＬ、１．０４ｍｍｏｌ）の溶液に、Ｔ$_{3}$Ｐ（１６６ｍｇ、５２１μｍｏｌ）を室温で加えた。得られた混合物を室温で２時間撹拌した。反応混合物を水（１５ｍＬ）で希釈し、水相をＤＣＭ（２０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を逆相フラッシュクロマトグラフィー（アセトニトリル／水）によって精製して、（（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２，２－ジフルオロシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１３０ｍｇ、６９．９％）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８９２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　５３５．００。ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９０１】

ステップ９．（１Ｓ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成
ＨＣｌ（ＭｅＯＨ中４Ｎ、３ｍＬ）中の（（１Ｓ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２，２－ジフルオロシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１２５ｍｇ、２３４μｍｏｌ）の混合物を室温で２時間撹拌した。混合物を濃縮した。得られた粗製物質を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（１Ｓ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド（１００ｍｇ、２３０μｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７１７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４３５．００、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９０２】

ステップ１０．（１Ｓ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（１Ｓ，４Ｓ）－４－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）、$NaHCO_3$（４８ｍｇ、０．５７ｍｍｏｌ）及び酢酸（８．３ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）の混合物に、ＨＡＴＵ（６６ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）を室温で加えた。得られた混合物を室温で２時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（２０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ Ｐｒｅｐ ＯＢＤ Ｃ１８ Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：２３％Ｂから５０％Ｂで８分、次いで、５０％Ｂ；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：７．５８）によって精製して、（１Ｓ，４Ｓ）－４－アセトアミド－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３，３－ジフルオロシクロペンタン－１－カルボキサミド（２９．７ｍｇ、６２．３μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ９．８１ （ｓ，１Ｈ），８．３７ （ｄ，Ｊ ＝ ８．６ Ｈｚ，１Ｈ），８．０８ （ｄ，Ｊ ＝ ８．８ Ｈｚ，１Ｈ），６．７９ （ｄｄ，Ｊ ＝ ５．８，２．９ Ｈｚ，１Ｈ），６．６５ （ｄｄ，Ｊ ＝ ５．４，２．９ Ｈｚ，１Ｈ），５．２０ （ｄ，Ｊ ＝ ８．７ Ｈｚ，１Ｈ），４．４８ （ｄｔ，Ｊ ＝ １８．１，９．２ Ｈｚ，１Ｈ），３．０８ （ｓ，１Ｈ），２．３７ － ２．１７ （ｍ，２Ｈ），２．０４ － １．９４ （ｍ，１Ｈ），１．８６ （ｓ，４Ｈ），１．８１ － １．６４ （ｍ，６Ｈ），１．６２ － １．５２ （ｍ，２Ｈ），１．３６ （ｓ，２Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ ０．８９９分、［Ｍ－Ｈ］$^-$ ４７５．１５、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０９０３】

実施例１～３２の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表２に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表２の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表２－１】

表２．追加の例示的な化合物

I-83	I-247	I-248	I-252	I-253
I-257	I-258	I-259	I-260	I-263
I-266	I-325	I-327	I-333	I-334
I-337	I-338	I-339	I-340	I-341
I-342	I-343	I-344	I-348	I-349
I-351	I-352	I-353	I-354	I-369
I-370	I-371	I-372	I-378	I-384
I-403	I-406	I-424	I-427	I-432
I-445	I-446	I-454	I-455	I-460
I-461	I-466	I-467	I-469	I-479
I-494	I-507	I-510	I-621	I-630
I-634	I-635	I-666	I-670	I-691
I-692	I-693	I-694	I-695	I-696
I-700	I-701	I-702	I-703	I-704
I-709	I-710	I-711	I-712	I-717
I-718	I-719	I-724	I-725	I-730
I-794	I-802	I-803	I-804	I-806
I-808	I-817	I-823	I-825	I-830
I-838	I-841	I-842	I-843	I-844
I-846	I-847	I-848	I-849	I-850
I-851	I-852	I-858	I-859	I-860
I-861	I-862	I-863	I-872	I-877
I-878	I-879	I-882	I-883	I-887
I-891	I-897	I-898	I-900	I-901
I-902	I-903	I-904	I-905	I-906
I-907	I-908	I-909	I-910	I-911
I-912	I-913	I-914	I-915	I-916
I-917	I-918	I-919	I-925	I-927
I-929	I-931	I-932	I-934	I-935
I-936	I-937	I-941	I-942	I-943
I-944	I-945	I-946	I-948	I-949
I-950	I-951	I-952	I-953	I-954
I-955	I-956	I-957	I-958	I-959
I-960	I-961	I-962	I-963	I-964
I-965	I-966	I-967	I-968	I-980
I-981	I-982	I-983	I-984	I-985
I-986	I-987	I-988	I-989	I-992
I-993	I-996	I-997	I-998	I-999
I-1000	I-1001	I-1002	I-1003	I-1004
I-1005	I-1011	I-1012	I-1013	I-1014
I-1017	I-1018	I-1019	I-1025	I-1026

【表２－２】

I-1028	I-1029	I-1030	I-1031	I-1032
I-1033	I-1034	I-1035	I-1036	I-1037
I-1038	I-1039	I-1040	I-1041	I-1045
I-1046	I-1047	I-1048	I-1049	I-1050
I-1051	I-1052	I-1053	I-1054	I-1055
I-1056	I-1057	I-1058	I-1059	I-1060
I-1061	I-1062	I-1063	I-1064	I-1065
I-1066	I-1067	I-1068	I-1069	I-1070
I-1071	I-1072	I-1073	I-1074	I-1075
I-1076	I-1077	I-1078	I-1079	I-1080
I-1081	I-1082	I-1083	I-1084	I-1085
I-1086	I-1087	I-1088	I-1089	I-1090
I-1091	I-1092	I-1093	I-1094	I-1095
I-1096	I-1097	I-1098	I-1099	I-1100
I-1101	I-1102	I-1103	I-1104	I-1105
I-1106	I-1107	I-1108	I-1109	I-1110
I-1111	I-1115	I-1120	I-1121	I-1122
I-1123	I-1124	I-1125	I-1126	I-1127
I-1128	I-1129	I-1130	I-1131	I-1132
I-1133	I-1134	I-1135	I-1136	I-1137
I-1138	I-1139	I-1140	I-1141	I-1142
I-1143	I-1144	I-1145	I-1146	I-1147
I-1148	I-1149	I-1150	I-1151	I-1152
I-1153	I-1154	I-1155	I-1156	I-1157
I-1158	I-1159	I-1160	I-1161	I-1162
I-1163	I-1164	I-1165	I-1166	I-1167
I-1168	I-1169	I-1170	I-1171	I-1172
I-1173	I-1174	I-1175	I-1176	I-1177
I-1178	I-1179	I-1180	I-1181	I-1182
I-1183	I-1184	I-1185	I-1186	I-1187
I-1188	I-1189	I-1190	I-1191	I-1192
I-1193	I-1194	I-1195	I-1196	I-1197
I-1198	I-1200	I-1201	I-1203	I-1204
I-1205	I-1206	I-1207	I-1208	I-1209
I-1210	I-1211	I-1212	I-1213	I-1217
I-1218	I-1219	I-1221	I-1226	I-1227
I-1228	I-1229	I-1230	I-1231	I-1232
I-1233	I-1234	I-1235	I-1236	I-1237
I-1238	I-1239	I-1240	I-1241	I-1242
I-1243	I-1244	I-1245	I-1246	I-1247
I-1248	I-1249	I-1250	I-1251	I-1252
I-1253	I-1254	I-1255	I-1256	I-1257

【表２－３】

I-1258	I-1261	I-1262	I-1263	I-1264
I-1265	I-1266	I-1267	I-1268	I-1269
I-1270	I-1271	I-1272	I-1273	I-1274
I-1279	I-1280	I-1281	I-1282	I-1283
I-1284	I-1285	I-1286	I-1287	I-1288
I-1289	I-1290	I-1291	I-1292	I-1293
I-1294	I-1295	I-1296	I-1297	I-1298
I-1299	I-1300	I-1301	I-1302	I-1303
I-1304	I-1305	I-1306	I-1307	I-1308
I-1309	I-1310	I-1311	I-1312	I-1313
I-1314	I-1315	I-1316	I-1317	I-1318
I-1319	I-1320	I-1321	I-1322	I-1323
I-1324	I-1325	I-1326	I-1327	I-1336
I-1337	I-1338	I-1339	I-1340	I-1341
I-1342	I-1344	I-1345	I-1346	I-1347
I-1348	I-1349	I-1350	I-1351	I-1352
I-1353	I-1354	I-1355	I-1356	I-1357
I-1358	I-1359	I-1360	I-1361	I-1362
I-1364	I-1365	I-1366	I-1367	I-1368
I-1369	I-1370	I-1371	I-1372	I-1373
I-1374	I-1375	I-1376	I-1377	I-1378
I-1379	I-1380	I-1381	I-1382	I-1383
I-1384	I-1385	I-1386	I-1387	I-1388
I-1389	I-1390	I-1391	I-1392	I-1393
I-1394	I-1395	I-1396	I-1397	I-1398
I-1399	I-1400	I-1401	I-1402	I-1403
I-1404	I-1405	I-1406	I-1407	I-1408
I-1409	I-1410	I-1411	I-1412	I-1413
I-1414	I-1415	I-1416	I-1417	I-1418
I-1419	I-1420	I-1421	I-1422	I-1423
I-1424	I-1425	I-1426	I-1427	I-1428
I-1429	I-1430	I-1431	I-1432	I-1433
I-1434	I-1435	I-1436	I-1437	I-1438
I-1439	I-1440	I-1441	I-1442	I-1443
I-1444	I-1445	I-1446	I-1447	I-1448
I-1449	I-1450	I-1451	I-1452	I-1453
I-1454	I-1455	I-1456	I-1457	I-1458
I-1459	I-1460	I-1461	I-1462	I-1463
I-1464	I-1465	I-1466	I-1467	I-1468
I-1469	I-1470	I-1471	I-1472	I-1473
I-1474	I-1475	I-1476	I-1477	I-1478
I-1479	I-1480	I-1481	I-1482	I-1483

【表２－４】

I-1484	I-1485	I-1486	I-1487	I-1488
I-1489	I-1490	I-1491	I-1492	I-1494
I-1495	I-1496	I-1497	I-1498	I-1499
I-1500	I-1501	I-1502	I-1503	I-1504
I-1505	I-1517	I-1518	I-1519	I-1520
I-1521	I-1522	I-1523	I-1524	I-1525
I-1526	I-1527	I-1528	I-1529	I-1530
I-1531	I-1532	I-1533	I-1534	I-1535
I-1536	I-1537	I-1538	I-1539	I-1540
I-1541	I-1542	I-1543	I-1544	I-1545
I-1546	I-1547	I-1548	I-1549	I-1550
I-1551	I-1552	I-1553	I-1554	I-1555
I-1556	I-1557	I-1558	I-1559	I-1560
I-1561	I-1562	I-1563	I-1564	I-1565
I-1566	I-1567	I-1568	I-1569	I-1570
I-1571	I-1572	I-1573	I-1574	I-1575
I-1576	I-1577	I-1578	I-1579	I-1580
I-1581	I-1582	I-1583	I-1584	I-1585
I-1586	I-1587	I-1588	I-1589	I-1590
I-1591	I-1592	I-1593	I-1594	I-1595
I-1596	I-1597	I-1598	I-1599	I-1600
I-1601	I-1602	I-1603	I-1604	I-1605
I-1606	I-1607	I-1608	I-1609	I-1610
I-1611	I-1612	I-1613	I-1614	I-1615
I-1616	I-1617	I-1618	I-1619	I-1620
I-1621	I-1622	I-1623	I-1624	I-1625
I-1626	I-1627	I-1628	I-1629	I-1630
I-1631	I-1632	I-1633	I-1634	I-1635
I-1636	I-1637	I-1638	I-1639	I-1643
I-1644	I-1645	I-1646	I-1647	I-1648
I-1649	I-1650	I-1652	I-1653	I-1654
I-1655	I-1656	I-1657	I-1658	I-1659
I-1660	I-1661	I-1662	I-1663	I-1664
I-1665	I-1666	I-1667	I-1668	I-1669
I-1670	I-1671	I-1672	I-1673	I-1674
I-1675	I-1676	I-1677	I-1679	I-1680
I-1681	I-1682	I-1683	I-1684	I-1686
I-1687	I-1688	I-1689	I-1690	I-1691
I-1692	I-1693	I-1694	I-1695	I-1696
I-1697	I-1698	I-1699	I-1700	I-1701
I-1702	I-1703	I-1704	I-1705	I-1706
I-1707	I-1708	I-1709	I-1710	I-1711

【表２－５】

I-1712	I-1713	I-1714	I-1715	I-1716
I-1717	I-1718	I-1719	I-1720	I-1721
I-1722	I-1723	I-1724	I-1725	I-1726
I-1727	I-1728	I-1729	I-1730	I-1731
I-1732	I-1733	I-1734	I-1735	I-1736
I-1737	I-1738	I-1739	I-1740	I-1741
I-1742	I-1743	I-1744	I-1745	I-1746
I-1747	I-1748	I-1749	I-1750	I-1751
I-1752	I-1753	I-1754	I-1755	I-1756
I-1757	I-1758	I-1759	I-1760	I-1761
I-1762	I-1763	I-1764	I-1765	I-1766
I-1767	I-1768	I-1769	I-1770	I-1771
I-1772	I-1773	I-1774	I-1775	I-1776
I-1777	I-1778	I-1779	I-1780	I-1781
I-1782	I-1783	I-1784	I-1785	I-1786
I-1787	I-1788	I-1789	I-1791	I-1792
I-1793	I-1794	I-1795	I-1796	I-1797
I-1798	I-1799	I-1800	I-1801	I-1814
I-1815	I-1828	I-1829	I-1833	I-1834
I-1835	I-1836	I-1837	I-1838	I-1840
I-1841	I-1842	I-1843	I-1845	I-1846
I-1847	I-1848	I-1849	I-1850	I-1851
I-1852	I-1854	I-1855	I-1856	I-1857
I-1858	I-1859	I-1860	I-1861	I-1862
I-1863	I-1864	I-1865	I-1866	I-1867
I-1868	I-1869	I-1870	I-1871	I-1873
I-1874	I-1875	I-1876	I-1877	I-1878
I-1879	I-1880	I-1881	I-1882	I-1883
I-1884	I-1885	I-1886	I-1887	I-1888
I-1889	I-1890	I-1891	I-1892	I-1893
I-1895	I-1896	I-1897	I-1898	I-1899
I-1900	I-1901	I-1902	I-1903	I-1904
I-1906	I-1907	I-1908	I-1909	I-1910
I-1911	I-1912	I-1913	I-1914	I-1916
I-1917	I-1918	I-1921	I-1922	I-1923
I-1924	I-1925	I-1926	I-1927	I-1928
I-1929	I-1930	I-1931	I-1932	I-1934
I-1935	I-1936	I-1937	I-1938	I-1939
I-1940	I-1941	I-1942	I-1943	I-1944
I-1945	I-1946	I-1947	I-1948	I-1949
I-1950	I-1951	I-1952	I-1953	I-1954
I-1955	I-1956	I-1957	I-1961	I-1962

【表２－６】

I-1963	I-1964	I-1965	I-1966	I-1967
I-1968	I-1970	I-1971	I-1972	I-1973
I-1974	I-1975	I-1976	I-1977	I-1978
I-1979	I-1980	I-1981	I-1984	I-1985
I-1986	I-1987	I-1988	I-1989	I-1990
I-1991	I-1992	I-1993	I-1994	I-1995
I-1996	I-1997	I-1998	I-1999	I-2000
I-2001	I-2002	I-2003	I-2004	I-2005
I-2006	I-2007	I-2008	I-2010	I-2011
I-2012	I-2013	I-2018	I-2019	I-2020
I-2021	I-2030	I-2031	I-2032	I-2033
I-2034	I-2035	I-2036	I-2040	I-2041
I-2042	I-2043	I-2044	I-2045	I-2046
I-2047	I-2048	I-2049	I-2050	I-2051
I-2052	I-2053	I-2054	I-2056	I-2057
I-2059	I-2060	I-2061	I-2062	I-2063
I-2064	I-2065	I-2066	I-2067	I-2068
I-2069	I-2070	I-2071	I-2072	I-2073
I-2074	I-2075	I-2076	I-2077	I-2078
I-2079	I-2080	I-2081	I-2082	I-2083
I-2084	I-2085	I-2086	I-2087	I-2088
I-2089	I-2090	I-2091	I-2092	I-2095
I-2096	I-2097	I-2098	I-2099	I-2100
I-2101	I-2102	I-2103	I-2104	I-2105
I-2106	I-2107	I-2109	I-2110	I-2112
I-2113	I-2114	I-2115	I-2116	I-2117
I-2118	I-2119	I-2129	I-2131	I-2133
I-2134	I-2136	I-2137	I-2138	I-2139
I-2140	I-2141	I-2142	I-2143	I-2144
I-2145	I-2146	I-2147	I-2148	I-2149
I-2150	I-2154	I-2155	I-2157	I-2158
I-2161	I-2162	I-2163	I-2164	I-2165
I-2166	I-2167	I-2168	I-2169	I-2170
I-2171	I-2172	I-2173	I-2174	I-2175
I-2176	I-2177	I-2178	I-2179	I-2180
I-2181	I-2182	I-2183	I-2184	I-2185
I-2186	I-2187	I-2188	I-2189	I-2190
I-2191	I-2192	I-2193	I-2194	I-2195
I-2196	I-2197	I-2198	I-2199	I-2200
I-2201	I-2202	I-2203	I-2204	I-2205
I-2206	I-2207	I-2208	I-2209	I-2210
I-2211	I-2212	I-2213	I-2214	I-2215

【表２－７】

I-2216	I-2217	I-2218	I-2219	I-2220
I-2222	I-2223	I-2224	I-2225	I-2226
I-2227	I-2228	I-2229	I-2230	I-2231
I-2232	I-2233	I-2234	I-2235	I-2236
I-2237	I-2238	I-2239	I-2240	I-2241
I-2242	I-2243	I-2244	I-2245	I-2246
I-2247	I-2248	I-2249	I-2250	I-2251
I-2252	I-2253	I-2254	I-2255	I-2256
I-2257	I-2258	I-2259	I-2260	I-2261
I-2262	I-2263	I-2264	I-2265	I-2266
I-2267	I-2268	I-2269	I-2271	I-2272
I-2274	I-2275	I-2276	I-2277	I-2278
I-2279	I-2280	I-2281	I-2282	I-2283
I-2284	I-2285	I-2286	I-2287	I-2288
I-2289	I-2290	I-2291	I-2292	I-2293
I-2294	I-2295	I-2296	I-2297	I-2298
I-2299	I-2300	I-2301	I-2302	I-2303
I-2304	I-2305	I-2306	I-2307	I-2308
I-2309	I-2310	I-2311	I-2313	I-2314
I-2316	I-2317	I-2318	I-2319	I-2320
I-2322	I-2323	I-2325	I-2326	I-2327
I-2328	I-2329	I-2330	I-2331	I-2332
I-2333	I-2334	I-2335	I-2336	I-2337
I-2338	I-2339	I-2340	I-2341	I-2342
I-2344	I-2345	I-2346	I-2348	I-2349
I-2350	I-2351	I-2352	I-2353	I-2354
I-2355	I-2356	I-2357	I-2358	I-2359
I-2360	I-2361	I-2362	I-2363	I-2364
I-2365	I-2366	I-2367	I-2368	I-2369
I-2370	I-2371	I-2372	I-2373	I-2374
I-2375	I-2376	I-2377	I-2378	I-2379
I-2380	I-2381	I-2382	I-2383	I-2384
I-2385	I-2386	I-2387	I-2388	I-2389
I-2390	I-2391	I-2392	I-2393	I-2394
I-2395	I-2396	I-2397	I-2398	I-2399
I-2400	I-2401	I-2402	I-2403	I-2404
I-2405	I-2406	I-2407	I-2408	I-2409
I-2410	I-2411	I-2412	I-2413	I-2414
I-2417	I-2418	I-2419	I-2420	I-2421
I-2422	I-2423	I-2424	I-2425	I-2426
I-2427	I-2428	I-2429	I-2430	I-2431
I-2432	I-2433	I-2434	I-2435	I-2436

【表２－８】

I-2437	I-2438	I-2439	I-2440	I-2441
I-2442	I-2443	I-2444	I-2445	I-2446
I-2447	I-2448	I-2449	I-2450	I-2451
I-2452	I-2453	I-2454	I-2455	I-2456
I-2457	I-2458	I-2459	I-2460	I-2461
I-2462	I-2463	I-2464	I-2465	I-2466
I-2467	I-2468	I-2469	I-2470	I-2471
I-2472	I-2473	I-2474	I-2475	I-2476
I-2477	I-2478	I-2479	I-2480	I-2481
I-2482	I-2483	I-2484	I-2485	I-2486
I-2487	I-2488	I-2489	I-2490	I-2491
I-2492	I-2493	I-2494	I-2495	I-2496
I-2497	I-2498	I-2499	I-2500	I-2501
I-2502	I-2503	I-2504	I-2505	I-2506
I-2507	I-2508	I-2509	I-2510	I-2511
I-2512	I-2513	I-2514	I-2515	I-2516
I-2517	I-2518	I-2519	I-2520	I-2521
I-2522	I-2523	I-2524	I-2525	I-2526
I-2527	I-2528	I-2529	I-2530	I-2531
I-2532	I-2533	I-2534	I-2535	I-2536
I-2537	I-2538	I-2539	I-2540	I-2541
I-2542	I-2543	I-2544	I-2545	I-2546
I-2547	I-2548	I-2549	I-2550	I-2551
I-2552	I-2553	I-2554	I-2555	I-2556
I-2557	I-2558	I-2559	I-2560	I-2561
I-2562	I-2563	I-2564	I-2565	I-2566
I-2567	I-2568	I-2569	I-2570	I-2571
I-2572	I-2573	I-2574	I-2575	I-2576
I-2577	I-2578	I-2579	I-2580	I-2581
I-2582	I-2583	I-2584	I-2585	I-2586
I-2587	I-2588	I-2589	I-2590	I-2591
I-2592	I-2593	I-2594	I-2595	I-2596
I-2597	I-2598	I-2599	I-2600	I-2601
I-2602	I-2603	I-2604	I-2605	I-2606
I-2607	I-2608	I-2609	I-2610	I-2611
I-2612	I-2613	I-2614	I-2615	I-2616
I-2617	I-2618	I-2619	I-2620	I-2621
I-2622	I-2623	I-2624	I-2625	I-2626
I-2627	I-2628	I-2629	I-2630	I-2631
I-2632	I-2633	I-2634	I-2635	I-2636
I-2637	I-2638	I-2639	I-2640	I-2641
I-2642	I-2643	I-2644	I-2645	I-2646

【表２－９】

I-2647	I-2648	I-2649	I-2650	I-2651
I-2652	I-2653	I-2654	I-2655	I-2656
I-2657	I-2658	I-2659	I-2660	I-2661
I-2662	I-2663	I-2664	I-2665	I-2666
I-2667	I-2668	I-2669	I-2670	I-2671
I-2672	I-2673	I-2674	I-2675	I-2676
I-2677	I-2678	I-2679	I-2680	I-2682
I-2684	I-2685	I-2686	I-2687	I-2688
I-2689	I-2690	I-2691	I-2692	I-2693
I-2696	I-2697	I-2698	I-2699	I-2700
I-2708	I-2709	I-2710	I-2711	I-2712
I-2713	I-2714	I-2715	I-2716	I-2717
I-2718	I-2719	I-2720	I-2721	I-2722
I-2723	I-2724	I-2725	I-2726	I-2727
I-2728	I-2729	I-2730	I-2731	I-2732
I-2733	I-2734	I-2735	I-2736	I-2737
I-2738	I-2739	I-2740	I-2741	I-2742
I-2743	I-2744	I-2745	I-2746	I-2747
I-2752	I-2753	I-2754	I-2755	I-2757
I-2758	I-2759	I-2760	I-2761	I-2762
I-2763	I-2770	I-2771	I-2772	I-2773
I-2774	I-2775	I-2777	I-2778	I-2779
I-2780	I-2781	I-2782	I-2783	I-2784
I-2785	I-2786	I-2787	I-2788	I-2789
I-2790	I-2791	I-2792	I-2793	I-2794
I-2795	I-2796	I-2797	I-2798	I-2799
I-2801	I-2802	I-2803	I-2804	I-2805
I-2808	I-2809	I-2810	I-281	I-2812
I-2813	I-2814	I-2815	I-2816	I-2817
I-2818	I-2823	I-2824	I-2825	I-2826
I-2827	I-2828	I-2829	I-2830	I-2831
I-2832	I-2833	I-2834	I-2835	I-2836
I-2837	I-2838	I-2839	I-2840	I-2843
I-2844	I-2845	I-2846	I-2857	I-2858
I-2859	I-2860	I-2861	I-2862	I-2863
I-2864	I-2865	I-2866	I-2867	I-2868
I-2869	I-2870	I-2871	I-2872	I-2873
I-2874	I-2875	I-2876	I-2877	I-2878
I-2879	I-2880	I-2881	I-2884	I-2885
I-2886	I-2887	I-2888	I-2889	I-2890
I-2891	I-2892	I-2893	I-2894	I-2895
I-2902	I-2903	I-2904	I-2905	I-2906

【表２－１０】

I-2915	I-2916	I-2917	I-2918	I-2919
I-2920	I-2921	I-2922	I-2923	I-2925
I-2926	I-2927	I-2928	I-2929	I-2942
I-2943	I-2944	I-2945	I-2946	I-2947
I-2948	I-2949	I-2950	I-2951	I-2952
I-2953	I-2954	I-2955	I-2956	I-2957
I-2958	I-2959	I-2960	I-2961	I-2962
I-2963	I-2964	I-2965	I-2966	I-2967
I-2973	I-2974	I-2975	I-2976	I-2977
I-2978	I-2979	I-2980	I-2981	I-2982
I-2983	I-2984	I-2985	I-2989	I-2990
I-2991	I-2996	I-2997	I-2998	I-2999
I-3000	I-3001	I-3002	I-3003	I-3004
I-3005	I-3006	I-3007	I-3008	I-3009
I-3010	I-3011	I-3012	I-3013	I-3014
I-3015	I-3016	I-3017	I-3018	I-3019
I-3020	I-3021	I-3022	I-3023	I-3024
I-3025	I-3026	I-3027	I-3028	I-3029
I-3044	I-3045	I-3046	I-3047	I-3048
I-3049	I-3050	I-3051	I-3052	I-3053
I-3054	I-3055	I-3056	I-3057	I-3058
I-3059	I-3060	I-3061	I-3062	I-3063
I-3064	I-3065	I-3067	I-3068	I-3069
I-3070	I-3071	I-3073	I-3081	I-3082
I-3083	I-3084	I-3085	I-3086	I-3087
I-3088	I-3089	I-3091	I-3092	I-3093
I-3094	I-3095	I-3096	I-3098	I-3099
I-3100	I-3101	I-3102	I-3103	I-3104
I-3105	I-3106	I-3109	I-3110	I-3111
I-3112	I-3113	I-3115	I-3118	I-3119
I-3120	I-3121	I-3122	I-3123	I-3124
I-3125	I-3126	I-3127	I-3128	I-3129
I-3130	I-3131	I-3132	I-3134	I-3137
I-3138	I-3139	I-3140	I-3141	I-3144
I-3145	I-3146	I-3147	I-3148	I-3149
I-3150	I-3151	I-3152	I-3153	I-3154
I-3156	I-3157	I-3160	I-3161	I-3164
I-3166	I-3167	I-3168	I-3169	I-3170
I-3171	I-3172	I-3173	I-3174	I-3175
I-3176	I-3177	I-3178	I-3179	I-3180
I-3181	I-3182	I-3183	I-3184	I-3185
I-3186	I-3187	I-3188	I-3189	I-3190

【表２－１１】

I-3191	I-3192	I-3193	I-3194	I-3195
I-3202	I-3203	I-3204	I-3212	I-3213
I-3214	I-3215	I-3216	I-3217	I-3218
I-3219	I-3220	I-3221	I-3222	I-3223
I-3224	I-3225	I-3226	I-3227	I-3228
I-3232	I-3233	I-3234	I-3235	I-3238
I-3239	I-3240	I-3241	I-3242	I-3243
I-3244	I-3245	I-3246	I-3247	I-3248
I-3249	I-3250	I-3251	I-3252	I-3253
I-3254	I-3255	I-3256	I-3257	I-3258
I-3259	I-3260	I-3261	I-3262	I-3263
I-3264	I-3265	I-3266	I-3267	I-3268
I-3269	I-3273	I-3274	I-3276	I-3277
I-3278	I-3279	I-3280	I-3281	I-3282
I-3283	I-3284	I-3285	I-3286	I-3287
I-3288	I-3289	I-3290	I-3291	I-3292
I-3293	I-3294	I-3297	I-3298	I-3316
I-3317	I-3318	I-3319	I-3320	I-3321
I-3324	I-3325	I-3326	I-3327	I-3328
I-3329	I-3331	I-3332	I-3333	I-3334
I-3335	I-3336	I-3337	I-3338	I-3339
I-3340	I-3341	I-3342	I-3350	I-3351
I-3352	I-3353	I-3354	I-3355	I-3356
I-3357	I-3358	I-3359	I-3367	I-3373
I-3374	I-3375	I-3376	I-3377	I-3378
I-3379	I-3380	I-3381	I-3382	I-3383
I-3384	I-3385	I-3386	I-3387	I-3388
I-3389	I-3390	I-3391	I-3392	I-3393
I-3394	I-3395	I-3396	I-3398	I-3401
I-3402	I-3403	I-3404	I-3405	I-3406
I-3408	I-3409	I-3410	I-3411	I-3414
I-3415	I-3416	I-3417	I-3423	I-3425
I-3426	I-3427	I-3428	I-3429	I-3430
I-3431	I-3432	I-3433	I-3434	I-3435
I-3436	I-3437	I-3438	I-3441	I-3442
I-3443	I-3444	I-3449	I-3450	I-3451
I-3479	I-3487	I-3488	I-3489	I-3490
I-3491	I-3492	I-3493	I-3494	I-3495
I-3496	I-3497	I-3498	I-3499	I-3500
I-3501	I-3502	I-3503	I-3504	I-3505
I-3506	I-3507	I-3508	I-3509	I-3510
I-3511	I-3512	I-3513	I-3514	I-3515

【表２－１２】

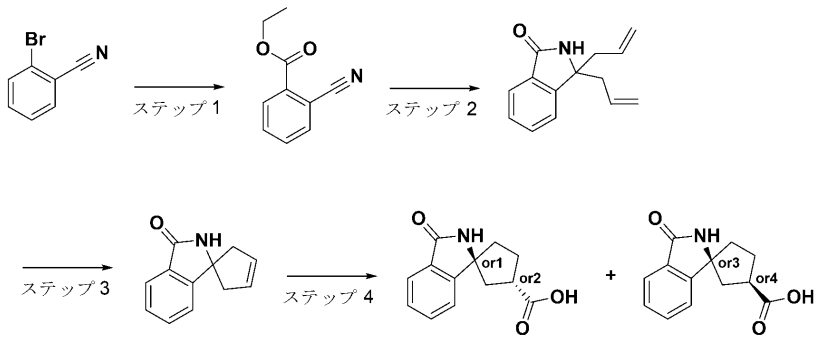
I-3516	I-3518	I-3519	I-3521	I-3522
I-3526	I-3527	I-3528	I-3529	I-3530
I-3531	I-3532	I-3533	I-3535	I-3536
I-3537	I-3538	I-3539	I-3540	I-3541
I-3544	I-3545	I-3546	I-3547	I-3548
I-3586	I-3587	I-3588	I-3589	I-3590
I-3591	I-3592	I-3593	I-3595	I-3596
I-3597	I-3598	I-3599	I-3600	I-3605
I-3606	I-3607	I-3608	I-3609	I-3610
I-3615	I-3616	I-3617	I-3618	I-3619
I-3620	I-3621	I-3622	I-3624	I-3626
I-3627	I-3629	I-3630	I-3634	I-3635
I-3636	I-3637	I-3638	I-3639	I-3640
I-3641	I-3642	I-3643	I-3644	I-3645
I-3646	I-3647	I-3648	I-3649	I-3650
I-3671	I-3673	I-3678	I-3679	I-3680
I-3682	I-3683	I-3688	I-3689	I-3691
I-3692	I-3693	I-3694	I-3695	I-3697
I-3698	I-3699	I-3700	I-3701	I-3702
I-3703	I-3704	I-3705	I-3706	I-3707
I-3709	I-3710	I-3712	I-3713	I-3717
I-3718	I-3721	I-3723	I-3724	I-3727
I-3728	I-3729	I-3730	I-3731	I-3732
I-3733	I-3734	I-3735	I-3736	I-3737
I-3738	I-3739	I-3740		

【０９０４】

実施例３３

ｒａｃ－（１Ｒ，３Ｒ）－３’－オキソスピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－カルボン酸及びｒａｃ－（１Ｒ，３Ｓ）－３’－オキソスピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－カルボン酸

【化７７１】



ステップ１．２－シアノ安息香酸エチルの合成

フレームドライした５０ｍＬフラスコに、２－ブロモベンゾニトリル（１．００ｇ、５．４９ｍｍｏｌ）を入れた。脱水ＴＨＦ（５０ｍＬ）をN_2雰囲気下にて加え、反応媒体を－７８℃まで冷却した。ｎ－ブチルリチウム（２．６４ｍＬ、ＴＨＦ中２．５モル、６

．５９ｍｍｏｌ）を滴下し、反応物を１５分間攪拌した。カルボノシアニド酸メチル（６５１μＬ、６．５９ｍｍｏｌ）を加え、反応物を室温までゆっくりと温めた。１時間後、反応物を飽和NH_4Cl溶液でクエンチした。水層をＥｔＯＡｃで２回抽出した。有機層を合わせ、水で１回洗浄し、次いで、Na_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。この物質を順相カラムクロマトグラフィー（ヘキサン：ＥｔＯＡｃ　１００：０から８０：２０）によって精製して、２－シアノ安息香酸エチル（３９６ｍｇ）を無色の粘稠な油状物として得た。^1H ＮＭＲ：（４００ ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ ８．１２ － ８．０８（ｍ，１Ｈ），７．７６（ｄｄ，Ｊ ＝ ７．０，１．６ Ｈｚ，１Ｈ），７．６７ － ７．５９（ｍ，２Ｈ），４．４２（ｑ，Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ，２Ｈ），１．４０（ｔ，Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ，３Ｈ）．

【０９０５】

ステップ２．３，３－ジアリルイソインドリン－１－オンの合成

ＴＨＦ（５ｍＬ）中の亜鉛末（２２４ｍｇ、３．４２ｍｍｏｌ）の懸濁液に、ＴＨＦ（０．５ｍＬ）中の２－シアノ安息香酸エチル（２００ｍｇ、１．１４ｍｍｏｌ）及び臭化アリル（２９４μＬ、３．４２ｍｍｏｌ）を順次加えた。溶液を加熱還流し、１５分加熱後、室温まで冷却した。ＨＣｌ（１Ｎ、５ｍＬ）を反応物に加え、水層をＥｔＯＡｃ（２×５ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を２Ｎ ＮａＯＨ及びブラインで洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させ、濾過した。溶媒を真空除去して、３，３－ジアリルイソインドリン－１－オン（２４０ｍｇ、粗製）を黄色の粘稠な油状物として得た。ＬＣＭＳ ＲＴ １．３９分、$[M+H]^+$ ２１４．１、ＬＣＭＳ方法Ｌ。

【０９０６】

ステップ３．スピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－エン－３’－オンの合成

フレームドライした１５０ｍＬフラスコに３，３－ジアリルイソインドリン－１－オン（２４０ｍｇ、１．１３ｍｍｏｌ）を入れた。脱水トルエン（４０ｍＬ）をN_2雰囲気下にて加え、反応物を７０℃まで加熱した。ベンジリデン（ジクロロ）（１，３－ジメシチル－２－イミダゾリジニリデン）ルテニウム－トリシクロヘキシルホスフィン（１：１）（４７．８ｍｇ、５６．３μｍｏｌ）を加え、反応物をこの温度で９０分間維持した。室温まで冷却した後、反応媒体を減圧下で濃縮し、粗製物質を順相カラムクロマトグラフィー（ＤＣＭ：ＥｔＯＡｃ　１００：０から５０：５０）を使用して生成して、スピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－エン－３’－オン（９８ｍｇ）を無色の油状物として得た。^1H ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ ７．７９（ｄ，Ｊ ＝ ７．５ Ｈｚ，１Ｈ），７．６０ － ７．５１（ｍ，２Ｈ），７．５０ － ７．４０（ｍ，２Ｈ），５．９０（ｄ，Ｊ ＝ ８．２ Ｈｚ，１Ｈ），５．８８（ｄ，Ｊ ＝ ８．３ Ｈｚ，１Ｈ），２．８９（ｄ，Ｊ ＝ １５．８ Ｈｚ，１Ｈ），２．８９（ｄ，Ｊ ＝ １５．８ Ｈｚ，１Ｈ），２．７７（ｄ，Ｊ ＝ １５．７ Ｈｚ，１Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ １．２３分、$[M+H]^+$ １８６．１、ＬＣＭＳ方法Ｌ。

【０９０７】

ステップ４．ｒａｃ－（１Ｒ，３Ｒ）－３’－オキソスピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－カルボン酸及びｒａｃ－（１Ｒ，３Ｓ）－３’－オキソスピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－カルボン酸の合成

フレームドライした１０ｍＬフラスコに、二酢酸パラジウム（６．０６ｍｇ、２７．０μｍｏｌ）及び４，５－ビス（ジフェニルホスフィノ）－９，９－ジメチルキサンテン（１５．６ｍｇ、２７．０μｍｏｌ）を入れた。脱水ＰｈＭｅ（０．２ｍＬ）をN_2雰囲気下にて加え、続いて、スピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－エン－３’－オン（１００ｍｇ、５４０μｍｏｌ）、ギ酸（４１．２μＬ、１．０８ｍｍｏｌ）、及び無水酢酸（１０．２μＬ、１０８μｍｏｌ）をシリンジにより順次加えた。バイアルをN_2でパージし、セプタムキャップで密封した。反応混合物を７０℃で２４時間攪拌した。反応媒体を室温まで冷却し、ＤＣＭ及びＨＣｌ（１Ｎ）で希釈した。水層をＤＣ

Ｍで３回抽出した。有機層をNa_2SO_4で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製材料をＤＭＦに希釈し、３０ｇ　Ｃ１８カラム（移動相Ａ：１０ｍＭギ酸アンモニウム／水、移動相Ｂ：アセトニトリル、グラジエント：Ａ：Ｂ９５：５から７０：３０）で精製して、ｒａｃ－（１Ｒ，３Ｒ）－３’－オキソスピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－カルボン酸及びｒａｃ－（１Ｒ，３Ｓ）－３’－オキソスピロ［シクロペンタン－１，１’－イソインドリン］－３－カルボン酸を得た。異性体１：２８ｍｇ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０４分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　２３２．０、ＬＣＭＳ方法Ｌ。異性体２：２９ｍｇ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０９分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　２３２．０、ＬＣＭＳ方法Ｌ。

【０９０８】

実施例３３の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表３に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表３の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表３】

表３．追加の例示的な化合物

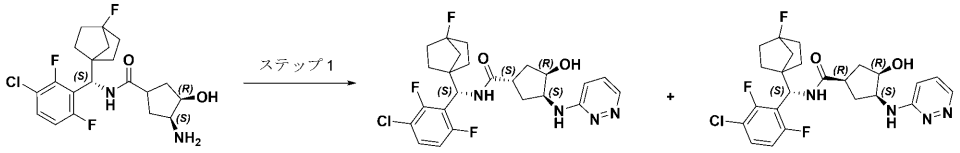
I-1898	I-1905	I-1982	I-1983	I-2022
I-2023	I-2024	I-2025	I-2026	I-2027
I-2028	I-2029	I-2120	I-2121	I-2122
I-2123	I-2124	I-2125	I-2126	I-2127

【０９０９】

実施例３４

（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－（ピリダジン－３－イルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－（ピリダジン－３－イルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７７２】



ステップ１．（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－（ピリダジン－３－イルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－（ピリダジン－３－イルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

１，４－ジオキサン（５ｍＬ）中の（３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１００ｍｇ、２４０μｍｏｌ）、３－ブロモピリダジン（４５．８ｍｇ、２８８μｍｏｌ）、Cs_2CO_3（２３５ｍｇ、７２０μｍｏｌ）及びＰｄ－ＰＥＰＰＳＩ－ＩＨｅｐｔ－Ｃｌ（４６．７ｍｇ、４８．０μｍｏｌ）の混合物をN_2雰囲気下にて９０℃で６時間撹拌した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ

１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍｍｏｌ／Ｌ　ＮＨ$_4$ＨＣＯ$_3$＋０．０５％ＮＨ$_4$ＯＨ）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：４２％Ｂから６２％Ｂで８分；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：８．５２）によって精製して、オフホワイト色の固体として得た（５０ｍｇ、４２％）。固体をキラルＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫＩＧ３；移動相Ａ：ヘキサン（０．２％ジエチルアミン）；移動相Ｂ：（ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１）；流量：１ｍＬ／分；グラジエント：アイソクラティック；注入量：３ｍＬ）によってさらに精製して、（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－（ピリダジン－３－イルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－ヒドロキシ－４－（ピリダジン－３－イルアミノ）シクロペンタン－１－カルボキサミドの両方をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ピーク１：１０．９ｍｇ（２２．０μｍｏｌ）。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．３７　（ｄｄ，　Ｊ　＝　４．３，　１．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．２４　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５６　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．７，　５．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２２　－　７．１０　（ｍ，　２Ｈ），　６．８７　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．０，　１．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．４７　（ｄ，　Ｊ　＝　７．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．２７　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．８８　（ｄ，　Ｊ　＝　３．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．１７　（ｄ，　Ｊ　＝　５．５　Ｈｚ，　２Ｈ），　３．１５　（ｑｄ，　Ｊ　＝　８．６，　６．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．９３　－　１．８５　（ｍ，　２Ｈ），　１．８４　－　１．７４　（ｍ，　６Ｈ），　１．７１　（ｄ，　Ｊ　＝　１２．３　Ｈｚ，　３Ｈ），　１．６０　（ｄ，　Ｊ　＝　８．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．４６　（ｄ，　Ｊ　＝　９．１　Ｈｚ，　２Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９４分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４９５、ＬＣＭＳ方法Ｄ；ピーク２：２０．０ｍｇ（４０．４μｍｏｌ）　^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．３８　（ｄｄ，　Ｊ　＝　４．４，　１．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．２４　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５７　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．７，　５．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．３０　－　７．０４　（ｍ，　２Ｈ），　６．９０　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．１，　１．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．５０　（ｄ，　Ｊ　＝　７．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．２９　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．８８　（ｄ，　Ｊ　＝　３．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２８　－　４．１０　（ｍ，　２Ｈ），　３．１４　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１２．７，　７．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．０２　（ｄｄｄ，　Ｊ　＝　１２．７，　８．１，　４．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．９０　－　１．７８　（ｍ，　４Ｈ），　１．７７　－　１．６５　（ｍ，　６Ｈ），　１．６０　（ｄ，　Ｊ　＝　８．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．４６　（ｄ，　Ｊ　＝　８．６　Ｈｚ，　２Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９４分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４９５、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０９１０】

実施例３４の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表４に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表４の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表４】

表４．追加の例示的な化合物

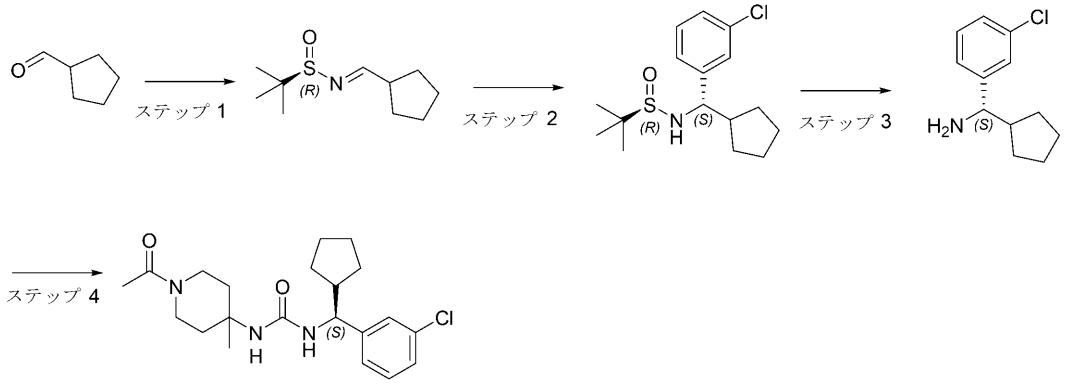
I-2015	I-2016	I-2094	I-2108	I-2111
I-2128	I-2130	I-2132	I-2135	I-2156
I-2159	I-2160	I-2221	I-2312	I-2315
I-2321	I-2324	I-2343	I-2800	I-2806
I-2807	I-2841	I-2842	I-2924	I-3439
I-3440	I-3542	I-3543	I-3623	I-3625
I-3628	I-3674	I-3675	I-3690	I-3696
I-3711	I-3719	I-3725	I-3726	

【０９１１】

実施例３５

（Ｓ）－１－（１－アセチル－４－メチルピペリジン－４－イル）－３－（（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）ウレア

【化７７３】



ステップ１．（Ｒ）－Ｎ－（シクロペンチルメチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（５６０ｍＬ）中のシクロペンタンカルバルデヒド（１１２ｇ、１．１５ｍｏｌ）及び（Ｒ）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１６７ｇ、１．３８ｍｏｌ）の溶液に、Ｔｉ（Ｏ^{i}－Ｐｒ）$_{4}$（６５１ｇ、２．２９ｍｏｌ）をN_2雰囲気下にて２５℃で加えた。混合物を７５℃まで加熱し、２時間撹拌した。室温まで冷却した後、混合物にブライン（３．００Ｌ）を加えた。懸濁液を濾過した。濾過ケーキを酢酸エチル（５．００Ｌ＊２）で洗浄した。濾液中の有機相を分離し、水相を酢酸エチル（３．００Ｌ）で抽出した。合わせた有機相をブライン（３．０Ｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、石油エーテル：酢酸エチル　１：０から１０：１）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（シクロペンチルメチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（３５７ｇ、１．７７ｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ　ＣＤＣｌ$_{3}$）

【０９１２】

δ　８．００　（ｄ，　Ｊ　＝　５．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．９８　－　２．９４（ｍ，　１Ｈ），　１．９４　－　１．８３　（ｍ，　２Ｈ），　１．７７　－　１．６２（ｍ，　６Ｈ），　１．１９　（ｓ，　９Ｈ）．

【０９１３】

ステップ２．（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

２つのバッチを実施した。ＴＨＦ（８００ｍＬ）中の（Ｒ）－Ｎ－（シクロペンチルメチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１６０ｇ、７９５ｍｍｏｌ）及び１－ブロモ－３－クロロベンゼン（１４０ｍＬ、１．１９ｍｏｌ）の溶液に、ｎ－ＢｕＬｉ（ＴＨＦ中２．５０Ｍ、４７７ｍＬ）をN_2下にて－６０～－７０℃で滴下した。反応物を－７０～－６０℃で２時間撹拌した。２つのバッチの混合物を合わせた。混合物を飽和NH_4Cl溶液（５．０Ｌ）中に注ぎ、酢酸エチル（２．００Ｌ＊３）で抽出した。次いで、合わせた有機相をブライン（２．００Ｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、粗生成物（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドを黄色の油状物として得、（５６３ｇ）、これをさらに精製することなく次のステップに使用した。

【０９１４】

ステップ３．（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミンの合成

２つのバッチを並行して実施した。酢酸エチル（２．６０Ｌ）中の（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（２６４ｇ、７５７ｍｍｏｌ）の溶液に、ＨＣｌ（ＥｔＯＡｃ中４Ｎ、４７３ｍＬ）を２５℃で加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。１時間撹拌すると、多量の白色の固体が形成された。２つのバッチの反応混合物を合わせた。懸濁液を４．０Ｌまで濃縮した。懸濁液を濾過し、濾過ケーキを酢酸エチル（２００ｍＬ＊２）で洗浄した。次いで、濾過ケーキを酢酸エチル（２．００Ｌ）と飽和$NaHCO_3$溶液（２．５０Ｌ）に分配した。懸濁液を固体がなくなるまで１０分間撹拌した。有機相を分離し、水相を酢酸エチル（１．００Ｌ＊２）で抽出した。合わせた有機相をブライン（２．００Ｌ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、粗生成物（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（２２０ｇ）を黄色の油状物として得、これをさらに精製することなく次のステップに使用した。

【０９１５】

ステップ４．（Ｓ）－１－（１－アセチル－４－メチルピペリジン－４－イル）－３－（（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）ウレアの合成

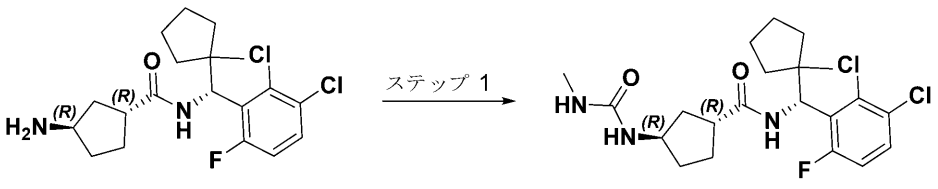
（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（１００ｍｇ、４７７μｍｏｌ）をＤＣＭ（５ｍＬ）中に溶解した。溶液を０℃まで冷却した。ＣＤＩ（９２．８ｍｇ、５７２μｍｏｌ）、続いて、ＤＭＡＰ（５．８３ｍｇ、４７．７μｍｏｌ）を加えた。溶液を０℃で１時間撹拌した。１－（４－アミノ－４－メチルピペリジン－１－イル）エタン－１－オン塩酸塩（９１．９ｍｇ、４７７μｍｏｌ）及びトリエチルアミン（１９９μＬ、１．４３ｍｍｏｌ）を加え、溶液を４０℃で１．５時間、次いで、室温で一晩撹拌した。次いで、４０℃で４．５時間加熱し、濃縮し、ＨＰＬＣによって精製して、生成物１－（１－アセチル－４－メチルピペリジン－４－イル）－３－（（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メチル）ウレア（５３．１ｍｇ、１３５μｍｏｌ）を無色の固体を得た。ＬＣＭＳ：ＲＴ　１．４１０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３９２．４６、ＬＣＭＳ方法Ｉ。

【０９１６】

実施例３６

（１Ｒ，３Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－（３－メチルウレイド）シクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７７４】



ステップ１．（１Ｒ，３Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェ

ニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－（３－メチルウレイド）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

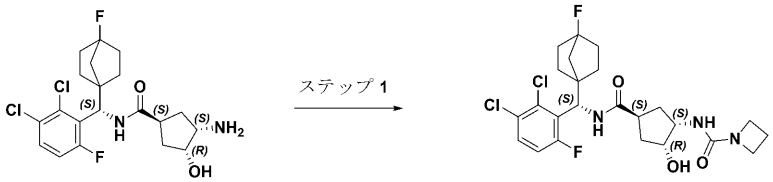
CH_3CN（１ｍＬ）中の（１Ｒ，３Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）シクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１３ｍｍｏｌ）、Ｎ－メチル－１Ｈ－イミダゾール－１－カルボキサミド（１６ｍｇ、０．１３ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（２６ｍｇ、０．２６ｍｍｏｌ）の混合物を２５℃で２時間撹拌した。反応物をＭｅＯＨ（１ｍＬ）でクエンチし、濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　ＰｒｅｐＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭNH_4HCO_3）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３５％Ｂから６５％Ｂで８分、次いで、６５％Ｂ；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：７．５３）によって精製して、（１Ｒ，３Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（１－メチルシクロペンチル）メチル）－３－（３－メチルウレイド）シクロペンタン－１－カルボキサミド（１７．４ｍｇ、３９．２μｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　８．０５　（ｄ，　Ｊ　＝　８．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６０　（ｄ，　Ｊ　＝　９．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２５　（ｔ，　Ｊ　＝　９．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．８１　（ｄ，　Ｊ　＝　７．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．５６　（ｓ，　１Ｈ），　５．４９　（ｄ，　Ｊ　＝　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．８８　（ｑ，　Ｊ　＝　６．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．９９－２．９１　（ｍ，　１Ｈ），　２．５３　（ｓ，　３Ｈ），　１．８８－１．７０　（ｍ，　３Ｈ），　１．６８－１．５７　（ｍ，　７Ｈ），　１．４４　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１２．６，　７．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．３７　（ｓ，　１Ｈ），　１．３５－１．２４　（ｍ，　２Ｈ），　０．９６　（ｄ，　Ｊ　＝　２．８　Ｈｚ，　３Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１５８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４４４、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９１７】

実施例３７

Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）アゼチジン－１－カルボキサミド

【化７７５】



ステップ１．Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）アゼチジン－１－カルボキサミドの合成

（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドを実施例５と同様に合成した。CH_2Cl_2（３ｍＬ）中のアゼチジン（１３ｍｇ、２３１μｍｏｌ）及びＴＥＡ（７０ｍｇ、６９２μｍｏｌ）の撹拌溶液に、トリホスゲン（２０ｍｇ、０．３０当量、６９．２μｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。得られた混合物を窒素下にて３０℃で１時間撹拌した。上記混合物に、（１Ｓ，３Ｓ，４Ｒ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（１００ｍｇ、２３１μｍｏｌ）を室温で加えた。得られた混合物を室温で１時間撹拌した。得られた

混合物を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、１０μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3＋０．０５％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３２％Ｂから４９％Ｂで８分；波長：２５４ｎｍ／２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：９．４８）によって精製して、Ｎ－（（１Ｓ，２Ｒ，４Ｓ）－４－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）－２－ヒドロキシシクロペンチル）アゼチジン－１－カルボキサミド（４．３ｍｇ、８．０μｍｏｌ）を白色の固体として得た。

【０９１８】

ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．３８９分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５１６．２０。ＬＣＭＳ方法Ｆ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（３００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．１７　（ｄ，　Ｊ　＝　８．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６２　（ｄｄ，　Ｊ　＝　８．９，　５．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２６　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．６，　９．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．４９　（ｄ，　Ｊ　＝　７．７　Ｈｚ，　２Ｈ），　４．７７　（ｄ，　Ｊ　＝　３．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９１－３．８５　（ｍ，　１Ｈ），　３．７８　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．９，　５．１　Ｈｚ，　４Ｈ），　３．１２－２．９８　（ｍ，　１Ｈ），　２．１５－２．０７　（ｍ，　２Ｈ），　１．８５－１．４９　（ｍ，　１５Ｈ）．　^{19}Ｆ　ＮＭＲ　（２８２　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ）　δ　－１０９．２７，　－１７３．５３，　－１７３．７７．

【０９１９】

実施例３５～３７の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表５に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表５の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表５－１】

表５．追加の例示的な化合物

I-1	I-2	I-4	I-5	I-7
I-8	I-9	I-10	I-11	I-12
I-13	I-14	I-15	I-16	I-17
I-18	I-19	I-20	I-21	I-22
I-23	I-24	I-25	I-26	I-27
I-28	I-29	I-30	I-31	I-32
I-33	I-34	I-35	I-36	I-37
I-38	I-39	I-40	I-41	I-42
I-43	I-44	I-45	I-46	I-47
I-48	I-49	I-50	I-51	I-52
I-53	I-54	I-55	I-56	I-57
I-58	I-59	I-60	I-61	I-62
I-63	I-64	I-65	I-66	I-67
I-68	I-69	I-70	I-71	I-72
I-73	I-74	I-75	I-76	I-77
I-78	I-79	I-80	I-81	I-82
I-84	I-85	I-86	I-87	I-88
I-89	I-90	I-91	I-92	I-93
I-94	I-95	I-96	I-97	I-98
I-99	I-100	I-101	I-102	I-103
I-104	I-105	I-106	I-107	I-108
I-109	I-110	I-111	I-112	I-113
I-114	I-115	I-116	I-117	I-118
I-119	I-120	I-121	I-122	I-123
I-124	I-125	I-126	I-127	I-128
I-129	I-130	I-131	I-132	I-133
I-134	I-135	I-136	I-137	I-138
I-139	I-140	I-141	I-142	I-143
I-144	I-145	I-146	I-147	I-148
I-149	I-150	I-151	I-152	I-153
I-154	I-155	I-156	I-157	I-158
I-159	I-160	I-161	I-162	I-163
I-164	I-165	I-166	I-167	I-168
I-169	I-170	I-171	I-172	I-173
I-174	I-175	I-176	I-177	I-178
I-179	I-182	I-184	I-185	I-186
I-187	I-188	I-189	I-190	I-195
I-196	I-197	I-204	I-205	I-206
I-207	I-215	I-219	I-220	I-221
I-223	I-225	I-230	I-231	I-232
I-233	I-235	I-254	I-255	I-256

【表５－２】

I-261	I-262	I-264	I-265	I-267
I-268	I-274	I-275	I-276	I-277
I-278	I-279	I-280	I-281	I-282
I-283	I-284	I-285	I-286	I-287
I-288	I-289	I-290	I-291	I-292
I-293	I-299	I-300	I-301	I-302
I-303	I-304	I-305	I-306	I-307
I-308	I-309	I-310	I-311	I-312
I-313	I-314	I-315	I-316	I-317
I-318	I-319	I-320	I-321	I-322
I-323	I-324	I-326	I-328	I-329
I-330	I-331	I-332	I-335	I-336
I-345	I-346	I-347	I-350	I-355
I-356	I-357	I-359	I-361	I-363
I-365	I-368	I-374	I-379	I-380
I-381	I-382	I-383	I-385	I-386
I-387	I-388	I-389	I-390	I-391
I-392	I-393	I-394	I-395	I-396
I-397	I-398	I-399	I-400	I-401
I-402	I-404	I-405	I-407	I-408
I-409	I-410	I-412	I-413	I-414
I-415	I-416	I-417	I-418	I-419
I-420	I-421	I-422	I-423	I-425
I-426	I-428	I-431	I-433	I-434
I-435	I-436	I-443	I-444	I-447
I-448	I-449	I-450	I-451	I-452
I-453	I-456	I-457	I-458	I-459
I-462	I-463	I-464	I-465	I-468
I-472	I-473	I-474	I-480	I-481
I-482	I-483	I-486	I-487	I-495
I-496	I-497	I-499	I-500	I-501
I-502	I-503	I-516	I-517	I-518
I-519	I-520	I-523	I-529	I-530
I-531	I-532	I-533	I-534	I-535
I-548	I-565	I-584	I-585	I-586
I-587	I-588	I-589	I-590	I-591
I-592	I-593	I-594	I-595	I-596
I-597	I-599	I-601	I-602	I-603
I-604	I-605	I-617	I-618	I-623
I-624	I-625	I-626	I-627	I-628
I-629	I-631	I-632	I-633	I-636
I-637	I-638	I-646	I-647	I-648

【表５－３】

I-649	I-653	I-654	I-655	I-656
I-662	I-663	I-664	I-677	I-697
I-698	I-699	I-705	I-706	I-707
I-708	I-713	I-714	I-715	I-716
I-720	I-721	I-722	I-723	I-726
I-727	I-728	I-729	I-731	I-732
I-733	I-734	I-735	I-736	I-737
I-738	I-739	I-740	I-741	I-742
I-743	I-749	I-750	I-751	I-752
I-753	I-754	I-759	I-779	I-805
I-807	I-810	I-813	I-815	I-687
I-880	I-881	I-884	I-885	I-886
I-888	I-889	I-890	I-892	I-893
I-894	I-895	I-896	I-899	I-926
I-928	I-930	I-933	I-969	I-970
I-971	I-972	I-991	I-994	I-995
I-1006	I-1008	I-1016	I-1112	I-1113
I-1114	I-1199	I-1678	I-1802	I-1803
I-1804	I-1805	I-1806	I-1807	I-1808
I-1809	I-1810	I-1811	I-1812	I-1813
I-1818	I-1819	I-1820	I-1821	I-1822
I-1823	I-1824	I-1825	I-1826	I-1830
I-1831	I-1832	I-1894	I-1915	I-1919
I-1920	I-1933	I-1958	I-1960	I-2014
I-2017	I-2038	I-2039	I-2093	I-2415
I-2416	I-2756	I-2764	I-2765	I-2776
I-3197	I-3271	I-3272	I-3275	I-3278
I-3397	I-3681	I-3708		

【０９２０】

ＴＦＡ（２ｍＬ）中の（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－アミン（１５０ｍｇ、３０５μｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：４０％Ｂから７０％Ｂで８分、次いで、７０％Ｂ；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：７．８３）によって精製した。真空濃縮により、（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－アミン（２０ｍｇ、５５μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　１０．３１　（ｓ，　１Ｈ），　７．５３　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．６，　５．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．２０　－　７．０９　（ｍ，　３Ｈ），　７．０７　（ｄ，　Ｊ　＝　８．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．８４　（ｓ，　２Ｈ），　５．１３　（ｔ，　Ｊ　＝　９．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　２．５１　（ｓ，　１Ｈ），　１．９６　－　１．８８　（ｍ，　１Ｈ），　１．６４　（ｓ，　２Ｈ），　１．５７　（ｄｔ，　Ｊ　＝　１５．２，　８．１

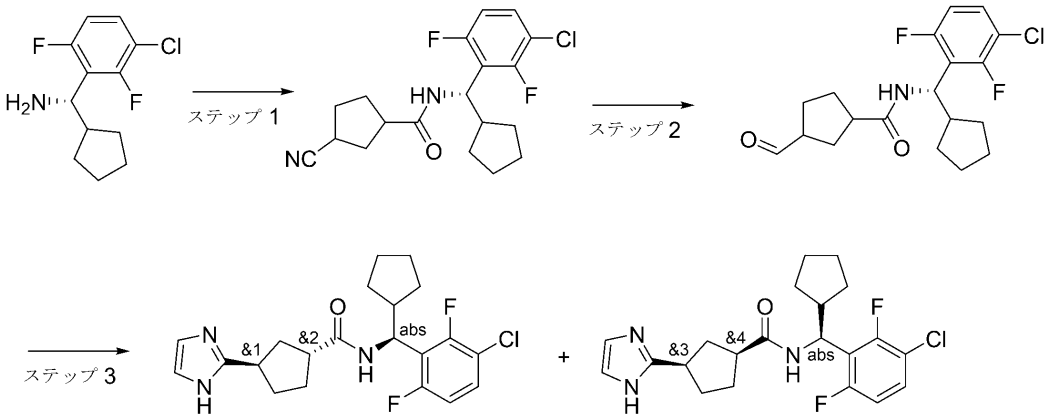
Ｈｚ，２Ｈ），１．４４（ｔｄ，Ｊ＝１２．５，６．６Ｈｚ，２Ｈ），１．１７－１．０９（ｍ，１Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ ０．８１５分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$ ３６２．０５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９２１】

実施例３８

（１ＲＳ，３ＲＳ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－（１Ｈ－イミダゾール－２－イル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１ＲＳ，３ＳＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－（１Ｈ－イミダゾール－２－イル）シクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７７６】



ステップ１．Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－シアノシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

磁気撹拌子を備えたフラスコに、３－シアノシクロペンタン－１－カルボン酸（１６０ｍｇ、１．１５ｍｍｏｌ）及び（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（３２４ｍｇ、１．１５ｍｍｏｌ）を入れた。ＤＭＦ（２ｍＬ）を加え、続いて、ＤＩＰＥＡ（６０１μＬ、３．４５ｍｍｏｌ）及びＴ３Ｐ（１．１０ｇ、５０重量％、１．７２ｍｍｏｌ）を滴下した。反応混合物を周囲温度で３０分間撹拌した。反応物をＥｔＯＡｃ（１０ｍＬ）及び$Ｈ_{2}Ｏ$（３０ｍＬ）で希釈した。有機層を水で２回、次いで、飽和$ＮＨ_{4}Ｃｌ$溶液、最後にブラインで洗浄した。有機層を$Ｎａ_{2}ＳＯ_{4}$で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製物質を逆相カラムクロマトグラフィー（移動相Ａ：１０ｍＭギ酸アンモニウム／水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：Ａ：Ｂ　９０：１０から３０：７０）で精製して、Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－シアノシクロペンタン－１－カルボキサミド（３２０ｍｇ）を得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．７９分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３６７．２、ＲＴ　１．８２分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３６７．２、ＬＣＭＳ方法Ｌ。

【０９２２】

ステップ２．Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－ホルミルシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

磁気撹拌子を備えたフレームドライマイクロ波バイアルに、Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－シアノシクロペンタン－１－カルボキサミド（１００ｍｇ、２７３μｍｏｌ）を入れた。ＤＣＭ（２ｍＬ）を$Ｎ_{2}$雰囲気下にて加え、反応物を－７８℃まで冷却した。水素化ジイソブチルアルミニウム（６５４μＬ、ＤＣＭ中１Ｍ、６５４μｍｏｌ）を滴下し、反応物を－７８℃で４０分間撹拌した。反応物を室温まで温め、ＤＣＭで希釈し、ロッシェル塩溶液（１０ｍＬ）でクエンチした。二相混合物を１５分間撹拌し、水層をＤＣＭで２回抽出した。有機層を合わせ、$Ｎａ_{2}ＳＯ_{4}$で乾燥させ、減圧下で濃縮して、Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－ホルミルシクロペンタン

－１－カルボキサミドを無色の粘稠な油状物として得（１００ｍｇ）、これをさらに精製することなく次のステップに使用した。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．８１分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３７０．２、ＬＣＭＳ方法Ｌ。

【０９２３】

ステップ３．（１ＲＳ，３ＲＳ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－（１Ｈ－イミダゾール－２－イル）シクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１ＲＳ，３ＳＲ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－（１Ｈ－イミダゾール－２－イル）シクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

０℃のエタノール（０．５ｍＬ）中のＮ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－３－ホルミルシクロペンタン－１－カルボキサミド（４０．０ｍｇ、１０８μｍｏｌ）の溶液に、グリオキサール（１８．６μＬ、水中４０重量％、１６２μｍｏｌ）及びNH_4OH（１４５μＬ、２９重量％、１．０８ｍｍｏｌ）の溶液を加えた。反応混合物を室温まで温め、５時間撹拌した。反応混合物をＥｔＯＡｃ及び水で希釈した。水相をＥｔＯＡｃで２回抽出した。有機相を合わせ、Na_2SO_4で乾燥させ、真空濃縮した。粗製混合物を逆相カラム（３０ｇ）、溶出：１０ｍＭギ酸アンモニウム／水：アセトニトリル９５：５から５０：５０で１６分間精製して、２つのラセミ体を得た。ラセミ体１：５．３ｍｇ；ＬＣＭＳ　ＲＴ　２．７９分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４０８．３、ＬＣＭＳ方法Ｍ。^{1}ＨＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．３７　（ｄ，　Ｊ　＝　７．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．１８　（ｓ，　１Ｈ），　７．４８　（ａｐｐ．　ｔｄ，　Ｊ　＝　８．５，　４．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．０８　（ａｐｐ．　ｔ，　Ｊ　＝　９．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．８０　（ｓ，　１Ｈ），　６．７９　（ｓ，　１Ｈ），　４．７８　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．８，　７．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．１８　－　３．０５　（ｍ，　１Ｈ），　２．８９　－　２．７９　（ｍ，　１Ｈ），　２．４２　－　２．３４　（ｍ，　１Ｈ），　２．０３　－　１．６２　（ｍ，　６Ｈ），　１．６２　－　１．３６　（ｍ，　５Ｈ），　１．３５　－　１．１６　（ｍ，　２Ｈ），　１．０１　－　０．８７　（ｍ，　１Ｈ）．　ラセミ体２：４．１ｍｇ、ラセミ体２：ラセミ体１の８０：２０混合物。ＬＣＭＳ　ＲＴ　２．９７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４０８．３、ＬＣＭＳ方法Ｍ。^{1}ＨＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．８７　（重複するｄ，　Ｊ　＝　６．３　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．８６　（重複するｄ，　Ｊ　＝　６．７　Ｈｚ，　１Ｈ），８．２８　（ｂｒ．　ｓｓ，　１Ｈ），　７．５６　－　７．４７　（ｍ，　１Ｈ），　７．１６　－　７．０８　（ｍ，　１Ｈ），　６．８５　（重複するｂｒ．　ｓ，　１Ｈ），　６．８３　（重複するｂｒ．　ｓ，　１Ｈ），　４．８４　（ｂｒ．　ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．９，　７．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．１４　（重複するｍ，　１Ｈ），　２．８３　－　２．７２　（ｍ，　１Ｈ），　２．４４　（重複するｍ，　１Ｈ），　２．２４　－　２．１３　（ｍ，　０．５Ｈ），　２．１３　－　２．０３　（ｍ，　０．５Ｈ），　１．９９　－　１．６７　（ｍ，　６Ｈ），　１．６５　－　１．４１　（ｍ，　４Ｈ），　１．３９　－　１．２０　（ｍ，　２Ｈ），　１．０７　－　０．９５　（ｍ，　１Ｈ）．

【０９２４】

実施例３８の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表６に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表６の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

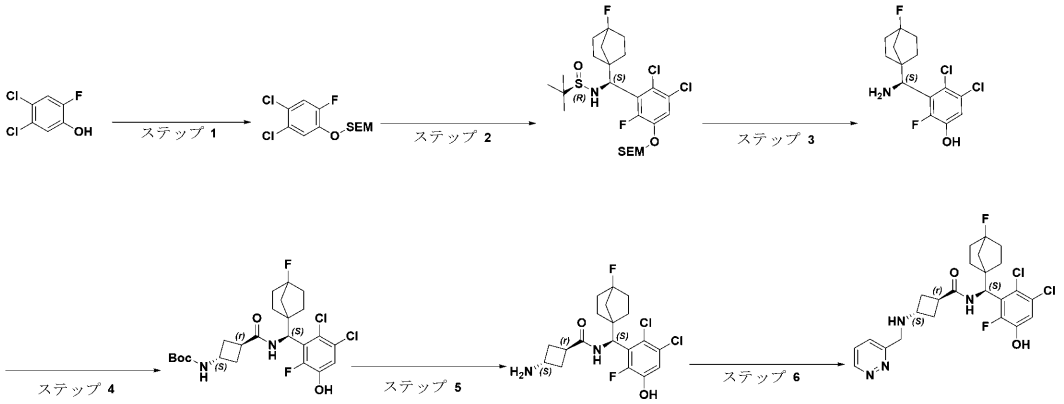
【表６】

表６．追加の例示的な化合物

I-2055	I-2058

【０９２５】

実施例３９
（１ｒ，３Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（（ピリダジン－３－イルメチル）アミノ）シクロブタン－１－カルボキサミド
【化７７７】



ステップ１．（２－（（４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノキシ）メトキシ）エチル）トリメチルシランの合成
アセトニトリル（７５ｍＬ）中の４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノール（７．５ｇ、４１．４ｍｍｏｌ）及びK_2CO_3（１１．４５ｇ、８２．９ｍｍｏｌ）の混合物に、ＳＥＭ－Ｃｌ（１１．０ｍＬ、６２．２ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応物を水（１００ｍＬ）でクエンチし、酢酸エチル（２００ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（３０ｇカラム；石油エーテルによる溶出）によって精製して、（２－（（４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノキシ）メトキシ）エチル）トリメチルシラン（１２ｇ、３９ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－d_6） δ ７．７７ （ｄ， Ｊ ＝ １０．８ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．５８ （ｄ， Ｊ ＝ ８．１ Ｈｚ， １Ｈ）， ５．３９ （ｓ， ２Ｈ）， ３．８１ － ３．７２ （ｍ， ２Ｈ），０．９６ － ０．８３ （ｍ， ２Ｈ），０．０３ － ０．０１ （ｍ， ９Ｈ）．
【０９２６】
ステップ２．（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メトキシ）フェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成
【０９２７】
ＴＨＦ（１５ｍＬ）中の（２－（（４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノキシ）メトキシ）エチル）トリメチルシラン（６６６ｍｇ、２．１４ｍｍｏｌ）の混合物に、ＬＤＡ（１．５３ｍＬ、ＴＨＦ中２Ｍ、３．０６ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－６０℃で滴下した。混合物を－６０℃で１時間撹拌した後、（Ｒ）－Ｎ－（（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチレン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（５００ｍｇ、２．０４ｍｍｏｌ）を－６０℃で加えた。混合物を室温で１時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液）でクエンチした。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（３０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から５０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メトキシ）フェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１

］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（９９０ｍｇ、１．７８ｍｍｏｌ）を得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４４０分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　５５６．１５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９２８】

ステップ３．（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノールの合成

【０９２９】

ＨＣｌ（１０ｍＬ、１，４－ジオキサン中４Ｎ）中の（Ｒ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メトキシ）フェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（９９０ｍｇ、１．７８ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間撹拌した。混合物を濃縮して、（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノール（５４３ｍｇ、１．６９ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７３０分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３２２．０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９３０】

ステップ４．（（１Ｓ，３ｒ）－３－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）シクロブチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

【０９３１】

ＤＭＦ（２ｍＬ）中の（Ｓ）－３－（アミノ（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４，５－ジクロロ－２－フルオロフェノール（１５０ｍｇ、４６６μｍｏｌ）、（１ｒ，３ｒ）－３－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）シクロブタン－１－カルボン酸（１００ｍｇ、４６６μｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（１１７ｍｇ、１．４０ｍｍｏｌ）の混合物に、ＨＡＴＵ（２６６ｍｇ、６９８μｍｏｌ）を加えた。混合物を室温で１時間撹拌した。反応混合物を水（３０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（５０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュによって精製して、（（１Ｓ，３ｒ）－３－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）シクロブチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１７８ｍｇ、３４３μｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１２７分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４６３、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９３２】

ステップ５．（１ｒ，３Ｓ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）シクロブタン－１－カルボキサミドの合成

【０９３３】

ＨＣｌ（３ｍＬ、ジオキサン中４Ｎ）中の（（１Ｓ，３ｒ）－３－（（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）カルバモイル）シクロブチル）カルバメート（１５８ｍｇ、３０４μｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。混合物を濃縮し、残渣を飽和$NaHCO_3$溶液で希釈した。反応混合物を酢酸エチル（５０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮して、（１ｒ，３Ｓ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）シクロブタン－１－カルボキサミド（９０ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．４３１分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４１９。ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９３４】

ステップ６．（１ｒ，３Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（（ピリダジン－３－イルメチル）アミノ）シクロブタン－１－カルボキサミドの合成

【０９３５】

ＭｅＯＨ（１ｍＬ）中のピリダジン－３－カルバルデヒド（７．７ｍｇ、７２μｍｏｌ）及び（１ｒ，３Ｓ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）シクロブタン－１－カルボキサミド（３０ｍｇ、７２μｍｏｌ）の混合物を２℃で０．５時間撹拌した後、$NaBH_3CN$（５．４ｍｇ、８５μｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、酢酸エチル（５０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ Ｓｈｉｅｌｄ ＲＰ１８ ＯＢＤ Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ NH_4HCO_3＋０．１％NH_4OH）、移動相Ｂ：ＭｅＯＨ；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３８％Ｂから５６％Ｂで１１分；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ（分）：１０．６；注入量：０．４７５ｍＬ）によって精製して、（１ｒ，３Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（２，３－ジクロロ－６－フルオロ－５－ヒドロキシフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（（ピリダジン－３－イルメチル）アミノ）シクロブタン－１－カルボキサミド（１６ｍｇ、３１μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ ９．１１（ｄｄ，Ｊ＝４．７，１．９ Ｈｚ，１Ｈ），８．０４（ｄ，Ｊ＝８．４ Ｈｚ，１Ｈ），７．７０（ｄｄ，Ｊ＝８．５，１．９ Ｈｚ，１Ｈ），７．６５（ｄｄ，Ｊ＝８．５，４．７ Ｈｚ，１Ｈ），７．１０（ｄ，Ｊ＝８．１ Ｈｚ，１Ｈ），６．５３（ｓ，１Ｈ），６．２９（ｓ，１Ｈ），５．５１－５．３３（ｍ，１Ｈ），３．９３（ｓ，２Ｈ），３．３２（ｔ，Ｊ＝７．４ Ｈｚ，１Ｈ），３．１１－３．０２（ｍ，１Ｈ），２．１８（ｄｑ，Ｊ＝７．８，４．１，３．２ Ｈｚ，１Ｈ），２．１０－１．８８（ｍ，３Ｈ），１．８１－１．５２（ｄｄ，Ｊ＝２２．７，１０．１ Ｈｚ，１０Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ ０．８７２分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$ ５１１．１５、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９３６】

実施例３９の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表７に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表７の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表７】

表７．追加の例示的な化合物

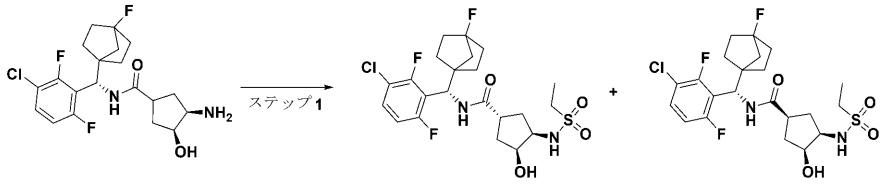
I-2992	I-2993	I-2994	I-2995

【０９３７】

実施例４０

（１Ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（エチルスルホンアミド）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（エチルスルホンアミド）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド

【化７７８】



ステップ１．（１Ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（エチルスルホンアミド）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（エチルスルホンアミド）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの合成

ＤＣＭ（２ｍＬ）中の（３Ｒ，４Ｓ）－３－アミノ－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１２ｍｍｏｌ）及びＤＩＥＡ（６３μＬ、０．３６ｍｍｏｌ）の混合物に、エタンスルホニルクロリド（１９ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）を０℃で滴下した。混合物を２５℃で１時間撹拌した。混合物を真空下で濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3＋０．０５％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３８％Ｂから５２％Ｂで７分；波長：２５４／２２０ｎｍｎｍ；ＲＴ（分）：７．４５）によって精製して、（３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（エチルスルホンアミド）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド（４０ｍｇ、６５μｍｏｌ）を白色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０９８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５０９．０５、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９３８】

生成物を分取キラルＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＤ、２＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：３０％アイソクラティック；波長：２２０／２５４ｎｍ；ＲＴ１（分）：６．９４；ＲＴ２（分）：１１．３８；試料溶媒：ＥｔＯＨ：ＤＣＭ　１：１；注入量：１．９ｍＬ）によってさらに精製して、（１Ｒ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（エチルスルホンアミド）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミド及び（１Ｓ，３Ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メチル）－３－（エチルスルホンアミド）－４－ヒドロキシシクロペンタン－１－カルボキサミドの両方を白色の非晶質固体として得た。

【０９３９】

異性体１：４ｍｇ、８μｍｏｌ。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０９４分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５０９．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９４０】

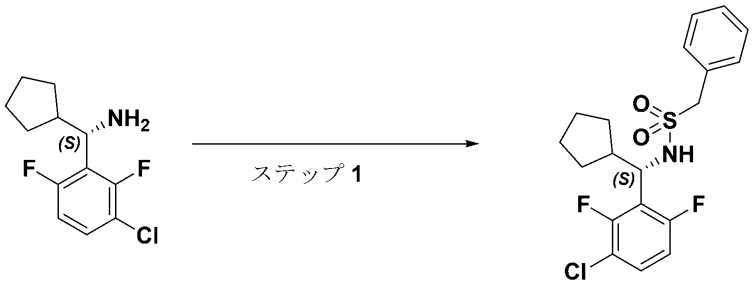
異性体２：５．２ｍｇ、１０μｍｏｌ。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０９２分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　５０９．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９４１】

実施例４１

（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１－フェニルメタンスルホンアミド

【化７７９】



ステップ１．（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１－フェニルメタンスルホンアミドの合成

ＤＣＭ（１ｍＬ）中の（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（１００ｍｇ、４０７μｍｏｌ）及びＴＥＡ（２０６ｍｇ、２．０４ｍｍｏｌ）の混合物に、フェニルメタンスルホニルクロリド（９３．１ｍｇ、４８８μｍｏｌ）を室温で加えた。混合物を室温で１時間攪拌した。反応物をＭｅＯＨ（１ｍｌ）でクエンチし、濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：１０％から６０％Ｂで１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によってまず精製し、次いで、分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：５０％Ｂから８０％Ｂで７分、次いで、８０％Ｂ；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：６．６）によって精製して、（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１－フェニルメタンスルホンアミド（３２．１ｍｇ、８０μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　７．９１　（ｄ，　Ｊ　＝　７．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５７　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．７，　５．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．３０　－　７．２１　（ｍ，　３Ｈ），　７．１９　－　７．１０　（ｍ，　３Ｈ），　４．４２　（ｄｄ，　Ｊ　＝　１０．７，　７．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２６　－　４．０７　（ｍ，　２Ｈ），　２．３９　（ｐ，　Ｊ　＝　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．９２　（ｄｐ，　Ｊ　＝　１２．３，　６．８，　５．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．６９　－　１．３４　（ｍ，　５Ｈ），　１．３２　－　１．１９　（ｍ，　１Ｈ），　０．９２　（ｄｑ，　Ｊ　＝　１２．２，　８．０　Ｈｚ，　１Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．６９２分、［Ｍ＋Ｎａ］$^+$　４２２、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９４２】

実施例４０～４１の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表８に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表８の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表８－１】

表８．追加の例示的な化合物

I-1816	I-1827	I-1959	I-2009	I-2151
I-2152	I-2153	I-2681	I-2683	I-2694
I-2695	I-2701	I-2702	I-2703	I-2704
I-2705	I-2706	I-2707	I-2748	I-2749
I-2750	I-2751	I-2766	I-2767	I-2768
I-2769	I-2819	I-2820	I-2821	I-2822
I-2847	I-2848	I-2849	I-2850	I-2851
I-2852	I-2853	I-2854	I-2855	I-2856
I-2882	I-2883	I-2896	I-2897	I-2898
I-2899	I-2900	I-2901	I-2907	I-2908
I-2909	I-2910	I-2911	I-2912	I-2913
I-2914	I-2930	I-2931	I-2932	I-2933
I-2934	I-2935	I-2936	I-2937	I-2938
I-2939	I-2940	I-2941	I-2968	I-2969
I-2970	I-2971	I-2972	I-2986	I-2987
I-2988	I-3030	I-3031	I-3032	I-3033
I-3034	I-3035	I-3036	I-3037	I-3038
I-3039	I-3040	I-3041	I-3042	I-3043
I-3066	I-3072	I-3074	I-3075	I-3076
I-3077	I-3078	I-3079	I-3080	I-3090
I-3097	I-3107	I-3108	I-3114	I-3116
I-3117	I-3133	I-3135	I-3136	I-3142
I-3143	I-3155	I-3158	I-3159	I-3162
I-3163	I-3165	I-3199	I-3200	I-3201
I-3205	I-3206	I-3207	I-3208	I-3209
I-3210	I-3211	I-3229	I-3230	I-3231
I-3236	I-3237	I-3295	I-3296	I-3299
I-3300	I-3301	I-3302	I-3303	I-3304
I-3305	I-3306	I-3307	I-3308	I-3309
I-3310	I-3311	I-3312	I-3313	I-3314
I-3315	I-3322	I-3323	I-3330	I-3343
I-3344	I-3345	I-3346	I-3347	I-3348
I-3349	I-3360	I-3361	I-3362	I-3363
I-3364	I-3365	I-3366	I-3368	I-3369
I-3370	I-3371	I-3372	I-3399	I-3400
I-3407	I-3412	I-3413	I-3418	I-3419
I-3420	I-3421	I-3422	I-3424	I-3445
I-3446	I-3447	I-3448	I-3452	I-3453
I-3454	I-3455	I-3456	I-3457	I-3458
I-3459	I-3460	I-3461	I-3462	I-3463
I-3464	I-3465	I-3466	I-3467	I-3468

【表８－２】

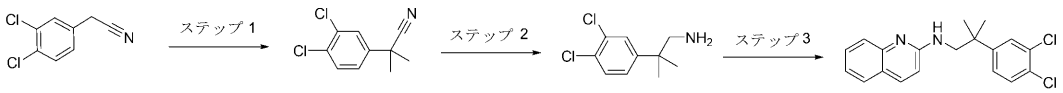
I-3469	I-3470	I-3471	I-3472	I-3473
I-3474	I-3475	I-3476	I-3477	I-3478
I-3480	I-3481	I-3482	I-3483	I-3484
I-3485	I-3486	I-3517	I-3520	I-3523
I-3524	I-3525	I-3549	I-3550	I-3551
I-3552	I-3553	I-3554	I-3555	I-3556
I-3557	I-3558	I-3559	I-3560	I-3561
I-3562	I-3563	I-3564	I-3565	I-3566
I-3567	I-3568	I-3569	I-3570	I-3571
I-3572	I-3573	I-3574	I-3575	I-3576
I-3577	I-3578	I-3579	I-3580	I-3581
I-3582	I-3583	I-3584	I-3585	I-3594
I-3601	I-3602	I-3603	I-3604	I-3611
I-3612	I-3613	I-3614	I-3631	I-3632
I-3633	I-3651	I-3652	I-3653	I-3654
I-3655	I-3656	I-3657	I-3658	I-3659
I-3660	I-3661	I-3662	I-3663	I-3664
I-3665	I-3666	I-3667	I-3668	I-3669
I-3670	I-3672	I-3684	I-3685	I-3686
I-3687	I-3714	I-3715	I-3716	I-3741
I-3742	I-3743	I-3744	I-3745	

【０９４３】

実施例４２

Ｎ－（２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロピル）キノリン－２－アミン

【化７８０】



ステップ１．２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロパンニトリルの合成

ＴＨＦ（１５ｍＬ）中の２－（３，４－ジクロロフェニル）アセトニトリル（１０００ｍｇ、５．３８ｍｍｏｌ）の混合物に、ＬｉＨＭＤＳ（１３．４ｍＬ、ＴＨＦ中１Ｍ、１３．４ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。混合物を０℃で１時間撹拌した後、ＭｅＩ（１．９１ｇ、１３．４ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液）でクエンチした。混合物を水（２０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（５０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を分取ＴＬＣ（石油エーテル／酢酸エチル、比率５／１）によって精製して、２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロパンニトリル（１．０ｇ、４．６７ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}ＨＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）７．７８（ｄ，Ｊ＝２．４Ｈｚ，１Ｈ），７．７１（ｄ，Ｊ＝８．５Ｈｚ，１Ｈ），７．５４（ｄｄ，Ｊ＝８．５，２．３Ｈｚ，１Ｈ），１．７０（ｓ，６Ｈ）．

【０９４４】

ステップ２．２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロパン－１－アミンの合成

ＴＨＦ（１０ｍＬ）中の２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロパンニトリル（１．０ｇ、４．６７ｍｍｏｌ）の混合物に、ＬｉＡｌＨ$_4$（２１３ｍｇ、５．６０ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で少しずつ加えた。混合物を８０℃で２時間撹拌した。次いで、反応物を０℃まで冷却し、水（３ｍＬ）、水酸化ナトリウム（６ｍＬ、４Ｎｉｎ水）及び水（３ｍＬ）でクエンチした。反応混合物をセライトパッドに通して濾過し、パッドを酢酸エチルで洗浄し、濾液を真空濃縮して、２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロパン－１－アミン（９００ｍｇ、１．３８ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．５２６分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　２１８、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９４５】

ステップ３．Ｎ－（２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロピル）キノリン－２－アミンの合成

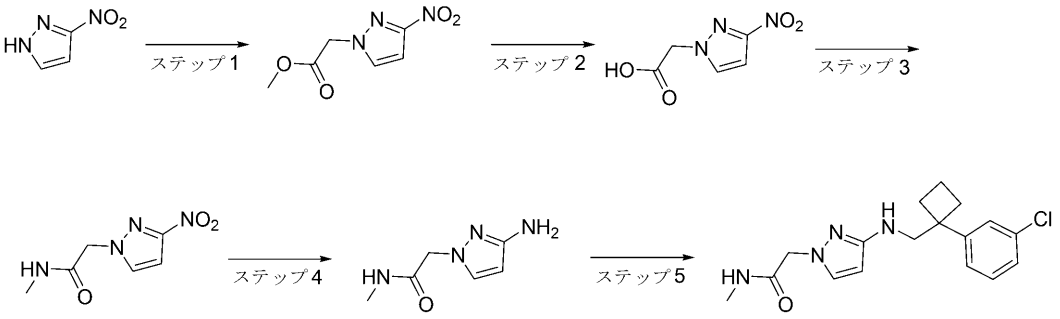
トルエン（４ｍＬ）中の２－クロロキノリン（２００ｍｇ、１．２２ｍｍｏｌ）、２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロパン－１－アミン（２６６ｍｇ、１．２２ｍｍｏｌ）、Ｐｄ$_2$（ｄｂａ）$_3$（１１１ｍｇ、１２２μｍｏｌ）、ＢＩＮＡＰ（１５１ｍｇ、２４４μｍｏｌ）及びｔ－ＢｕＯＮａ（１１７ｍｇ、１．２２ｍｍｏｌ）の混合物を８０℃で１時間撹拌した。混合物を水（２０ｍｌ）で希釈し、酢酸エチル（２０ｍｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Ｎａ$_2$ＳＯ$_4$で乾燥させ、濃縮した。残渣を分取ＴＬＣ（ＭｅＯＨ：ＤＣＭ　１：１０）によってまず精製し、次いで、分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｓｈｉｅｌｄ　ＲＰ１８　ＯＢＤ　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　ＮＨ$_4$ＨＣＯ$_3$）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：５５％Ｂから８５％Ｂで７分、次いで、８５％Ｂ；波長：２５４ｎｍ；ＲＴ（分）：７．４８）によって精製して、Ｎ－［２－（３，４－ジクロロフェニル）－２－メチルプロピル］キノリン－２－アミン（９１．３ｍｇ、２６４μｍｏｌ）を無色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　７．７８　（ｄ，　Ｊ　＝　８．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６８　（ｄ，　Ｊ　＝　２．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６１　－　７．５１　（ｍ，　２Ｈ），　７．５１　－　７．４０　（ｍ，　３Ｈ），　７．１２　（ｄｄｄ，　Ｊ　＝　８．０，　６．６，　１．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．８４　－　６．７２　（ｍ，　２Ｈ），　３．７１　（ｄ，　Ｊ　＝　５．８　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．３６　（ｓ，　６Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８５５分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３４５．００、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９４６】

実施例４３

２－（３－（（（１－（３－クロロフェニル）シクロブチル）メチル）アミノ）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド

【化７８１】



ステップ１．２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）酢酸メチルの合成

ＤＭＦ（３０．０ｍＬ）中の３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール（５．００ｇ、４４ｍｍｏｌ）の溶液に、２－ブロモ酢酸メチル（４．１８ｍＬ、４４．２ｍｍｏｌ）及びＫ$_2$ＣＯ

$_3$（１２．２ｇ、８８．４ｍｍｏｌ）を加えた。次いで、混合物を２５℃で１６時間撹拌した。混合物を水（３０．０ｍＬ）中に注ぎ、酢酸エチル（３０．０ｍＬ＊５）で抽出した。合わせた有機層をブライン（３０．０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、真空下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（SiO_2、石油エーテル／酢酸エチル　１／１）によって精製して、２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）酢酸メチル（６．２８ｇ、２８．５ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　８．０５　（ｄ，　Ｊ　＝　２．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　８．０３　－　７．９９　（ｍ，　１Ｈ），　７．１１　－　７．０５　（ｍ，　１Ｈ），　７．０４　－　６．９９　（ｍ，　１Ｈ），　５．２９　（ｓ，　２Ｈ），　３．７２　（ｓ，　３Ｈ）．

【０９４７】

ステップ２．２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）酢酸の合成

ＴＨＦ（４０．０ｍＬ）及びH_2O（８．００ｍＬ）中の２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）酢酸メチル（４．００ｇ、１８．１ｍｍｏｌ）の溶液に、$LiOH・H_2O$（３．８１ｇ、９０．８ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を６０℃で１６時間撹拌した。酢酸エチル（１０．０ｍＬ）及び水（１０．０ｍＬ）を加え、層を分離した。水相のｐＨを１Ｎ　ＨＣｌで２に調整し、混合物を酢酸エチル（１０．０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた抽出物をブライン（１０．０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させた。混合物を濾過し、真空下で濃縮して、２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）酢酸（２．４５ｇ、１４．３ｍｍｏｌ）を黄色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　１４．０４　－　１３．８５　（ｍ，　１Ｈ），　８．０３　（ｓ，　１Ｈ），　７．０７　（ｄ，　Ｊ　＝　２．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．１５　（ｓ，　２Ｈ）．

【０９４８】

ステップ３．Ｎ－メチル－２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）アセトアミドの合成

ＤＭＦ（２０．０ｍＬ）中の２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）酢酸（２．００ｇ、１１．７ｍｍｏｌ）の溶液に、メタンアミンＨＣｌ塩（１．５８ｇ、２３．３ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（５．７８ｇ、１５．１ｍｍｏｌ）及びＤＩＥＡ（１０．１ｍＬ、５８．４ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で１６時間撹拌した。合わせた混合物を水（２０．０ｍＬ）中に注ぎ、酢酸エチル（２０．０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（２０．０ｍＬ＊３）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、真空下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（石油エーテル／酢酸エチル　１／１）によって精製して、Ｎ－メチル－２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）アセトアミド（９００ｍｇ、４．８９ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　８．２１　－　８．１３　（ｍ，　１Ｈ），　７．９９　（ｄ，　Ｊ　＝　２．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．０５　（ｄ，　Ｊ　＝　２．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．９５　－　４．９３　（ｍ，　２Ｈ），　２．６４　（ｄ，　Ｊ　＝　４．４　Ｈｚ，　３Ｈ）．

【０９４９】

ステップ４．２－（３－アミノ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－Ｎ－メチルアセトアミドの合成

ＭｅＯＨ（１０．０ｍＬ）中のＮ－メチル－２－（３－ニトロ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）アセトアミド（８００ｍｇ、４．３４ｍｍｏｌ）の溶液に、Ｐｄ／Ｃ（０．１０ｇ、１０％）をN_2雰囲気下にて加えた。懸濁液を脱気し、H_2で３回パージした。混合物をH_2（１５ｐｓｉ）下にて２５℃で３時間撹拌した。混合物を濾過し、濾液を濃縮して、２－（３－アミノ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド（５４４ｍｇ、３．５３ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　７．７１　（ｂｒ　ｓ，　１Ｈ），　７．３０　（ｄ，　Ｊ　＝　２．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．４０　（ｄ，　Ｊ　＝　２．０　Ｈｚ，　１Ｈ）

，４．４２（ｓ，２Ｈ），２．５９（ｄ，Ｊ＝４．４Ｈｚ，３Ｈ）．

【０９５０】

ステップ５．２－（３－（（（１－（３－クロロフェニル）シクロブチル）メチル）アミノ）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－Ｎ－メチルアセトアミドの合成

ＭｅＯＨ（５．０ｍＬ）中の２－（３－アミノ－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド（５４０ｍｇ、３．５０ｍｍｏｌ）の溶液に、１－（３－クロロフェニル）シクロブタン－１－カルバルデヒド（６８１ｍｇ、３．５０ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２０℃で１時間撹拌した。$NaBH_3CN$（１．１０ｇ、１７ｍｍｏｌ）を０℃で加え、混合物を２０℃で１５時間撹拌した。混合物を濃縮し、残渣を分取ＨＰＬＣ（カラム：Ｗａｔｅｒｓ　Ｘｂｒｉｄｇｅ　１５０＊２５ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（０．０５％水酸化アンモニアｖ／ｖ）、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：９分かけて３０％～６０％Ｂ）によって精製して、２－（３－（（（１－（３－クロロフェニル）シクロブチル）メチル）アミノ）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド（２８１ｍｇ、８３８ｕｍｏｌ）を白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）

【０９５１】

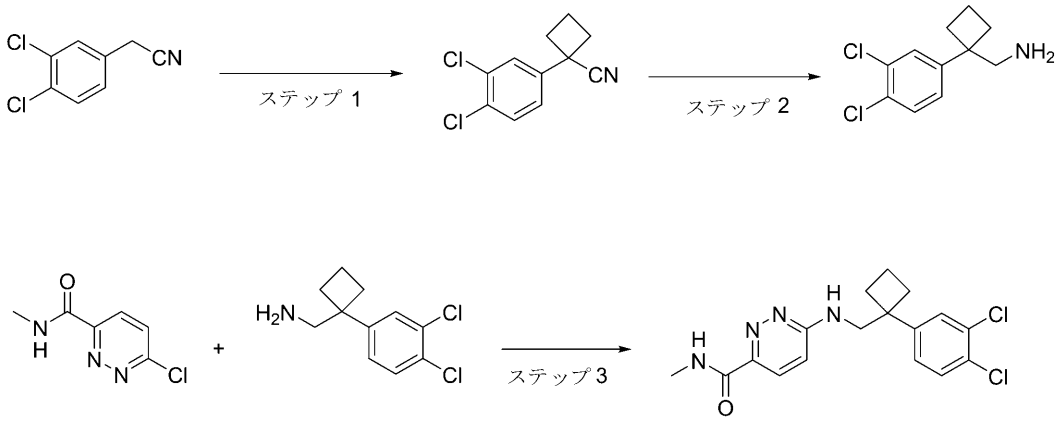
δ　７．６６（ｂｒ　ｄ，Ｊ＝４．４Ｈｚ，１Ｈ），７．３６－７．２８（ｍ，２Ｈ），７．２４－７．１７（ｍ，２Ｈ），７．１７－７．１２（ｍ，１Ｈ），５．３７（ｄ，Ｊ＝２．４Ｈｚ，１Ｈ），４．８６（ｔ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，１Ｈ），４．４２（ｓ，２Ｈ），３．３１（ｄ，Ｊ＝６．４Ｈｚ，２Ｈ），２．５８（ｄ，Ｊ＝４．８Ｈｚ，３Ｈ），２．３１－２．１４（ｍ，４Ｈ），２．１０－１．９７（ｍ，１Ｈ），１．８４－１．７１（ｍ，１Ｈ）．

【０９５２】

実施例４４

６－（（（１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブチル）メチル）アミノ）－Ｎ－メチルピリダジン－３－カルボキサミド

【化７８２】



ステップ１．１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブタン－１－カルボニトリルの合成

ＴＨＦ（１００ｍＬ）中のＮａＨ（鉱油中６０％、２６．９ｇ、６７２ｍｍｏｌ）の懸濁液に、ＴＨＦ（２００ｍＬ）中の２－（３，４－ジクロロフェニル）アセトニトリル（５０．０ｇ、２６９ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で滴下した。混合物を０℃で１時間撹拌した。次いで、１，３－ジブロモプロパン（５７．０ｇ、２８２ｍｍｏｌ）を０℃で１．５時間かけて滴下した。混合物を２５℃まで温め、２５℃で０．５時間撹拌した。混合物を飽和NH_4Cl溶液（４００ｍＬ）中に注ぎ、濾過した。濾液を酢酸エチル（２５０ｍＬ＊３）で抽出した。有機層をブライン（２５０ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（石油エーテル：酢

酸エチル　５０：１から６：１）によって精製して、１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブタン－１－カルボニトリル（２２．１ｇ、９６．０ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＣＤＣｌ$_{3}$）　δ　７．５５　（ｄ，　Ｊ　＝　２．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５２　（ｄ，　Ｊ　＝　８．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．３２　－　７．２９　（ｍ，　１Ｈ），　２．９０　－　２．８５　（ｍ，　２Ｈ），　２．６４　－　２．６２　（ｍ，　２Ｈ），　２．６１　－　２．４７　（ｍ，　１Ｈ），　２．１５　－　２．０９　（ｍ，　１Ｈ）．

【０９５３】

ステップ２．（１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブチル）メタンアミンの合成

ＴＨＦ（１００ｍＬ）中のＬｉＡｌＨ$_{4}$（４．３６ｇ、１１５ｍｍｏｌ）の懸濁液に、ＴＨＦ（５０．０ｍＬ）中の１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブタン－１－カルボニトリル（２０．０ｇ、８８．５ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で滴下した。混合物を２５℃まで温め、２５℃で１時間攪拌した。攪拌混合物を１０℃まで冷却した。水（５．００ｍＬ）、続いて、１５％ＮａＯＨ溶液（５．００ｍＬ）、水（１５．０ｍＬ）、及びＮａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$（６．０ｇ）を加えた。混合物をセライトに通して濾過した。濾液を酢酸エチル（５０．０ｍＬ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Ｎａ$_{2}$ＳＯ$_{4}$で乾燥させ、濾過し、濃縮して、（１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブチル）メタンアミン（１１．０ｇ、４６．３ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００　ＭＨｚ，　ＣＤＣｌ$_{3}$）　δ　７．２８　（ｄ，　Ｊ　＝　８．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１９　（ｄ，　Ｊ　＝　２．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．９６　－　６．９４　（ｍ，　１Ｈ），　２．９３　（ｓ，　２Ｈ），　２．３１　－　２．２６　（ｍ，　２Ｈ），　２．１６　－　２．１１　（ｍ，　２Ｈ），　２．０９　－　２．０２　（ｍ，　１Ｈ），　１．９２　－　１．８４　（ｍ，　１Ｈ）．

【０９５４】

ステップ３．６－（（（１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブチル）メチル）アミノ）－Ｎ－メチルピリダジン－３－カルボキサミドの合成

バイアルで、６－クロロ－Ｎ－メチルピリダジン－３－カルボキサミド（２５ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）及び（１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブチル）メタンアミン（３４ｍｇ、０．１５ｍｍｏｌ）をＮＭＰ（０．５ｍＬ）中に溶解した。ＤＩＥＡ（３８μＬ、０．２２ｍｍｏｌ）を加えた。バイアルを密封し、週末にわたって１００℃で加熱した。室温まで冷却した後、反応物をＡｃｃＱｐｒｅｐにより、３５～６５％の水中アセトニトリル（０．１％ギ酸）を使用して精製して、６－（（（１－（３，４－ジクロロフェニル）シクロブチル）メチル）アミノ）－Ｎ－メチルピリダジン－３－カルボキサミド（２２ｍｇ、６０μｍｏｌ）を得た。ＬＣＭＳ：　ＲＴ　１．４２６分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　３６５．２５。ＬＣＭＳ方法Ｋ。

【０９５５】

実施例４２～４４の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表９に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表９の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表９－１】

表９．バックワルド、還元的アミノ化、尿素形成、またはカップリング反応を使用して同様に合成することができる追加の例示的な化合物

I-3	I-6	I-180	I-181	I-191
I-192	I-193	I-194	I-198	I-199
I-200	I-201	I-202	I-203	I-209
I-210	I-211	I-212	I-213	I-214
I-216	I-217	I-218	I-222	I-358
I-360	I-362	I-364	I-366	I-367
I-376	I-377	I-411	I-429	I-430
I-437	I-438	I-439	I-440	I-441
I-442	I-470	I-471	I-475	I-476
I-477	I-478	I-488	I-489	I-490
I-492	I-504	I-505	I-506	I-508
I-509	I-511	I-512	I-513	I-514
I-524	I-526	I-527	I-528	I-536
I-537	I-538	I-539	I-540	I-541
I-542	I-543	I-544	I-545	I-546
I-547	I-549	I-550	I-551	I-559

【表９－２】

I-560	I-561	I-562	I-569	I-570
I-576	I-598	I-600	I-616	I-619
I-620	I-622	I-640	I-641	I-642
I-643	I-644	I-659	I-660	I-661
I-665	I-678	I-679	I-680	I-681
I-682	I-683	I-684	I-685	I-686
I-688	I-744	I-747	I-755	I-756
I-758	I-760	I-761	I-766	I-771
I-773	I-778	I-780	I-781	I-782
I-783	I-784	I-785	I-786	I-788
I-789	I-792	I-809	I-811	I-812
I-814	I-816	I-820	I-826	I-827
I-828	I-829	I-831	I-832	I-833
I-836	I-839	I-840	I-845	I-864
I-865	I-866	I-867	I-868	I-869
I-870	I-871	I-921	I-922	I-923
I-924	I-375	I-939	I-940	I-947

【表９－３】

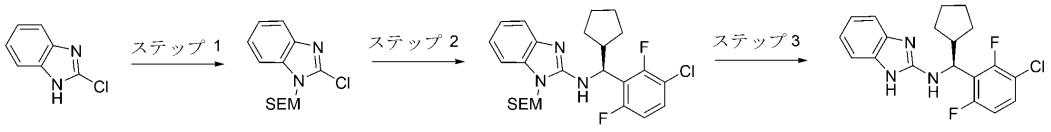
I-974	I-975	I-990	I-1007	I-1009
I-1010	I-1015	I-1020	I-1021	I-1022
I-1023	I-1024	I-1027	I-1042	I-1043
I-1044	I-1117	I-1118	I-1119	I-1202
I-1214	I-1215	I-1216	I-1220	I-1222
I-1223	I-1224	I-1225	I-1259	I-1260
I-1275	I-1276	I-1277	I-1278	I-1328
I-1329	I-1330	I-1331	I-1332	I-1333
I-1334	I-1335	I-1343	I-1363	I-1493
I-1506	I-1507	I-1508	I-1509	I-1510
I-1511	I-1512	I-1513	I-1514	I-1515
I-1516	I-1640	I-1641	I-1642	I-1685
I-2270	I-2273	I-3196	I-3198	

【０９５６】

実施例４５

（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－アミン

【化７８３】



ステップ１．２－クロロ－１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾールの合成

ＤＭＦ（５ｍＬ）中の２－クロロ－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール（８００ｍｇ、５

．２４ｍｍｏｌ）及びCs_2CO_3（５．１２ｇ、１５．７ｍｍｏｌ）の混合物に、ＳＥＭ－Ｃｌ（１．３９ｍＬ、７．８６ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を水（３０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（５０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィーによって精製して、２－クロロ－１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール（８００ｍｇ、２．８３ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９８７分、$[M+H]^+$　２８３、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９５７】

ステップ２．（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－アミンの合成

ジオキサン（３ｍＬ）中の２－クロロ－１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール（３００ｍｇ、１．０６ｍｍｏｌ）、（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（２６１ｍｇ、１．０６ｍｍｏｌ）、Cs_2CO_3（１．０４ｇ、３．１８ｍｍｏｌ）、ＢＩＮＡＰ（６６．０ｍｇ、１０６μｍｏｌ）及び$Pd_2(dba)_3$（１１０ｍｇ、１０６μｍｏｌ）の混合物をN_2雰囲気下にて１１０℃で１６時間撹拌した。反応混合物を水（２０ｍｌ）で希釈し、酢酸エチル（５０ｍｌ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１０ｍｌ）で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（CH_3CN／H_2O）によって精製して、（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－アミン（１５０ｍｇ、３０５μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．６０４分、$[M+H]^+$　４９２、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９５８】

ステップ３．（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－アミンの合成

ＴＦＡ（２ｍＬ）中の（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１－（（２－（トリメチルシリル）エトキシ）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－アミン（１５０ｍｇ、３０５μｍｏｌ）の混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応混合物を真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：４０％Ｂから７０％Ｂで８分、次いで、７０％Ｂ；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：７．８３）によって精製した。真空濃縮により、（Ｓ）－Ｎ－（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－アミン（２０ｍｇ、５５μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^1H ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ １０．３１（ｓ，１Ｈ），７．５３（ｔｄ，Ｊ＝８．６，５．４ Ｈｚ，１Ｈ），７．２０－７．０９（ｍ，３Ｈ），７．０７（ｄ，Ｊ＝８．９ Ｈｚ，１Ｈ），６．８４（ｓ，２Ｈ），５．１３（ｔ，Ｊ＝９．７ Ｈｚ，１Ｈ），２．５１（ｓ，１Ｈ），１．９６－１．８８（ｍ，１Ｈ），１．６４（ｓ，２Ｈ），１．５７（ｄｔ，Ｊ＝１５．２，８．１ Ｈｚ，２Ｈ），１．４４（ｔｄ，Ｊ＝１２．５，６．６ Ｈｚ，２Ｈ），１．１７－１．０９（ｍ，１Ｈ）．ＬＣＭＳ ＲＴ ０．８１５分、$[M+H]^+$　３６２．０５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９５９】

実施例４５の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表１０に列挙する。これらの

化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表１０の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表１０】

表１０．追加の例示的な化合物

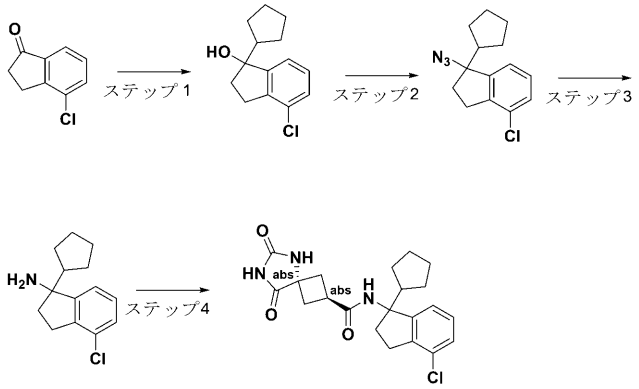
I-183	I-208	I-224	I-226	I-227
I-228	I-229	I-234	I-236	I-237
I-238	I-239	I-240	I-241	I-242
I-243	I-244	I-245	I-246	I-249
I-250	I-251	I-269	I-270	I-271
I-294	I-295	I-296	I-373	I-493
I-515	I-521	I-522	I-525	I-552
I-553	I-554	I-555	I-556	I-557
I-558	I-563	I-564	I-566	I-567
I-568	I-571	I-572	I-573	I-574
I-575	I-577	I-578	I-579	I-580
I-581	I-582	I-583	I-606	I-607
I-608	I-609	I-610	I-611	I-612
I-613	I-614	I-615	I-639	I-650
I-651	I-652	I-657	I-658	I-667
I-668	I-669	I-671	I-672	I-673
I-674	I-675	I-676	I-689	I-690
I-745	I-746	I-748	I-757	I-762
I-763	I-764	I-765	I-767	I-768
I-769	I-770	I-772	I-774	I-775
I-776	I-777	I-787	I-790	I-791
I-793	I-795	I-796	I-797	I-798
I-799	I-800	I-801	I-818	I-819
I-821	I-822	I-824	I-834	I-835
I-837	I-853	I-854	I-855	I-856
I-857	I-873	I-874	I-875	I-876
I-920	I-938	I-976	I-977	I-978
I-979	I-491	I-1651	I-1872	

【０９６０】

実施例４６

（２ｒ，４ｒ）－Ｎ－（４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド

【化７８４】



ステップ１．４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－オール

磁気撹拌子を備え、ゴムセプタムで栓をしたフレームドライ丸底フラスコに、ＴＨＦ（１．００ｍＬ）中の４－クロロ－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－オン（８３ｍｇ、０．５０ｍｍｏｌ）の溶液を入れた。この溶液を、$LaCl_3$・２ＬｉＣｌ（０．８３ｍＬ、ＴＨＦ中０．６Ｍ、０．５０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液を入れた別個のフレームドライ丸底フラスコに周囲温度で滴下した。得られた混合物を周囲温度で１時間撹拌し、次いで、撹拌しながら０℃まで冷却した。次いで、シクロペンチルマグネシウムブロミドの溶液（０．２８ｍＬ、Et_2O中２．０Ｍ、０．５５ｍｍｏｌ）を滴下し、反応混合物を０℃で約４５分間撹拌した。この後、シクロペンチルマグネシウムブロミド（０．１４ｍＬ、Et_2O中２．０Ｍ、０．２８ｍｍｏｌ）の追加分量を反応混合物に滴下し、混合物を０℃でさらに約３０分間撹拌した。次いで、飽和NH_4Cl水溶液（０．５ｍＬ）をゆっくりと滴下することにより、反応物を０℃でクエンチした。水（０．５ｍＬ）を加えて沈殿した無機塩を溶解し、混合物を激しく撹拌しながら周囲温度まで温めた。混合物を水（２０ｍＬ）でさらに希釈し、有機物をジエチルエーテル（３×１０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機物を飽和ＮａＣｌ水溶液で洗浄し、$MgSO_4$で乾燥させ、濾過し、真空濃縮して、粗生成物を得た。シリカゲル上でのフラッシュクロマトグラフィー（溶出：ＥｔＯＡｃ／ヘキサン、０：１から２０：８０）によって精製して、４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－オール（６８ｍｇ、０．２９ｍｍｏｌ）を粘稠な無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４３分、$(M-OH)^+$　２１９．１、ＬＣＭＳ方法Ｋ。^1H ＮＭＲ（４００ ＭＨｚ，$CDCl_3$）δ ７．２５ － ７．２２ （ｍ， ２Ｈ），７．２０ － ７．１５ （ｍ， １Ｈ），３．０４ （ｄｄｄ， Ｊ ＝ １６．８， ９．０， ４．５ Ｈｚ， １Ｈ），２．８４ （ｄｄｄ， Ｊ ＝ １６．５， ８．３， ６．５ Ｈｚ， １Ｈ），２．４２ － ２．３４ （ｍ， ２Ｈ），２．０６ （ｄｄｄ， Ｊ ＝ １３．５， ９．０，６．５ Ｈｚ， １Ｈ），１．８３ － １．７６ （ｍ， ２Ｈ），１．７０ － １．６３ （ｍ， １Ｈ），１．６２ － １．４９ （ｍ， ５Ｈ），１．３２ － １．２２ （ｍ， １Ｈ）．

【０９６１】

ステップ２．１－アジド－４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン

磁気撹拌子を備え、ゴム製セプタムで栓をしたフレームドライ丸底フラスコに、無水クロロホルム（０．７０ｍＬ）中の４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－オール（５８ｍｇ、０．２４ｍｍｏｌ）の溶液を入れ、撹拌しながら溶液を０℃まで冷却した。冷却した溶液に固体のアジ化ナトリウム（３２ｍｇ、０．４９ｍｍｏｌ）を少量ずつ加え、続いて、トリフルオロ酢酸（０．１２ｍＬ、１．６０ｍｍｏｌ）をゆっくりと滴下した。次いで、反応混合物を撹拌しながら３０℃まで約２時間温

めた。次いで、反応混合物を周囲温度まで冷却し、ｐＨが８～９にほぼ等しくなるまでＮＨ$_4$ＯＨの１０％水溶液で窒素下にて慎重にクエンチした。次いで、混合物を分液漏斗に注ぎ、クロロホルム（３×１０ｍＬ）で抽出した。次いで、合わせた有機物をＭｇＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、真空濃縮して、粗製１－アジド－４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデンを得た。定量的な収率が想定され、これを次のステップに直ちに使用した。

【０９６２】

ステップ３．４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－アミン

粗製アジドをＴＨＦ（２．４０ｍＬ）中に撹拌しながら溶解し、トリメチルホスフィンの溶液（０．２６ｍＬ、ＴＨＦ中１．０Ｍ、０．２６ｍｍｏｌ）を周囲温度で滴下し、続いて、水（０．２４ｍＬ）を滴下した。次いで、反応混合物を撹拌しながら３０℃まで約１８時間加熱した。次いで、反応混合物を周囲温度まで冷却し、ＥｔＯＡｃ（１０ｍＬ）で希釈した。相を分離し、有機相を飽和ＮａＨＣＯ$_3$水溶液（３×５ｍＬ）及び飽和ＮａＣｌ水溶液で洗浄した。次いで、有機物をＭｇＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、真空濃縮して、粗製４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－アミンを得た。定量的な収率が想定され、これを次のステップに直ちに使用した。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８９分、［Ｍ－ＮＨ$_2$］$^+$　２１９．２、ＬＣＭＳ方法Ｋ。

【０９６３】

ステップ４．（２ｒ，４ｒ）－Ｎ－（４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド

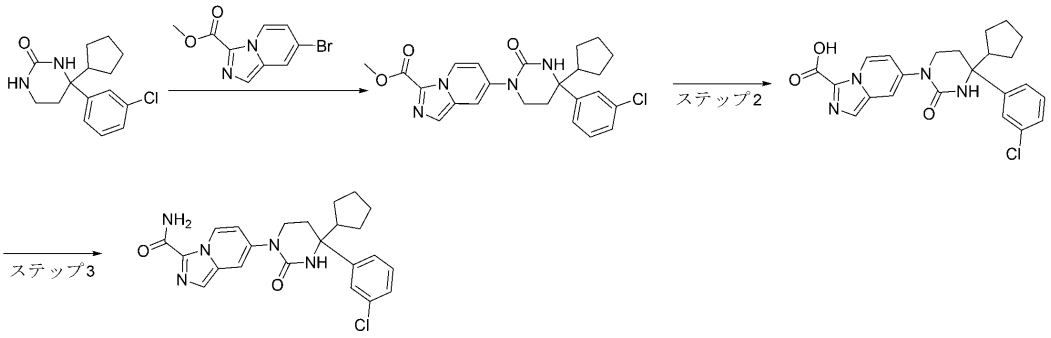
磁気撹拌子を備えた丸底フラスコで粗製アミンをＤＭＦ（２．４０ｍＬ）中に周囲温度で溶解し、撹拌しながら（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（４７ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を一度に加えた。次いで、混合物にＤＩＰＥＡ（０．１７ｍＬ、０．９８ｍｍｏｌ）及びＴ３Ｐの溶液（０．１４ｍＬ、ＥｔＯＡｃ中５０重量％、０．２４ｍｍｏｌ）を周囲温度で滴下し、反応混合物を約１時間撹拌した。この後、Ｔ３Ｐ（０．０７ｍＬ、ＥｔＯＡｃ中５０重量％、０．１２ｍｍｏｌ）の追加分量を加え、混合物を周囲温度でさらに約３０分間撹拌した。次いで、反応混合物をＤＣＭ（１０ｍＬ）で希釈し、飽和ＮａＨＣＯ$_3$水溶液（１０ｍＬ）でクエンチし、周囲温度で一晩撹拌した。次いで、相を分離し、水相をＤＣＭ（３×１０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機物を水（１０ｍｌ）及び飽和ＮａＣｌ水溶液で洗浄し、ＭｇＳＯ$_4$で乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。次いで、残渣を少量のＤＭＦ中に溶解し、１２ｇ　Ｃ１８カートリッジにローディングし、逆相クロマトグラフィー（移動相Ａ：１０ｍＭギ酸アンモニウム／水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：４０から６０％Ｂ）によって精製して、（２ｒ，４ｒ）－Ｎ－（４－クロロ－１－シクロペンチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（４ｍｇ）を明るい黄色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．２１分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４０２．３、ＬＣＭＳ方法Ｋ。^{1}ＨＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ １０．５５（ｂｒ．ｓ，１Ｈ），８．６１（ｓ，１Ｈ），７．８６（ｓ，１Ｈ），７．２４－７．１９（ｍ，１Ｈ），７．１９－７．１５（ｍ，２Ｈ），３．１１（ｐ，Ｊ＝９．１Ｈｚ，１Ｈ），２．９９（ｄｄｄ，Ｊ＝１６．１，９．６，４．８Ｈｚ，１Ｈ），２．７９（ｄｄｄ，Ｊ＝１６．５，９．３，５．７Ｈｚ，１Ｈ），２．７１－２．４３（重複するｍ，３Ｈ），２．３６（ｄｄｄ，Ｊ＝１１．６，８．８，４．６Ｈｚ，１Ｈ），２．１７－２．０６（ｍ，３Ｈ），１．８０－１．７１（ｍ，１Ｈ），１．５７－１．３７（ｍ，４Ｈ），１．３２－１．１３（ｍ，２Ｈ），１．０８－０．９８（ｍ，１Ｈ）．

【０９６４】

実施例４７

７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボキサミド

【化７８５】



ステップ１．７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボン酸メチルの合成

丸底フラスコに、４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチルテトラヒドロピリミジン－２（１Ｈ）－オン（１００ｍｇ、３５９μｍｏｌ）、７－ブロモイミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボン酸メチル（９１．５ｍｇ、３５９μｍｏｌ）、Ｐｄ－ＰＥＰＰＳＩ－ＩＰｅｎｔＣｌ（１０５ｍｇ、１０８μｍｏｌ）、Cs_2CO_3（３５１ｍｇ、１．０８ｍｍｏｌ）及び撹拌子を入れた。１，４－ジオキサン（１ｍＬ）を加え、溶液を９０℃で４時間撹拌した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％で１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボン酸メチル（３０ｍｇ、６６μｍｏｌ）を黄色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９８８分、$[M+H]^+$　４５３．２０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９６５】

ステップ２．７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボン酸の合成

丸底フラスコに、７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボン酸メチル（３０ｍｇ、６６μｍｏｌ）、ＮａＯＨ（０．３３ｍＬ、２モル、０．６６ｍｍｏｌ）及び撹拌子を入れた。ＭｅＯＨ（１ｍＬ）を加え、溶液を２５℃で１時間撹拌した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー：（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％で１０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボン酸（２５ｍｇ、５７μｍｏｌ）を黄色の非晶質固体として得、これをさらに精製することなく次のステップに使用した。

【０９６６】

ステップ３．７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボキサミドの合成

丸底フラスコに７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボン酸（２５ｍｇ、５７μｍｏｌ）、NH_4Cl（３．０ｍｇ、５７μｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（３２ｍｇ、８５μｍｏｌ）、ＮａＨＣＯ３（１４ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）及び撹

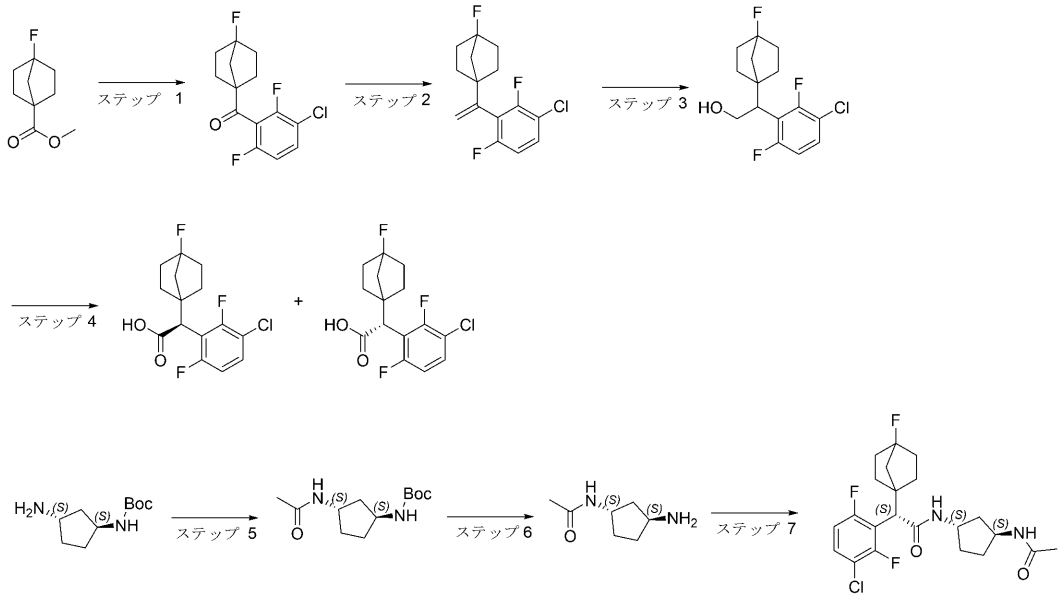
拌子を入れた。ＤＭＦ（１ｍＬ）を加え、溶液を２５℃で１時間撹拌した。得られた粗製物質をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：（Ｒ，Ｒ）ＷＨＥＬＫ－Ｏ１、４．６＊５０ｍｍ、３．５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．２％ＩＰＡｍｉｎｅ）：ＥｔＯＨ＝８０：２０；流量：１ｍＬ／分；グラジエント：０％Ｂから０％Ｂ；注入量：５ｕｌ　ｍＬ）によって精製した。凍結乾燥により、７－（４－（３－クロロフェニル）－４－シクロペンチル－２－オキソテトラヒドロピリミジン－１（２Ｈ）－イル）イミダゾ［１，５－ａ］ピリジン－３－カルボキサミド（７．８ｍｇ、１８μｍｏｌ、３１％）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．９０３分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４３８．１５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９６７】

実施例４８

（Ｓ）－Ｎ－（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アセトアミドシクロペンチル）－２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）アセトアミド

【化７８６】



ステップ１．（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタノンの合成

ｎ－ＢｕＬｉ（２．５Ｍ、６１．０ｍＬ）をＴＨＦ（１７５ｍＬ）で希釈した。ＴＨＦ（１００ｍＬ）中の１－クロロ－２，４－ジフルオロベンゼン（１８．１ｇ、１２２ｍｍｏｌ）の溶液をN_2下にて－７８℃で滴下した。－７８℃で２時間撹拌した後、ＴＨＦ（１７５ｍＬ）中の４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－カルボン酸メチル（１７．５ｇ、１０２ｍｍｏｌ）の溶液をN_2下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で４時間撹拌した。反応混合物を飽和NH_4Cl溶液（３５０ｍＬ）中に注ぎ、酢酸エチル（２００ｍＬ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブライン（２００ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮して、残渣を得た。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、石油エーテル：酢酸エチル　１：０から０：１）によって精製して、（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタノンを黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００ＭＨｚ，ＣＤＣｌ$_3$）δ　７．４３（ｄｔ，Ｊ＝５．６，８．６Ｈｚ，１Ｈ），６．９３（ｄｄｄ，Ｊ＝１．６，７．８，９．０Ｈｚ，１Ｈ），２．２９－２．１５（ｍ，２Ｈ），２．０６－１．９３（ｍ，４Ｈ），１．９２－１．７７（ｍ，４Ｈ）．

【０９６８】

ステップ２．１－（１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）ビニル）－４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタンの合成
ＴＨＦ（６６．０ｍＬ）中のPh_3PMeBr（１６．３ｇ、４５．７ｍｍｏｌ）の溶液に、ｔ－ＢｕＯＫ（１．０Ｍ、４５．７ｍＬ）を０℃で加えた。混合物を１５℃まで温め、１５℃で２時間撹拌した。次いで、ＴＨＦ（６６．０ｍＬ）中の（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）メタノン（６．６０ｇ、２２．９ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で加えた。混合物を０℃で２時間撹拌し、次いで、１５℃まで温め、１５℃で１２時間撹拌した。反応物を水（６．００ｍＬ）の添加によりクエンチし、濾過した。濾液を減圧下で濃縮して、残渣を得た。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、石油エーテル：酢酸エチル　１：０から１０：１）によって精製して、１－（１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）ビニル）－４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン（５．６０ｇ、１７．３ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　$CDCl_3$）
【０９６９】
δ　７．３１　（ｄｔ，　Ｊ　＝　５．６，　８．４　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．８７　（ｂｒ　ｄ，　Ｊ　＝　０．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．４３　（ｓ，　１Ｈ），　５．０６　（ｓ，　１Ｈ），　２．０２　－　１．８９　（ｍ，　４Ｈ），　１．８３　－　１．７４　（ｍ，　４Ｈ），　１．７０　－　１．６１　（ｍ，　２Ｈ）．
【０９７０】
ステップ３．２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）エタン－１－オールの合成
ＴＨＦ（１６５ｍＬ）中の１－（１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）ビニル）－４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン（５．５０ｇ、１９．２ｍｍｏｌ）の溶液に、BH_3－Me_2S（３．８４ｍＬ）をN_2下にて２５℃で加えた。混合物を５０℃まで加熱し、５０℃で１時間撹拌した。ＭｅＯＨ（１８．７ｍＬ）を０℃で滴下した。その後、ＮａＯＨ（２Ｍ、２８．８ｍＬ）を０℃で滴下し、次いで、H_2O_2（３０％、９．２８ｍＬ、９６．６ｍｍｏｌ）を０℃でゆっくりと加えた。混合物を０℃で１．５時間撹拌した。混合物を飽和$Na_2S_2O_3$水溶液（２００ｍＬ）中にゆっくりと注ぎ、１０分間撹拌し、酢酸エチル（２００ｍＬ＊２）で抽出した。合わせた有機相を水（２００ｍＬ）、ブライン（２００ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、石油エーテル：酢酸エチル　１：０から０：１）によって精製して、２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）エタン－１－オール（４．８０ｇ、１５．８ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ）　δ　７．５２　（ｄｔ，　Ｊ　＝　５．６，　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１９　－　７．０５　（ｍ，　１Ｈ），　４．７２　－　４．６３　（ｍ，　１Ｈ），　３．９３　－　３．７７　（ｍ，　２Ｈ），　３．４３　－　３．３５　（ｍ，　１Ｈ），　１．８８　－　１．５７　（ｍ，　７Ｈ），　１．５２　－　１．２９　（ｍ，　３Ｈ）．
【０９７１】
ステップ４．（Ｒ）－２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）酢酸及び（Ｓ）－２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）酢酸の合成
アセトニトリル（７６．０ｍＬ）中の２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）エタン－１－オール（４．８０ｇ、１５．８ｍｍｏｌ）の溶液に、H_2O（１４．０ｍＬ）中の$NaClO_2$（１１．４ｇ、１２６ｍｍｏｌ）の溶液を０℃で加えた。次いで、ＴＥＭＰＯ（２９７ｍｇ、１．８９ｍｍｏｌ）、水中のNa_2HPO_4（０．６７Ｍ、２３．５ｍＬ）及びNaH_2PO_4（０．６７Ｍ、２３．５ｍＬ）の溶液、及びH_2O（１４．０ｍＬ）中のＮａＣｌＯ（２．３５ｇ、１．８９ｍｍｏｌ、１．９４ｍＬ）の溶液を０℃で加えた。混合

物を１５℃まで温め、１５℃で１２時間撹拌した。反応混合物を０℃まで冷却した。水（２００ｍＬ）を加え、続いて、Na_2SO_3（２８．４ｇ）を０℃で加えた。混合物を１５℃で３０分間撹拌した。ｐＨをH_3PO_4で１～２に調整し、溶液を酢酸エチル（２００ｍＬ＊２）で抽出した。合わせた有機層をブライン（２００ｍＬ）で洗浄し、Na_2SO_4で乾燥させ、濾過し、減圧下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（シリカゲル、石油エーテル：酢酸エチル　１：０から０：１）によって精製して、２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）酢酸を白色の固体として得た。キラルＳＦＣ（カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＡＳ　２５０ｍｍ＊３０ｍｍ、１０μｍ）；移動相：［CO_2－^{i}ＰｒＯＨ］；グラジエント：１５％^{i}ＰｒＯＨアイソクラティック）によってさらに精製して、（Ｒ）－２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）酢酸及び（Ｓ）－２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）酢酸を得た。

【０９７２】

異性体１：２．００ｇ、６．２８ｍｍｏｌを白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００　ＭＨｚ，　ＣＤＣｌ$_3$）　δ　７．３７　（ｄｔ，　Ｊ　＝　５．６，　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．９３　（ｄｔ，　Ｊ　＝　１．６，　９．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２１　（ｓ，　１Ｈ），　２．０７　－　１．９１　（ｍ，　３Ｈ），　１．９１　－　１．８０　（ｍ，　３Ｈ），　１．８０　－　１．６８　（ｍ，　２Ｈ），　１．６７　－　１．５６　（ｍ，　２Ｈ）．

【０９７３】

異性体２：２．０１ｇ、６．２８ｍｍｏｌを白色の固体として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ：（４００　ＭＨｚ，　ＣＤＣｌ$_3$）　δ　７．３７　（ｄｔ，　Ｊ　＝　５．６，　８．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．９３　（ｄｔ，　Ｊ　＝　１．６，　９．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．２０　（ｓ，　１Ｈ），　２．０７　－　１．９３　（ｍ，　３Ｈ），　１．９２　－　１．８１　（ｍ，　３Ｈ），　１．８１　－　１．７０　（ｍ，　２Ｈ），　１．６８　－　１．５７　（ｍ，　２Ｈ）．

【０９７４】

ステップ５．（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アセトアミドシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成

ＤＣＭ（８ｍＬ）中の（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アミノシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（５００ｍｇ、２．５０ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（１．０４ｍＬ、７．４９ｍｍｏｌ）の混合物に、Ac_2O（２８３μＬ、３．００ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で滴下した。混合物を室温で２時間撹拌した。混合物を濃縮した。得られた粗製物質を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％Ｂで２０分；検出器：ＵＶ２００ｎｍ）によって精製して、（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アセトアミドシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（３００ｍｇ、１．２４ｍｍｏｌ）をオフホワイト色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７３８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　２４３．１５、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９７５】

ステップ６．Ｎ－（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アミノシクロペンチル）アセトアミドの合成

ＤＣＭ：ＴＦＡ（２：１、１ｍＬ）中の（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アセトアミドシクロペンチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１２０ｍｇ、４９５μｍｏｌ）の混合物を室温で２時間撹拌した。混合物を真空濃縮して、Ｎ－（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アミノシクロペンチル）アセトアミド（６０ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌを無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．１５８分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　１４２．００、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９７６】

ステップ７．（Ｓ）－Ｎ－（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アセトアミドシクロペンチル）－２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２

．１］ヘプタン－１－イル）アセトアミドの合成
ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（Ｓ）－２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）酢酸（２５ｍｇ、７８μｍｏｌ）、Ｎ－（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アミノシクロペンチル）アセトアミド（１３ｍｇ、９４μｍｏｌ）及び$NaHCO_3$（３３ｍｇ、０．３９ｍｍｏｌ）の混合物に、ＨＡＴＵ（６０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を２５℃で６時間撹拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（２０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ Ｐｒｅｐ ＯＢＤ Ｃ１８ Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ NH_4HCO_3）＋０．０５％NH_4OH、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ ｍＬ／分；グラジエント：３１％Ｂから５８％Ｂで７分；波長：２５４／２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：７．６２）によって精製して、（Ｓ）－Ｎ－（（１Ｓ，３Ｓ）－３－アセトアミドシクロペンチル）－２－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２－（４－フルオロビシクロ［２．２．１］ヘプタン－１－イル）アセトアミド（３．６ｍｇ、８．１μｍｏｌ）をオフホワイト色の非晶質固体として得た。^{1}ＨＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ７．８３ （ｓ， １Ｈ）， ７．６９ （ｄ， Ｊ ＝ ７．３ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．５８ （ｔｄ， Ｊ ＝ ８．７， ５．５ Ｈｚ， １Ｈ）， ７．１５ （ｔｄ， Ｊ ＝ ９．３， １．６ Ｈｚ， １Ｈ）， ４．１３ （ｐ， Ｊ ＝ ７．１ Ｈｚ， １Ｈ）， ３．９７ （ｐ， Ｊ ＝ ７．０ Ｈｚ， １Ｈ）， ３．８６ （ｓ， １Ｈ）， １．９４ － １．７６ （ｍ， ５Ｈ）， １．７０ （ｄ， Ｊ ＝ ２８．３ Ｈｚ， ９Ｈ）， １．６２ － １．３８ （ｍ， ３Ｈ）， １．３８ － １．１４ （ｍ， ２Ｈ）． ＬＣＭＳ ＲＴ １．００８分、$[M+H]^+$ ４４３．２５、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０９７７】
実施例４８の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表１１に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表１１の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

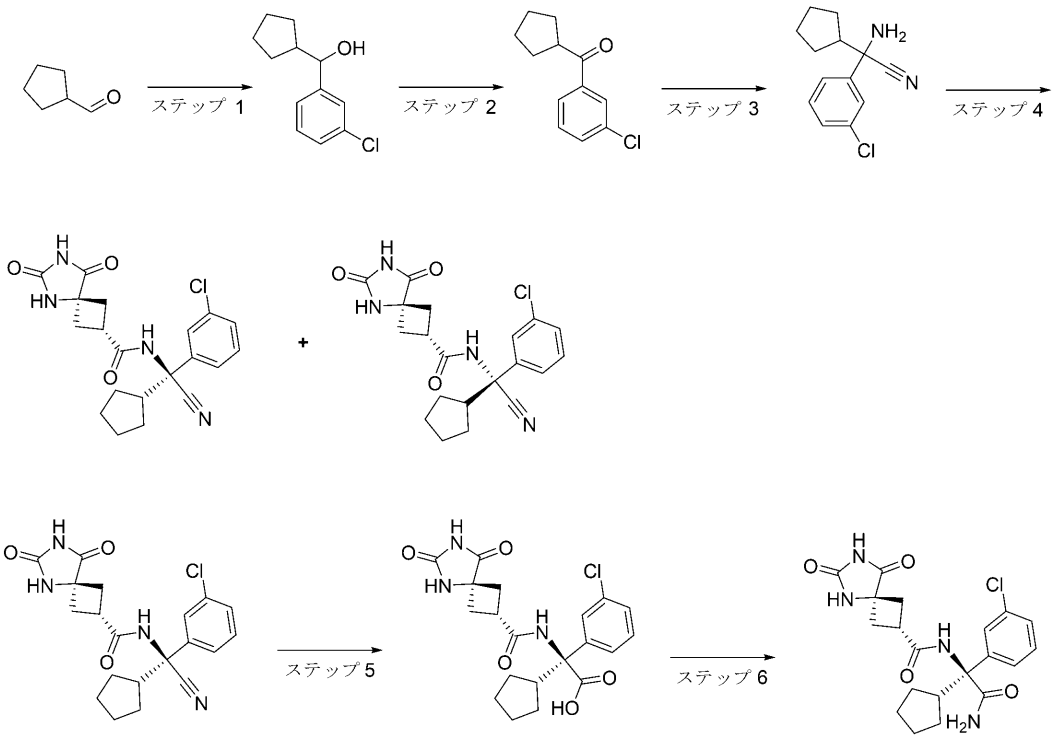
【表１１】

表１１．追加の例示的な化合物

I-272	I-273	I-297	I-298	I-3720
I-3722				

【０９７８】
実施例４９
（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－２－アミノ－１－（３－クロロフェニル）－１－シクロペンチル－２－オキソエチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド

【化７８７】



ステップ１．（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタノールの合成

ＴＨＦ（３０ｍＬ）中のシクロペンタンカルバルデヒド（３．９２ｇ、０．０４０ｍｏｌ）の混合物に、（３－クロロフェニル）マグネシウムブロミド（ＴＨＦ中１Ｍ、４０ｍｌ、０．０４０ｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて－７８℃で滴下した。混合物を－７８℃で２時間撹拌した。反応物を飽和NH_4Cl（水溶液）でクエンチし、水相を酢酸エチル（１００ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（CH_3CN／水）によって精製して、（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタノール（２．７４ｇ、０．０１３ｍｏｌ、３０％）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．００３分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$観察されず、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９７９】

ステップ２．（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタノンの合成

ＤＣＭ（１０ｍＬ）中の（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタノール（１．０５ｇ、５．０ｍｍｏｌ）及びモレキュラーシーブ４Å（５．０ｇ）の混合物に、ＰＣＣ（１．２９ｇ、６．０ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて０℃で少しずつ加えた。混合物を２５℃で２時間撹拌した。反応混合物をセライトに通して濾過し、パッドをＤＣＭで洗浄し、濾液を真空濃縮して、（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタノン（１．２２ｇ、５．８５ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　１７　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　δ　７．９３　（ｄｔ，　Ｊ　＝　６．０，　１．６　Ｈｚ，２Ｈ），　７．７６－７．６５　（ｍ，　１Ｈ），　７．５６　（ｔ，　Ｊ　＝　８．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．８３　（ｔｔ，　Ｊ　＝　８．８，　６．８　Ｈｚ，　１Ｈ），　１．８８　（ｄｄｔ，　Ｊ　＝　１２．７，　８．８，　６．４　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．７８－１．６６　（ｍ，　２Ｈ），　１．７０－１．５４　（ｍ，　４Ｈ）．

【０９８０】

ステップ３．２－アミノ－２－（３－クロロフェニル）－２－シクロペンチルアセトニトリルの合成

（３－クロロフェニル）（シクロペンチル）メタノン（１．０４ｇ、５．０ｍｍｏｌ）、ＴＭＳＣＮ（１．９８ｇ、０．０２ｍｏｌ）及びNH_3（１０ｍＬ、ＭｅＯＨ中７Ｎ）

の混合物を９０℃で１６時間攪拌した。反応混合物を真空濃縮した。残渣をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（CH_3CN／H_2O）によって精製して、２－アミノ－２－（３－クロロフェニル）－２－シクロペンチルアセトニトリル（６００ｍｇ、２．５６ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８７０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　２３５、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９８１】

ステップ４．（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シアノ）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド及び（２ｒ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シアノ）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

ＤＭＦ（５ｍＬ）中の２－アミノ－２－（３－クロロフェニル）－２－シクロペンチルアセトニトリル（５００ｍｇ、２．１３ｍｍｏｌ）、（２ｒ，４ｒ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボン酸（３９２ｍｇ、２．１３ｍｍｏｌ）、ＴＥＡ（８９１μＬ、６．３９ｍｍｏｌ）及びT_3P（１．０２ｇ、３．２０ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を水（３０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（５０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィーによって精製して、（２ｒ，４ｒ）－Ｎ－（（３－クロロフェニル）（シアノ）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドを白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８５５分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４０１、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０９８２】

生成物をキラル分取ＨＰＬＣ（カラム：ＤＺ－ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＨ－３、４．６＊５０ｍｍ、３．０μｍ；移動相Ａ：ヘキサン；移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：１ｍＬ／分；グラジエント：２０％Ｂアイソクラティック；注入量：５ｍＬ）によってさらに精製して、（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シアノ）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド　及び（２ｒ，４Ｒ）－Ｎ－（（Ｒ）－（３－クロロフェニル）（シアノ）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの両方をオフホワイト色の非晶質固体として得た。

【０９８３】

異性体１：１０ｍｇ。^1H ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ １０．５９（ｓ，１Ｈ），８．９９（ｓ，１Ｈ），８．６４（ｓ，１Ｈ），７．５０－７．３８（ｍ，２Ｈ），７．３５（ｄｔ，Ｊ＝４．６，１．９Ｈｚ，２Ｈ），３．３４（ｓ，１Ｈ），２．６８（ｔ，Ｊ＝１０．９Ｈｚ，１Ｈ），２．４４（ｔ，Ｊ＝８．６Ｈｚ，１Ｈ），２．２２（ｄｄ，Ｊ＝１２．８，９．０Ｈｚ，２Ｈ），２．０５（ｄｄ，Ｊ＝１３．４，８．０Ｈｚ，１Ｈ），１．６２－１．４８（ｍ，４Ｈ），１．４３－１．１３（ｍ，４Ｈ）．ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８３８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４０１．１０、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９８４】

異性体２：５ｍｇ。ＬＣＭＳ　１．３１８分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　４０１．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。^1H ＮＭＲ（４００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－d_6）δ １０．６０（ｓ，１Ｈ），８０９８（ｓ，１Ｈ），８．６４（ｓ，１Ｈ），７．３４－７．４７（ｍ，４Ｈ），３．２４（ｔ，Ｊ＝８．８Ｈｚ，１Ｈ），２．６６－２．６９（ｍ，１Ｈ），２．４０－２．５８（ｍ，２Ｈ），２．１９－２．３０（ｍ，２Ｈ），２．０１－２．０８（ｍ，１Ｈ），１．４０－１．７２（ｍ，５Ｈ），１．１０－１．２９（ｍ，２Ｈ）．

【０９８５】

ステップ５．（Ｓ）－２－（３－クロロフェニル）－２－シクロペンチル－２－（（２ｒ，４Ｓ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド）酢酸の合成

（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－（３－クロロフェニル）（シアノ）（シクロペンチル）メチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（８５ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）及びＨＣｌ（５ｍＬ，１２Ｎ）の混合物を４０℃で１時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物をジクロロメタン（２０ｍＬ）で３回抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮して、（Ｓ）－２－（３－クロロフェニル）－２－シクロペンチル－２－（（２ｒ，４Ｓ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド）酢酸（７０ｍｇ、０．１７ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．８２０分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４２０．０、ＬＣＭＳ方法Ｄ。

【０９８６】

ステップ６．（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－２－アミノ－１－（３－クロロフェニル）－１－シクロペンチル－２－オキソエチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミドの合成

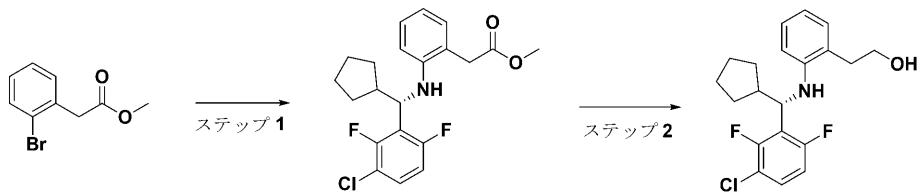
ＤＭＦ（２ｍＬ）中の（Ｓ）－２－（３－クロロフェニル）－２－シクロペンチル－２－（（２ｒ，４Ｓ）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド）酢酸（７５ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）、ＤＩＥＡ（９３μＬ、０．５４ｍｍｏｌ）、ＨＡＴＵ（０．１０ｇ、０．２７ｍｍｏｌ）及びNH_4Cl（１０ｍｇ、０．２０ｍｍｏｌ）の混合物を室温で１時間攪拌した。反応混合物を水（１０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（１０ｍＬ）で３回で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。得られた粗製物質をＣ１８フラッシュクロマトグラフィー（CH_3CN／H_2O）によって精製して、（２ｒ，４Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－２－アミノ－１－（３－クロロフェニル）－１－シクロペンチル－２－オキソエチル）－６，８－ジオキソ－５，７－ジアザスピロ［３．４］オクタン－２－カルボキサミド（５０ｍｇ、０．１２ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－d_6）　１０．５９　（ｓ，　１Ｈ），　８．５８　（ｓ，　１Ｈ），　７．９５　（ｓ，　１Ｈ），　７．５４　（ｓ，　１Ｈ），　７．３７　（ｓ，　１Ｈ），　７．２８　（ｄ，　Ｊ　＝　１３．４　Ｈｚ，　２Ｈ），　７．１８　（ｓ，　１Ｈ），　７．１０　（ｓ，　１Ｈ），　２．７２　（ｓ，　２Ｈ），　２．６２　（ｓ，　１Ｈ），　２．２８　（ｄ，　Ｊ　＝　１２．５　Ｈｚ，　２Ｈ），　１．５８　（ｓ，　１Ｈ），　１．４２　（ｓ，　８Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７１５分、［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$　４１９、ＬＣＭＳ方法Ｃ。

【０９８７】

実施例５０

（Ｓ）－２－（２－（（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）アミノ）フェニル）エタン－１－オール

【化７８８】



ステップ１．（Ｓ）－２－（２－（（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）アミノ）フェニル）酢酸メチルの合成

トルエン（１ｍＬ）中の２－（２－ブロモフェニル）酢酸メチル（４００ｍｇ、１．７５ｍｍｏｌ）、（Ｓ）－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メタンアミン（４２９ｍｇ、１．７５ｍｍｏｌ）及びCs_2cO_3（１．７０ｇ、５．

２４ｍｍｏｌ）の混合物に、Ｐｄ－ＰＥＰＰＳＩ－ＩＨｅｐｔ－Ｃｌ（ＣＡＳ：１８１４９３６－５４－３）（１７０ｍｇ、１７５μｍｏｌ）をＮ$_2$雰囲気下にて加えた。混合物を１００℃で１６時間撹拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を水（５０ｍＬ）で希釈し、水相を酢酸エチル（５０ｍＬ＊３）で抽出した。合わせた有機層をブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、濾過し、真空濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８シリカゲル；移動相Ａ：水、移動相Ｂ：アセトニトリル；グラジエント：０％から１００％で２０分；検出器：ＵＶ２２０ｎｍ）によって精製して、（Ｓ）－２－（２－（（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）アミノ）フェニル）酢酸メチル（３８０ｍｇ、９６５μｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．５３０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３９４．０５、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９８８】

ステップ２．（Ｓ）－２－（２－（（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）アミノ）フェニル）エタン－１－オールの合成

ＴＨＦ（１ｍＬ）中の（Ｓ）－２－（２－（（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）アミノ）フェニル）酢酸メチル（１００ｍｇ、２５４μｍｏｌ）の混合物に、ＬｉＡｌＨ$_4$（１９ｍｇ、５０８μｍｏｌ）を０℃で少しずつ加えた。混合物を２５℃で１時間撹拌した。反応物をＨ$_2$Ｏ（１９μｌ）、ＮａＯＨ（４Ｎ、３８μｌ）、Ｈ$_2$Ｏ（１９μｌ）でクエンチした。混合物をセライトパッドに通して濾過し、パッドを酢酸エチルで洗浄し、合わせた濾液を真空濃縮した。得られた粗製物質を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　Ｐｈｅｎｙｌ　ＯＢＤ　Ｃｏｌｕｍｎ、１９＊２５０ｍｍ、５μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　ＮＨ$_4$ＨＣＯ$_3$）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：２５ｍＬ／分；グラジエント：５５％Ｂから７５％Ｂで１０分；波長：２２０ｎｍ；ＲＴ１（分）：９．７７）によって精製して、（Ｓ）－２－（２－（（（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）（シクロペンチル）メチル）アミノ）フェニル）エタン－１－オール（５ｍｇ、０．０１ｍｍｏｌ）を無色の油状物として得た。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（４００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　７．５２　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．８，　５．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１４　（ｔｄ，　Ｊ　＝　９．５，　１．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．９７　－　６．９１　（ｍ，　２Ｈ），　６．５０　（ｔｄ，　Ｊ　＝　７．４，　１．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．４１　（ｄ，　Ｊ　＝　７．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　５．３４　（ｄ，　Ｊ　＝　８．７　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．８５　（ｔ，　Ｊ　＝　５．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．４９　（ｔ，　Ｊ　＝　９．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．５９　（ｄｔ，　Ｊ　＝　７．１，　５．６　Ｈｚ，　２Ｈ），　２．７０　－　２．５５　（ｍ，　３Ｈ），　２．１３　－　２．０３　（ｍ，　１Ｈ），　１．７１　－　１．３４　（ｍ，　６Ｈ），　１．１１　（ｄｑ，　Ｊ　＝　１６．２，　８．２，　６．８　Ｈｚ，　１Ｈ）．　ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．３８３分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３６６．１０、ＬＣＭＳ方法Ｂ。

【０９８９】

実施例５０の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表１２に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表１２の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表１２】

表１２：他の例示的な化合物

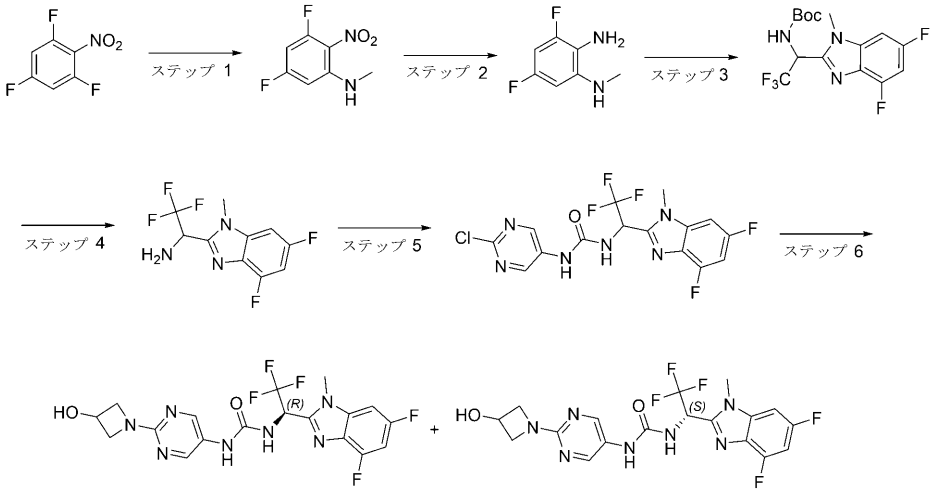
I-1790	I-1817	I-1839	I-1844	I-1853
I-1969				

【０９９０】

実施例５１

（Ｒ）－１－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－３－（２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）ウレア及び（Ｓ）－１－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－３－（２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）ウレア

【化７８９】



ステップ１．３，５－ジフルオロ－Ｎ－メチル－２－ニトロアニリンの合成

ＴＨＦ（１ｍＬ）中の１，３，５－トリフルオロ－２－ニトロベンゼン（５０ｍｇ、０．２８ｍｍｏｌ）及びメタンアミン（１３ｍｇ、０．４２ｍｍｏｌ）の撹拌混合物に、ＴＥＡ（８６ｍｇ、０．８５ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を窒素下にて２５℃で１６時間撹拌した。混合物を濾過し、濾過ケーキをＥｔＯＡｃ（３×５０ｍＬ）で洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、石油エーテル／ＥｔＯＡｃ（１０：１）で溶出して、３，５－ジフルオロ－Ｎ－メチル－２－ニトロアニリン（３０ｍｇ、０．１６ｍｍｏｌ）を黄色の油状物として得た。^{1}Ｈ ＮＭＲ （３００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ７．７３ （ｓ， １Ｈ）， ６．７０ － ６．４９ （ｍ， ２Ｈ）， ２．８６ （ｄ，Ｊ ＝ ４．９ Ｈｚ， ３Ｈ）．

【０９９１】

ステップ２．３，５－ジフルオロ－Ｎ１－メチルベンゼン－１，２－ジアミンの合成

ＭｅＯＨ（１ｍＬ）中の３，５－ジフルオロ－Ｎ－メチル－２－ニトロアニリン（２００ｍｇ、１．０６ｍｍｏｌ）及びＺｎ粉末（６９５ｍｇ、１０．６ｍｍｏｌ）の撹拌混合物に、飽和NH_4Cl溶液（１ｍＬ）を窒素雰囲気下にて室温で加えた。得られた混合物を窒素下にて５０℃で３時間撹拌した。室温まで冷却した後、混合物を濾過し、濾過ケーキをＥｔＯＨ（３×５０ｍＬ）で洗浄した。濾液を減圧下で濃縮した。残渣を水（１００ｍＬ）で希釈し、ＤＣＭ（２×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層を水（１×１００ｍＬ）及びブライン（１×１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮して、３，５－ジフルオロ－Ｎ１－メチルベンゼン－１，２－ジアミン（１２０ｍｇ、７５９μｍｏｌ）を黒色の固体として得た。ＬＣＭＳ ＲＴ １．０８７分、［Ｍ－Ｈ］$^{-}$１５７．００、ＬＣＭＳ方法Ｅ。^{1}Ｈ ＮＭＲ （４００ ＭＨｚ， ＤＭＳＯ－ｄ６） δ ６．２７ （ｄｄｄ， Ｊ ＝ １０．９， ９．１， ２．８ Ｈｚ， １Ｈ）， ６．０８ （ｄｄｄ， Ｊ ＝ １１．６， ２．８， １．６ Ｈｚ， １Ｈ）， ５．３２ （ｓ， １Ｈ）， ４．１９ （ｓ， ２Ｈ）， ２．７２ （ｄ， Ｊ ＝ ４．９ Ｈｚ， ３Ｈ）．

【０９９２】

ステップ３．（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾ

ール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルの合成
ＤＭＦ（１ｍＬ）中の３，５－ジフルオロ－Ｎ１－メチルベンゼン－１，２－ジアミン（２００ｍｇ、１．２６ｍｍｏｌ）及び２－（（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）アミノ）－３，３，３－トリフルオロプロパン酸（３０８ｍｇ、１．２６ｍｍｏｌ）の撹拌混合物に、ＨＡＴＵ（７３６ｍｇ、１．３９ｍｍｏｌ）及びＴＥＡ（６４７ｍｇ、２．５３ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で加えた。得られた混合物を窒素下にて６０℃で一晩撹拌した。室温まで冷却した後、水を加え、混合物をＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（１×１００ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、石油エーテル／ＥｔＯＡｃ（１０：１）で溶出して、（３－（（２，４－ジフルオロ－６－（メチルアミノ）フェニル）アミノ）－１，１，１－トリフルオロ－３－オキソプロパン－２－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１５０ｍｇ）を黄色の固体として得た。

【０９９３】

ＨＯＡｃ（２ｍＬ）中の（３－（（２，４－ジフルオロ－６－（メチルアミノ）フェニル）アミノ）－１，１，１－トリフルオロ－３－オキソプロパン－２－イル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１４０ｍｇ）の溶液を窒素雰囲気下にて８０℃で３時間撹拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮して、（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１５０ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）を黄色の固体として得、これをさらに精製することなく次のステップに使用した。

【０９９４】

ステップ４．１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－アミンの合成
ＤＣＭ（１ｍＬ）中の（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチル（１２６ｍｇ、３４５μｍｏｌ）の撹拌混合物に、１，４－ジオキサン中ＨＣｌ（２ｍＬ、１Ｍ、２ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を窒素下にて２５℃で２時間撹拌した。混合物を減圧下で濃縮して、１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－アミン（１４０ｍｇ、５２８μｍｏｌ）を黄色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０２７分、$[M+H]^+$　２６５．９５、ＬＣＭＳ方法Ｅ。

【０９９５】

ステップ５．１－（２－クロロピリミジン－５－イル）－３－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）ウレア
ピリジン（２ｍＬ）中の１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－アミン（１５５ｍｇ、５８４μｍｏｌ）の撹拌混合物に、（２－クロロピリミジン－５－イル）カルバミン酸フェニル（１４６ｍｇ、５８４μｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を窒素下にて８０℃で１６時間撹拌した。得られた混合物をＤＣＭ（２×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（３×５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、石油エーテル／ＥｔＯＡｃ（１０：１）で溶出して、１－（２－クロロピリミジン－５－イル）－３－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）ウレア（８０ｍｇ、０．１９ｍｍｏｌ）を黄色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１４２分、$[M+H]^+$　４２１．０５、ＬＣＭＳ方法Ｅ。^1H ＮＭＲ（３００ ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ ９．３５（ｓ，１Ｈ），８．８２（ｄ，Ｊ＝６．４

Ｈｚ，２Ｈ），８．１０（ｄ，Ｊ＝９．０Ｈｚ，１Ｈ），７．６５－７．４５（ｍ，１Ｈ），７．２７－７．１１（ｍ，１Ｈ），６．２８（ｐ，Ｊ＝７．１Ｈｚ，１Ｈ），３．９１（ｓ，３Ｈ）．

【０９９６】

ステップ６．（Ｒ）－１－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－３－（２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）ウレア及び（Ｓ）－１－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－３－（２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）ウレアの合成

ＮＭＰ（３ｍＬ）中の１－（２－クロロピリミジン－５－イル）－３－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）ウレア（８５ｍｇ、０．２０ｍｍｏｌ）及びＤＩＥＡ（０．１１ｍＬ、０．６１ｍｍｏｌ）の撹拌混合物に、アゼチジン－３－オール（７４ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて２５℃で加えた。得られた混合物を窒素下にて８０℃で１６時間撹拌した。生成物を分取ＨＰＬＣ（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、１０μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3＋０．０５％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：２４％Ｂから３４％Ｂで８分；波長：２５４／２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：９．６３）によって精製して、１－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－３－（２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）ウレア（５０ｍｇ、０．１１ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１３２分、$[M+H]^+$　４５８．１０、ＬＣＭＳ方法Ｆ。

【０９９７】

１－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－３－（２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）ウレア（５０ｍｇ）を分取キラルＨＰＬＣ（カラム：ＣＨＩＲＡＬ　ＡＲＴ　Ｃｅｌｌｕｌｏｓｅ－ＳＺ、２．０＊２５ｃｍ、５μｍ；移動相Ａ：ヘキサン（０．５％　２Ｍ　NH_3／ＭｅＯＨ）、移動相Ｂ：ＥｔＯＨ；流量：２０ｍＬ／分；グラジエント：５０％Ｂアイソクラティック；波長：１９６／２００ｎｍ；ＲＴ１（分）：４．５；ＲＴ２（分）：６．６；試料溶媒：ＭｅＯＨ：ＤＣＭ　１：２；注入量：０．５ｍＬ）によってさらに精製して、（Ｒ）－１－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－３－（２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）ウレア及び（Ｓ）－１－（１－（４，６－ジフルオロ－１－メチル－１Ｈ－ベンゾ［ｄ］イミダゾール－２－イル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－３－（２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）ウレアの両方を白色の固体として得た。

【０９９８】

異性体１：７ｍｇ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１６７分、$[M+H]^+$　４５８．１５、ＬＣＭＳ方法Ｆ。^1H ＮＭＲ（３００ＭＨｚ，ＤＭＳＯ－ｄ６）δ８．５８（ｓ，１Ｈ），８．３７（ｓ，２Ｈ），７．７４（ｄ，Ｊ＝９．１Ｈｚ，１Ｈ），７．５０（ｄｄ，Ｊ＝８．９，２．３Ｈｚ，１Ｈ），７．１９（ｔｄ，Ｊ＝１０．６，２．２Ｈｚ，１Ｈ），６．２８－６．１８（ｍ，１Ｈ），５．６５（ｄ，Ｊ＝６．５Ｈｚ，１Ｈ），４．５９－４．４９（ｍ，１Ｈ），４．１８（ｄｄ，Ｊ＝９．１，６．６Ｈｚ，２Ｈ），３．９０（ｓ，３Ｈ），３．８０－３．７１（ｍ，２Ｈ）．

【０９９９】

異性体２：５ｍｇ、ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．１８０分、$[M+H]^+$　４５８．１０、Ｌ

ＣＭＳ方法Ｆ。^{1}Ｈ　ＮＭＲ　（３００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．５８　（ｓ，　１Ｈ），　８．３７　（ｓ，　２Ｈ），　７．７４　（ｄ，　Ｊ　＝　９．１　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．５０　（ｄｄ，　Ｊ　＝　８．７，　２．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．１９　（ｔｄ，　Ｊ　＝　１０．６，　２．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．２７　－　６．１５　（ｍ，　１Ｈ），　５．６５　（ｄ，　Ｊ　＝　６．５　Ｈｚ，　１Ｈ），　４．６０　－　４．４５　（ｍ，　１Ｈ），　４．１８　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．１，　６．６　Ｈｚ，　２Ｈ），　３．９０　（ｓ，　３Ｈ），　３．７３　（ｄｄ，　Ｊ　＝　９．１，　４．６　Ｈｚ，　２Ｈ）．

【１０００】

実施例５１の方法に従って調製した追加の化合物を以下の表１３に列挙する。これらの化合物について該当する^{1}Ｈ　ＮＭＲ及び質量分析法の特性評価を表１に示す。以下の表１３の特定の化合物は、他の化合物とともに調製され、その調製については実施例においてさらに後述する。

【表１３】

表１３．追加の例示的な化合物

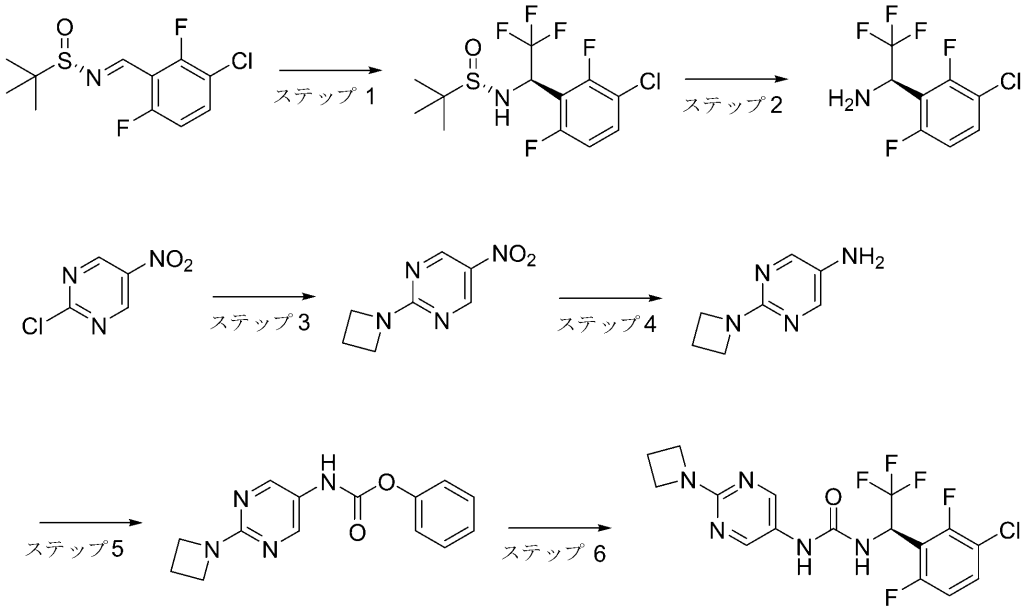
I-3676

【１００１】

実施例５２

（Ｒ）－１－（２－（アゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）－３－（１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエチル）ウレア

【化７９０】



ステップ１．（Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミドの合成

ＴＨＦ（１５ｍＬ）中の（Ｓ，Ｅ）－Ｎ－（３－クロロ－２，６－ジフルオロベンジリデン）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（１．９６ｇ、７ｍｍｏｌ）及びテトラブチルアンモニウムジフルオロトリフェニルシリケート（４．８６ｇ、９ｍｍｏｌ）の溶液を窒素雰囲気下にて－６０℃で１時間撹拌した。トリフルオロメチルトリメチルシラン（１．１４ｇ、８ｍｍｏｌ）を－６０℃で加えた。得られた混合物を－６０℃で１時間撹拌した。室温まで温めた後、水を加え、溶液をＥｔＯＡｃ（３×１００ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（３×５０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥さ

せた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。残渣を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：Ｃ１８ゲル；移動相、アセトニトリル／水（０．１％NH_4OH）、グラジエント：１０％から９０％のアセトニトリルで４０分；検出器：ＵＶ２５４ｎｍ）によって精製して、（Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（６００ｍｇ、１．６ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．３９０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　３５０、ＬＣＭＳ方法Ｅ。

【１００２】

ステップ２．（Ｒ）－１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－アミンの合成

１，４－ジオキサン（１０ｍＬ）中の（Ｓ）－Ｎ－（（Ｒ）－１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－メチルプロパン－２－スルフィンアミド（６００ｍｇ、１．７２ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＨＣｌ（８．５８ｍＬ、ＭｅＯＨ中２Ｍ、１７．２ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で滴下した。得られた混合物を窒素下にて３０℃で２時間撹拌した。溶液を減圧下で濃縮した。残渣をEt_2O（３×５ｍＬ）でのトリチュレーションによって精製した。粗生成物（Ｒ）－１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－アミン（４００ｍｇ、１．５ｍｍｏｌ）をさらに精製することなく次のステップに直接使用した。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．３９０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　２４６、ＬＣＭＳ方法Ｅ。

【１００３】

ステップ３．２－（アゼチジン－１－イル）－５－ニトロピリミジンの合成

ＤＭＦ（５ｍＬ）中の２－クロロ－５－ニトロピリミジン（０．９６ｇ、６ｍｍｏｌ）及びアゼチジン（０．４６ｇ、８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、K_2CO_3（２．７６ｇ、０．０２ｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で加えた。得られた混合物を窒素下にて９０℃で１時間撹拌した。混合物を室温まで放冷し、水で希釈した。溶液をＥｔＯＡｃ（３×６０ｍＬ）で抽出した。合わせた有機層をブライン（５×１０ｍＬ）で洗浄し、無水Na_2SO_4で乾燥させた。濾過後、濾液を減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、石油エーテル／ＥｔＯＡｃ（１：１）で溶出して、２－（アゼチジン－１－イル）－５－ニトロピリミジン（４３０ｍｇ、２．３９ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．３６０分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　１８１、ＬＣＭＳ方法Ｅ。

【１００４】

ステップ４．２－（アゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－アミンの合成

ＴＨＦ（８ｍＬ）中の２－（アゼチジン－１－イル）－５－ニトロピリミジン（４３０ｍｇ、２．３９ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、室温でＰｄ／Ｃ（２０３ｍｇ）を加えた。フラスコを水素でパージし、水素雰囲気下にて１２時間撹拌した。濾過後、濾液を減圧下で濃縮して、２－（アゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－アミン（２２０ｍｇ、１．４６ｍｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．０７６分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　１５０．１９。ＬＣＭＳ方法Ｅ。

【１００５】

ステップ５．（２－（アゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）カルバミン酸フェニルの合成

ＤＭＦ（２ｍＬ）中の２－（アゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－アミン（６０ｍｇ、０．４０ｍｍｏｌ）及びクロロギ酸フェニル（６３ｍｇ、０．４０ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＥＡ（０．２１ｍＬ、１．２ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で滴下した。得られた混合物を窒素下にて０℃で１時間撹拌した。粗生成物を精製することなく次のステップに直接使用した。ＬＣＭＳ　ＲＴ　０．７５５分、［Ｍ＋Ｈ］$^+$　２７１、ＬＣＭＳ方法Ｅ。

【１００６】

ステップ６．（Ｒ）－１－（２－（アゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）－

３－（１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエチル）ウレアの合成

ＤＭＦ（１ｍＬ）中の（２－（アゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）カルバミン酸フェニル（５０ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）及び（Ｒ）－１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－アミン（４５ｍｇ、０．１８ｍｍｏｌ）の撹拌溶液に、ＤＩＥＡ（７２ｍｇ、０．５５ｍｍｏｌ）を窒素雰囲気下にて室温で滴下した。得られた混合物を窒素下にて３０℃で３時間撹拌した。混合物を室温まで放冷した。得られた混合物を逆相フラッシュクロマトグラフィー（カラム：ＸＢｒｉｄｇｅ　Ｐｒｅｐ　ＯＢＤ　Ｃ１８　Ｃｏｌｕｍｎ、３０＊１５０ｍｍ、１０μｍ；移動相Ａ：水（１０ｍＭ　NH_4HCO_3＋０．０５％NH_4OH）、移動相Ｂ：アセトニトリル；流量：６０ｍＬ／分；グラジエント：３４％Ｂから４９％Ｂで８分；波長：２５４／２２０ｎｍ；ＲＴ（分）：９．３２）によって精製して、（Ｒ）－１－（２－（アゼチジン－１－イル）ピリミジン－５－イル）－３－（１－（３－クロロ－２，６－ジフルオロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエチル）ウレア（４．５ｍｇ、１１μｍｏｌ）を白色の固体として得た。ＬＣＭＳ　ＲＴ　１．４３５分、$[M+H]^+$　４２２．０５、ＬＣＭＳ方法Ｆ。^1H　ＮＭＲ　（３００　ＭＨｚ，　ＤＭＳＯ－ｄ６）　δ　８．６７　（ｓ，　１Ｈ），　８．３６　（ｓ，　２Ｈ），　７．８４　（ｔｄ，　Ｊ　＝　８．８，　５．６　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．６０　（ｄ，　Ｊ　＝　９．９　Ｈｚ，　１Ｈ），　７．３９　（ｔ，　Ｊ　＝　９．２　Ｈｚ，　１Ｈ），　６．０９　（ｐ，　Ｊ　＝　９．０　Ｈｚ，　１Ｈ），　３．９９　（ｔ，　Ｊ　＝　７．４　Ｈｚ，　４Ｈ），　２．２８　（ｐ，　Ｊ　＝　７．５　Ｈｚ，　２Ｈ）．

【１００７】

実施例４３

本開示の選択化合物をＡＤＰ－Ｇｌｏ　Ｂｉｏｃｈｅｍｉｃａｌ　ＰＩＫ３ＣＡ　Ｋｉｎａｓｅ　Ａｓｓａｙで試験した。アッセイする化合物を１６用量の１：２連続希釈液（各ウェル容量２０ｎＬ）で１５３６ウェルプレートにプレーティングし、プレートを室温まで温めた。ＰＩＫ３ＣＡ酵素（例えば、Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、Ｅ５４５Ｋ、または野生型）（Ｅｎｚｙｍｅ　Ａｓｓａｙ　Ｂｕｆｆｅｒ（５０ｍＭ　ＨＥＰＥＳ　ｐＨ７．４、５０ｍＭ　ＮａＣｌ、６ｍＭ　$MgCl_2$、５ｍＭ　ＤＴＴ及び０．０３％ＣＨＡＰＳを含む）中の２ｎＭ溶液１μＬ）を加え、１０秒間振盪し、３０分間プレインキュベートした。ウェルにＳｕｂｓｔｒａｔｅ　Ａｓｓａｙ　Ｂｕｆｆｅｒ（５０ｍＭ　ＨＥＰＥＳ　ｐＨ７．４、５０ｍＭ　ＮａＣｌ、５ｍＭ　ＤＴＴ及び０．０３％ＣＨＡＰＳ）中の１μＬの２００μＭ　ＡＴＰ及び２０μＭのジＣ８－ＰＩＰ２を加えて反応を開始させ、プレートを１０秒間振盪し、次いで、１５００ｒｐｍで軽く遠心し、次いで、室温で６０分間インキュベートした。反応を２μＬのＡＤＰ－Ｇｌｏ試薬（Ｐｒｏｍｅｇａ）を加えることによって停止し、１５００ｒｐｍで軽く遠心し、次いで、４０分間インキュベートした。ＡＤＰ－Ｇｌｏ　Ｄｅｔｅｃｔｉｏｎ試薬（Ｐｒｏｍｅｇａ）を加え、プレートを１５００ｒｐｍで軽く遠心し、次いで、３０分間インキュベートした。プレートをＥｎｖｉｓｉｏｎ　２１０５（Ｐｅｒｋｉｎ　Ｅｌｍｅｒ）で読み取り、Ｇｅｎｅｄａｔａソフトウェアを使用してIC_{50}値を算出した。

【１００８】

Ｈ１０４７Ｒ　ＰＩＫ３ＣＡ酵素を使用したＡＤＰ－Ｇｌｏ　Ｂｉｏｃｈｅｍｉｃａｌ　ＰＩＫ３ＣＡ　Ｋｉｎａｓｅ　Ａｓｓａｙの結果を表１に示す。１００ｎＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ａ」と表し、１００ｎＭを超えるが５００ｎＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ｂ」と表し、５００ｎＭを超えるが１μＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ｃ」と表し、１μＭを超えるが１０μＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ｄ」と表し、１０μＭを超えるが１００μＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ｅ」と表す。

【１００９】

実施例４４

本開示の選択化合物をＭＣＦ１０Ａ　Ｃｅｌｌ－Ｂａｓｅｄ　ＰＩＫ３ＣＡ　Ｋｉｎａ

ｓｅ　Ａｓｓａｙ、すなわち、ＣｉｓＢｉｏ　Ｐｈｏｓｐｈｏ－ＡＫＴ（Ｓｅｒ４７３）ＨＴＲＦアッセイで試験して、ＰＩＫ３ＣＡを介したＡＫＴリン酸化の程度を測定した。ホットスポットＰＩＫ３ＣＡ変異（Ｈ１０４７Ｒ、Ｅ５４２Ｋ、及びＥ５４５Ｋ変異を含む）を過剰発現するＭＣＦ１０Ａ細胞（不死化非形質転換乳房細胞株）を使用した。細胞を、０．５ｍｇ／ｍＬのヒドロコルチゾン、１００ｎｇ／ｍＬのコレラ毒素、１０μｇ／ｍＬのインスリン、及び０．５％ウマ血清を添加したＤＭＥＭ／Ｆ１２（Ｔｈｅｒｍｏ　Ｆｉｓｈｅｒ　Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ）中、ウェルあたり５，０００細胞で播種した。プレーティングしたら、細胞を５％CO_2、３７℃のインキュベーター内に入れ、一晩接着させた。

【１０１０】

翌日、化合物を１２用量の１：３連続希釈液で細胞プレートに加えた。用量反応曲線をデュプリケートで行った。化合物の添加は、Ｅｃｈｏ　５５　Ｌｉｑｕｉｄ　Ｈａｎｄｌｅｒアコースティック分注機（Ｌａｂｃｙｔｅ）を利用して行った。細胞プレートを５％CO_2、３７℃のインキュベーター内で２時間インキュベートした。化合物のインキュベーション後、細胞を室温で６０分間溶解した。最後に、ＨＴＲＦ抗体との４時間のインキュベーションを室温で実施した。全ての試薬、溶解緩衝液と抗体の両方は、ＣｉｓＢｉｏｐＡＫＴ　Ｓ４７３　ＨＴＲＦアッセイキットのものを製造者のプロトコルに従って使用した。プレートをＥｎｖｉｓｉｏｎ　２１０５（Ｐｅｒｋｉｎ　Ｅｌｍｅｒ）で読み取り、Ｇｅｎｅｄａｔａソフトウェアを使用してIC_{50}値を算出した。

【１０１１】

ＭＣＦ１０Ａ　Ｃｅｌｌ－Ｂａｓｅｄ　ＰＩＫ３ＣＡ　Ｋｉｎａｓｅ　Ａｓｓａｙの結果を表１に示す。１μＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ａ」と表し、１μＭを超えるが５μＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ｂ」と表し、５μＭを超えるが１０μＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ｃ」と表し、１０μＭを超えるが３６μＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ｄ」と表し、３６μＭを超えるが１００μＭ以下のIC_{50}を有する化合物を「Ｅ」と表す。

【１０１２】

参照による援用

本明細書で言及される全ての出版物及び特許は、それぞれ個々の出版物または特許が具体的かつ個別に参照により組み込まれるかのように、あらゆる目的のためにその全体が参照により本明細書に組み込まれる。矛盾する場合は、本明細書におけるいかなる定義をも含む本出願が優先する。

【１０１３】

同等物

主題の開示の特定の実施形態が論じられたが、上記明細書は例証的であって制限的ではない。本開示の多くの変形は、本明細書を検討すれば当業者には明らかになるであろう。本開示の全範囲は、特許請求の範囲を、それらの同等物の全範囲とともに、及び明細書をそのような変型とともに参照することによって決定されるべきである。

【１０１４】

別段の指示がない限り、本明細書及び特許請求の範囲で使用される成分、反応条件などの量を表す全ての数字は、全ての場合において「約」という用語によって修飾されるものとして理解されるべきである。したがって、反対の指示がない限り、本明細書及び添付の特許請求の範囲に記載される数値パラメーターは、近似値であり、本開示によって得ようとする所望の特性に応じて変化し得る。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US2023/021668

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC(8) - INV. - C07C 25/02 (2023.01)
ADD. - A61P 35/00; A61K 31/03 (2023.01)

CPC - INV. - C07C 25/02 (2023.08)
ADD. - A61P 35/00; A61K 31/03 (2023.08)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
See Search History document

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched
See Search History document

Electronic database consulted during the international search (name of database and, where practicable, search terms used)
See Search History document

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	PUBCHEM, SID 26676046, Modify Date: 01 August 2020 [retrieved on 26 June 2023]. Retrieved from the Internet: <URL: https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/substance/26676046> entire document	1-3
A	US 9,926,324 B2 (CALITOR SCIENCES LLC) 27 March 2018 (27.03.2018) entire document	1-3
A	US 2007/0010548 A1 (DREES et al.) 11 January 2007 (11.01.2007) entire document	1-3
A	US 8,614,215 B2 (GAILLARD et al.) 24 December 2013 (24.12.2013) entire document	1-3
A	WO 2020/231990 A1 (RELAY THERAPEUTICS INC et al.) 19 November 2020 (19.11.2020) entire document	1-3

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"D" document cited by the applicant in the international application
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
18 August 2023	NOV 21 2023
Name and mailing address of the ISA/ Mail Stop PCT, Attn: ISA/US, Commissioner for Patents P.O. Box 1450, Alexandria, VA 22313-1450 Facsimile No. 571-273-8300	Authorized officer Taina Matos Telephone No. PCT Helpdesk: 571-272-4300

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 2022)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US2023/021668

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☒ Claims Nos.: 4-36, 38-46
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See extra sheet(s).

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.

3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
1-3

Remark on Protest

☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.

☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US2023/021668

Continued from Box No. III Observations where unity of invention is lacking

This application contains the following inventions or groups of inventions which are not so linked as to form a single general inventive concept under PCT Rule 13.1. In order for all inventions to be examined, the appropriate additional examination fees need to be paid.

Group I+: claims 1-3 and 37 are drawn to compound of formula I, or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

The first invention of Group I+ is restricted to a compound of formula I, or a pharmaceutically acceptable salt thereof, wherein Cy1 is phenyl, wherein Cy1 is substituted with n instances of R1, n is 0, and R1 is absent; Cy2 is phenyl, wherein Cy2 is substituted with m instances of R2, m is 0, and R2 is absent; Q is LQ, wherein LQ is a covalent bond; and T is a bivalent C1-3 aliphatic chain substituted with q instances of RT, wherein q is 0, RT is absent, and T is methylene. It is believed that claims 1-3 read on this first named invention and thus these claims will be searched without fee to the extent that they read on the above embodiment.

Applicant is invited to elect additional formula(e) for each additional compound to be searched in a specific combination by paying an additional fee for each set of election. Each additional elected formula(e) requires the selection of a single definition for each compound variable. An exemplary election would be a compound of formula I, or a pharmaceutically acceptable salt thereof, wherein Cy1 is naphthyl, wherein Cy1 is substituted with n instances of R1, n is 0, and R1 is absent; Cy2 is phenyl, wherein Cy2 is substituted with m instances of R2, m is 0, and R2 is absent; Q is LQ, wherein LQ is a covalent bond; and T is a bivalent C1-3 aliphatic chain substituted with q instances of RT, wherein q is 0, RT is absent, and T is methylene. Additional formula(e) will be searched upon the payment of additional fees. Applicants must specify the claims that read on any additional elected inventions. Applicants must further indicate, if applicable, the claims which read on the first named invention if different than what was indicated above for this group. Failure to clearly identify how any paid additional invention fees are to be applied to the "+" group(s) will result in only the first claimed invention to be searched/examined.

The inventions listed in Groups I+ do not relate to a single general inventive concept under PCT Rule 13.1, because under PCT Rule 13.2 they lack the same or corresponding special technical features for the following reasons:

The Groups I+ formulae do not share a significant structural element requiring the selection of alternatives for the compound variables Cy1, Cy2, Q, T, and accordingly these groups lack unity a priori.

Additionally, even if Groups I+ were considered to share the technical features of a compound having the core structure of formula I, or a pharmaceutically acceptable salt thereof, these shared technical features do not represent a contribution over the prior art as disclosed by Substance Record for SID 26676046 to PubChem (hereinafter, "PubChem").

PubChem teaches a compound having the core structure of formula I, or a pharmaceutically acceptable salt thereof (Pg. 2, compound as shown).

The inventions listed in Groups I+ therefore lack unity under Rule 13 because they do not share a same or corresponding special technical feature.

フロントページの続き

(51)国際特許分類	FI			テーマコード（参考）
C07D 207/27 (2006.01)	C07D	207/27	Z	
A61K 31/4015(2006.01)	A61K	31/4015		
A61K 31/50 (2006.01)	A61K	31/50		
A61K 31/443(2006.01)	A61K	31/443		
A61K 31/44 (2006.01)	A61K	31/44		
A61K 31/415(2006.01)	A61K	31/415		
C07D 405/12 (2006.01)	C07D	405/12		
C07D 237/24 (2006.01)	C07D	237/24		
C07D 213/75 (2006.01)	C07D	213/75		
C07D 211/58 (2006.01)	C07D	211/58		
A61K 31/4468(2006.01)	A61K	31/4468		
A61K 31/433(2006.01)	A61K	31/433		
C07D 417/04 (2006.01)	C07D	417/04		
C07D 413/04 (2006.01)	C07D	413/04		
A61K 31/42 (2006.01)	A61K	31/42		
A61K 31/17 (2006.01)	A61K	31/17		
A61K 31/47 (2006.01)	A61K	31/47		
C07D 215/38 (2006.01)	C07D	215/38		
A61K 31/506(2006.01)	A61K	31/506		
C07D 295/135(2006.01)	C07D	295/135		
C07D 295/26 (2006.01)	C07D	295/26		
A61K 31/495(2006.01)	A61K	31/495		
A61K 31/4704(2006.01)	A61K	31/4704		
C07D 215/22 (2006.01)	C07D	215/22		
C07D 207/22 (2006.01)	C07D	207/22		
C07D 231/14 (2006.01)	C07D	231/14		
C07D 233/74 (2006.01)	C07D	233/74		
A61K 31/4166(2006.01)	A61K	31/4166		
A61K 31/551(2006.01)	A61K	31/551		
C07D 243/08 (2006.01)	C07D	243/08	508	
C07D 307/14 (2006.01)	C07D	307/14		
C07D 223/12 (2006.01)	C07D	223/12	A	
A61K 31/341(2006.01)	A61K	31/341		
A61K 31/55 (2006.01)	A61K	31/55		
A61K 31/4155(2006.01)	A61K	31/4155		
C07D 413/06 (2006.01)	C07D	413/06		
A61K 31/5377(2006.01)	A61K	31/5377		
C07D 295/185(2006.01)	C07D	295/185		
C07D 277/42 (2006.01)	C07D	277/42		
A61K 31/454(2006.01)	A61K	31/454		
C07D 401/04 (2006.01)	C07D	401/04		
C07D 209/04 (2006.01)	C07D	209/04		
C07D 403/04 (2006.01)	C07D	403/04		
C07D 295/15 (2006.01)	C07D	295/15		
A61K 31/496(2006.01)	A61K	31/496		
C07D 213/74 (2006.01)	C07D	213/74		
C07D 333/48 (2006.01)	C07D	333/48		
A61K 31/381(2006.01)	A61K	31/381		
C07D 307/82 (2006.01)	C07D	307/82		

(51)国際特許分類	FI		テーマコード（参考）
A61K 31/343(2006.01)	A61K	31/343	
C07D 235/30 (2006.01)	C07D	235/30	A
A61K 31/4184(2006.01)	A61K	31/4184	
C07D 417/14 (2006.01)	C07D	417/14	
A61K 31/437(2006.01)	A61K	31/437	
C07D 277/82 (2006.01)	C07D	277/82	
A61K 31/428(2006.01)	A61K	31/428	
C07D 487/04 (2006.01)	C07D	487/04	140
A61K 31/519(2006.01)	A61K	31/519	
A61K 31/498(2006.01)	A61K	31/498	
C07D 241/44 (2006.01)	C07D	241/44	
C07D 471/04 (2006.01)	C07D	471/04	108A
C07D 333/68 (2006.01)	C07D	333/68	
A61K 31/277(2006.01)	A61K	31/277	
C07D 409/12 (2006.01)	C07D	409/12	
A61K 31/4535(2006.01)	A61K	31/4535	
A61K 31/351(2006.01)	C07D	487/04	143
C07D 309/14 (2006.01)	A61K	31/351	
C07D 305/08 (2006.01)	C07D	309/14	
A61K 31/337(2006.01)	C07D	305/08	
A61K 31/397(2006.01)	A61K	31/337	
C07D 205/04 (2006.01)	A61K	31/397	
C07D 405/04 (2006.01)	C07D	205/04	
C07D 285/06 (2006.01)	C07D	405/04	
A61K 31/137(2006.01)	C07D	285/06	
C07D 491/052 (2006.01)	A61K	31/137	
A61K 31/436(2006.01)	C07D	491/052	
A61K 31/395(2006.01)	A61K	31/436	
A61K 31/4192(2006.01)	A61K	31/395	
C07D 249/04 (2006.01)	A61K	31/4192	
C07D 401/06 (2006.01)	C07D	249/04	503
C07D 271/08 (2006.01)	C07D	401/06	
A61K 31/4245(2006.01)	C07D	271/08	
C07D 263/22 (2006.01)	A61K	31/4245	
A61K 31/421(2006.01)	C07D	263/22	
C07D 239/36 (2006.01)	A61K	31/421	
C07D 235/02 (2006.01)	C07D	239/36	
C07D 319/12 (2006.01)	C07D	235/02	E
A61K 31/357(2006.01)	C07D	319/12	
A61K 31/16 (2006.01)	A61K	31/357	
A61K 31/407(2006.01)	A61K	31/16	
C07D 251/52 (2006.01)	A61K	31/407	
C07D 471/10 (2006.01)	C07D	471/04	106A
A61K 31/438(2006.01)	C07D	471/04	106C
C07D 265/32 (2006.01)	C07D	251/52	A
C07D 417/12 (2006.01)	C07D	471/10	101
C07D 263/52 (2006.01)	A61K	31/438	
A61K 31/424(2006.01)	C07D	265/32	
C07D 409/06 (2006.01)	C07D	417/12	

(51)国際特許分類	FI		テーマコード（参考）
C07D 498/04 (2006.01)	C07D	471/04	106H
A61K 31/5383(2006.01)	C07D	487/04	144
A61K 31/18 (2006.01)	C07D	263/52	
A61K 31/538 (2006.01)	A61K	31/424	
C07D 265/36 (2006.01)	C07D	409/06	
C07D 313/08 (2006.01)	C07D	498/04	111
A61K 31/335 (2006.01)	A61K	31/5383	
A61K 31/553 (2006.01)	A61K	31/18	
C07D 267/10 (2006.01)	A61K	31/538	
C07D 513/04 (2006.01)	C07D	265/36	
C07D 491/048 (2006.01)	C07D	313/08	
C07D 333/38 (2006.01)	A61K	31/335	
C07D 237/28 (2006.01)	A61K	31/553	
A61K 31/502 (2006.01)	C07D	267/10	
C07D 495/04 (2006.01)	C07D	513/04	301
A61K 31/4196(2006.01)	C07D	471/04	104Z
C07D 331/04 (2006.01)	C07D	491/048	
A61K 31/38 (2006.01)	C07D	333/38	
C07D 335/04 (2006.01)	C07D	487/04	145
A61K 31/382 (2006.01)	C07D	237/28	
A61K 31/425 (2006.01)	A61K	31/502	
C07D 333/50 (2006.01)	C07D	495/04	105Z
C07D 239/70 (2006.01)	A61K	31/4196	
A61K 31/517 (2006.01)	C07D	331/04	
C07D 487/08 (2006.01)	A61K	31/38	
C07D 493/08 (2006.01)	C07D	335/04	
A61K 31/439 (2006.01)	A61K	31/382	
C07D 305/14 (2006.01)	A61K	31/425	
C07C 311/08 (2006.01)	C07D	333/50	
C07C 317/44 (2006.01)	C07D	239/70	
C07C 235/26 (2006.01)	A61K	31/517	
C07C 237/24 (2006.01)	C07D	487/08	
C07C 275/26 (2006.01)	C07D	493/08	
C07C 275/32 (2006.01)	A61K	31/439	
C07C 275/38 (2006.01)	C07D	305/14	
C07C 275/42 (2006.01)	C07C	311/08	
C07C 235/06 (2006.01)	C07C	317/44	
C07C 233/59 (2006.01)	C07C	235/26	
C07C 235/40 (2006.01)	C07C	237/24	
C07C 311/16 (2006.01)	C07C	275/26	
C07C 237/20 (2006.01)	C07C	275/32	
C07C 237/22 (2006.01)	C07C	275/38	
C07C 237/42 (2006.01)	C07C	275/42	
C07C 255/46 (2006.01)	C07C	235/06	
C07C 237/04 (2006.01)	C07C	233/59	
C07C 235/54 (2006.01)	C07C	235/40	
C07C 317/22 (2006.01)	C07C	311/16	
C07C 237/38 (2006.01)	C07C	237/20	
C07C 235/82 (2006.01)	C07C	237/22	

(51)国際特許分類	FI		テーマコード（参考）
C07C 311/24 (2006.01)	C07C	237/42	
C07C 311/14 (2006.01)	C07C	255/46	
C07D 231/12 (2006.01)	C07C	237/04 D	
C07D 239/48 (2006.01)	C07C	235/54	
C07D 211/60 (2006.01)	C07C	317/22	
C07D 207/34 (2006.01)	C07C	237/38	
C07C 311/47 (2006.01)	C07C	235/82	
C07D 413/12 (2006.01)	C07C	311/24	
C07D 285/135 (2006.01)	C07C	311/14	
C07D 265/30 (2006.01)	C07D	231/12 C	
C07D 401/12 (2006.01)	C07D	239/48	
C07D 211/34 (2006.01)	C07D	211/60	
C07D 257/04 (2006.01)	C07D	207/34	
C07D 261/08 (2006.01)	C07C	311/47	
C07D 333/66 (2006.01)	C07D	413/12	
C07D 487/10 (2006.01)	C07D	285/135	
C07D 205/12 (2006.01)	C07D	265/30	
C07D 209/96 (2006.01)	C07D	471/04 １０７Ａ	
C07D 491/107 (2006.01)	C07D	401/12	
C07D 311/00 (2006.01)	C07D	211/34	
C07D 217/26 (2006.01)	C07D	471/04 １０１	
C07D 249/16 (2006.01)	C07D	257/04 A	
C07D 249/08 (2006.01)	C07D	261/08	
	C07D	333/66	
	C07D	487/10	
	C07D	205/12	
	C07D	209/96	
	C07D	491/107	
	C07D	311/00	
	C07D	217/26	
	C07D	249/16	
	C07D	249/08 ５３５	

,MC,ME,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CV,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JM,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,MG,MK,MN,MU,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

弁護士　山本 健策

(72)発明者　パン， ユエ
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９， ２エヌディー フロア

(72)発明者　ボエツィオ， アレッサンドロ
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９， ２エヌディー フロア

(72)発明者　フリドリック， ケーリー グリフィン
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９， ２エヌディー フロア

(72)発明者　クルーガー， エレイン ビー．
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９， ２エヌディー フロア

(72)発明者　ムスタカス， ディミトリ ティー．
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９，

２エヌディー フロア
(72)発明者 レイナー， ケビン デイビッド
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９，２エヌディー フロア
(72)発明者 ショートスリーブス， ケリー シー．
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９，２エヌディー フロア
(72)発明者 マクリーン， トーマス エイチ．
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９，２エヌディー フロア
(72)発明者 デニノ， マイケル ポール
アメリカ合衆国 コネチカット ０６３３５， ゲールズ フェリー， ハーミテイジ ドライブ ９
(72)発明者 トムソン， クリストファー
イギリス国 イーエヌ１１ ９エフエイチ ハートフォードシャー， ホッデスドン， ハートフォード ロード， ウエスト ヒル イノベーション パーク
(72)発明者 ラリヴェ， アレクサンドル
カナダ国 エイチ４エス ２イー１ ケベック， モントリオール， マリー－キュリー ２５２５
(72)発明者 バーニー， アンドリュー ジェイ．
カナダ国 エイチ４エス ２イー１ ケベック， モントリオール， マリー－キュリー ２５２５
(72)発明者 アティエンザ， ブレン－ジョルダン
カナダ国 エイチ４エス ２イー１ ケベック， モントリオール， マリー－キュリー ２５２５
(72)発明者 ペロー， クリスチャン
カナダ国 エイチ４エス ２イー１ ケベック， モントリオール， マリー－キュリー ２５２５
(72)発明者 マルテンス， ゲタン
カナダ国 エイチ４エス ２イー１ ケベック， モントリオール， マリー－キュリー ２５２５
(72)発明者 モハメド， タレク
カナダ国 エイチ４エス ２イー１ ケベック， モントリオール， マリー－キュリー ２５２５
(72)発明者 ルピトゥル， トマ
カナダ国 エイチ４エス ２イー１ ケベック， モントリオール， マリー－キュリー ２５２５
(72)発明者 バウム， エリック ダブリュー．
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９，２エヌディー フロア
(72)発明者 グネイディン， ハカン
アメリカ合衆国 マサチューセッツ ０２１３９， ケンブリッジ， ビニー ストリート ３９９，２エヌディー フロア

Ｆターム（参考） 4C086 AA01 AA02 AA03 BA02 BA03 BA05 BA06 BA07 BA10 BA14
BB01 BB02 BB03 BC02 BC07 BC17 BC21 BC28 BC31 BC36 BC38
BC39 BC41 BC50 BC52 BC54 BC60 BC61 BC62 BC67 BC69 BC73
BC74 BC79 BC82 BC84 BC85 CA01 CB02 CB03 CB05 CB06 CB22
CB26 GA02 GA04 GA07 GA08 GA09 GA10 GA12 MA01 MA04 NA14
ZB26 ZC20
4C206 AA01 AA02 AA03 FA31 GA06 GA30 HA13 HA26 JA11 NA14
ZB26 ZC20
4H006 AA01 AB28 BJ20 BJ30 BJ50 BM10 BM30 BM71 BM72 BN10
BN20 BR70 BU34 BU36 BV22 BV62 TA02 TA04