(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7165129号
(P7165129)

(45)発行日　令和4年11月2日(2022.11.2)

(24)登録日　令和4年10月25日(2022.10.25)

(51)国際特許分類		FI		
C07D 215/54 (2006.01)		C07D	215/54	CSP
A61K 31/47 (2006.01)		A61K	31/47	
A61K 31/4709(2006.01)		A61K	31/4709	
A61K 31/4725(2006.01)		A61K	31/4725	
A61K 31/506 (2006.01)		A61K	31/506	

請求項の数　21　（全494頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2019-524276(P2019-524276)
(86)(22)出願日　平成29年11月6日(2017.11.6)
(65)公表番号　特表2019-535706(P2019-535706A)
(43)公表日　令和1年12月12日(2019.12.12)
(86)国際出願番号　PCT/EP2017/078319
(87)国際公開番号　WO2018/087036
(87)国際公開日　平成30年5月17日(2018.5.17)
審査請求日　令和2年11月4日(2020.11.4)
(31)優先権主張番号　16198550.2
(32)優先日　平成28年11月11日(2016.11.11)
(33)優先権主張国・地域又は機関
欧州特許庁(EP)

(73)特許権者　508270727
バイエル・アニマル・ヘルス・ゲゼルシャフト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツング
ＢＡＹＥＲ ＡＮＩＭＡＬ ＨＥＡＬＴＨ ＧＭＢＨ
ドイツ連邦共和国デー－５１３７３レーバークーゼン、カイザー－ビルヘルム－アレー、２０
(74)代理人　100114188
弁理士　小野 誠
(74)代理人　100119253
弁理士　金山 賢教
(74)代理人　100124855
弁理士　坪倉 道明

最終頁に続く

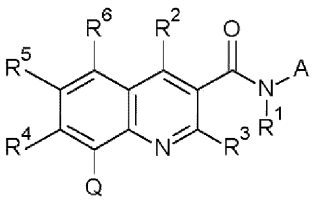
(54)【発明の名称】　新規な駆虫性キノリン－３－カルボキサミド誘導体

(57)【特許請求の範囲】

【請求項１】

下記一般式（Ｉ）の化合物又は該化合物の立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物若しくは塩、又はそれらの混合物。

【化１】

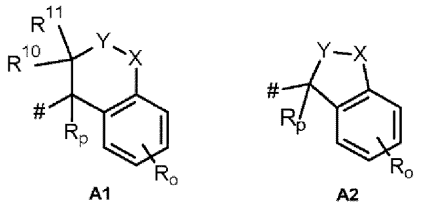


(I)

［式中、

Ａは、Ａ１又はＡ２：

【化２】



であり、

ｏは、０、１、２、３又は４であり、

Ｒは、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、

Ｒｐは、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｘ、Ｙは、独立にＣＲ７Ｒ８、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ９からなる群から選択され、ここで、Ｘ及びＹの少なくとも一つが、ＣＲ７Ｒ８であり、又は

Ｘ、Ｙが一緒に、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ９－、－Ｓ（Ｏ）－ＮＲ９－、－ＳＯ２－ＮＲ９－及び－ＳＯ２－Ｏ－からなる群から選択される環員を形成しており、

Ｒ１は、

水素、シアノ、－ＣＨＯ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ３－Ｃ６－ハロゲノシクロアルキル、Ｃ３－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ４－アルキニル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ３－アルキル、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＮＨ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、ＮＨ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－ＮＨ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２Ｎ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、ベンジルオキシ－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル；

フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらは、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有す

るＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］からなる群から選択され、

Ｒ２は、

水素、ハロゲン、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２；

－ＮＲ１２Ｒ１３；

－ＯＲ１４；

－ＳＲ１５、－Ｓ（Ｏ）Ｒ１５、－ＳＯ２Ｒ１５；

Ｃ１－Ｃ６－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルケニル、Ｃ２－Ｃ４－アルキニル又はフェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル［これは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それ

らはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ３は、水素又はＣ１－Ｃ４－アルキルであり、

Ｒ４は、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ５は、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ，Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ６は、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ７は、水素、－ＯＨ、フッ素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ８は、水素、－ＯＨ、フッ素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

又は、Ｒ７及びＲ８は一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、

又はＲ７及びＲ８は、それらが結合している炭素原子とともに、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル及び３～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される３～６員環を形成しており、

Ｒ９は、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ１０は、水素、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ１１は、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

又は、R^{10}及びR^{11}は、それらが結合している炭素原子とともに、C_3－C_6－シクロアルキル及び３～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される３～６員環を形成しており、

R^{12}及びR^{13}は、独立に、

水素、－ＯＨ、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルコキシ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－；

C_1－C_4－アルキル、C_3－C_6－シクロアルキル、フェニル－C_1－C_4－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び（C_1－C_4－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－C_1－C_4－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、ヒドロキシ－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル、ベンゾ－C_5－C_6－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（

Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ１４は、

－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル［それは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ

（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。
]
からなる群から選択され、

Ｒ^{15}は、

水素；

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、フェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル［それは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールから

なる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。
］
からなる群から選択され、
Ｑは、６員アリール及びＮ、Ｏ及び／又はＳから選択される１又は２個のヘテロ原子を含む５～９員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、ハロゲン、ＳＦ５、シアノ、－ＣＨＯ、ニトロ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－ヒドロキシアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（ＳＯ２－［Ｃ１－Ｃ４－アルキル］）（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシイミノ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、４～６員複素環［それは、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－ＣＨ２－Ｏ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、４～６員複素環［自体が、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基で置換されていても良い。］で置換されているメチル、－ＣＨ２－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良く、
ここで、ＹがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ９である場合、Ｒ７、Ｒ８、Ｒ１０及びＲ１１のいずれも－ＯＨではなく、及びここで、ＸがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ９である場合、Ｒ７及びＲ８のいずれも－ＯＨではない。］
【請求項２】
Ｒ４が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２からなる群から選択され、
Ｒ５が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２からなる群から選択され、

R^6が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$からなる群から選択され、

R^7が、水素、－ＯＨ、フッ素、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、

R^8が、水素、－ＯＨ、フッ素、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、

又は、R^7及びR^8が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、

R^{10}が、水素、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、

R^{11}が、水素、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、

R^{12}及びR^{13}が、独立に、

水素、－ＯＨ、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルコキシ；　C_1－C_4－アルキル、C_3－C_6－シクロアルキル、フェニル－C_1－C_4－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）－（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び（C_1－C_4－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－C_1－C_4－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、ヒドロキシ－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

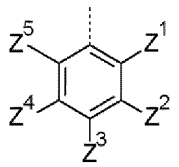
フェニル、ベンゾ－C_5－C_6－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン

原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：

【化４】



(Q1)

であり、

式中、

Ｚ^1、Ｚ^2、Ｚ^3、Ｚ^4、及びＺ^{5}が、独立に水素、ハロゲン、ＳＦ$_5$、シアノ、－ＣＨＯ、ニトロ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、シアノ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（ＳＯ$_2$－［Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル］）（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシイミノ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、４～６員複素環［それは、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－ＣＨ$_2$－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、４～６員複素環［それ自体が、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基で置換されていても良い。］で置換されているメチル、－ＣＨ$_2$－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル）、１～５個

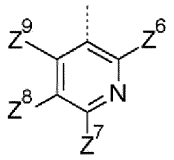
のハロゲン原子を有する－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）からなる群から選択され、又は

Ｚ^{1}及びＺ^{2}が、それらが結合している炭素原子とともに、５員の部分飽和複素環又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及びＺ^3、Ｚ^4、及びＺ^{5}が、独立に水素、ハロゲン、ＳＦ$_5$、シアノ、ＣＨＯ、ニトロ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、シアノ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（ＳＯ$_2$－［Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル］）（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシイミノ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、４～６員ヘテロシクロアルキル［それは、フッ素、メチル若しくはシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－ＣＨ$_2$－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、４～６員ヘテロシクロアルキル［自体が、フッ素、メチル又はシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基で置換されていても良い。］で置換されているメチル、－ＣＨ$_2$－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）からなる群から選択され、又は

Ｚ^{2}及びＺ^{3}が、それらが結合している炭素原子とともに、５員の部分飽和複素環又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及び

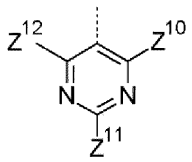
Ｚ^1、Ｚ^4、及びＺ^{5}が、独立に水素、ハロゲン、ＳＦ$_5$、シアノ、ＣＨＯ、ニトロ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、シアノ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（ＳＯ$_2$－［Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル］）（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシイミノ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、４～６員ヘテロシクロアルキル［それは、フッ素、メチル若しくはシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－ＣＨ$_2$－Ｏ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、４～６員ヘテロシクロアルキル［それ自体が、フッ素、メチル又はシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基で置換されていても良い。］で置換されているメチル、－ＣＨ$_2$－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＨ$_2$－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＮＨＣＯ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）からなる群から選択され

、又は
Ｑが、下記式（Ｑ２）のピリジン環：
【化５】



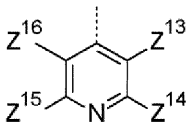
(Q2)

であり、
式中、
Ｚ^{6}、Ｚ^{7}、Ｚ^{8}及びＺ^{9}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$からなる群から選択され、又は　Ｑが、下記式（Ｑ３）のピリミジン環：
【化６】



(Q3)

であり、
式中、
Ｚ^{10}、Ｚ^{11}及びＺ^{12}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$からなる群から選択され、又は　Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化７】



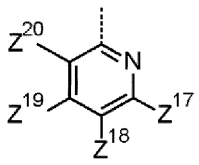
(Q4)

であり、
式中、
Ｚ^{13}、Ｚ^{14}、Ｚ^{15}及びＺ^{16}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ヒドロキシアルキル、ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－ＣＯ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環からなる群から選択され、これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アル

キル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良く、又は

Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化８】



(Q5)

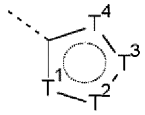
であり、

式中、

Ｚ１７、Ｚ１８、Ｚ１９及びＺ２０が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：

【化９】



(Q6)

であり、

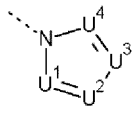
式中、

Ｔ１～Ｔ４が、独立にＮ、Ｏ、Ｓ、Ｃ－Ｚ２１及びＮ－Ｚ２２からなる群から選択され、ここで、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＯであり、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＳであり、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＮ－Ｚ２２であり、及びここで、

各Ｚ２１が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、及び　各Ｚ２２が、独立に水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：

【化１０】



(Q7)

であり、

式中、

U^1～U^4が、独立にN及び$C-Z^{23}$からなる群から選択され、ここで、U^1～U^4のうちの１個以下がNであり、及びここで、

各Z^{23}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、

ここで、YがO、S又は$N-R^9$である場合、R^7、R^8、R^{10}及びR^{11}のうちのいずれも－ＯＨではなく、及びここで、XがO、S又は$N-R^9$である場合、R^7及びR^8のうちのいずれも－ＯＨではない、

請求項１に記載の化合物、又は該化合物の立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物若しくは塩、又はそれらの混合物。

【請求項３】

ｏが、０、１又は２であり、

Ｒが、ハロゲン、C_1-C_4－アルキル及びC_1-C_4－アルコキシ、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、

Ｘ、Ｙが、独立にCR^7R^8、Ｏ、Ｓ、及び$N-R^9$からなる群から選択され、ここで、Ｘ及びＹの少なくとも一つが、CR^7R^8であり、

R^1が、水素、C_1-C_4－アルキル、C_3-C_6－シクロアルキル、C_3-C_4－アルケニル、C_3-C_4－アルキニル、C_1-C_4－アルコキシ－C_1-C_4－アルキル、C_3-C_6－シクロアルキル－C_1-C_3－アルキル、シアノ－C_1-C_4－アルキルからなる群から選択され、

R^2が、

水素、ハロゲン、シアノ、－ＣＯＯＨ、C_1-C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$；

－$NR^{12}R^{13}$；

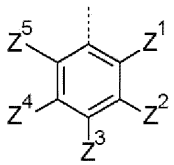
－OR^{14}；

－SR^{15}、－Ｓ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}；

C_1-C_4－アルキル、C_3-C_6－シクロアルキル、C_2-C_4－アルケニル、C_3-C_6－シクロアルケニル、C_2-C_4－アルキニル又はフェニル－C_1-C_4－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、C_1-C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、－NH_2、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ（Ｃ（Ｏ）－C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－C_1-C_4－アルキル）、－Ｓ－C_1-C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1-C_4－アルキル、－SO_2－C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1-C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1-C_4－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1-C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；及び　４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、C_1-C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$、C_1-C_4－アルキル、C_1-C_4－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、ヒドロキシ－C_1-C_4－アルキル、C_1-C_4－アルコキシ－C_1-C_4－アルキル－、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3-C_6－シクロア

ルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
Ｒ^{4}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、
Ｒ^{5}が、水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、
Ｒ^{6}が、水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、
Ｒ^{7}が、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、
Ｒ^{8}が、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、
又はＲ^{7}及びＲ^{8}が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、
Ｒ^{9}が、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルであり、
Ｒ^{10}が、水素、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシからなる群から選択され、
Ｒ^{11}が、水素であり、
Ｒ^{12}及びＲ^{13}が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ；
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、フェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）－（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル、ベンゾ－Ｃ$_5$－Ｃ$_6$－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
Ｒ１４が、
Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；
Ｒ１５が、
水素；
Ｃ１－Ｃ４－アルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；
Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化１２】



(Q1)

であり、
Ｚ１、Ｚ２、Ｚ３、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、４～６員複素環［それは、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若し

くは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）からなる群から選択され、又は

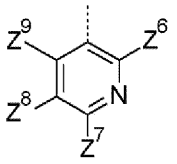
Ｚ１及びＺ２が、それらが結合している炭素原子とともに、５員の部分飽和ヘテロシクロアルキル又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらは、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及び

Ｚ３、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、又は　Ｚ２及びＺ３が、それらが結合している炭素原子とともに、５員の部分飽和複素環又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及び

Ｚ１、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ２）のピリジン環：

【化１３】



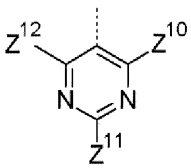
(Q2)

であり、

式中、

Ｚ６、Ｚ７、Ｚ８及びＺ９が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２からなる群から選択され、又は　Ｑが、下記式（Ｑ３）のピリミジン環：

【化１４】



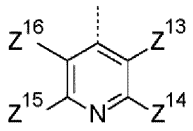
(Q3)

であり、

式中、

Ｚ１０、Ｚ１１及びＺ１２が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２からなる群から選択され、又は　Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：

【化１５】



(Q4)

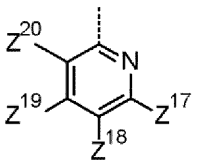
であり、

式中、

Ｚ^{13}、Ｚ^{14}、Ｚ^{15}及びＺ^{16}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ヒドロキシアルキル、ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＣＯ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環からなる群から選択され、これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良く、又は

Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化１６】



(Q5)

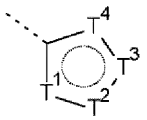
であり、

式中、

Ｚ^{17}、Ｚ^{18}、Ｚ^{19}及びＺ^{20}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は

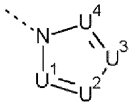
Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：

【化１７】



(Q6)

であり、
式中、
T^1～T^4が、独立にN、O、S、C－Z^{21}及びN－Z^{22}からなる群から選択され、ここで、T^1～T^4のうちの１個以下がOであり、T^1～T^4のうちの１個以下がSであり、T^1～T^4のうちの１個以下がN－Z^{22}であり、及びここで、
各Z^{21}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、
各Z^{22}が、独立に水素、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルキル－C_3－C_6－シクロアルキル、C_1－C_4－アルコキシ－C_1－C_4－アルキルからなる群から選択され、又は
Qが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：
【化１８】



(Q7)

であり、
式中、
U^1～U^4が、独立にN及びC－Z^{23}からなる群から選択され、ここで、U^1～U^4のうちの１個以下がNであり、及びここで、
各Z^{23}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、
ここで、YがO、S又はN－R^9である場合、R^{10}が－OHではない、
請求項１若しくは２に記載の化合物又は該化合物の立体異性体、互変異体、N－オキサイド、水和物、溶媒和物若しくは塩、又はそれらの混合物。
【請求項４】
oが、０、１又は２であり、
Rが、ハロゲン、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、
R_pが、水素、C_1－C_4－アルキルからなる群から選択され、
Xが、CR^7R^8、O、S、及びN－R^9からなる群から選択され、
Yが、CR^7R^8又はOであり、
R^1が、水素又はC_1－C_4－アルキルであり、
R^2が、
水素、ハロゲン、－C（O）－N（C_1－C_4－アルキル）$_2$；
－N$R^{12}R^{13}$；
－OR^{14}；
－SR^{15}、－S（O）R^{15}、－SO_2R^{15}；
C_1－C_4－アルキル、C_3－C_6－シクロアルキル、C_2－C_4－アルケニル又はC_3－C_6－シクロアルケニル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－OH、シアノ、C_1－C_4－アルコキシ－C（O）－及び－C（O）－NH_2、C_1－C_4－アルコキシ、－NH_2、－N（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－N（C_1－C_4－アルキル）（C（O）－C_1－C_4－アルキル）からなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール、及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［そ

れらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］からなる群から選択され、

Ｒ４が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、

Ｒ５が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ６が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ７が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ８が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

又はＲ７及びＲ８が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、

Ｒ９が、Ｃ１－Ｃ４－アルキルであり、

Ｒ１０が、水素、－ＯＨ及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ１１が、水素であり、

Ｒ１２及びＲ１３が、独立に、

水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、及び（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ）２Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

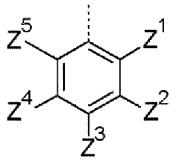
フェニル及びベンゾ－Ｃ５－Ｃ６－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］

からなる群から選択され、

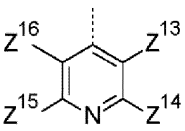
Ｒ１４が、

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ及びＣ３－Ｃ６－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
４～１０員ヘテロシクロアルキル
からなる群から選択され、
Ｒ１５が、
水素；
Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それは、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
６員ヘテロアリール
からなる群から選択され、
Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化２０】



(Q1)

であり、
式中、
Ｚ１及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、
Ｚ２及びＺ４が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）及び４～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、
Ｚ３が、水素、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、及び－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２からなる群から選択され、又は
Ｚ１及びＺ２が、それらが結合している炭素原子とともに、５員の部分飽和ヘテロシクロアルキル又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、　Ｚ３及びＺ５が水素であり、及び
Ｚ４が、水素であり、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化２１】



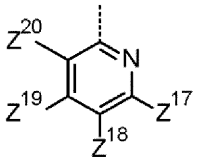
(Q4)

であり、
式中、

Z^{13}、Z^{14}、Z^{15}及びZ^{16}が、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、C_1-C_4－アルコキシ、C_1-C_4－ヒドロキシアルキル、NH_2、－NH（C_1-C_4－アルキル）、－N（C_1-C_4－アルキル）$_2$、－NH－CO－C_1-C_4－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環［これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－OH、オキソ、チオノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3-C_6－シクロアルキル、$-NH_2$、－NH（C_1-C_4－アルキル）、－N（C_1-C_4－アルキル）$_2$、－S－C_1-C_4－アルキル、－S（O）－C_1-C_4－アルキル、$-SO_2-C_1-C_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－S－（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－S（O）－（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する$-SO_2-$（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］からなる群から選択され、又は

Qが、下記式（Q５）のピリジン環：

【化２２】



(Q5)

であり、

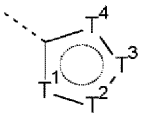
式中、

Z^{17}、Z^{18}、及びZ^{19}が水素であり、

Z^{20}が、ハロゲンであり、又は

Qが、下記式（Q６）の５員芳香族複素環：

【化２３】



(Q6)

であり、

式中、

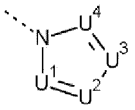
T^1～T^4が、独立にN、O、S、C－Z^{21}及びN－Z^{22}からなる群から選択され、ここで、T^1～T^4のうちの１個以下がOであり、T^1～T^4のうちの１個以下がSであり、T^1～T^4のうちの１個以下がN－Z^{22}であり、及びここで、

各Z^{21}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシからなる群から選択され、及び

各Z^{22}が、独立に水素、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルキル－C_3-C_6－シクロアルキル、C_1-C_4－アルコキシ－C_1-C_4－アルキルからなる群から選択され、又は

Qが、下記式（Q７）の５員芳香族複素環：

【化２４】



(Q7)

であり、

式中、

U^1～U^4が、独立にＮ及びＣ－Z^{23}からなる群から選択され、ここで、U^1～U^4のうちの１個以下がＮであり、及びここで、

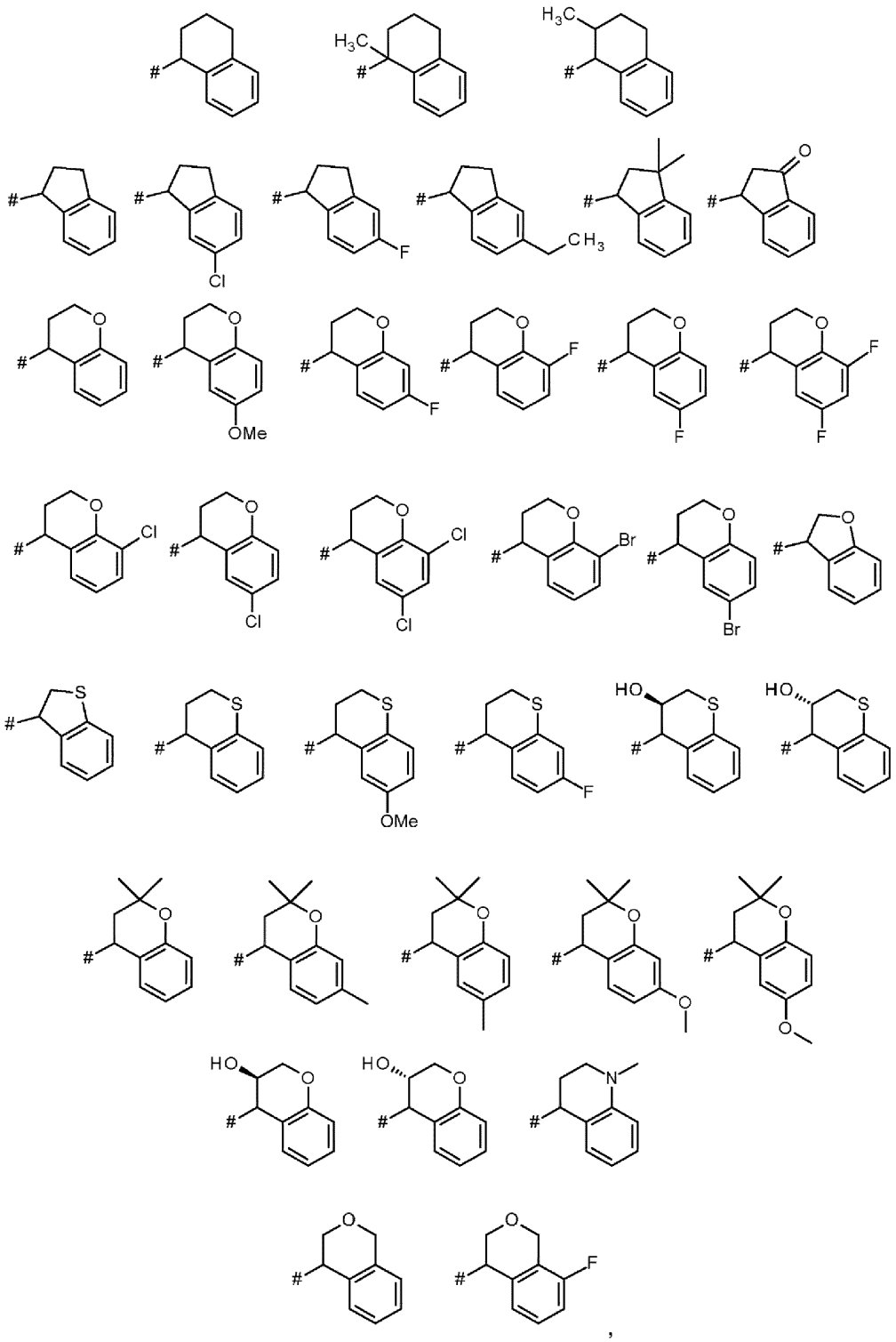
各Z^{23}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシからなる群から選択される、

請求項１、２若しくは３に記載の化合物又は該化合物の立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物若しくは塩、又はそれらの混合物。

【請求項５】

Ａが、

【化２５】



,

からなる群から選択され、
　Ｒ^{1}が、水素又はメチルであり、
　Ｒ^{2}が、
　　水素、塩素、ヨウ素、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$；
　　－ＮＲ^{12}Ｒ^{13}；
　　－ＯＲ^{14}；
　　－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{15}；
　　メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、エテニル、プロペニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニ

ル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ、シアノ、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、メトキシ、ＮＨ$_2$、Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$、Ｎ（ＣＨ$_3$）（Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_3$）からなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

アゼチジン、オキセタン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロピリジン、ジヒドロ－２Ｈ－ピラン、１，２－オキサゾリジン、１，２－オキサジン、モルホリン、チオモルホリン、３，４－ジヒドロイソキノリン、２，３－ジヒドロ－インドール、１，３－ジヒドロ－イソインドール、３，９－ジオキサ－７－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、６－オキサ－３－アザビシクロ［３．１．１］ヘプタン、８－オキサ－３－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、チオフェン、イミダゾール、ピラゾール、１，２，４－トリアゾール、１，２，３－トリアゾール、１，２，３，４－テトラゾール、ピリジン、ジヒドロピリジン、ピリミジン、テトラヒドロピリミジン、４－オキサ－７－アザスピロ［２．５］オクタンからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、シアノ、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、メチル、メチル－Ｃ（Ｏ）－、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル－、メトキシメチル－、－ＮＨ$_2$、－ＮＭｅ$_2$、ピロリジンからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ^{3}が、水素又はメチルであり、

Ｒ^{4}が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ及びＮＨ$_2$からなる群から選択され、

Ｒ^{5}が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、

Ｒ^{6}が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル及びメトキシからなる群から選択され、

Ｒ^{12}及びＲ^{13}が、独立に、

水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－メチル）、メトキシ；

メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、ベンジル、１－フェニルエチル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＭｅ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－メチル、メチル、メトキシ、シクロプロピル、－ＮＨ$_2$、ＮＭｅ$_2$、Ｓ－メチル、Ｓ（Ｏ）－メチル、ＳＯ$_2$－メチル、及び（ＥｔＯ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－メチル、複素環－エチル［当該複素環置換基は、オキセタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ピロリジン、モルホリン、ピラゾール、イミダゾール、１，２，４－オキサジアゾール、ピリジンからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、－ＯＨ、オキソ及びメチルからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル；

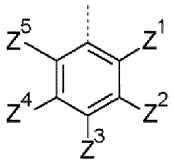
２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン、及び

オキセタン、チエタン、ピロリジン、モルホリン、テトラヒドロピラン、ピリジン及びピラゾールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、－ＯＨ、オキソ、メチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；

Ｒ^{14}が、

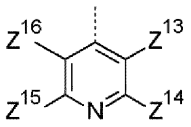
メチル、エチル、イソプロピル、ブチル、シクロペンチル、ベンジル［それらはそれ

ぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、メチル、メトキシ及びシクロペンチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
　ピロリジン及びテトラヒドロピランからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環
からなる群から選択され、
Ｒ^{15}が、
　メチル及びエチル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
　ピリジン
からなる群から選択され、
Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化２６】



(Q1)

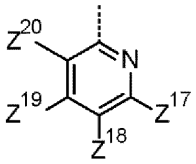
であり、
　式中、
　Ｚ^{1}及びＺ^{5}が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル及びメトキシからなる群から選択され、
　Ｚ^{2}及びＺ^{4}が、独立に水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、エチル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＮＨＭｅ、－ＮＭｅ$_{2}$、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、－ＳＭｅ及びモルホリニルからなる群から選択され、及び
　Ｚ^{3}が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ及び－ＮＭｅ$_{2}$からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化２７】



(Q4)

であり、
　式中、
　Ｚ^{13}、Ｚ^{14}、Ｚ^{15}及びＺ^{16}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ヒドロキシメチル、ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＭｅ　－ＮＭｅ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｍｅ、モルホリニルからなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化２８】



(Q5)

であり、

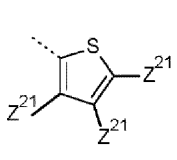
式中、

Ｚ１７、Ｚ１８、及びＺ１９が水素であり、及び

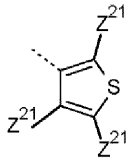
Ｚ２０が、フッ素、塩素であり、又は

Ｑが、

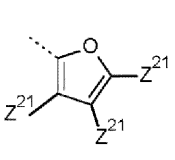
【化２９】



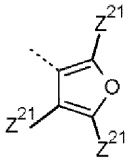
(Q6-1)



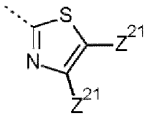
(Q6-2)



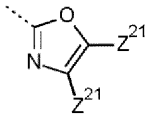
(Q6-3)



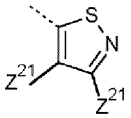
(Q6-4)



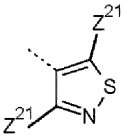
(Q6-5)



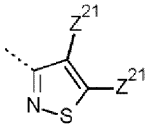
(Q6-6)



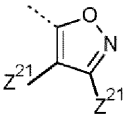
(Q6-7)



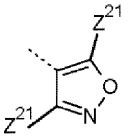
(Q6-8)



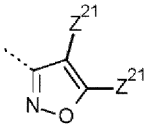
(Q6-9)



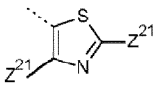
(Q6-10)



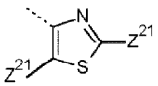
(Q6-11)



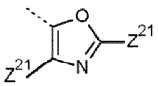
(Q6-12)



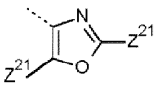
(Q6-13)



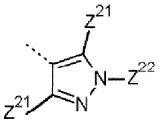
(Q6-14)



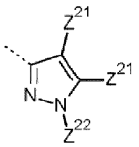
(Q6-15)



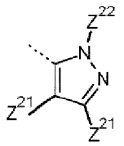
(Q6-16)



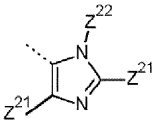
(Q6-17)



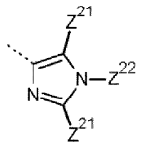
(Q6-18)



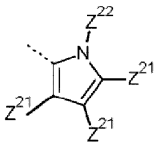
(Q6-19)



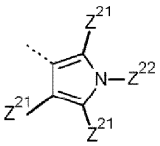
(Q6-20)



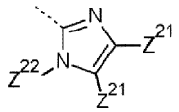
(Q6-21)



(Q6-22)



(Q6-23)



または (Q6-39)

からなる群から選択され、

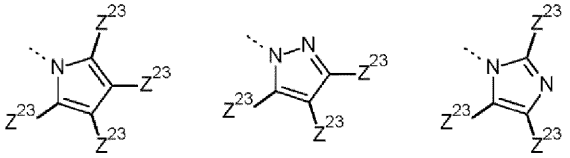
式中、

各Ｚ２１は、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、及び

Ｚ２２が、水素、メチルであり、又は

Ｑが、

【化３０】



(Q7-1) (Q7-2) (Q7-3)

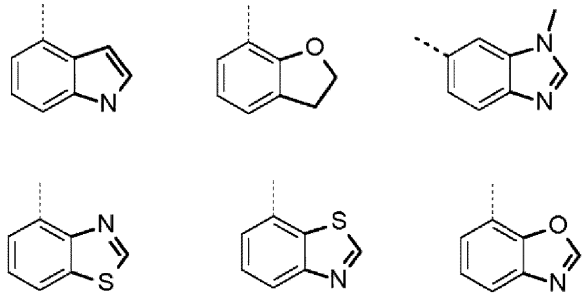
からなる群から選択され、

式中、

各Ｚ^{23}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、又は

Ｑが、

【化３１】



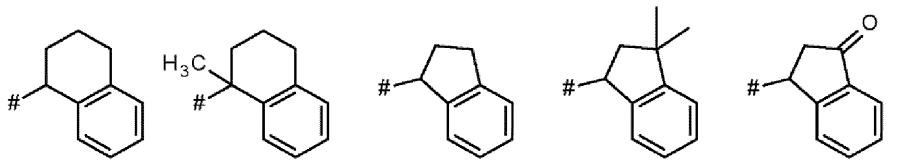
からなる群から選択される、

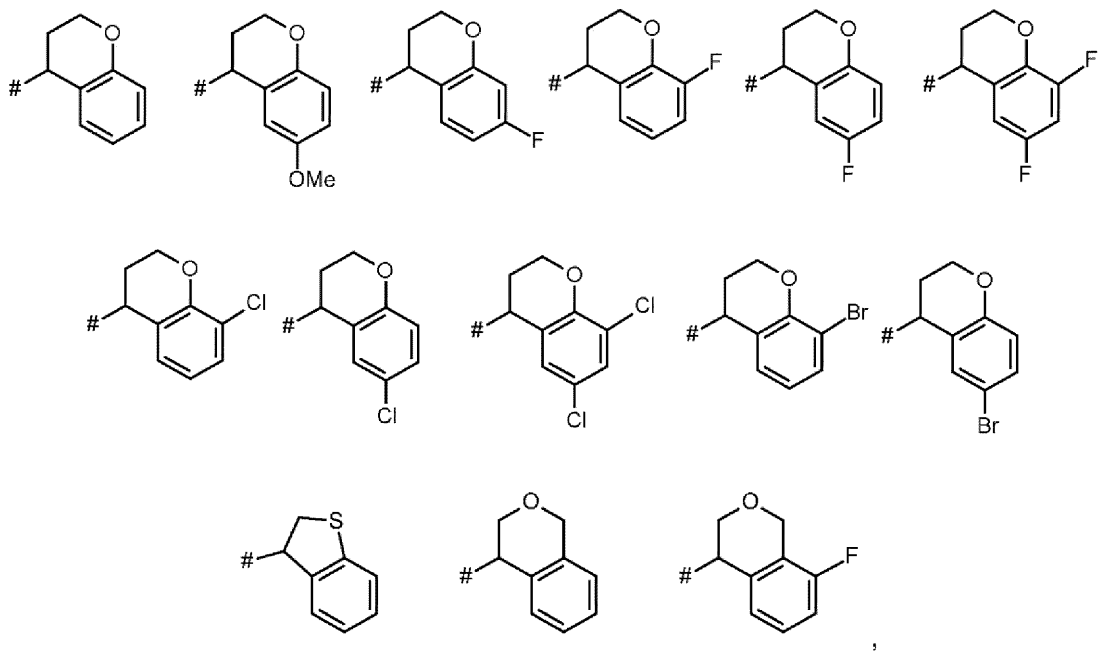
請求項１、２、３若しくは４に記載の化合物又は該化合物の立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物若しくは塩、又はそれらの混合物。

【請求項６】

Ａが、

【化３２】





からなる群から選択され、

R^1が、水素又はメチルであり、

R^2が、

塩素、ヨウ素、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（CH_3）$_2$、

－$NR^{12}R^{13}$；

－OR^{14}；

－SR^{15}、－Ｓ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}；

メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、エテニル、プロペニル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ、シアノ、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、メトキシ、NH_2、Ｎ（CH_3）$_2$、Ｎ（CH_3）（Ｃ（Ｏ）CH_3）からなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

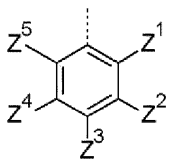
アゼチジン、オキセタン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、テトラヒドロピラン、ジヒドロ－２Ｈ－ピラン、１，２－オキサゾリジン、モルホリン、チオモルホリン、３，４－ジヒドロイソキノリン、２，３－ジヒドロ－インドール、１，３－ジヒドロ－イソインドール、３，９－ジオキサ－７－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、６－オキサ－３－アザビシクロ［３．１．１］ヘプタン、８－オキサ－３－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、チオフェン、イミダゾール、ピラゾール、１，２，３－トリアゾール、１，２，３，４－テトラゾール、ピリジン、ジヒドロピリジン、ピリミジン、テトラヒドロピリミジンからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、メチル、メチル－Ｃ（Ｏ）－、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル－、メトキシメチル－、－NH_2、－NMe_2、ピロリジンからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］からなる群から選択され、

R^3が、水素又はメチルであり、

R^4が、水素、塩素、フッ素、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R^5が、水素、塩素、フッ素、－ＯＨ、シアノ、メチル、トリフルオロメトキシ及びNH_2からなる群から選択され、

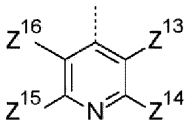
R^6が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル及びメトキシからなる群から選択され、
R^{12}及びR^{13}が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－メチル）、メトキシ；
メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、ベンジル、１－フェニルエチル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－NMe_2、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－メチル、メチル、メトキシ、シクロプロピル、－NH_2、－NMe_2、SO_2－メチル及び$(EtO)_2P$（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－メチル、複素環－エチル［当該複素環置換基は、オキセタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ピロリジン、ピラゾール、イミダゾール、１，２，４－オキサジアゾール、モルホリン、ピリジンからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にオキソ及びメチルからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル；
２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン、及び
オキセタン、モルホリン、テトラヒドロピラン、ピリジン及びピラゾールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環
からなる群から選択され；
R^{14}が、
メチル、エチル、イソプロピル、ブチル、シクロペンチル、ベンジル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、メチル、メトキシ及びシクロペンチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
ピロリジン及びテトラヒドロピランからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環
からなる群から選択され、
R^{15}が、
メチル及びエチル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
ピリジン
からなる群から選択され、
Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化３３】



(Q1)

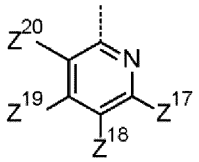
であり、
式中、
Z^1及びZ^5が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、
Z^2及びZ^4が、独立に水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、エチル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＮＨＭｅ、－NMe_2、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、－ＳＭｅ及びモルホリニルからなる群から選択され、及び
Z^3が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ及び－

ＮＭｅ$_2$からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化３４】



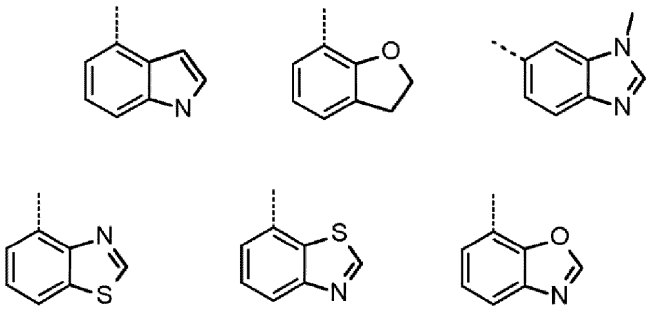
(Q4)

であり、
式中、
Ｚ^{14}及びＺ^{15}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ヒドロキシメチル、ＮＨ$_2$、モルホリニルからなる群から選択され、及び
Ｚ^{13}及びＺ^{16}が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシからなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：
【化３５】



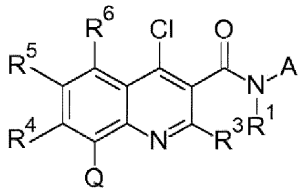
(Q5)

であり、
式中、
Ｚ^{17}、Ｚ^{18}、及びＺ^{19}が水素であり、及び
Ｚ^{20}が、フッ素であり、又は
Ｑが、
【化３６】



からなる群から選択される、
請求項１、２、３、４若しくは５に記載の化合物又は該化合物の立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物若しくは塩、又はそれらの混合物。
【請求項７】
請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、
下記一般式１Ｎの中間体化合物：

【化３７】



1N,

［Ａ、Ｒ[1]、Ｒ[3]、Ｒ[4]、Ｒ[5]、Ｒ[6]、及びＱは、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、

一般式１Ｆの化合物：

【化３８】

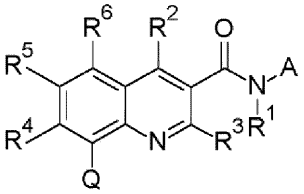
R^2H

1F,

［Ｒ[2]は、ＮＲ[12]Ｒ[13]、ＯＲ[14]、又はＳＲ[15]であり、それらはそれぞれ請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］と反応させることで、

下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化３９】

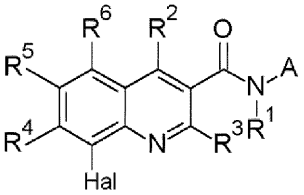


［Ａ、Ｒ[1]、Ｒ[2]、Ｒ[3]、Ｒ[4]、Ｒ[5]、Ｒ[6]、及びＱは請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を得る段階、

又は、

下記一般式１Ｔの中間体化合物：

【化４０】



1T,

［Ａ、Ｒ[1]、Ｒ[2]、Ｒ[3]、Ｒ[4]、Ｒ[5]及びＲ[6]は、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、Ｈａｌは、ハロゲン、特には塩素、臭素又はヨウ素である。］

を、

下記一般式１Ｈの化合物：

【化４１】

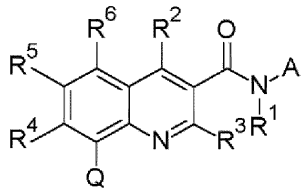
$Q\text{-}B(OR)_2$

1H,

［Ｑは、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、及び各Ｒは個々にＨ若しくはＭｅであることができるか、又は両方のＲがピナコレートである。］と反応させることで、

下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化４２】



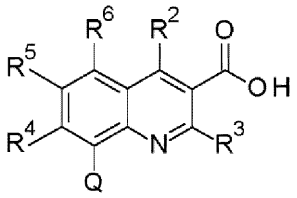
(I),

［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を得る段階、

又は

下記一般式１Ｗの中間体化合物：

【化４３】



1W,

［Ｑ、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、

下記一般式１Ｍの化合物：

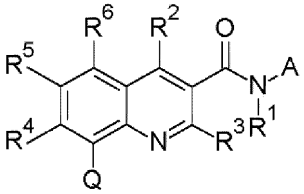
【化４４】

1M,

［Ｒ^{1}及びＡは、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］と反応させることで、

下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化４５】



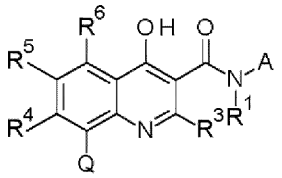
(I),

［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を得る段階、

又は

下記一般式１Ｘの中間体化合物：

【化４６】



1X,

［Ｑ、Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、

下記一般式１Ｙの化合物：

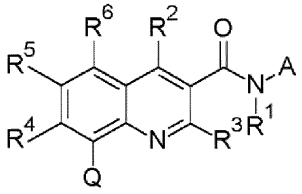
【化４７】

1Y,

［Ｒ^{2}は、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義のＯＲ^{14}である。］と反応させることで、

下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化４８】



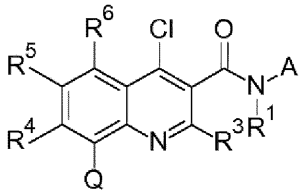
(I),

［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、及びＲ^{2}はC_1－C_4－アルコキシであり、それは請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義のように置換されていても良い。］を得る段階、

又は

下記一般式１Ｎの中間体化合物：

【化４９】



1N,

［Ｑ、Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、

下記一般式２Ａの化合物：

【化５０】

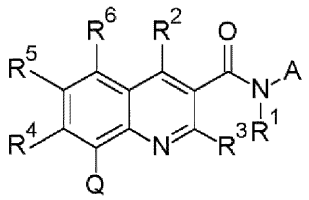
$R^2Met\text{-}X$

2A,

［Ｒ２は、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルケニル、Ｃ２－Ｃ４－アルキニル又はフェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキルであり、それらはそれぞれ請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義のように置換されていても良く、Ｍｅｔはマグネシウム又は亜鉛であり、Ｘは塩素、臭素又はヨウ素である。］と反応させることで、

下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化５１】



(I),

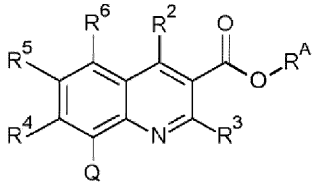
［Ａ、Ｒ１、Ｒ３、Ｒ４、Ｒ５、Ｒ６、及びＱは請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、Ｒ２は、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルケニル、Ｃ２－Ｃ４－アルキニル又はフェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキルであり、それらはそれぞれ、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義のように置換されていても良い。］を得る段階

を含む方法。

【請求項８】

下記一般式（ＩＩ）の化合物又は該化合物の立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物若しくは塩、又はそれらの混合物。

【化５２】



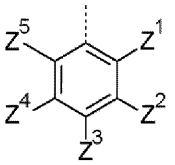
(II),

［式中、

Ｒ２は、－ＯＨであるか、又は請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

Ｒ３、Ｒ４、Ｒ５、Ｒ６は、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：



(Q1)

であり、

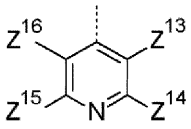
式中、

Z^1及びZ^5が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、

Z^2及びZ^4が、独立に水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、エチル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＮＨＣＨ$_3$、－Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、－ＳＣＨ$_3$及びモルホリニルからなる群から選択され、

Z^3が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ及び－Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：



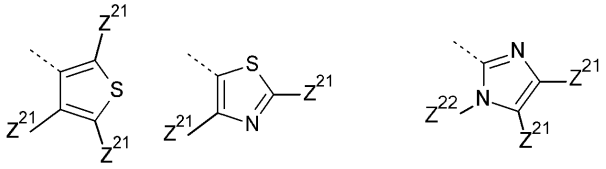
(Q4)

であり、

式中、

Z^{13}、Z^{14}、Z^{15}及びZ^{16}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ヒドロキシメチル、ＮＨ$_2$、－ＮＨＣＨ$_3$、－Ｎ（ＣＨ$_3$）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－ＣＨ$_3$、モルホリニルからなる群から選択され、又は

Ｑが、



(Q6-2) (Q6-13) 又は (Q6-39)

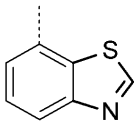
から選択され、

式中、

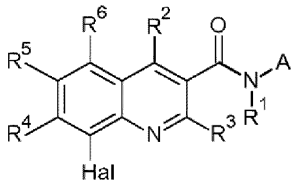
それぞれのZ^{21}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、

Z^{22}が、水素又はメチルであり、又は

Ｑが、

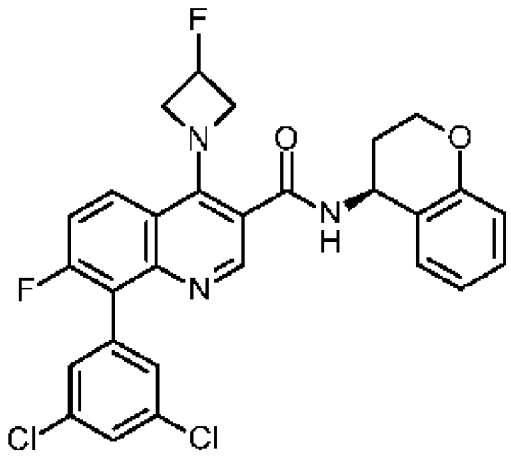


であり、
　R^Aは、Ｈ又はC_1－C_4－アルキルである。］
【請求項９】
　下記一般式（ＩＩＩ）の化合物又は該化合物の立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物若しくは塩、又はそれらの混合物。
【化５３】



(III),

［式中、
　R^2は、－ＯＨであるか、又は請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、
　Ａ、R^1、R^3、R^4、R^5、及びR^6は、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、
　Ｈａｌは、ハロゲンである。］
【請求項１０】
　疾患の防除、治療及び／又は予防で使用される、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物。
【請求項１１】
前記疾患が蠕虫感染である、請求項１０に記載の化合物。
【請求項１２】
　請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物、及び１以上の薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。
【請求項１３】
ヒト以外の疾患の防除、治療及び／又は予防のための、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物の使用。
【請求項１４】
前記疾患が蠕虫感染である、請求項１３に記載の使用。
【請求項１５】
　疾患の防除、治療及び／又は予防のための医薬製造のための、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物の使用。
【請求項１６】
　前記疾患が蠕虫感染である、請求項１５に記載の使用。
【請求項１７】
　駆虫薬的に有効量の少なくとも一つの請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物を、それを必要とする非ヒト動物に投与することにより、非ヒト動物での蠕虫感染を防除する方法。
【請求項１８】
　式（Ｉ－ａ）

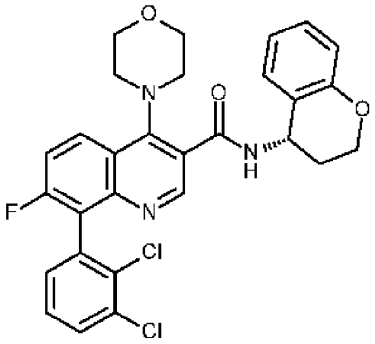


(I－a)

の化合物である、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物。

【請求項１９】

式（Ｉ－ｂ）

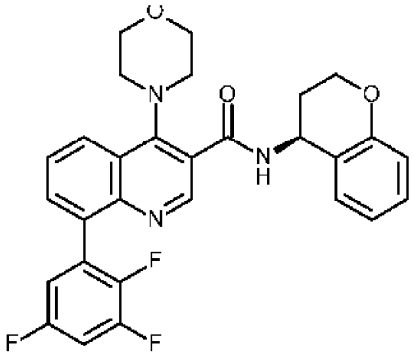


(I－b)

の化合物である、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物。

【請求項２０】

式（Ｉ－ｃ）

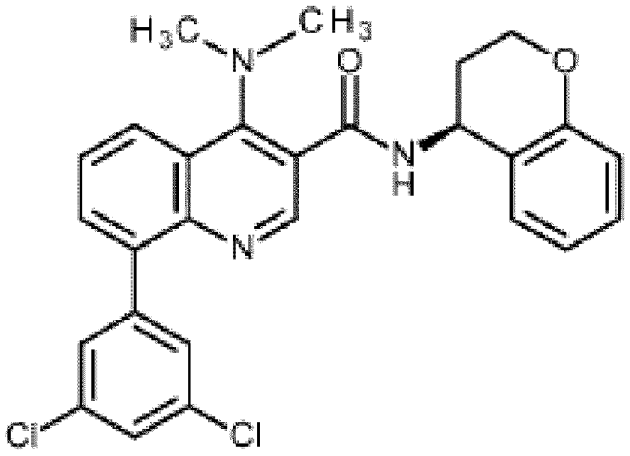


(I－c)

の化合物である、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物。

【請求項２１】

式（Ｉ－ｄ）



(Ｉ－ｄ)

の化合物である、請求項１～６のいずれか１項に記載の一般式（Ｉ）の化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【０００１】

本発明は、本明細書で記載及び定義される一般式（Ｉ）の新規なキノリン誘導体、前記化合物の製造方法、前記化合物、前記化合物を含む医薬組成物及び組み合わせの製造に有用な中間体化合物、及び疾患の防除、治療及び／又は予防のための、特には動物及びヒトでの蠕虫による感染、詳細には消化管及び腸外線虫による感染の防除、治療及び／又は予防のための医薬組成物を製造するための前記化合物の使用、そのような化合物を含む製剤並びに単独薬剤としての又は他の有効成分と組み合わせての動物及びヒトでの蠕虫による感染、詳細には消化管及び腸外線虫による感染の防除、治療及び／又は予防方法を包含するものである。

【背景技術】

【０００２】

全ての市販の駆虫薬に対する抵抗性の発生は、動物薬の分野において大きい問題となりつつあるように思われる。線虫防除を管理するために駆虫薬を大規模に使用することで、非常に抵抗性の強い蠕虫群が顕著に選択される結果となった。従って、全ての駆虫薬類に対する抵抗性が蔓延することで、ウシ、ヤギ、ヒツジ及びウマにおける効果的な蠕虫防除が脅威に曝されている。さらに、イヌでのイヌ糸状虫病の予防が奏功するか否かは、現在のところ、専ら大環状ラクトン系の使用にかかっているが、複数の大環状ラクトン類における効力喪失が米国の一部地域について、特に犬糸状虫感染の問題が大きい区域で報告されていることから、それは危険な状態にある。最後に、低地ミシシッピデルタでの圃場効力喪失の疑いのある症例からの犬糸状虫（Ｄｉｒｏｆｉｌａｒｉａ　ｉｍｍｉｔｉｓ）幼虫を用いた実験的感染研究により、大環状ラクトン抵抗性の存在を示すイン・ビボの確証が得られた。

【０００３】

駆虫薬に対するヒト蠕虫の抵抗性は現時点では希であると思われるが、前述の獣医学分野での駆虫薬抵抗性の蔓延について、ヒト蠕虫病（ｈｅｌｍｉｎｔｈｏｓｉｓ）の治療でも考慮する必要がある。フィラリア症に対する持続的過小投与治療によって、非常に抵抗性の高い遺伝子型が生じ得るものであり、ある種の駆虫薬（例えば、プラジカンテル、ベンゾイミダゾール及びニクロサミド）に関して抵抗性が既に報告されている。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【０００４】

従って、新たな分子作用機序を有する抵抗性打破性駆虫薬が至急必要とされている。

【０００５】

本発明の目的は、好ましくは、処理を受ける生物に対して有害な毒性効果を持たずに、動物及びヒトにおける蠕虫による感染の防除、治療及び／又は予防のための、特には比較的低用量で、広スペクトルの蠕虫に対して満足な若しくは改良された駆虫薬活性を有する、医学分野、特別には獣医学分野で駆虫薬として使用することが可能な化合物を提供することにある。

【０００６】

ある種のキノリンカルボキサミド類が、ＪＰ２００８－２１４３２３Ａにおいて、皮膚疾患、例えば尋常性座瘡、皮膚炎などの治療及び／又は予防に好適な薬剤として記載されている。

【０００７】

ＷＯ２０１７１０３８５１には、アテローム性動脈硬化症、乾癬、副鼻腔炎、及びデュシェンヌ型筋ジストロフィーの治療に有用なＨ－ＰＧＤＳ阻害薬としてのキノリン－３－カルボキサミド類が開示されている。

【０００８】

しかしながら、最新技術には、本明細書で記載及び定義されている本発明の一般式（Ｉ）の新規なキノリン誘導体についての記載はない。

【０００９】

本発明の化合物が驚くべき及び有利な特性を有することが見出され、それが本発明の基礎をなしている。

【００１０】

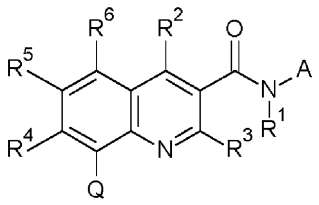
特に、本発明の化合物は、驚くべきことに、線虫のＳｌｏ－１カルシウム依存性カリウムチャンネルと効果的に相互作用することが認められている。この相互作用は、特には消化管線虫、自由生息線虫及びフィラリアの麻痺／阻害を達成することを特徴とするものであり、そのデータについては生物実験の部に記載している。従って、本発明の化合物は、消化管及び腸外蠕虫感染、特にはフィラリアなどの線虫による消化管及び腸外感染の防除、治療及び／又は予防のための駆虫薬として用いることができる。

【課題を解決するための手段】

【００１１】

第１の態様によれば、本発明は、下記一般式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含するものである。

【化１】



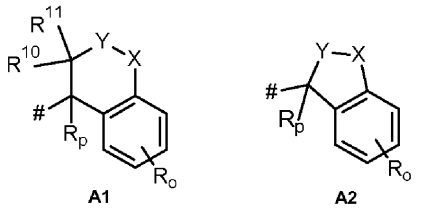
(I)

【００１２】

式中、

Ａは、Ａ１又はＡ２：

【化２】



【００１３】

であり、

ｏは、０、１、２、３又は４であり、

Ｒは、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、

Ｒｐは、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｘ、Ｙは、独立にＣＲ７Ｒ８、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ９からなる群から選択され、ここで、Ｘ及びＹの少なくとも一つが、ＣＲ７Ｒ８であり、又は

Ｘ、Ｙが一緒に、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ９－、－Ｓ（Ｏ）－ＮＲ９－、－ＳＯ２－ＮＲ９－及び－ＳＯ２－Ｏ－からなる群から選択される環員を形成しており、

Ｒ１は、

水素、シアノ、－ＣＨＯ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ３－Ｃ６－ハロゲノシクロアルキル、Ｃ３－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ４－アルキニル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ３－アルキル、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＮＨ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、ＮＨ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－ＮＨ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２Ｎ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、ベンジルオキシ－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル；

フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有する

Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］からなる群から選択され、

Ｒ２は、

水素、ハロゲン、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２；

－ＮＲ１２Ｒ１３；

－ＯＲ１４；

－ＳＲ１５、－Ｓ（Ｏ）Ｒ１５、－ＳＯ２Ｒ１５；

Ｃ１－Ｃ６－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルケニル、Ｃ２－Ｃ４－アルキニル又はフェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル［これは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリー

ル及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ３は、水素又はＣ１－Ｃ４－アルキルであり、

Ｒ４は、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ５は、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ，Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ６は、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ７は、水素、－ＯＨ、フッ素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ８は、水素、－ＯＨ、フッ素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

又は、Ｒ７及びＲ８は一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、

又は、Ｒ７及びＲ８は、それらが結合している炭素原子とともに、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル及び３～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される３～６員環を形成しており、

Ｒ９は、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ１０は、水素、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ１１は、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択

され、
又は、R^{10}及びR^{11}は、それらが結合している炭素原子とともに、C_3－C_6－シクロアルキル及び３～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される３～６員環を形成しており、
R^{12}及びR^{13}は、独立に、
水素、－ＯＨ、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルコキシ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－；
C_1－C_4－アルキル、C_3－C_6－シクロアルキル、フェニル－C_1－C_4－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び（C_1－C_4－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－C_1－C_4－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、ヒドロキシ－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル、ベンゾ－C_5－C_6－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）

－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ^{14}は、

－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$；

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、フェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル［それは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン

、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ１５は、

水素；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル［それは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールから

なる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｑは、６員若しくは１０員アリール及び５～１０員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、ハロゲン、ＳＦ５、シアノ、－ＣＨＯ、ニトロ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－ヒドロキシアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（ＳＯ２－［Ｃ１－Ｃ４－アルキル］）（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシイミノ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、４～６員複素環［それは、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－ＣＨ２－Ｏ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、４～６員複素環（自体が、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基で置換されていても良い。）で置換されているメチル、－ＣＨ２－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良く、

ここで、ＹがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ９である場合、Ｒ７、Ｒ８、Ｒ１０及びＲ１１のいずれも－ＯＨではなく、及びここで、ＸがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ９である場合、Ｒ７及びＲ８のいずれも－ＯＨではない。

【発明を実施するための形態】

【００１４】

定義

「置換された」という用語は、指定の原子若しくは基上の１以上の水素原子が、指定の基から選択されるものによって置き換わっていることを意味するが、ただし、現状下で、指定の原子の通常の価数を超えるものではない。置換基及び／又は可変要素の組み合わせが許容される。

【００１５】

「置換されていても良い」という用語は、置換基の数がゼロに等しいかゼロ以外であることができることを意味する。別段の断りがない限り、置換されていても良い基は、いずれか利用可能な炭素若しくは窒素原子上で水素原子に代えて非水素置換基とすることで収

容できるだけの数の適宜の置換基によって置換されていても良い。通常、適宜の置換基（存在する場合）の数は、１、２、３、４又は５、特には１、２又は３であることができる。

【００１６】

本明細書で使用される場合、「１以上」という用語は、例えば本発明の一般式（Ｉ）の化合物の置換基の定義において「１、２、３、４又は５、特には１、２、３又は４、詳細には１、２又は３、更に詳細には１又は２」を意味する。

【００１７】

本明細書で使用される場合、オキソ置換基は、二重結合を介して炭素原子又は硫黄原子に結合している酸素原子を表す。

【００１８】

「環置換基」という用語は、環上の利用可能な水素原子に置き換わる芳香環若しくは非芳香環に結合した置換基を意味する。

【００１９】

複合置換基が複数部分から構成される場合、例えば（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）－の場合、ある部分の位置は、前記複合置換基のいずれか好適な位置にあることが可能である。すなわち、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ部分は、前記（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）－基のＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル部分のいずれかの炭素原子に結合していることができる。そのような複合置換基の開始点又は終端にあるハイフンは、前記複合置換基の分子の残りの部分への結合箇所を示すものである。炭素原子及び適宜に例えば窒素、酸素若しくは硫黄原子などの１硫黄のヘテロ原子を含む環が置換基で置換されている場合、前記置換基は前記環のいずれか好適な位置で結合していることが可能であり、それは好適な炭素原子及び／又は好適なヘテロ原子に結合している。

【００２０】

本明細書で使用される場合、個々の置換基が分子の残り部分に連結される位置は、描かれた構造において、前記置換基でハッシュマーク（＃）又は点線によって描くことができる。

【００２１】

本明細書で使用される場合、「含む」という用語は、「からなる」を包含するものである。

【００２２】

本明細書の範囲内において、いずれかの項目が「本明細書で言及の」と称される場合、それは、それが本明細書のいずれかの箇所で言及され得ることを意味している。

【００２３】

本明細書において言及される用語は、次の意味を有する。

【００２４】

「ハロゲン原子」という用語は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素原子、特にはフッ素、塩素又は臭素原子を意味する。

【００２５】

「Ｃ$_1$－Ｃ$_6$－アルキル」という用語は、１、２、３、４、５若しくは６個の炭素原子を有する直鎖若しくは分岐の飽和１価炭化水素基を意味する。「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」という用語は、１、２、３若しくは４個の炭素原子を有する直鎖若しくは分岐の飽和１価炭化水素基を意味し、例えばメチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、ｓｅｃ－ブチル、イソブチル若しくはｔｅｒｔ－ブチル基、又はそれの異性体である。特に、前記基は、１、２若しくは３個の炭素原子を有し（「Ｃ$_1$－Ｃ$_3$－アルキル」）、例えばメチル、エチル、ｎ－プロピル又はイソプロピル基である。

【００２６】

「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ヒドロキシアルキル」という用語は、直鎖若しくは分岐の飽和１価炭化水素基であって、「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」という用語が上記で定義の通りであり、１個若しくは２個の水素原子がヒドロキシ基で置き換わっているものを意味し、例えばヒドロキシメチル、１－ヒドロキシエチル、２－ヒドロキシエチル、１，２－ジヒドロキシエチ

ル、３－ヒドロキシプロピル、２－ヒドロキシプロピル、１－ヒドロキシプロピル、１－ヒドロキシプロパン－２－イル、２－ヒドロキシプロパン－２－イル、２，３－ジヒドロキシプロピル、１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル、３－ヒドロキシ－２－メチル－プロピル、２－ヒドロキシ－２－メチル－プロピル、１－ヒドロキシ－２－メチル－プロピル基である。

【００２７】

「－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）」又は「－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$」という用語は、直鎖若しくは分岐の飽和１価基であって、「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」という用語が上記で定義の通りであるものを意味し、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、ｎ－プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ、Ｎ－メチル－Ｎ－エチルアミノ又はＮ，Ｎ－ジエチルアミノ基である。

【００２８】

「－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」、「－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」又は「－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」という用語は、直鎖若しくは分岐の飽和基であって、「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」という用語が上記で定義の通りであるものを意味し、例えばメチルスルファニル、エチルスルファニル、ｎ－プロピルスルファニル、イソプロピルスルファニル、ｎ－ブチルスルファニル、ｓｅｃ－ブチルスルファニル、イソブチルスルファニル又はｔｅｒｔ－ブチルスルファニル基、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、ｎ－プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、ｎ－ブチルスルフィニル、ｓｅｃ－ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル又はｔｅｒｔ－ブチルスルフィニル基、又はメチルスルホニル、エチルスルホニル、ｎ－プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ｎ－ブチルスルホニル、ｓｅｃ－ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル又はｔｅｒｔ－ブチルスルホニル基である。

【００２９】

「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル」という用語は、直鎖若しくは分岐の飽和１価炭化水素基であって、「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」という用語が上記で定義の通りであり、１以上の水素原子が、ハロゲン原子によって同一若しくは異なって置き換わっているものを意味する。特に、前記ハロゲン原子はフッ素原子である。詳細には、全ての前記ハロゲン原子がフッ素原子である（「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－フルオロアルキル」）。前記Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル基は、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、２－フルオロエチル、２，２－ジフルオロエチル、２，２，２－トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、３，３，３－トリフルオロプロピル又は１，３－ジフルオロプロパン－２－イルである。

【００３０】

「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ」という用語は、式（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）－Ｏ－の直鎖若しくは分岐の飽和１価基であって、「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル」という用語が上記で定義の通りであるものを意味し、例えばメトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ、イソプロポキシ、ｎ－ブトキシ、ｓｅｃ－ブトキシ、イソブトキシ又はｔｅｒｔ－ブトキシ基、又はそれの異性体である。

【００３１】

「Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ」という用語は、１以上の水素原子がハロゲン原子で同一又は異なって置き換わっている上記で定義の直鎖若しくは分岐の飽和１価Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ基を意味する。特に、前記ハロゲン原子はフッ素原子である。前記Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ基は、例えばフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、２，２，２－トリフルオロエトキシ又はペンタフルオロエトキシである。

【００３２】

「Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルケニル」という用語は、１個の二重結合を含み、２、３若しくは４個の炭素原子を有する直鎖若しくは分岐の１価炭化水素基を意味する。前記Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルケニル基は、例えば、エテニル（又は「ビニル」）、プロパ－２－エン－１－イル（又は「アリル」）、プロパ－１－エン－１－イル、ブタ－３－エンイル、ブタ－２－エン

イル、ブタ－１－エンイル、プロパ－１－エン－２－イル（又は「イソプロペニル」）、２－メチルプロパ－２－エンイル、１－メチルプロパ－２－エンイル、２－メチルプロパ－１－エンイル又は１－メチルプロパ－１－エンイル基である。特に、前記基はアリルである。

【００３３】

「Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルキニル」という用語は、１個の三重結合を含み、２、３若しくは４個の炭素原子を含む直鎖１価炭化水素基を意味する。前記Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルキニル基は、例えば、エチニル、プロパ－１－インイル、プロパ－２－インイル（又は「プロパルギル」）、ブタ－１－インイル、ブタ－２－インイル、ブタ－３－インイル又は１－メチルプロパ－２－インイル基である。特に、前記アルキニル基は、プロパ－１－インイル又はプロパ－２－インイルである。

【００３４】

「Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル」という用語は、３、４、５若しくは６個の炭素原子を含む飽和１価単環式炭化水素環を意味する（「Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル」）。前記Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル基は、例えば単環式炭化水素環であり、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はシクロヘキシル基である。

【００３５】

「Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－ハロゲノシクロアルキル」という用語は、飽和１価単環式炭化水素環であって、「Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル」という用語が上記で定義の通りであり、１以上の水素原子がハロゲン原子によって同一又は異なって置き換わっているものを意味する。特に、前記ハロゲン原子はフッ素又は塩素原子である。前記Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－ハロゲノシクロアルキル基は例えば、１個若しくは２個のフッ素又は塩素原子で置換されている単環式炭化水素環であり、例えば１－フルオロ－シクロプロピル、２－フルオロシクロプロピル、２，２－ジフルオロシクロプロピル、２，３－ジフルオロシクロプロピル、１－クロロシクロプロピル、２－クロロシクロプロピル、２，２－ジクロロシクロプロピル、２，３－ジクロロシクロプロピル、２－フルオロ－２－クロロシクロプロピル及び２－フルオロ－３－クロロシクロプロピル基である。

【００３６】

「ベンゾ－Ｃ$_5$－Ｃ$_6$－シクロアルキル」という用語は、５個若しくは６個の炭素原子を含む飽和一価単環式炭化水素環（「Ｃ$_5$－Ｃ$_6$－シクロアルキル」）がフェニル環に縮環している一価の二環式炭化水素環を意味する。当該ベンゾ－Ｃ$_5$－Ｃ$_6$－シクロアルキル基は、例えば、二環式炭化水素環、例えばインダン（即ち２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン）又はテトラリン（例えば１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン）基である。

【００３７】

「スピロシクロアルキル」という用語は、飽和の一価二環式炭化水素基であって、２個の環が共通の環炭素原子を共有し、前記二環式炭化水素基が５、６、７、８、９、１０若しくは１１個の炭素原子を含み、前記スピロシクロアルキル基が、スピロ炭素原子以外の炭素原子のいずれか一つを介して分子の残り部分に結合していることができるものを意味する。前記スピロシクロアルキル基は、例えば、スピロ［２．２］ペンチル、スピロ［２．３］ヘキシル、スピロ［２．４］ヘプチル、スピロ［２．５］オクチル、スピロ［２．６］ノニル、スピロ［３．３］ヘプチル、スピロ［３．４］オクチル、スピロ［３．５］ノニル、スピロ［３．６］デシル、スピロ［４．４］ノニル、スピロ［４．５］デシル、スピロ［４．６］ウンデシル又はスピロ［５．５］ウンデシルである。

【００３８】

「ヘテロシクロアルキル」という用語は、シリーズＮ、Ｏ及びＳからの１個若しくは２個の同一若しくは異なる環ヘテロ原子を含む、合計で４、５、６、７、８、９若しくは１０個の環原子を有する単環式又は二環式、飽和若しくは部分飽和複素環（「４～１０員ヘテロシクロアルキル」基）、特には４、５若しくは６個の環原子を有する単環式又は二環式、飽和若しくは部分飽和複素環（「４～６員ヘテロシクロアルキル」基）を意味し、前記ヘテロシクロアルキル基は、炭素原子又は存在する場合は窒素原子のいずれか一つを介

して分子の残り部分に結合していることができる。
【００３９】
前記ヘテロシクロアルキル基は、４員環、例えばアゼチジニル、オキセタニル若しくはチエタニル；又は５員環、例えばテトラヒドロフラニル、オキソラニル、１，３－ジオキソラニル、チオラニル、ピロリジニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、１，１－ジオキシドチオラニル、１，２－オキサゾリジニル、１，３－オキサゾリジニル、１，３－チアゾリジニル若しくは１，２，４－トリアゾリジニル；又は６員環、例えばテトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペリジニル、モルホリニル、ジチアニル、チオモルホリニル、ピペラジニル、オキサニル、１，３－ジオキサニル、１，４－ジオキサニル又は１，２－オキサジナニル、又は７員環、例えばアゼパニル、１，４－ジアゼパニル又は１，４－オキサゼパニル；又は二環式７員環、例えば６－オキサ－３－アザビシクロ［３．１．１］ヘプタン；又は二環式８員環、例えば５，６－ジヒドロ－４Ｈ－フロ［２，３－ｃ］ピロール又は８－オキサ－３－アザビシクロ［３．２．１］オクタン；又は二環式９員環、例えばオクタヒドロ－１Ｈ－ピロロ［３，４－ｂ］ピリジン、１，３－ジヒドロ－イソインドール、２，３－ジヒドロ－インドール又は３，９－ジオキサ－７－アザビシクロ［３．３．１］ノナン；又は二環式１０員環、例えばデカヒドロキノリン又は３，４－ジヒドロイソキノリンであることができるが、これらに限定されるものではない。
【００４０】
「ヘテロスピロシクロアルキル」という用語は、合計６、７、８、９、１０若しくは１１個の環原子を有する二環式飽和複素環であって、その二つの環が１個の共通の環炭素原子を共有しているものを意味し、「ヘテロスピロシクロアルキル」は、シリーズＮ、Ｏ、Ｓからの１個若しくは２個の同一若しくは異なる環ヘテロ原子を含み；前記ヘテロスピロシクロアルキル基は、スピロ炭素原子以外の炭素原子又は存在する場合は窒素原子のうちのいずれか１個を介して分子の残り部分に結合していることができる。
【００４１】
前記ヘテロスピロシクロアルキル基は、例えば、アザスピロ［２．３］ヘキシル、アザスピロ［３．３］ヘプチル、オキサアザスピロ［３．３］ヘプチル、チアアザスピロ［３．３］ヘプチル、オキサスピロ［３．３］ヘプチル、オキサアザスピロ［５．３］ノニル、オキサアザスピロ［４．３］オクチル、オキサアザスピロ［２．５］オクチル、アザスピロ［４．５］デシル、オキサアザスピロ［５．５］ウンデシル、ジアザスピロ［３．３］ヘプチル、チアアザスピロ［３．３］ヘプチル、チアアザスピロ［４．３］オクチル、アザスピロ［５．５］ウンデシル、又はスピロ［３．４］－、スピロ［４．４］－、スピロ［２．４］－、スピロ［２．５］－、スピロ［２．６］－、スピロ［３．５］－、スピロ［３．６］－、スピロ［４．５］－及びスピロ［４．６］－などのさらなる相同的骨格のうちの一つである。
【００４２】
「６員若しくは１０員のアリール」という用語は、６又は１０個の炭素環原子を有する１価の単環式若しくは二環式芳香環を意味し、例えばフェニル又はナフチル基である。
【００４３】
「ヘテロアリール」という用語は、５、６、９若しくは１０個の環原子（「５～１０員ヘテロアリール」基）、特には５若しくは６個の環原子（「５～６員のヘテロアリール」基）を有する１価の単環式、二環式若しくは三環式芳香環であって、少なくとも１個の環ヘテロ原子及び適宜に一連のＮ、Ｏ及び／又はＳからの１個、２個若しくは３個のさらなる環ヘテロ原子を含み、環炭素原子を介して、又は適宜に環窒素原子（価数によって許容される場合）を介して結合しているものを意味する。
【００４４】
前記ヘテロアリール基は、５員ヘテロアリール基、例えば、チエニル、フラニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル若しくはテトラゾリル；又は６員ヘテロアリール基、例えばピリジニル、ジヒドロピリジニル、ピリダジニル、ピ

リミジニル、テトラヒドロピリミジニル、ピラジニル又はトリアジニルであることができる。

【００４５】

「複素環」という用語は、ヘテロシクロアルキル及びヘテロアリールからなる群から選択される複素環を意味する。特に、「４～６員複素環」という用語は、４～６員ヘテロシクロアルキル及び５～６員ヘテロアリールからなる群から選択される複素環を意味する。

【００４６】

概して、及び別段の断りがない限り、ヘテロアリール又はヘテロアリーレン基は、それの全ての可能な異性体型、例えば互変異体及び分子の残りの部分への連結箇所に関しての位置異性体を含む。従って、いくつかの例示的な非限定的例を挙げると、ピリジニルという用語は、ピリジン－２－イル、ピリジン－３－イル及びピリジン－４－イルを含み；又はチエニルという用語は、チエン－２－イル及びチエン－３－イルを含む。

【００４７】

例えば「C_1－C_4－アルキル」、「C_1－C_4－ハロゲノアルキル」、「C_1－C_4－ヒドロキシアルキル」、「C_1－C_4－アルコキシ」又は「C_1－C_4－ハロゲノアルコキシ」の定義の文脈で、本明細書で使用される場合の「C_1－C_4」という用語は、１～４個の有限数の炭素原子、すなわち１、２、３若しくは４個の炭素原子を有するアルキル基を意味する。

【００４８】

さらに、本明細書で使用される場合、例えば「C_3－C_6－シクロアルキル」又はC_3－C_6－ハロゲノシクロアルキルの定義の文脈で、本明細書において使用される場合の「C_3－C_6」という用語は、３～６の有限数の炭素原子、すなわち３、４、５若しくは６個の炭素原子を有するシクロアルキル基を意味する。

【００４９】

ある範囲の値が提供されている場合、その範囲は、その範囲内の各値及び下位範囲を包含するものである。

【００５０】

例えば：

「C_1－C_4」は、C_1、C_2、C_3、C_4、C_1－C_4、C_1－C_3、C_1－C_2、C_2－C_4、C_2－C_3、及びC_3－C_4を包含し；

「C_2－C_6」は、C_2、C_3、C_4、C_5、C_6、C_2－C_6、C_2－C_5、C_2－C_4、C_2－C_3、C_3－C_6、C_3－C_5、C_3－C_4、C_4－C_6、C_4－C_5、及びC_5－C_6を包含し；

「C_3－C_4」は、C_3、C_4、及びC_3－C_4を包含し；

「C_3－C_{10}」は、C_3、C_4、C_5、C_6、C_7、C_8、C_9、C_{10}、C_3－C_{10}、C_3－C_9、C_3－C_8、C_3－C_7、C_3－C_6、C_3－C_5、C_3－C_4、C_4－C_{10}、C_4－C_9、C_4－C_8、C_4－C_7、C_4－C_6、C_4－C_5、C_5－C_{10}、C_5－C_9、C_5－C_8、C_5－C_7、C_5－C_6、C_6－C_{10}、C_6－C_9、C_6－C_8、C_6－C_7、C_7－C_{10}、C_7－C_9、C_7－C_8、C_8－C_{10}、C_8－C_9及びC_9－C_{10}を包含し；

「C_3－C_8」は、C_3、C_4、C_5、C_6、C_7、C_8、C_3－C_8、C_3－C_7、C_3－C_6、C_3－C_5、C_3－C_4、C_4－C_8、C_4－C_7、C_4－C_6、C_4－C_5、C_5－C_8、C_5－C_7、C_5－C_6、C_6－C_8、C_6－C_7及びC_7－C_8を包含し；

「C_3－C_6」は、C_3、C_4、C_5、C_6、C_3－C_6、C_3－C_5、C_3－C_4、C_4－C_6、C_4－C_5、及びC_5－C_6を包含し；

「C_4－C_8」は、C_4、C_5、C_6、C_7、C_8、C_4－C_8、C_4－C_7、C_4－C_6、C_4－C_5、C_5－C_8、C_5－C_7、C_5－C_6、C_6－C_8、C_6－C_7及びC_7－C_8を包含し；

「C_4－C_7」は、C_4、C_5、C_6、C_7、C_4－C_7、C_4－C_6、C_4－C_5、C_5－C_7、C_5－C_6及びC_6－C_7を包含し；

「Ｃ４－Ｃ６」は、Ｃ４、Ｃ５、Ｃ６、Ｃ４－Ｃ６、Ｃ４－Ｃ５及びＣ５－Ｃ６を包含し；
「Ｃ５－Ｃ１０」は、Ｃ５、Ｃ６、Ｃ７、Ｃ８、Ｃ９、Ｃ１０、Ｃ５－Ｃ１０、Ｃ５－Ｃ９、Ｃ５－Ｃ８、Ｃ５－Ｃ７、Ｃ５－Ｃ６、Ｃ６－Ｃ１０、Ｃ６－Ｃ９、Ｃ６－Ｃ８、Ｃ６－Ｃ７、Ｃ７－Ｃ１０、Ｃ７－Ｃ９、Ｃ７－Ｃ８、Ｃ８－Ｃ１０、Ｃ８－Ｃ９及びＣ９－Ｃ１０を包含し；
「Ｃ６－Ｃ１０」は、Ｃ６、Ｃ７、Ｃ８、Ｃ９、Ｃ１０、Ｃ６－Ｃ１０、Ｃ６－Ｃ９、Ｃ６－Ｃ８、Ｃ６－Ｃ７、Ｃ７－Ｃ１０、Ｃ７－Ｃ９、Ｃ７－Ｃ８、Ｃ８－Ｃ１０、Ｃ８－Ｃ９及びＣ９－Ｃ１０を包含する。

【００５１】

本明細書で使用される場合、「脱離基」という用語は、結合電子を一緒に取り込む安定化学種として化学反応で置き換えられる原子又は原子群を意味する。特に、そのような脱離基は、ハライド、特にはフッ化物、塩化物、臭化物若しくはヨウ化物、（メチルスルホニル）オキシ、［（トリフルオロメチル）スルホニル］オキシ、［（ノナフルオロブチル）スルホニル］オキシ、（フェニルスルホニル）オキシ、［（４－メチルフェニル）スルホニル］オキシ、［（４－ブロモフェニル）スルホニル］オキシ、［（４－ニトロフェニル）スルホニル］オキシ、［（２－ニトロフェニル）スルホニル］オキシ、［（４－イソプロピルフェニル）スルホニル］オキシ、［（２，４，６－トリイソプロピルフェニル）スルホニル］オキシ、［（２，４，６－トリメチルフェニル）スルホニル］オキシ、［（４－ｔｅｒｔ－ブチルフェニル）スルホニル］オキシ及び［（４－メトキシフェニル）スルホニル］オキシを含む群から選択される。

【００５２】

本発明の文脈におけるオキソ置換基は、二重結合を介して炭素原子に結合している酸素原子を意味する。

【００５３】

一般式（Ｉ）の化合物が同位体型として存在することが可能である。従って本発明は、一般式（Ｉ）の化合物の１以上の同位体型、特には一般式（Ｉ）の重水素含有化合物を含む。

【００５４】

化合物又は試薬の「同位体型」という用語は、そのような化合物を構成する同位体の１以上の不自然な割合を示す化合物と定義される。

【００５５】

「一般式（Ｉ）の化合物の同位体型」という用語は、そのような化合物を構成する同位体の１以上の不自然な割合を示す一般式（Ｉ）の化合物と定義される。

【００５６】

「不自然な割合」という表現は、天然の存在比より高いそのような同位体の割合を意味する。この文脈で適用される同位体の天然存在比は、″Ｉｓｏｔｏｐｉｃ Ｃｏｍｐｏｓｉｔｉｏｎｓ ｏｆ ｔｈｅ Ｅｌｅｍｅｎｔｓ １９９７″，Ｐｕｒｅ Ａｐｐｌ．Ｃｈｅｍ．，７０（１），２１７－２３５，１９９８に記載されている。

【００５７】

そのような同位体の例には、水素、炭素、窒素、酸素、リン、硫黄、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素の安定且つ放射性同位体、例えばそれぞれ^{2}Ｈ（重水素）、^{3}Ｈ（三重水素）、^{11}Ｃ、^{13}Ｃ、^{14}Ｃ、^{15}Ｎ、^{17}Ｏ、^{18}Ｏ、^{32}Ｐ、^{33}Ｐ、^{33}Ｓ、^{34}Ｓ、^{35}Ｓ、^{36}Ｓ、^{18}Ｆ、^{36}Ｃｌ、^{82}Ｂｒ、^{123}Ｉ、^{124}Ｉ、^{125}Ｉ、^{129}Ｉ及び^{131}Ｉなどがある。

【００５８】

本明細書で指定の障害の治療及び／又は予防に関して、一般式（Ｉ）の化合物の同位体型は好ましくは、重水素を含む（「一般式（Ｉ）の重水素含有化合物」）。１以上の放射性同位体、例えば^{3}Ｈ又は^{14}Ｃが組み込まれた一般式（Ｉ）の化合物の同位体型が、例えば、薬剤及び／又は基質組織分布研究において有用である。これらの同位体は、それの組み込みの容易さ及び検出性のために特に好ましい。^{18}Ｆ又は^{11}Ｃなどの陽電子放出同位

体を、一般式（Ｉ）の化合物に組み込むことができる。一般式（Ｉ）の化合物のこれらの同位体型は、イン・ビボ撮像用途において有用である。一般式（Ｉ）の重水素含有及び^{13}Ｃ含有化合物を、前臨床又は臨床試験の文脈での質量分析で用いることができる。

【００５９】

一般式（Ｉ）の化合物の同位体型は、通常、試薬に代えて前記試薬の同位体型を用いることで、好ましくは重水素含有試薬を用いることで、本明細書における図式及び／又は実施例に記載のものなどの、当業者に公知の方法によって製造することができる。所望の重水素化部位に応じて、一部の場合で、D_2Oからの重水素を、化合物に直接、又はそのような化合物を合成するのに有用な試薬に組み込むことができる。重水素ガスも、分子中に重水素を組み込む上で有用な試薬である。オレフィン結合及びアセチレン結合の接触重水素化が、重水素組み込みの迅速な経路である。重水素ガス存在下の金属触媒（すなわち、Ｐｄ、Ｐｔ、及びＲｈ）を用いて、炭化水素を含む官能基における水素を重水素に直接交換することができる。多様な重水素化試薬及び合成構成単位が、例えばＣ／Ｄ／ＮＩｓｏｔｏｐｅｓ，Ｑｕｅｂｅｃ，Ｃａｎａｄａ；Ｃａｍｂｒｉｄｇｅ Ｉｓｏｔｏｐｅ Ｌａｂｏｒａｔｏｒｉｅｓ Ｉｎｃ．，Ａｎｄｏｖｅｒ，ＭＡ，ＵＳＡ；及びＣｏｍｂｉＰｈｏｓ Ｃａｔａｌｙｓｔｓ，Ｉｎｃ．，Ｐｒｉｎｃｅｔｏｎ，ＮＪ，ＵＳＡなどの会社から市販されている。

【００６０】

「一般式（Ｉ）の重水素含有化合物」という用語は、１以上の水素原子が１以上の重水素原子によって置き換わっており、一般式（Ｉ）の化合物の各重水素化位置での重水素の存在比が、約０．０１５％である重水素の天然存在比より高い一般式（Ｉ）の化合物と定義される。特に、一般式（Ｉ）の重水素含有化合物において、一般式（Ｉ）の化合物の各重水素化位置での重水素の存在比は、前記位置で、１０％、２０％、３０％、４０％、５０％、６０％、７０％又は８０％より高く、好ましくは９０％、９５％、９６％又は９７％より高く、さらにより好ましくは９８％又は９９％より高い。各重水素化位置での重水素の存在比が、他の重水素化位置での重水素の存在比から独立であることは明らかである。

【００６１】

１以上の重水素原子の一般式（Ｉ）の化合物への選択的組み込みによって、分子の物理化学特性（例えば、酸性度［Ｃ．Ｌ．Ｐｅｒｒｉｎ，ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．，２００７，１２９，４４９０］，塩基性［Ｃ．Ｌ．Ｐｅｒｒｉｎ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．，２００５，１２７，９６４１］、親油性［Ｂ．Ｔｅｓｔａ ｅｔ ａｌ．，Ｉｎｔ．Ｊ．Ｐｈａｒｍ．，１９８４，１９（３），２７１］）及び／又は代謝プロファイルが変わる可能性があり、親化合物の代謝物に対する比率又は生成する代謝物の量に変化が生じる可能性がある。そのような変化によって、ある種の治療上の利点が生じ得ることから、状況によっては好ましいことがあり得る。代謝及び代謝物の比率が変化する代謝切り換えの速度低下が報告されている（Ａ．Ｅ．Ｍｕｔｌｉｂ ｅｔ ａｌ．，Ｔｏｘｉｃｏｌ．Ａｐｐｌ．Ｐｈａｒｍａｃｏｌ．，２０００，１６９，１０２）。親薬剤及び代謝物への曝露におけるこれらの変化により、一般式（Ｉ）の重水素含有化合物の薬力学、耐容性及び効力に関して重要な結果を生じる可能性がある。場合により、重水素置換によって、望ましくないか有毒な代謝物の生成が低減若しくは消失し、所望の代謝物の生成が促進される（例えば、Ｎｅｖｉｒａｐｉｎｅ：Ａ．Ｍ．Ｓｈａｒｍａ ｅｔ ａｌ．，Ｃｈｅｍ．Ｒｅｓ．Ｔｏｘｉｃｏｌ．，２０１３，２６，４１０；Ｅｆａｖｉｒｅｎｚ：Ａ．Ｅ．Ｍｕｔｌｉｂ ｅｔ ａｌ．，Ｔｏｘｉｃｏｌ．Ａｐｐｌ．Ｐｈａｒｍａｃｏｌ．，２０００，１６９，１０２）。他の場合、重水素化の主要な効果は、全身クリアランス速度を低下させることである。結果的に、化合物の生物学的半減期が延長される。可能性がある臨床上の利点には、ピークレベル低下及びトラフレベル上昇を伴って同様の全身曝露を維持する能力などがあると考えられる。これによって、特定の化合物の薬物動態／薬力学関係に応じて、副作用軽減及び効力増強に至ると考えられる。ＭＬ－３３７（Ｃ．Ｊ．Ｗｅｎｔｈｕｒ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．，２０１３，

５６，５２０８）及びオダナカティブ（Ｋ．Ｋａｓｓａｈｕｎ ｅｔ ａｌ．，ＷＯ２０１２／１１２３６３）が、この重水素効果の例である。代謝速度低下によって、全身クリアランス速度の変化をもたらすことなく薬剤の曝露が増加する更に他の場合が報告されている（例えば、ロフェコキシブ：Ｆ．Ｓｃｈｎｅｉｄｅｒ ｅｔ ａｌ．，Ａｒｚｎｅｉｍ．Ｆｏｒｓｃｈ．／Ｄｒｕｇ．Ｒｅｓ．，２００６，５６，２９５；テラプレビル：Ｆ．Ｍａｌｔａｉｓ ｅｔ ａｌ．，Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．，２００９，５２，７９９３）。この効果を示す重水素化薬剤によって、投与必要量が低減する可能性があり（例えば、所望の効果を達成するための投与回数低下及び用量低下）、及び／又は代謝物負荷が軽減される可能性がある。

【００６２】

一般式（Ｉ）の化合物は、複数の可能な代謝攻撃部位を有し得る。物理化学特性及び代謝プロファイルに対する上記効果を至適化するため、１以上の重水素－水素交換のある種のパターンを有する一般式（Ｉ）の重水素含有化合物を選択することができる。特に、一般式（Ｉ）の重水素含有化合物の重水素原子は、炭素原子に結合し、シトクロムＰ$_{450}$などの代謝酵素の攻撃部位である一般式（Ｉ）の化合物の位置に存在する。

【００６３】

化合物、塩、多形体、水和物、溶媒和物などの言葉の複数形が本明細書で用いられている場合、それは、単数の化合物、塩、多形体、異性体、水和物、溶媒和物なども意味するものと理解される。

【００６４】

「安定な化合物」又は「安定構造」は、反応混合物から有用な程度の純度までの単離、及び有効な治療剤への製剤を生き残るのに十分な堅牢性を有する化合物を意味する。

【００６５】

本発明の化合物は、各種所望の置換基の位置及び性質に応じて、１以上の不斉中心を含む場合がある。１以上の不斉炭素原子が（Ｒ）又は（Ｓ）配置で存在することが可能であることで、単一の不斉中心の場合にはラセミ混合物が、複数の不斉中心の場合にはジアステレオマー混合物が生じ得る。場合によっては、所定の結合、例えば特定化合物の二つの置換された芳香環に隣接する中心結合周囲での回転が制限されていることによって、不斉が存在することも可能である。

【００６６】

好ましい化合物は、より望ましい生理活性を生じるものである。本発明の化合物の分離、純粋若しくは部分精製された異性体及び立体異性体又はラセミ若しくはジアステレオマー混合物も、本発明の範囲に含まれる。そのような材料の精製及び分離は、当業界で公知の標準的技術によって行うことができる。

【００６７】

好ましい異性体は、より望ましい生理活性を生じるものである。本発明の化合物のこれらの分離、純粋若しくは部分精製された異性体又はラセミ混合物も、本発明の範囲に含まれる。そのような材料の精製及び分離は、当業界で公知の標準的技術によって行うことができる。

【００６８】

光学異性体は、従来の方法に従うラセミ混合物の分割によって、例えば光学活性な酸若しくは塩基を用いるジアステレオ異性体塩の形成、又は共有結合ジアステレオマーの形成によって得ることができる。適切な酸の例は、酒石酸、ジアセチル酒石酸、ジトルオイル酒石酸及びカンファースルホン酸である。ジアステレオ異性体の混合物は、方法当業界で公知の方法によって、例えば、クロマトグラフィー若しくは分別結晶によって、物理的及び／又は化学的差異に基づいて、それらの個々のジアステレオマーに分離することができる。次に、光学活性塩基若しくは酸を、分離されたジアステレオマー塩から遊離させる。光学異性体の異なる分離方法は、キラルクロマトグラフィー（例えば、キラル相を用いるＨＰＬＣカラム）を用いるものであり、その場合に、従来の誘導体化を行っても行わなくても良く、それはエナンチオマーの分離を最大とするために至適に選択される。キラル相

を用いる好適なＨＰＬＣカラムは市販されており、例えば特には、いずれも通常選択可能であるダイセル（Ｄａｉｃｅｌ）の製造品、例えばＣｈｉｒａｃｅｌ　ＯＤ及びキラセルＣｈｉｒａｃｅｌ　ＯＪがある。誘導体を伴っても良い酵素分離も有用である。本発明の光学活性化合物は、光学活性原料を用いるキラル合成によっても得ることができる。

【００６９】

異なる種類の異性体を互いから区別するには、ＩＵＰＡＣ規則セクションＥ（Ｐｕｒｅ　Ａｐｐｌ　Ｃｈｅｍ　４５，　１１－３０，　１９７６）を参照する。

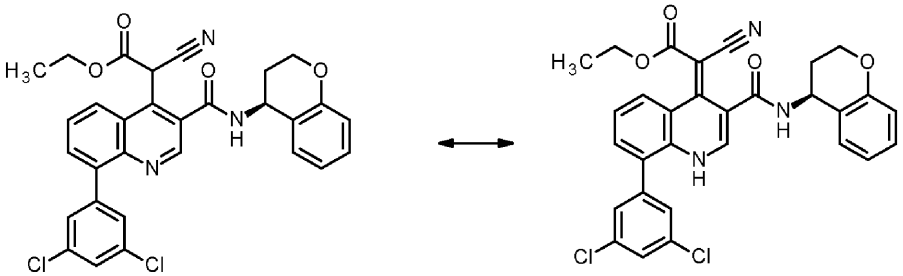
【００７０】

本発明は、単一の立体異性体として、又はいずれかの比率での前記立体異性体、の混合物としての本発明の化合物の全ての可能な立体異性体、例えば（Ｒ）－若しくは（Ｓ）－異性体を含む。本発明の化合物の単一の立体異性体、例えば単一のエナンチオマー若しくは単一のジアステレオマーの単離は、いずれか好適な最新の方法、例えばクロマトグラフィー、特には例えばキラルクロマトグラフィーによって行われる。

【００７１】

さらに、本発明の化合物は互変異体として存在することができる。例えば、高いＣ－Ｈ－酸性を有するキノリンでα－ＣＨ－部分を生じる置換パターンを含む本発明の化合物は、１，４－ジヒドロキノリン互変異体、又は二つの互変異体、即ち下記のもののいずれかの量での混合物として存在することができる。

【化３】



【００７２】

本発明は、単一の互変異体として、又はいずれかの比率での前記互変異体の混合物としての本発明の化合物の全ての可能な互変異体を含む。

【００７３】

さらに、本発明の化合物は、本発明の化合物の少なくとも１個の窒素が酸化されているものと定義されるＮ－オキサイドとして存在することができる。本発明は、全てのそのような可能なＮ－オキサイドを含む。

【００７４】

本発明はまた、代謝物、水和物、溶媒和物、プロドラッグ、塩、特には薬学的に許容される塩、及び／又は共沈物などの本発明の化合物の有用な形態も包含する。

【００７５】

本発明の化合物は、本発明の化合物が極性溶媒、特には例えば水、メタノール又はエタノールを、その化合物の結晶格子の構造要素として含む水和物として、又は溶媒和物として存在することができる。極性溶媒、特に水の量が、化学量論比で又は非化学量論比で存在することが可能である。化学量論量の溶媒和物、例えば水和物の場合、それぞれ半、（セミ－）、モノ－、セスキ－、ジ－、トリ－、テトラ－、ペンタ－などの溶媒和物又は水和物が可能である。本発明は、全てのそのような水和物又は溶媒和物を含む。

【００７６】

さらに、本発明の化合物が、遊離型で、例えば遊離塩基として、又は遊離酸として、又は両性イオンとして存在することが可能であるか、塩の形態で存在することができる。その塩は、有機塩若しくは無機塩のいかなる塩でも良く、特には、薬学において一般に使用される、又は例えば本発明の化合物の単離若しくは精製に用いられる薬学的に許容される

有機若しくは無機付加塩であることができる。
【００７７】
「薬学的に許容される塩」という用語は、本発明の化合物の無機若しくは有機酸付加塩を指す。例えば、Ｓ．Ｍ．Ｂｅｒｇｅ、ｅｔ ａｌ．"Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ Ｓａｌｔｓ，" Ｊ．Ｐｈａｒｍ．Ｓｃｉ．１９７７，６６，１－１９を参照する。
【００７８】
本発明の化合物の好適な医薬として許容される塩は、例えば、例えば十分に塩基性である窒素原子を鎖中又は環中に有する本発明の化合物の酸付加塩であることができ、例えば無機酸又は「鉱酸」、例えば塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、スルファミン酸、重硫酸、リン酸若しくは硝酸などとの酸付加塩、又は有機酸、例えばギ酸、酢酸、アセト酢酸、ピルビン酸、トリフルオロ酢酸、プロピオン酸、酪酸、ヘキサン酸、ヘプタン酸、ウンデカン酸、ラウリン酸、安息香酸、サリチル酸、２－（４－ヒドロキシベンゾイル）－安息香酸、樟脳酸、ケイ皮酸、シクロペンタンプロピオン酸、ジグルコン酸、３－ヒドロキシ－２－ナフトエ酸、ニコチン酸、パモ酸、ペクチニン酸、３－フェニルプロピオン酸、ピバル酸、２－ヒドロキシエタンスルホン酸、イタコン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ドデシル硫酸、エタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、パラ－トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸、２－ナフタレンスルホン酸、ナフタリンジスルホン酸、カンファースルホン酸、クエン酸、酒石酸、ステアリン酸、乳酸、シュウ酸、マロン酸、コハク酸、リンゴ酸、アジピン酸、アルギン酸、マレイン酸、フマル酸、Ｄ－グルコン酸、マンデル酸、アスコルビン酸、グルコヘプタン酸、グリセロリン酸、アスパラギン酸、スルホサリチル酸、ヘミ硫酸又はチオシアン酸などとの酸付加塩などである。
【００７９】
さらに、十分に酸性である本発明の化合物の別の好適に医薬として許容される塩は、アルカリ金属塩、例えばナトリウム塩又はカリウム塩、アルカリ土類金属塩、例えばカルシウム塩、マグネシウム塩若しくはストロンチウム塩、又はアルミニウム若しくは亜鉛塩、又はアンモニアから又は１～２０個の炭素原子を有する有機１級、２級若しくは３級アミン、例えばエチルアミン、ジエチルアミン、トリエチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、モノエタノールアミン、ジエタノールアミン、トリエタノールアミン、ジシクロヘキシルアミン、ジメチルアミノエタノール、ジエチルアミノエタノール、トリス（ヒドロキシメチル）アミノメタン、プロカイン、ジベンジルアミン、Ｎ－メチルモルホリン、アルギニン、リジン、１，２－エチレンジアミン、Ｎ－メチルピペリジン、Ｎ－メチル－グルカミン、Ｎ，Ｎ－ジメチル－グルカミン、Ｎ－エチル－グルカミン、１，６－ヘキサンジアミン、グルコサミン、サルコシン、セリノール、２－アミノ－１，３－プロパンジオール、３－アミノ－１，２－プロパンジオール、４－アミノ－１，２，３－ブタントリオールから誘導されるアンモニウム塩、又は１～２０個の炭素原子を有する四級アンモニウムイオン、例えばテトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラ（ｎ－プロピル）アンモニウム、テトラ（ｎ－ブチルアンモニウム）、Ｎ－ベンジル－Ｎ，Ｎ，Ｎ－トリメチルアンモニウム、コリン又はベンザルコニウムとの塩である。
【００８０】
当業者であれば、さらに、特許請求の範囲に記載されている化合物の酸付加塩を、多数の公知の方法のいずれかを介して、本化合物と適切な無機酸又は有機酸との反応により製造可能であることは理解するものである。あるいは、本発明の酸性化合物のアルカリ金属塩及びアルカリ土類金属塩は、各種公知の方法を介して、本発明の化合物を適切な塩基と反応させることにより製造される。
【００８１】
本発明は、単一の塩としての、又は任意の比率の前記塩の任意の混合物としての、本発明の化合物の全ての可能な塩を包含する。
【００８２】
本明細書において、特に実験の部において、本発明の中間体又は実施例の合成に関して、ある化合物が相当する塩基若しくは酸との塩型と言及され場合、個々の製造及び／又は

精製方法によって得られるその塩型の正確な化学量論的組成は、ほとんどの場合で不明である。

【００８３】

別段の断りがない限り、例えば「塩酸塩」、「トリフルオロ酢酸塩」、「ナトリウム塩」又は「ｘＨＣｌ」、「ｘＣＦ$_3$ＣＯＯＨ」、「ｘＮａ$^+$」などの塩に関連する化学名又は構造式に付加される言葉は、塩型を意味するものであり、その塩型の化学量論について言及していない。

【００８４】

このことは、合成中間体又は実施例化合物又はそれらの塩が、記載の製造及び／又は精製方法により、溶媒和物として、例えば（定義されている場合）化学量論組成未知の水和物として得られている場合にも当てはまる。

【００８５】

さらに、本発明は、単一の多形体として、又はあらゆる比率での複数の多形体の混合物としての本発明の化合物のあらゆる可能な結晶型又は多形体を含む。

【００８６】

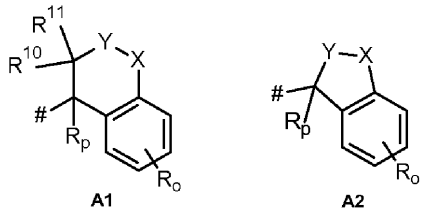
さらに、本発明は、本発明による化合物のプロドラッグも含む。本明細書での「プロドラッグ」という用語は、自体は生理的に活性であっても不活性であっても良いが、それが身体中に滞留している間に本発明による化合物に変換（例えば、代謝的に又は加水分解的に）される化合物を指す。

【００８７】

第１の態様の第２の実施形態によれば、本発明は、

Ａが、Ａ１又はＡ２：

【化４】



【００８８】

であり、

ｏが、０、１、２、３又は４であり、

Ｒが、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、

Ｒ$_p$が、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、

Ｘ、Ｙが、独立にＣＲ^{7}Ｒ^8、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ^{9}からなる群から選択され、ここで、Ｘ及びＹの少なくとも一つが、ＣＲ^{7}Ｒ^{8}であり、又は

Ｘ、Ｙが一緒に、－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＲ^9－、－Ｓ（Ｏ）－ＮＲ^9－、－ＳＯ$_2$－ＮＲ^9－及び－ＳＯ$_2$－Ｏ－からなる群から選択される環員を形成しており、

Ｒ^{1}が、

水素、シアノ、－ＣＨＯ、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、１～５個のハ

ロゲン原子を有するＣ３－Ｃ６－ハロゲノシクロアルキル、Ｃ３－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ４－アルキニル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ３－アルキル、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＮＨ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、ＮＨ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－ＮＨ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２Ｎ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、ベンジルオキシ－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル；

フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それは、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］からなる群から選択され、

Ｒ２が、

水素、ハロゲン、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２；

－ＮＲ１２Ｒ１３；

－ＯＲ１４；

－ＳＲ１５、－Ｓ（Ｏ）Ｒ１５、－ＳＯ２Ｒ１５；

Ｃ１－Ｃ６－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルケニル、Ｃ２－Ｃ４－アルキニル又はフェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ２、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されて

いても良い。］；

複素環－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＮＯ$_2$、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル［それは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ^{3}が、水素、又はＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルであり、

Ｒ^{4}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、

Ｒ^{5}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、

Ｒ^{6}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、

R^7が、水素、－ＯＨ、フッ素、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、
R^8が、水素、－ＯＨ、フッ素、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、
又は、R^7及びR^8が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、
R^9が、水素、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、
R^{10}が、水素、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、
R^{11}が、水素、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、
R^{12}及びR^{13}が、独立に、
水素、－ＯＨ、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルコキシ；
C_1－C_4－アルキル、C_3－C_6－シクロアルキル、フェニル－C_1－C_4－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）－（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び（C_1－C_4－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－C_1－C_4－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、ヒドロキシ－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－C_1－C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル、ベンゾ－C_5－C_6－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－C_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－

Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ１４が、

－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル［それは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル

、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ^{15}が、

水素；

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、フェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

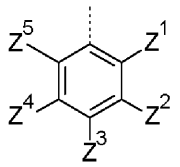
フェニル［それは、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$

－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：

【化５】



(Q1)

【００８９】

であり、

式中、

Ｚ１、Ｚ２、Ｚ３、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、ＳＦ５、シアノ、－ＣＨＯ、ニトロ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（ＳＯ２－［Ｃ１－Ｃ４－アルキル］）（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシイミノ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、４～６員複素環［それは、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－ＣＨ２－Ｏ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、４～６員複素環（自体が、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基で置換されていても良い。）で置換されているメチル、－ＣＨ２－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、１～５個のハ

ロゲン原子を有する－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）からなる群から選択され、又は

Ｚ１及びＺ２が、それらが結合している炭素原子とともに、５員若しくは６員の飽和若しくは部分飽和複素環、５員ヘテロアリール、又は６員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及び

Ｚ３、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、ＳＦ５、シアノ、ＣＨＯ、ニトロ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（ＳＯ２－［Ｃ１－Ｃ４－アルキル］）（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシイミノ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、４～６員ヘテロシクロアルキル［それは、フッ素、メチル若しくはシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－ＣＨ２－Ｏ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、４～６員ヘテロシクロアルキル（それ自体が、フッ素、メチル又はシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基で置換されていても良い。）で置換されているメチル、－ＣＨ２－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）からなる群から選択され、又は

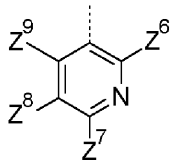
Ｚ２及びＺ３が、それらが結合している炭素原子とともに、５員若しくは６員の飽和若しくは部分飽和複素環、５員ヘテロアリール、又は６員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、

Ｚ１、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、ＳＦ５、シアノ、ＣＨＯ、ニトロ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（ＳＯ２－［Ｃ１－Ｃ４－アルキル］）（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシイミノ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、４～６員ヘテロシクロアルキル［それは、フッ素、メチル若しくはシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－ＣＨ２－Ｏ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、４～６員ヘテロシクロアルキル（それ自体が、フッ素、メチル又はシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基で置換されていても良い。）で置換されているメチル、－ＣＨ２－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＨ２－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、－ＣＯ

ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＣＯＮＨ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＮＨＣＯ（Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＮＨＣＯ（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ２）のピリジン環：

【化６】



(Q2)

【００９０】

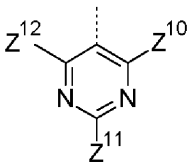
であり、

式中、

Z^6、Z^7、Z^8及びZ^9が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ３）のピリミジン環：

【化７】



(Q3)

【００９１】

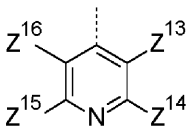
であり、

式中、

Z^{10}、Z^{11}及びZ^{12}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：

【化８】



(Q4)

【００９２】

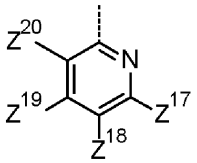
であり、

式中、

Ｚ^{13}、Ｚ^{14}、Ｚ^{15}及びＺ^{16}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ヒドロキシアルキル、ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＣＯ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環からなる群から選択され、これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良く、又は

Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化９】



(Q5)

【００９３】

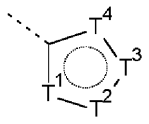
であり、

式中、

Ｚ^{17}、Ｚ^{18}、Ｚ^{19}及びＺ^{20}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：

【化１０】



(Q6)

【００９４】

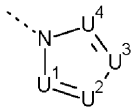
であり、

式中、

Ｔ^{1}～Ｔ^{4}が、独立にＮ、Ｏ、Ｓ、Ｃ－Ｚ^{21}及びＮ－Ｚ^{22}からなる群から選択され、ここで、Ｔ^{1}～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＯであり、Ｔ^{1}～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＳであり、Ｔ^{1}～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＮ－Ｚ^{22}であり、及びここで、

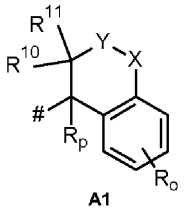
各Ｚ^{21}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハ

ロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、及び
各Ｚ２２が、独立に水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：
【化１１】

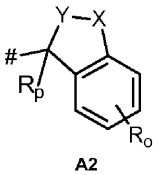


(Q7)

【００９５】
であり、
式中、
Ｕ１～Ｕ４が、独立にＮ及びＣ－Ｚ２３からなる群から選択され、ここで、Ｕ１～Ｕ４のうちの３個以下がＮであり、及びここで、
各Ｚ２３が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、
ここで、ＹがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ９である場合、Ｒ７、Ｒ８、Ｒ１０及びＲ１１のうちのいずれも－ＯＨではなく、及びここで、ＸがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ９である場合、Ｒ７及びＲ８のうちのいずれも－ＯＨではない、
上記一般式（Ｉ）の化合物、並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【００９６】
第１の態様の第３の実施形態によれば、本発明は、
Ａが、Ａ１又はＡ２：
【化１２】



A1



A2

【００９７】
であり、
ｏが、０、１又は２であり、
Ｒが、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシ、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、
Ｒｐが、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、
Ｘ、Ｙが、独立にＣＲ７Ｒ８、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ９からなる群から選択され、ここで、Ｘ及びＹの少なくとも一つが、ＣＲ７Ｒ８であり、
Ｒ１が、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ３－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ４－アルキニル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル－Ｃ１－Ｃ３－アルキル、シアノ－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、
Ｒ２が、
水素、ハロゲン、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ

（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$；
　－ＮＲ^{12}Ｒ^{13}；
　－ＯＲ^{14}；
　－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_2$Ｒ^{15}；
　Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルケニル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルキニル又はフェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ（Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
　４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
　Ｒ^{3}が、水素又はＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルであり、
　Ｒ^{4}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、
　Ｒ^{5}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、
　Ｒ^{6}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、
　Ｒ^{7}が、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、
　Ｒ^{8}が、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、
　又はＲ^{7}及びＲ^{8}が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、
　Ｒ^{9}が、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルであり、
　Ｒ^{10}が、水素、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシからなる群から選択され、
　Ｒ^{11}が、水素であり、

R^{12}及びR^{13}が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル）、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ；
$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$－シクロアルキル、フェニル－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－$ＮＨ_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、－Ｎ（$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル）－（－Ｃ（Ｏ）－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル）、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルコキシ、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$－シクロアルキル、$ＮＨ_2$、－ＮＨ（$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル）、－Ｎ（$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、－$ＳＯ_2$－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－$ＳＯ_2$－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル及び（$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル、ベンゾ－$Ｃ_5$－$Ｃ_6$－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
R^{14}が、
$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$－シクロアルキル、フェニル－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルコキシ、$Ｃ_3$－$Ｃ_6$－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
複素環－$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルキル、$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有する$Ｃ_1$－$Ｃ_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；
R^{15}が、
水素；

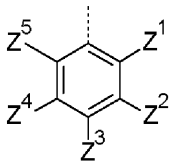
Ｃ１－Ｃ４－アルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］

からなる群から選択され；

Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：

【化１３】



(Q1)

【００９８】

であり、

式中、

Ｚ１、Ｚ２、Ｚ３、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、４～６員複素環［それは、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）からなる群から選択され、又は

Ｚ１及びＺ２が、それらが結合している炭素原子とともに、５員若しくは６員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール、又は６員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及び、

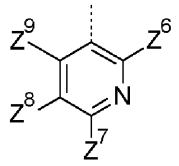
Ｚ３、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、又は

Ｚ２及びＺ３が、それらが結合している炭素原子とともに、５員若しくは６員の飽和若しくは部分飽和複素環、５員ヘテロアリール、又は６員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及び、

Ｚ１、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ２）のピリジン環：

【化１４】



(Q2)

【００９９】

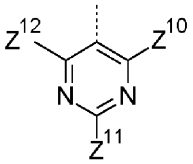
であり、

式中、

Z^6、Z^7、Z^8及びZ^9が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ３）のピリミジン環：

【化１５】



(Q3)

【０１００】

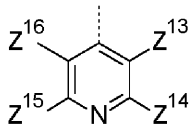
であり、

式中、

Z^{10}、Z^{11}及びZ^{12}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：

【化１６】



(Q4)

【０１０１】

であり、

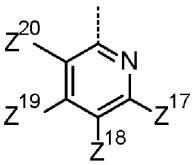
式中、

Z^{13}、Z^{14}、Z^{15}及びZ^{16}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、C_1-C_4－ヒドロキシアルキル、NH_2、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－

アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＣＯ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環からなる群から選択され、これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良く、又は

Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化１７】



(Q5)

【０１０２】

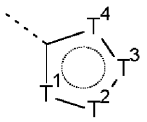
であり、

式中、

Ｚ^{17}、Ｚ^{18}、Ｚ^{19}及びＺ^{20}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：

【化１８】



(Q6)

【０１０３】

であり、

式中、

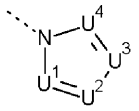
Ｔ^1～Ｔ^{4}が、独立にＮ、Ｏ、Ｓ、Ｃ－Ｚ^{21}及びＮ－Ｚ^{22}からなる群から選択され、ここで、Ｔ^1～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＯであり、Ｔ^1～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＳであり、Ｔ^1～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＮ－Ｚ^{22}であり、及びここで、

各Ｚ^{21}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシからなる群から選択され、

各Ｚ^{22}が、独立に水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：

【化１９】



(Q7)

【０１０４】

であり、

式中、

Ｕ^{1}～Ｕ^{4}が、独立にＮ及びＣ－Ｚ^{23}からなる群から選択され、ここで、Ｕ^{1}～Ｕ^{4}のうちの３個以下がＮであり、及びここで、

各Ｚ^{23}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシからなる群から選択され、

ここで、ＹがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ^{9}である場合、Ｒ^{10}が－ＯＨではない、

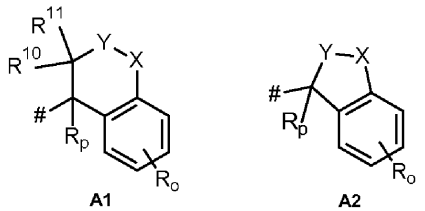
上記一般式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１０５】

第１の態様の第４の実施形態によれば、本発明は、

Ａが、Ａ１又はＡ２：

【化２０】



A1　　A2

【０１０６】

であり、

ｏが、０、１又は２であり、

Ｒが、ハロゲン、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル及びＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ$_{p}$が、水素、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルからなる群から選択され、

Ｘが、ＣＲ^{7}Ｒ^{8}、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ^{9}からなる群から選択され、

Ｙが、ＣＲ^{7}Ｒ^{8}又はＯであり、

Ｒ^{1}が、水素又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルであり、

Ｒ^{2}が、

水素、ハロゲン、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$；

－ＮＲ^{12}Ｒ^{13}；

－ＯＲ^{14}；

－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{15}；

Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルケニル又はＣ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルケニル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－及び－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、－ＮＨ$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）からなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール、及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ^{3}が、水素又はＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルであり、

Ｒ^{4}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ$_2$からなる群から選択され、

Ｒ^{5}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ^{6}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ^{7}が、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ^{8}が、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、

又はＲ^{7}及びＲ^{8}が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、

Ｒ^{9}が、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルであり、

Ｒ^{10}が、水素、－ＯＨ及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ^{11}が、水素であり、

Ｒ^{12}及びＲ^{13}が、独立に、

水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ；

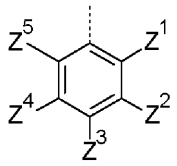
Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、フェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、及び（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル及びベンゾ－Ｃ$_5$－Ｃ$_6$－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって

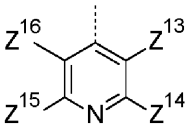
置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
　R^{14}が、
　　C_1－C_4－アルキル、C_3－C_6－シクロアルキル、フェニル－C_1－C_4－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルコキシ及びC_3－C_6－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
　　４～１０員ヘテロシクロアルキル
からなる群から選択され、
　R^{15}が、
　　水素；
　　C_1－C_4－アルキル［それは、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
　　６員ヘテロアリール
からなる群から選択され、
　Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化２１】



(Q1)

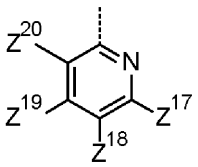
【０１０７】
であり、
　　式中、
　　Z^1及びZ^5が、独立に水素、ハロゲン、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、
　　Z^2及びZ^4が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルコキシ、－ＮＨ（C_1－C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、－Ｓ－（C_1－C_4－アルキル）及び４～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、及び
　　Z^3が、水素、ハロゲン、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、及び－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は
　　Z^1及びZ^2が、それらが結合している炭素原子とともに、５員ヘテロシクロアルキル又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、
　　Z^3及びZ^5が水素であり、及び
　　Z^4が、水素及びC_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、又は
　Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：

【化２２】



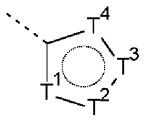
(Q4)

【０１０８】
であり、
式中、
Ｚ１３、Ｚ１４、Ｚ１５及びＺ１６が、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ１－Ｃ４－ヒドロキシアルキル、ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－ＣＯ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環［これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：
【化２３】



(Q5)

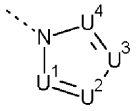
【０１０９】
であり、
式中、
Ｚ１７、Ｚ１８、及びＺ１９が水素であり、及び
Ｚ２０が、ハロゲンであり、又は
Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：
【化２４】



(Q6)

【０１１０】

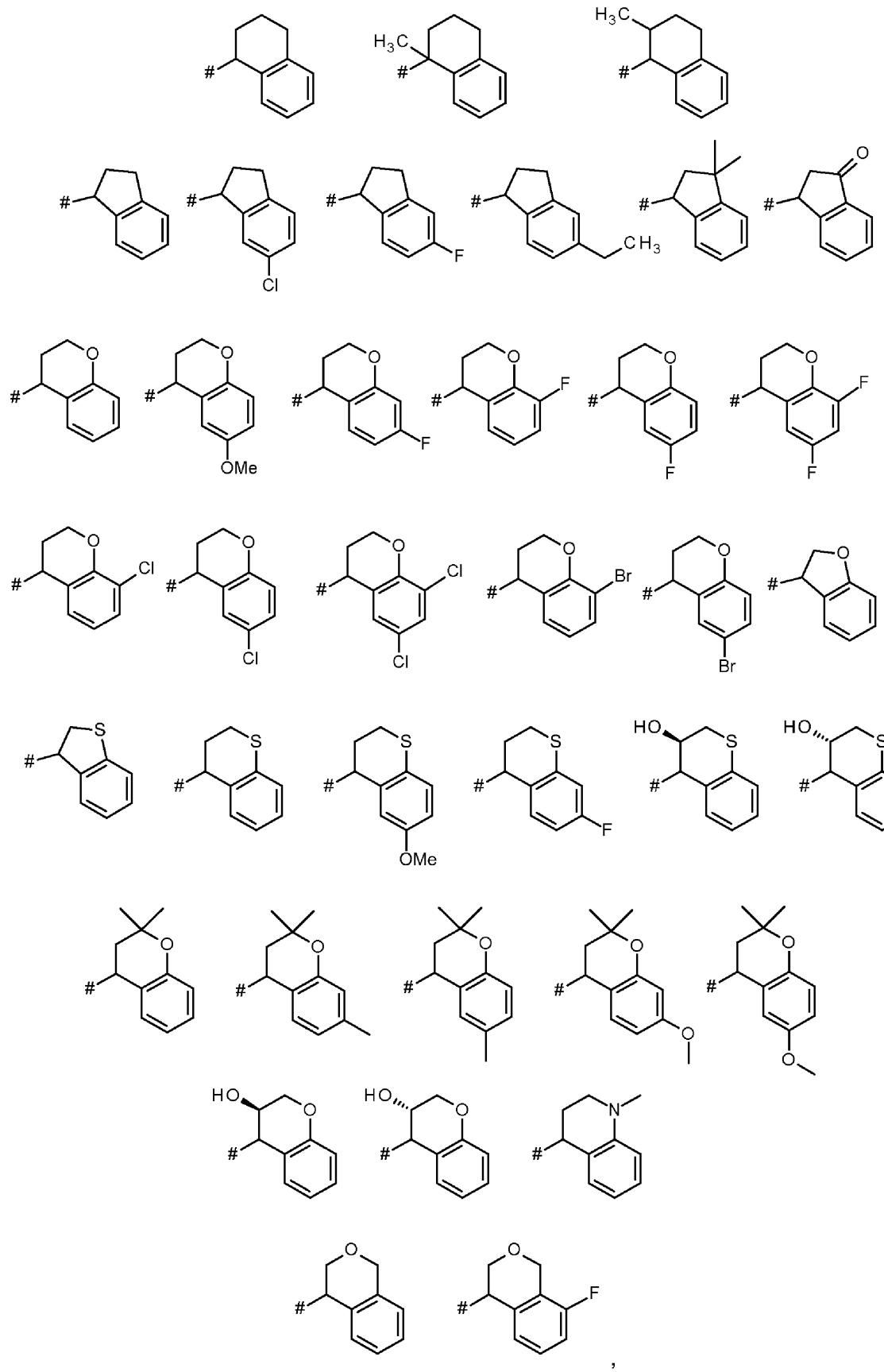
であり、
式中、
T^1～T^4が、独立にN、O、S、C－Z^{21}及びN－Z^{22}からなる群から選択され、ここで、T^1～T^4のうちの１個以下がOであり、T^1～T^4のうちの１個以下がSであり、T^1～T^4のうちの１個以下がN－Z^{22}であり、及びここで、
各Z^{21}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、及び
各Z^{22}が、独立に水素、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルキル－C_3－C_6－シクロアルキル、C_1－C_4－アルコキシ－C_1－C_4－アルキルからなる群から選択され、又は
Qが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：
【化２５】



(Q7)

【０１１１】
であり、
式中、
U^1～U^4が、独立にN及びC－Z^{23}からなる群から選択され、ここで、U^1～U^4のうちの３個以下がNであり、及びここで、
各Z^{23}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシからなる群から選択される、
上記一般式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１１２】
第１の態様の第５の実施形態によれば、本発明は、
Ａが、

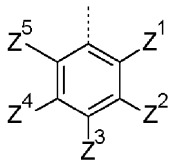
【化２６】



【０１１３】
からなる群から選択され、

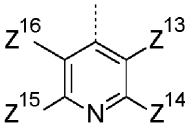
R^1が、水素又はメチルであり、
R^2が、
水素、塩素、ヨウ素、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（CH_3）$_2$；
－$NR^{12}R^{13}$；
－OR^{14}；
－SR^{15}、－Ｓ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}；
メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、エテニル、プロペニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ、シアノ、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、メトキシ、NH_2、Ｎ（CH_3）$_2$、Ｎ（CH_3）（Ｃ（Ｏ）CH_3）からなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
アゼチジン、オキセタン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、テトラヒドロピラン、テトラヒドロピリジン、ジヒドロ－２Ｈ－ピラン、１，２－オキサゾリジン、１，２－オキサジン、モルホリン、チオモルホリン、３，４－ジヒドロイソキノリン、２，３－ジヒドロ－インドール、１，３－ジヒドロ－イソインドール、３，９－ジオキサ－７－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、６－オキサ－３－アザビシクロ［３．１．１］ヘプタン、８－オキサ－３－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、チオフェン、イミダゾール、ピラゾール、１，２，４－トリアゾール、１，２，３－トリアゾール、１，２，３，４－テトラゾール、ピリジン、ジヒドロピリジン、ピリミジン、テトラヒドロピリミジン、４－オキサ－７－アザスピロ［２．５］オクタンからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、シアノ、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、メチル、メチル－Ｃ（Ｏ）－、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル－、メトキシメチル－、－NH_2、－NMe_2、ピロリジンからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
R^3が、水素又はメチルであり、
R^4が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ及びNH_2からなる群から選択され、
R^5が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、
R^6が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル及びメトキシからなる群から選択され、
R^{12}及びR^{13}が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－メチル）、メトキシ；
メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、ベンジル、１－フェニルエチル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－NMe_2、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－メチル、メチル、メトキシ、シクロプロピル、－NH_2、NMe_2、Ｓ－メチル、Ｓ（Ｏ）－メチル、SO_2－メチル、及び（ＥｔＯ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－メチル、複素環－エチル［当該複素環置換基は、オキセタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ピロリジン、モルホリン、ピラゾール、イミダゾール、１，２，４－オキサジアゾール、ピリジンからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、－ＯＨ、オキソ及びメチルからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル；

２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン、及び
オキセタン、チエタン、ピロリジン、モルホリン、テトラヒドロピラン、ピリジン及びピラゾールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、－ＯＨ、オキソ、メチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；
Ｒ^{14}が、
メチル、エチル、イソプロピル、ブチル、シクロペンチル、ベンジル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、メチル、メトキシ及びシクロペンチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
ピロリジン及びテトラヒドロピランからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環
からなる群から選択され、
Ｒ^{15}が、
メチル及びエチル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
ピリジン
からなる群から選択され、
Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化２７】



(Q1)

【０１１４】
であり、
式中、
Ｚ^{1}及びＺ^{5}が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル及びメトキシからなる群から選択され、
Ｚ^{2}及びＺ^{4}が、独立に水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、エチル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＮＨＭｅ、－ＮＭｅ$_{2}$、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、－ＳＭｅ及びモルホリニルからなる群から選択され、及び
Ｚ^{3}が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ及び－ＮＭｅ$_{2}$からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化２８】



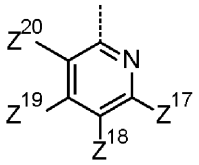
(Q4)

【０１１５】
であり、
式中、

Ｚ^{13}、Ｚ^{14}、Ｚ^{15}及びＺ^{16}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ヒドロキシメチル、ＮＨ$_2$、－ＮＨＭｅ－ＮＭｅ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｍｅ、モルホリニルからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化２９】



(Q5)

【０１１６】

であり、

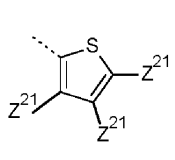
式中、

Ｚ^{17}、Ｚ^{18}、及びＺ^{19}が水素であり、及び

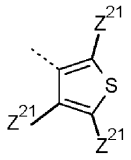
Ｚ^{20}が、フッ素、塩素であり、又は

Ｑが、

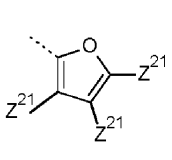
【化３０】



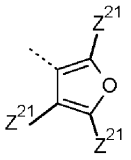
(Q6-1)



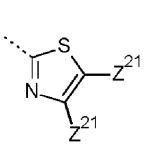
(Q6-2)



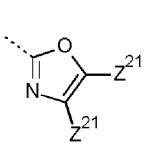
(Q6-3)



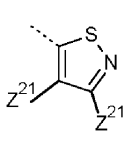
(Q6-4)



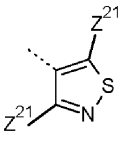
(Q6-5)



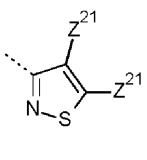
(Q6-6)



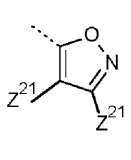
(Q6-7)



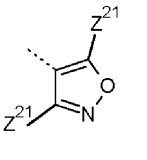
(Q6-8)



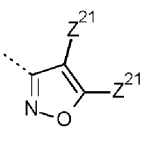
(Q6-9)



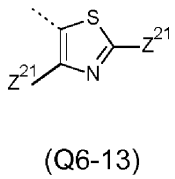
(Q6-10)



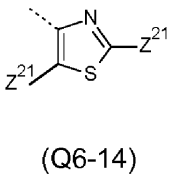
(Q6-11)



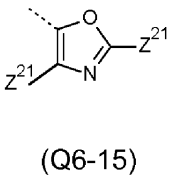
(Q6-12)



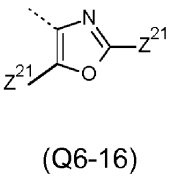
(Q6-13)



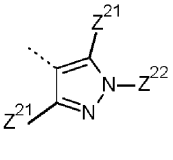
(Q6-14)



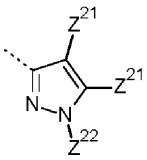
(Q6-15)



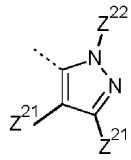
(Q6-16)



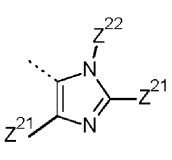
(Q6-17)



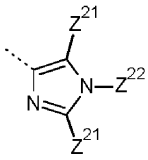
(Q6-18)



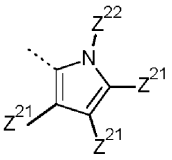
(Q6-19)



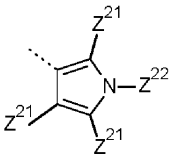
(Q6-20)



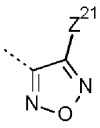
(Q6-21)



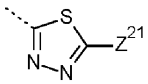
(Q6-22)



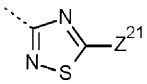
(Q6-23)



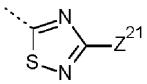
(Q6-24)



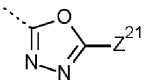
(Q6-25)



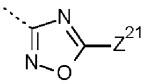
(Q6-26)



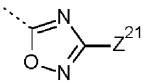
(Q6-27)



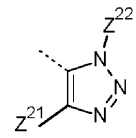
(Q6-28)



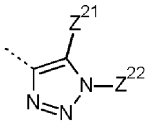
(Q6-29)



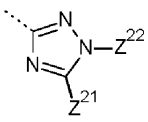
(Q6-30)



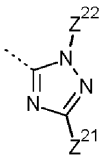
(Q6-31)



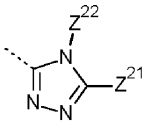
(Q6-32)



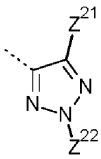
(Q6-33)



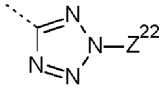
(Q6-34)



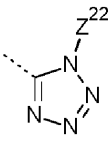
(Q6-35)

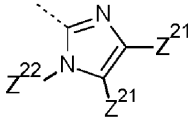


(Q6-36)



(Q6-37)

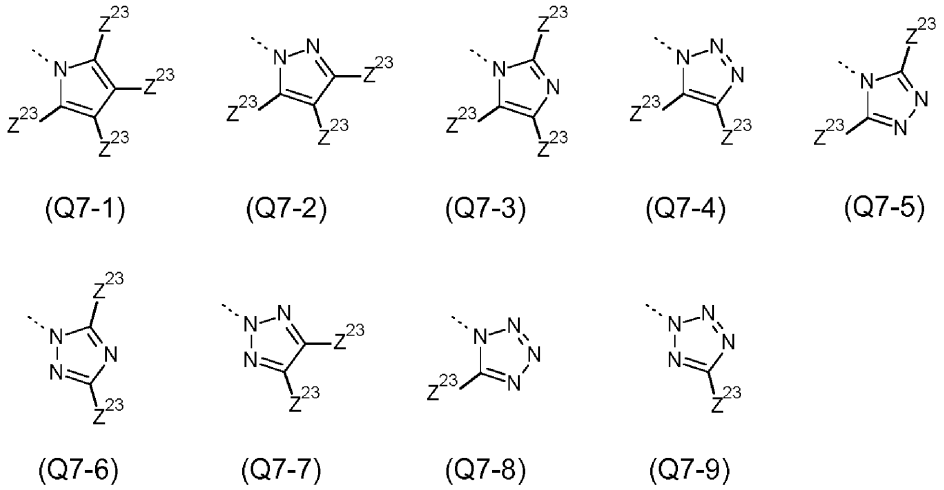




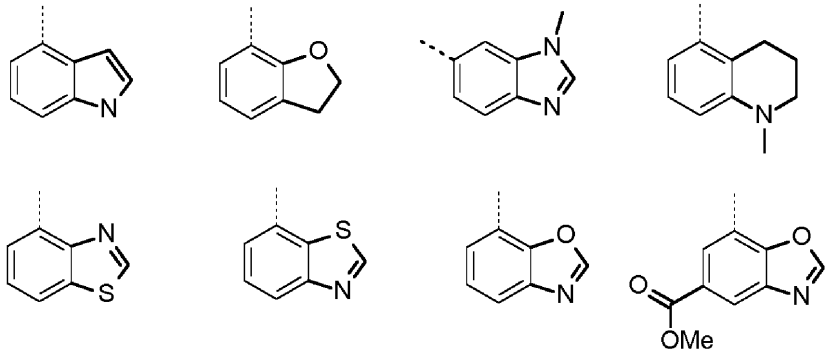
(Q6-38) または (Q6-39)

【０１１７】

からなる群から選択され、
式中、
各Ｚ^{21}は、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、及び
Ｚ^{22}が、水素、メチルであり、又は
Ｑが、
【化３１】



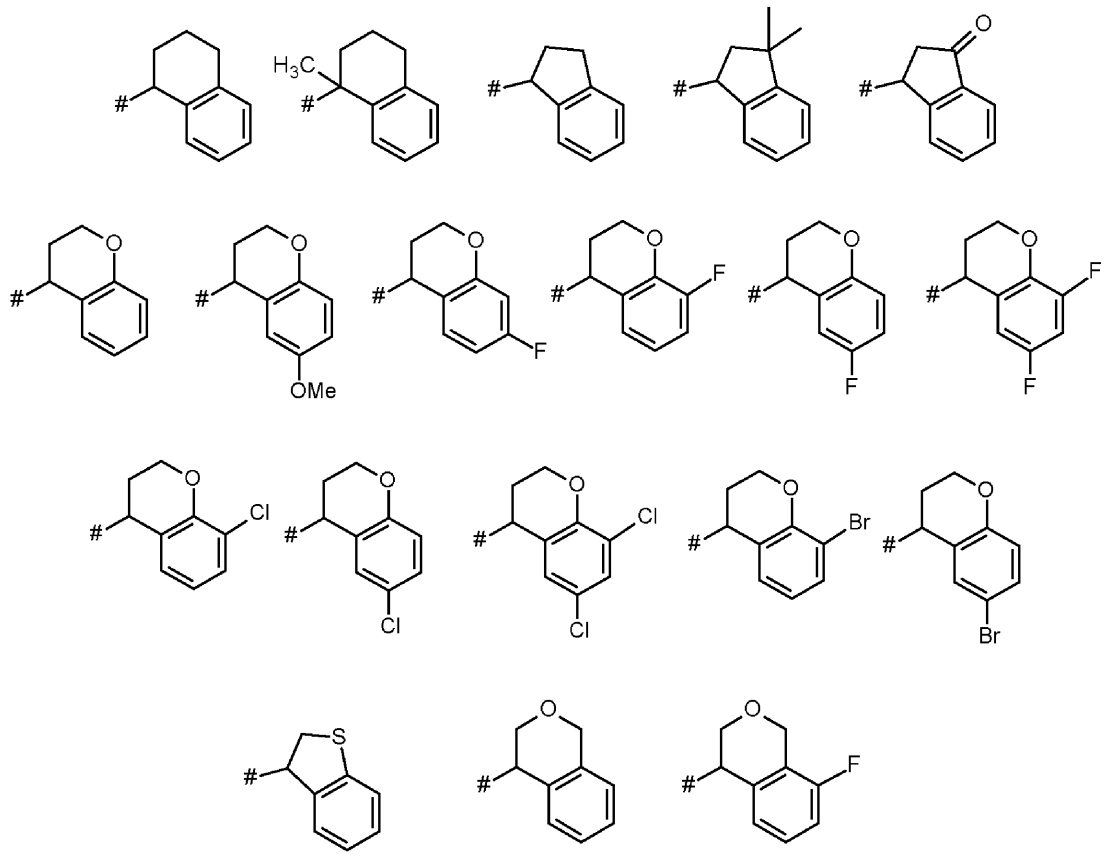
【０１１８】
からなる群から選択され、
式中、
各Ｚ^{23}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、又は
Ｑが、
【化３２】



,

【０１１９】
からなる群から選択される、
上記一般式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１２０】
第１の態様の第６の実施形態によれば、本発明は、
Ａが、

【化３３】



,

【０１２１】

からなる群から選択され、

Ｒ^{1}が、水素又はメチルであり、

Ｒ^{2}が、

塩素、ヨウ素、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、

－ＮＲ^{12}Ｒ^{13}；

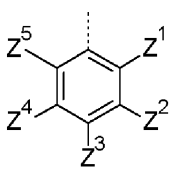
－ＯＲ^{14}；

－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{15}；

メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、エテニル、プロペニル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ、シアノ、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、メトキシ、ＮＨ$_{2}$、Ｎ（ＣＨ$_{3}$）$_{2}$、Ｎ（ＣＨ$_{3}$）（Ｃ（Ｏ）ＣＨ$_{3}$）からなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

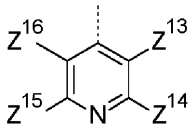
アゼチジン、オキセタン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、テトラヒドロピラン、ジヒドロ－２Ｈ－ピラン、１，２－オキサゾリジン、モルホリン、チオモルホリン、３，４－ジヒドロイソキノリン、２，３－ジヒドロ－インドール、１，３－ジヒドロ－イソインドール、３，９－ジオキサ－７－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、６－オキサ－３－アザビシクロ［３．１．１］ヘプタン、８－オキサ－３－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、チオフェン、イミダゾール、ピラゾール、１，２，３－トリアゾール、１，２，３，４－テトラゾール、ピリジン、ジヒドロピリジン、ピリミジン、テトラヒドロピリミジンからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、メチル、メチル－Ｃ（Ｏ）－、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル－、メトキシメチル－、

－ＮＨ$_2$、－ＮＭｅ$_2$、ピロリジンからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
Ｒ^{3}が、水素又はメチルであり、
Ｒ^{4}が、水素、塩素、フッ素、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、
Ｒ^{5}が、水素、塩素、フッ素、－ＯＨ、シアノ、メチル、トリフルオロメトキシ及びＮＨ$_2$からなる群から選択され、
Ｒ^{6}が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル及びメトキシからなる群から選択され、
Ｒ^{12}及びＲ^{13}が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－メチル）、メトキシ；
メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、ベンジル、１－フェニルエチル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＭｅ$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－メチル、メチル、メトキシ、シクロプロピル、－ＮＨ$_2$、－ＮＭｅ$_2$、ＳＯ$_2$－メチル及び（ＥｔＯ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－メチル、複素環－エチル［当該複素環置換基は、オキセタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ピロリジン、ピラゾール、イミダゾール、１，２，４－オキサジアゾール、モルホリン、ピリジンからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にオキソ及びメチルからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル；
２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン、及び
オキセタン、モルホリン、テトラヒドロピラン、ピリジン及びピラゾールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環
からなる群から選択され；
Ｒ^{14}が、
メチル、エチル、イソプロピル、ブチル、シクロペンチル、ベンジル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、メチル、メトキシ及びシクロペンチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
ピロリジン及びテトラヒドロピランからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環
からなる群から選択され、
Ｒ^{15}が、
メチル及びエチル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
ピリジン
からなる群から選択され、
Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化３４】



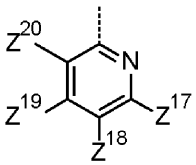
(Q1)

【０１２２】
であり、
式中、
Z^1及びZ^5が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、
Z^2及びZ^4が、独立に水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、エチル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＮＨＭｅ、－NMe_2、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、－ＳＭｅ及びモルホリニルからなる群から選択され、及び
Z^3が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ及び－NMe_2からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化３５】



(Q4)

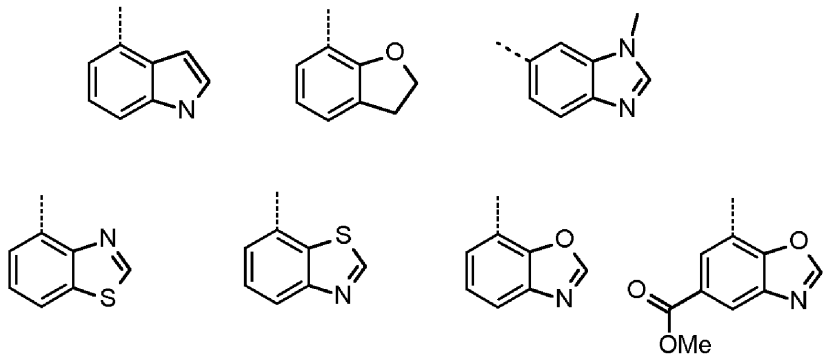
【０１２３】
であり、
式中、
Z^{14}及びZ^{15}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ヒドロキシメチル、NH_2、モルホリニルからなる群から選択され、及び
Z^{13}及びZ^{16}が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシからなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：
【化３６】



(Q5)

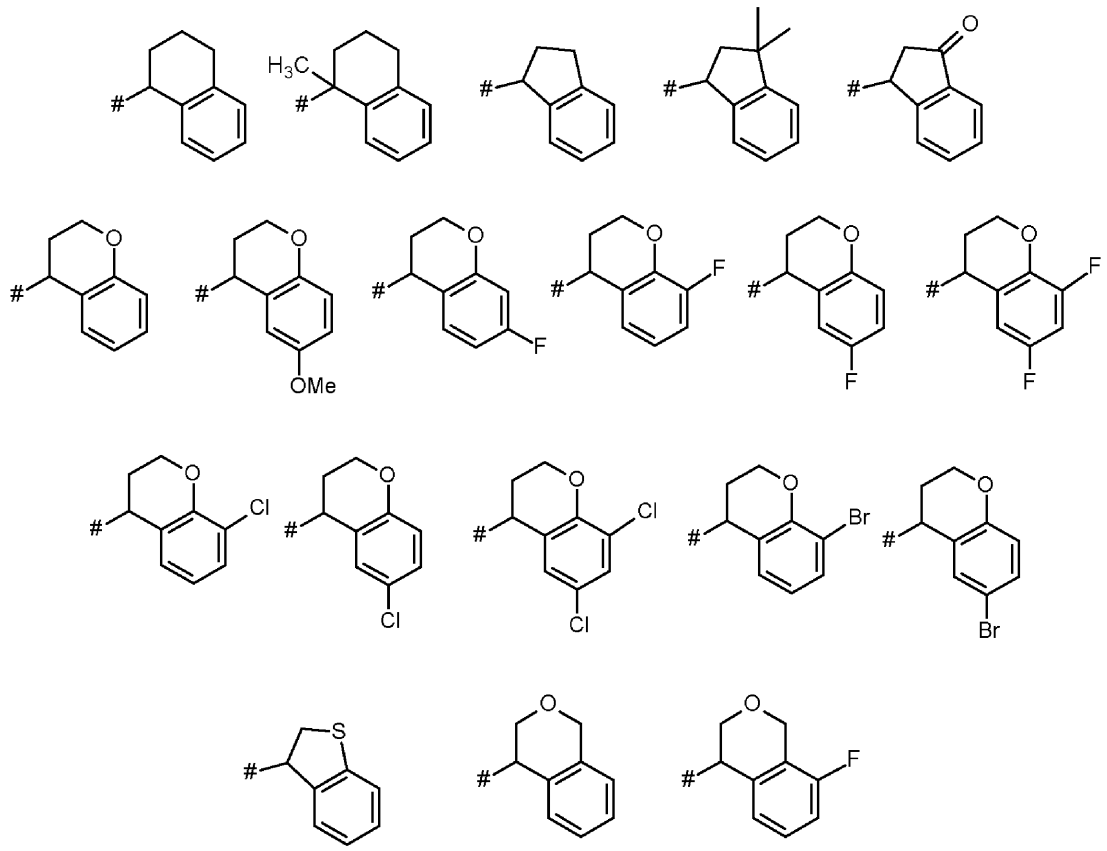
【０１２４】
であり、
式中、
Z^{17}、Z^{18}、及びZ^{19}が水素であり、及び
Z^{20}が、フッ素であり、又は
Ｑが、

【化３７】



,

【０１２５】
からなる群から選択される、
上記一般式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１２６】
第１の態様の第７の実施形態によれば、本発明は、
Ａが、
【化３８】



,

【０１２７】
からなる群から選択され、
R^1が、水素又はメチルであり、
R^2が、水素、（１Ｓ）－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イルアミノ、（２，３－ジフルオロベンジル）オキシ、（２－アセトアミドエチル）アミノ、（２－アミノ

－２－オキソエチル）アミノ、（２－アミノエチル）アミノ、（２－カルボキシエチル）スルファニル、（２－エトキシ－２－オキソエチル）（メチル）アミノ、（２－ヒドロキシエチル）（メチル）アミノ、（２－ヒドロキシエチル）アミノ、ヒドロキシメチル、メトキシメチル、２－ヒドロキシエチル、（２－ヒドロキシエチル）オキシ、（２－ヒドロキシエチル）スルファニル、（２－メトキシ－２－オキソエチル）アミノ、（３－メトキシ－３－オキソプロピル）－メチルアミノ、（２－メトキシエチル）（メチル）アミノ、（２－メトキシエチル）アミノ、（２－メトキシエチル）オキシ、（２Ｒ）－２－（ヒドロキシメチル）ピロリジン－１－イル、（２Ｒ）－２－（メトキシカルボニル）ピロリジン－１－イル、（２Ｒ）－２－（メトキシメチル）ピロリジン－１－イル、（２Ｒ）－２－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）ピロリジン－１－イル、（２Ｒ）－２－カルボキシラトピロリジン－１－イル、（２Ｒ）－２－カルボキシピロリジン－１－イル、（２Ｒ，６Ｓ）－２，６－ジメチルモルホリン－４－イル、２－（トリフルオロメチル）モルホリン－４－イル、（２ｒａｃ）－２－カルボキシピロリジン－１－イル、（２Ｓ）－２－（エトキシカルボニル）ピロリジン－１－イル、（２Ｓ）－２－（ヒドロキシメチル）ピロリジン－１－イル、（２Ｓ）－２－（メトキシカルボニル）ピロリジン－１－イル、（２Ｓ）－２－（メトキシメチル）ピロリジン－１－イル、（２Ｓ）－２－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）ピロリジン－１－イル、（２Ｓ）－２－カルバモイルピロリジン－１－イル、（２Ｓ）－２－カルボキシピロリジン－１－イル、（２Ｓ）－２－メチル－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インドール－１－イル、（２Ｓ）－２－メチルモルホリン－４－イル、（２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル）（メチル）アミノ、（２－ｔｅｒｔ－ブトキシ－２－オキソエチル）アミノ、２，２－ジフルオロエチル（メチル）アミノ、（３，３，３－トリフルオロプロピル）アミノ、（３，３－ジメチルブチル）オキシ、（３－アミノ－３－オキソプロピル）（メチル）アミノ、（３－アミノ－３－オキソプロピル）アミノ、（３－フルオロベンジル）オキシ、（３－メトキシ－３－メチルブチル）オキシ、（３－メトキシベンジル）オキシ、（３Ｒ）－３－（ヒドロキシメチル）ピロリジン－１－イル、（３Ｒ）－３－（メトキシカルボニル）ピロリジン－１－イル、（３Ｒ）－３－アミノピロリジン－１－イル、（３Ｒ）－３－カルボキシピロリジン－１－イル、（３Ｒ）－３－ヒドロキシピロリジン－１－イル、（３Ｒ）－ピロリジン－３－イルオキシ、（３ｒａｃ，４ｒａｃ）－３－アミノ－４－フルオロピロリジン－１－イル、（３Ｓ）－３－（ジメチルアミノ）ピロリジン－１－イル、（３Ｓ）－３－（ヒドロキシメチル）ピロリジン－１－イル、（３Ｓ）－３－（メトキシカルボニル）ピロリジン－１－イル、（３Ｓ）－３－ヒドロキシピロリジン－１－イル、（カルボキシラトメチル）アミノ、（カルボキシメチル）（メチル）アミノ、（カルボキシエチル）アミノ、（シクロペンチルメチル）オキシ、（シクロプロピルメチル）（メチル）アミノ、（ピリジン－２－イルメチル）アミノ、（ｒａｃ）－３－ヒドロキシピロリジン－１－イル、［（１Ｒ，３Ｓ）－３－アミノ－２，２－ジメチルシクロプロピル］アミノ、［（２Ｒ）－１－ヒドロキシブタン－２－イル］アミノ、［（２Ｓ）－１－アミノ－１－オキソプロパン－２－イル］アミノ、［（５－メチル－１，２，４－オキサジアゾール－３－イル）メチル］アミノ、［（ジエトキシホスホリル）メチル］（メチル）アミノ、［２－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）エチル］アミノ、２－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）エチルアミノ、２－（１Ｈ－イミダゾール－１－イル）エチル－メチルアミノ、［２－（シクロプロピルアミノ）エチル］アミノ、［２－（ジメチルアミノ）エチル］アミノ、［２－（ピロリジン－１－イル）エチル］アミノ、［３－（ジメチルアミノ）－３－オキソプロピル］アミノ、１，１－ジオキシドチオモルホリン－４－イル、１，２－オキサゾリジン－２－イル、１，３－ジヒドロ－２Ｈ－イソインドール－２－イル、１－シアノ－２－エトキシ－２－オキソエチル、１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル、１Ｈ－イミダゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イル、１Ｈ－ピラゾール－４－イルアミノ、２，２－ジメチルモルホリン－４－イル、２，２－ジメチルピロリジン－１－イル、２，４－ジメチル－３，５－ジオキソ－１，２，４－トリアゾリジン－１－イル、２－アセチルヒドラジノ、２－アミノ－２－オキソエチル、２Ｈ－１，２，３－トリアゾ

ール－２－イル、１Ｈ－テトラゾール－５－イル、３－（ピロリジン－１－イル）アゼチジン－１－イル、３，３－ジフルオロアゼチジン－１－イル、３，３－ジフルオロピロリジン－１－イル、３，４－ジヒドロイソキノリン－２（１Ｈ）－イル、３，９－ジオキサ－７－アザビシクロ［３．３．１］ノナ－７－イル、３－フルオロアゼチジン－１－イル、３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル、３－メチルアゼチジン－１－イル、３－オキソピラゾリジン－１－イル、１－（ジフルオロメチル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル、４－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－ピラゾール－１－イル、１－メチル－ピペリジン－４－イル、４－フルオロピペリジン－１－イル、４，４－ジフルオロピペリジン－１－イル、４－アセチルピペラジン－１－イル、４－オキソイミダゾリジン－１－イル、６－オキサ－３－アザビシクロ［３．１．１］ヘプタ－３－イル、８－オキサ－３－アザビシクロ［３．２．１］オクタ－３－イル、アミノ、アニリノ、アゼチジン－１－イル、ベンジル（メチル）アミノ、ビス（２－メトキシエチル）アミノ、塩素、ヨウ素、シアノメチル、シクロブチル（メチル）アミノ、シクロペンチルオキシ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロプロピル（エチル）アミノ、シクロプロピル（メチル）アミノ、シクロプロピルアミノ、ジエチルアミノ、ジメチルアミノ、ジメチルアミノカルボニル、アミノメチル、２－アミノエチル、（ジメチルアミノ）メチル、２－（ジメチルアミノ）エチル、［アセチル（メチル）アミノ］メチル、エテニル、エチル、エチル（２－メトキシエチル）アミノ、エチルアミノ、エチルオキシ、エチルスルファニル、エチルスルフィニル、エチルスルホニル、エチル（メチル）アミノ、イソブチル（メチル）アミノ、イソプロピル（メチル）アミノ、イソプロピル、イソプロピルオキシ、メトキシ（メチル）アミノ、メトキシアミノ、メチル、メチル（２－メチルスルホニルエチル）アミノ、メチル－オキソラン－３－イル］メチル］アミノ、メチル（オキサン－４－イルメチル）アミノ、メチル（１－フェニルエチル）アミノ、メチル（２，２，２－トリフルオロエチル）アミノ、オキセタン－３－イルメチルアミノ、メチル（オキセタン－３－イル）アミノ、メチル（フェニル）アミノ、メチル［２－（２－オキソピロリジン－１－イル）エチル］アミノ、メチル［２－（モルホリン－４－イル）エチル］アミノ、メチルアミノ、メチルオキシ、メチルスルファニル、モルホリン－４－イル、モルホリン－４－イルアミノ、ニトリロメチル、プロパ－１－エン－２－イル、プロピル、プロピルアミノ、ピリジン－４－イル、ピリジン－２－イルスルファニル、ピリジン－４－イルアミノ、ピロリジン－１－イル、ピロリジン－３－イル、オキセタン－３－イル、テトラヒドロフラン－３－イル、３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル、テトラヒドロピラン－４－イル、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イルアミノ、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イルオキシ、２－アミノピリミジン－５－イル、１，３－ジメチル－２，４－ジオキソ－１，２，３，４－テトラヒドロピリミジン－５－イル、３－フルオロ－２－オキソ－１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、２－オキソ－１，２－ジヒドロピリジン－５－イル、３－チエニル及びチオモルホリン－４－イルからなる群から選択され、

R^3が、水素又はメチルであり、

R^4が、水素、塩素、フッ素、－ＯＨ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ及びNH_2からなる群から選択され、

R^5が、水素、塩素、フッ素、－ＯＨ、シアノ、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、

R^6が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル及びメトキシからなる群から選択され、

Ｑが、フェニル、１，３－ベンゾチアゾール－４－イル、１，３－ベンゾチアゾール－７－イル、１，３－ベンゾオキサゾール－７－イル、１Ｈ－インドール－４－イル、１－メチル－１Ｈ－ベンゾイミダゾール－６－イル、２，５－ビス（トリフルオロメチル）フェニル、２，３，４－トリフルオロフェニル、２，３，５－トリクロロフェニル、２，３，５－トリフルオロフェニル、２，３，６－トリフルオロフェニル、２，３－ジクロロフェニル、２，３－ジクロロ－５－シアノフェニル、２，３－ジクロロ－５－ヒドロキシフェニル、２，３－ジヒドロ－１－ベンゾフラン－７－イル、２，３－ジフルオロフェニル

、２，４，５－トリフルオロフェニル、２，４，６－トリフルオロ－３－メトキシフェニル、２，４－ジフルオロ－３－ヒドロキシフェニル、２，４－ジフルオロ－３－メトキシフェニル、２，５－ジクロロフェニル、２－クロロ－５－シアノフェニル、２－クロロ－５－メチルフェニル、２，５－ジフルオロ－４－メトキシフェニル、２，６－ジフルオロフェニル、２－クロロ－６－メチルピリジン－４－イル、３－メチルピリジン－４－イル、２，６－ジメチルピリジン－４－イル、２－クロロ－３－フルオロフェニル、２－クロロ－４－（ジメチルアミノ）フェニル、２－クロロ－４－フルオロフェニル、２－クロロ－５－フルオロフェニル、２－クロロ－６－フルオロフェニル、２－クロロフェニル、２－クロロピリジン－４－イル、３－クロロピリジン－４－イル、２，３－ジクロロピリジン－４－イル、２，５－ジクロロピリジン－４－イル、２，６－ジクロロピリジン－４－イル、３，５－ジクロロピリジン－４－イル、２，６－ジフルオロピリジン－４－イル、３，５－ジフルオロピリジン－４－イル、２－クロロ－３－フルオロピリジン－４－イル、２－シアノピリジン－４－イル、３－クロロ－２－メトキシピリジン－４－イル、５－クロロ－２－メトキシピリジン－４－イル、５－フルオロ－２－メトキシピリジン－４－イル、５－フルオロ－２－イソプロピルオキシピリジン－４－イル、２，３－ジメトキシピリジン－４－イル、２，６－ジメトキシピリジン－４－イル、２－フルオロ－５－メチルフェニル、３－フルオロ－５－メチルフェニル、２－フルオロ－３－（トリフルオロメトキシ）フェニル、２－フルオロ－３－（トリフルオロメチル）フェニル、５－フルオロ－２－（トリフルオロメチル）フェニル、３－シアノ－５－メチルフェニル、２－フルオロピリジン－４－イル、２－エトキシ－５－フルオロピリジン－４－イル、２－（ヒドロキシメチル）ピリジン－４－イル、２－メチルピリジン－４－イル、２－メトキシピリジン－４－イル、３－メトキシピリジン－４－イル、２－アミノピリジン－４－イル、２－モルホリン－４－イルピリジン－４－イル、３－（ジメチルアミノ）－２，４－ジフルオロフェニル、３－（ジメチルアミノ）フェニル、３－（メチルアミノ）フェニル、３－（トリフルオロメチル）フェニル、３－（トリフルオロメトキシ）フェニル、３，４，５－トリフルオロフェニル、３，４－ジクロロ－５－（ジメチルアミノ）フェニル、３，４－ジクロロフェニル、３，４－ジフルオロ－２－メトキシフェニル、３，４－ジフルオロフェニル、３，５－ジクロロ－４－（ジメチルアミノ）フェニル、３，５－ジクロロ－４－フルオロフェニル、３，５－ジクロロフェニル、３，５－ジフルオロフェニル、４－（ジフルオロメトキシ）－３，５－ジフルオロフェニル、２，５－ジメチルフェニル、３，５－ジメチルフェニル、３－ｔｅｒｔ－ブチル－５－メチルフェニル、５－ｔｅｒｔ－ブチル－２－クロロ－３－メチルフェニル、３－クロロ－２－フルオロ－５－メチルフェニル、３－クロロ－２－フルオロフェニル、３－クロロ－２－メチルフェニル、３－クロロ－４－（ジメチルアミノ）－５－フルオロフェニル、３－クロロ－４－（ジメチルアミノ）フェニル、３－クロロ－４－フルオロフェニル、３－クロロ－４－メチルフェニル、３－クロロ－５－（ジメチルアミノ）フェニル、３－クロロ－５－（メチルスルファニル）フェニル、３－クロロ－５－（モルホリン－４－イル）フェニル、２－クロロ－３－（トリフルオロメチル）フェニル、２－メチル－５－（トリフルオロメチル）フェニル、３－クロロ－５－（トリフルオロメチル）フェニル、３－クロロ－５－エチルフェニル、３－クロロ－５－フルオロフェニル、３－クロロ－５－メトキシフェニル、３－クロロ－５－メチルフェニル、３－クロロフェニル、３－フルオロ－２－メチルフェニル、３－フルオロ－４－メトキシフェニル、３－フルオロ－５－メチルフェニル、３－フルオロピリジン－２－イル、３－フルオロピリジン－４－イル、４－クロロ－３－（ジメチルアミノ）フェニル、４－フルオロ－３－メトキシフェニル、５－（メトキシカルボニル）－１，３－ベンゾオキサゾール－７－イル、５－クロロ－２，４－ジフルオロフェニル、５－クロロ－２－フルオロ－３－メチルフェニル、５－クロロ－２－フルオロ－４－メチルフェニル、５－クロロ－２－フルオロフェニル、５－クロロ－２－メトキシフェニル、５－フルオロ－２－メチルフェニル、５－フルオロ－２－メトキシフェニル、５－クロロ－１Ｈ－イミダゾール－２－イル、３，５－ジエチルフェニル、２－クロロ－３，５－ジエチルフェニル、３－クロロ－２－チエニル、４－クロロ－２－チエニル、５－クロロ－２－チエニル

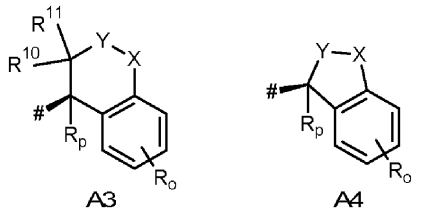
、２，５－ジクロロ－３－チエニル、５－フルオロ－２－チエニル、５－シアノ－２－チエニル、５－シアノ－４－メチル－２－チエニル、５－メチル－２－チエニル、２，５－ジメチル－３－チエニル、５－（トリフルオロメチル）－２－チエニル及び２－メチル－１，３－チアゾール－５－イルからなる群から選択される、
上記一般式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１２８】

第１の態様の第８の実施形態によれば、本発明は、

Ａが、Ａ３又はＡ４：

【化３９】



【０１２９】

であり、

ｏが、０又は１であり、

Ｒが、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシからなる群から選択され、

Ｒ$_p$が、水素、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルからなる群から選択され、

Ｘが、ＣＲ^{7}Ｒ^8、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ^{9}からなる群から選択され、

Ｙが、ＣＲ^{7}Ｒ^{8}又はＯであり、

Ｒ^{1}が、水素又はＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルであり、

Ｒ^{2}が、

水素、ハロゲン、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$；

－ＮＲ^{12}Ｒ^{13}；

－ＯＲ^{14}；

－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_2$Ｒ^{15}；

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルケニル又はＣ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルケニル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－及び－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）からなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］、及び

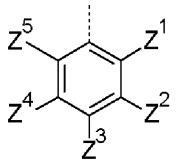
４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール、及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－、－ＮＨ$_2$、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ^{3}が、水素又はＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキルであり、

Ｒ^{4}が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、ＮＨ$_2$からなる群から選択され、

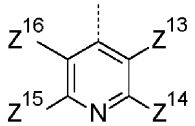
R^5が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、
R^6が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、
R^7が、水素及びC_1－C_4－アルキルからなる群から選択され、
R^8が、水素及びC_1－C_4－アルキルからなる群から選択され、
又はR^7及びR^8が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、
R^9が、C_1－C_4－アルキルであり、
R^{10}が、水素、－ＯＨ及びC_1－C_4－アルキルからなる群から選択され、
R^{11}が、水素であり、
R^{12}及びR^{13}が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル）、C_1－C_4－アルコキシ；
C_1－C_4－アルキル、C_3－C_6－シクロアルキル、フェニル－C_1－C_4－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、C_1－C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルコキシ、C_3－C_6－シクロアルキル、$-NH_2$、－Ｎ（C_1－C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1－C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1－C_4－アルキル、－SO_2－C_1－C_4－アルキル、及び（C_1－C_4－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－C_1－C_4－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル及びベンゾ－C_5－C_6－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
R^{14}が、
C_1－C_4－アルキル、C_3－C_6－シクロアルキル、フェニル－C_1－C_4－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル、C_1－C_4－アルコキシ及びC_3－C_6－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
４～１０員ヘテロシクロアルキル
からなる群から選択され、
R^{15}が、
水素；
C_1－C_4－アルキル［それは、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

６員ヘテロアリール
からなる群から選択され、
Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化４０】



(Q1)

【０１３０】
であり、
式中、
Z^1及びZ^5が、独立に水素、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ及び１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、
Z^2及びZ^4が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、－ＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、－Ｓ－（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）及び４～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、及び
Z^3が、水素、ハロゲン、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ及び－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は
Z^1及びZ^2が、それらが結合している炭素原子とともに、５員ヘテロシクロアルキル又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、
Z^3及びZ^5が水素であり、及び
Z^4が、水素及びＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化４１】



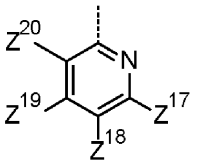
(Q4)

【０１３１】
であり、
式中、
Z^{13}、Z^{14}、Z^{15}及びZ^{16}が、独立に、水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ヒドロキシアルキル、ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＣＯ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環［これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアル

キル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化４２】



(Q5)

【０１３２】

であり、

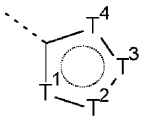
式中、

Ｚ１７、Ｚ１８、及びＺ１９が水素であり、及び

Ｚ２０が、ハロゲンであり、又は

Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：

【化４３】



(Q6)

【０１３３】

であり、

式中、

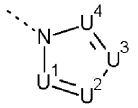
Ｔ１～Ｔ４が、独立にＮ、Ｏ、Ｓ、Ｃ－Ｚ２１及びＮ－Ｚ２２からなる群から選択され、ここで、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＯであり、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＳであり、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＮ－Ｚ２２であり、及びここで、

各Ｚ２１が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、及び

各Ｚ２２が、独立に水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、又は

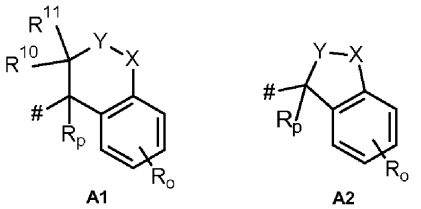
Ｑが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：

【化４４】



(Q7)

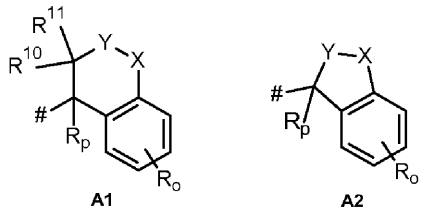
【０１３４】
であり、
式中、
U^1～U^4が、独立にＮ及びＣ－Z^{23}からなる群から選択され、ここで、U^1～U^4のうちの３個以下がＮであり、及びここで、
各Z^{23}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシからなる群から選択される、
上記一般式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１３５】
本発明の第１の態様のさらなる実施形態：
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、Ａ１又はＡ２：，
【化４５】



A1 A2

【０１３６】
であり、
ｏが、０、１又は２であり、
Ｒが、ハロゲン、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシ、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、
R_pが、水素であり、
Ｘ、Ｙが、独立にＣ$R^7$$R^8$、Ｏ、Ｓ、及びＮ－$R^9$からなる群から選択され、ここで、
Ｘ及びＹの少なくとも一つが、Ｃ$R^7$$R^8$であり、
R^7が、水素及びC_1－C_4－アルキルからなる群から選択され、
R^8が、水素及びC_1－C_4－アルキルからなる群から選択され、
R^9が、C_1－C_4－アルキルであり、
R^{10}が、水素、－ＯＨ、C_1－C_4－アルキル及びC_1－C_4－アルコキシからなる群から選択され、及び
R^{11}が、水素であり、
ここで、ＹがＯ、Ｓ又はＮ－R^9である場合、R^{10}が－ＯＨではない、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１３７】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、Ａ１又はＡ２：

【化４６】



【０１３８】

であり、

ｏが、０、１又は２であり、

Ｒが、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシ、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、

Ｒｐが、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｘ、Ｙが、独立にＣＲ７Ｒ８、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ９からなる群から選択され、ここで、

Ｘ及びＹの少なくとも一つが、ＣＲ７Ｒ８であり、

Ｒ７が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ８が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

又はＲ７及びＲ８が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、

Ｒ９が、Ｃ１－Ｃ４－アルキルであり、

Ｒ１０が、水素、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、及び

Ｒ１１が、水素であり、

ここで、ＹがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ９である場合、Ｒ１０が－ＯＨでない、

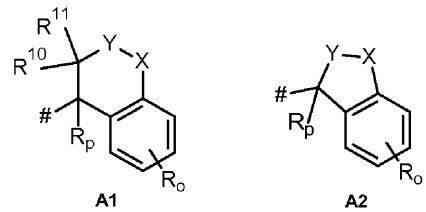
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１３９】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、

Ａが、Ａ１又はＡ２：

【化４７】



【０１４０】

であり、

ｏが、０、１又は２であり、

Ｒが、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシ、シアノ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、

Ｒｐが、水素であり、

Ｘ、Ｙが、独立にＣＲ７Ｒ８、Ｏ、及びＳからなる群から選択され、ここで、

Ｘ及びＹの少なくとも一つが、ＣＲ７Ｒ８であり、

Ｒ７が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ８が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

又はＲ７及びＲ８が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、

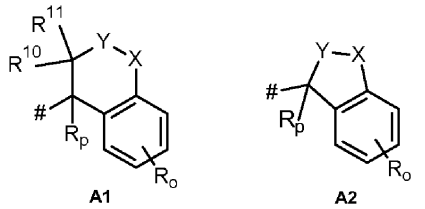
Ｒ１０が、水素、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、及び

Ｒ１１が、水素であり、
ここで、ＹがＯ、Ｓ又はＮ－Ｒ９である場合、Ｒ１０が－ＯＨではない、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１４１】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、Ａ１又はＡ２：

【化４８】



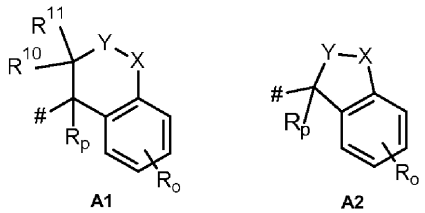
【０１４２】

であり、
ｏが、０又は１であり、
Ｒが、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、
Ｒｐが、水素であり、
Ｘが、ＣＲ７Ｒ８、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ９からなる群から選択され、
Ｙが、ＣＲ７Ｒ８であり、
Ｒ７が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、
Ｒ８が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、
Ｒ９が、Ｃ１－Ｃ４－アルキルであり、
Ｒ１０が、水素、－ＯＨ及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、及び
Ｒ１１が、水素である、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１４３】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、Ａ１又はＡ２：

【化４９】



【０１４４】

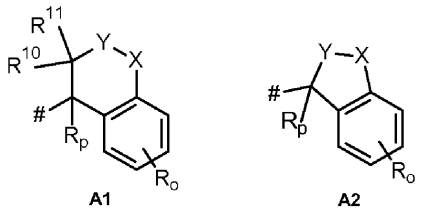
であり、
ｏが、０又は１であり、
Ｒが、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、
Ｒｐが、水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、
Ｘが、ＣＲ７Ｒ８、Ｏ、Ｓ、及びＮ－Ｒ９からなる群から選択され、
Ｙが、ＣＲ７Ｒ８又はＯであり、
Ｒ７が、水素及びＣ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、

Ｒ^{8}が、水素及びＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルからなる群から選択され、
又はＲ^{7}及びＲ^{8}が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、
Ｒ^{9}が、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルであり、
Ｒ^{10}が、水素、－ＯＨ及びＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルからなる群から選択され、及び
Ｒ^{11}が、水素である、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１４５】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、Ａ１又はＡ２：

【化５０】



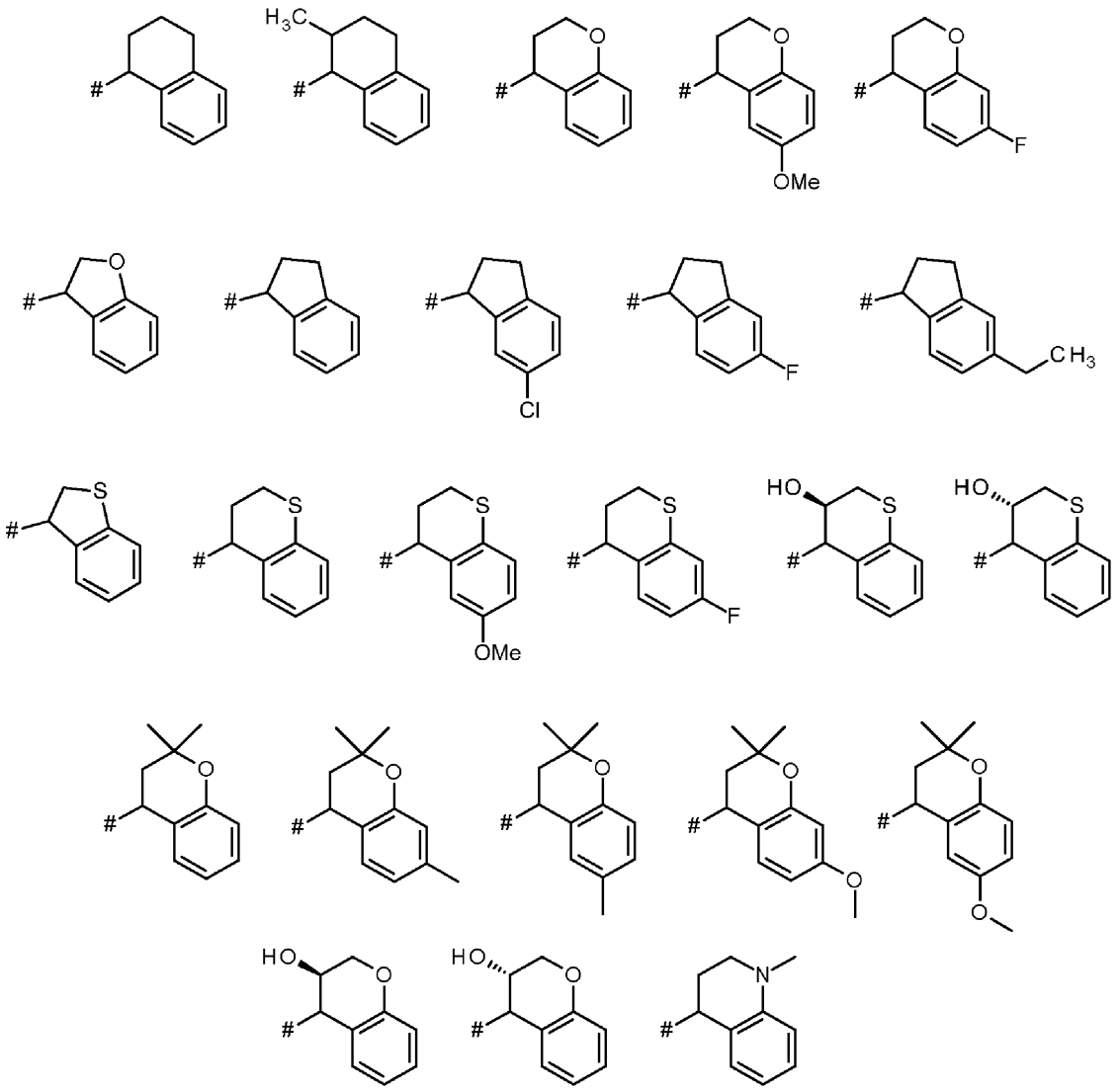
【０１４６】

であり、
ｏが、０又は１であり、
Ｒが、ハロゲン、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル及びＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシからなる群から選択され、
Ｒ$_{p}$が、水素であり、
Ｘが、ＣＲ^{7}Ｒ^{8}、Ｏ及びＳ、及びＮ－Ｒ^{9}からなる群から選択され、
Ｙが、ＣＲ^{7}Ｒ^{8}又はＯであり、
Ｒ^{7}が、水素及びＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルからなる群から選択され、
Ｒ^{8}が、水素及びＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルからなる群から選択され、
又はＲ^{7}及びＲ^{8}が一緒に、オキソ基（＝Ｏ）を形成しており、
Ｒ^{10}が、水素、－ＯＨ及びＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルからなる群から選択され、及び
Ｒ^{11}が、水素である、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１４７】

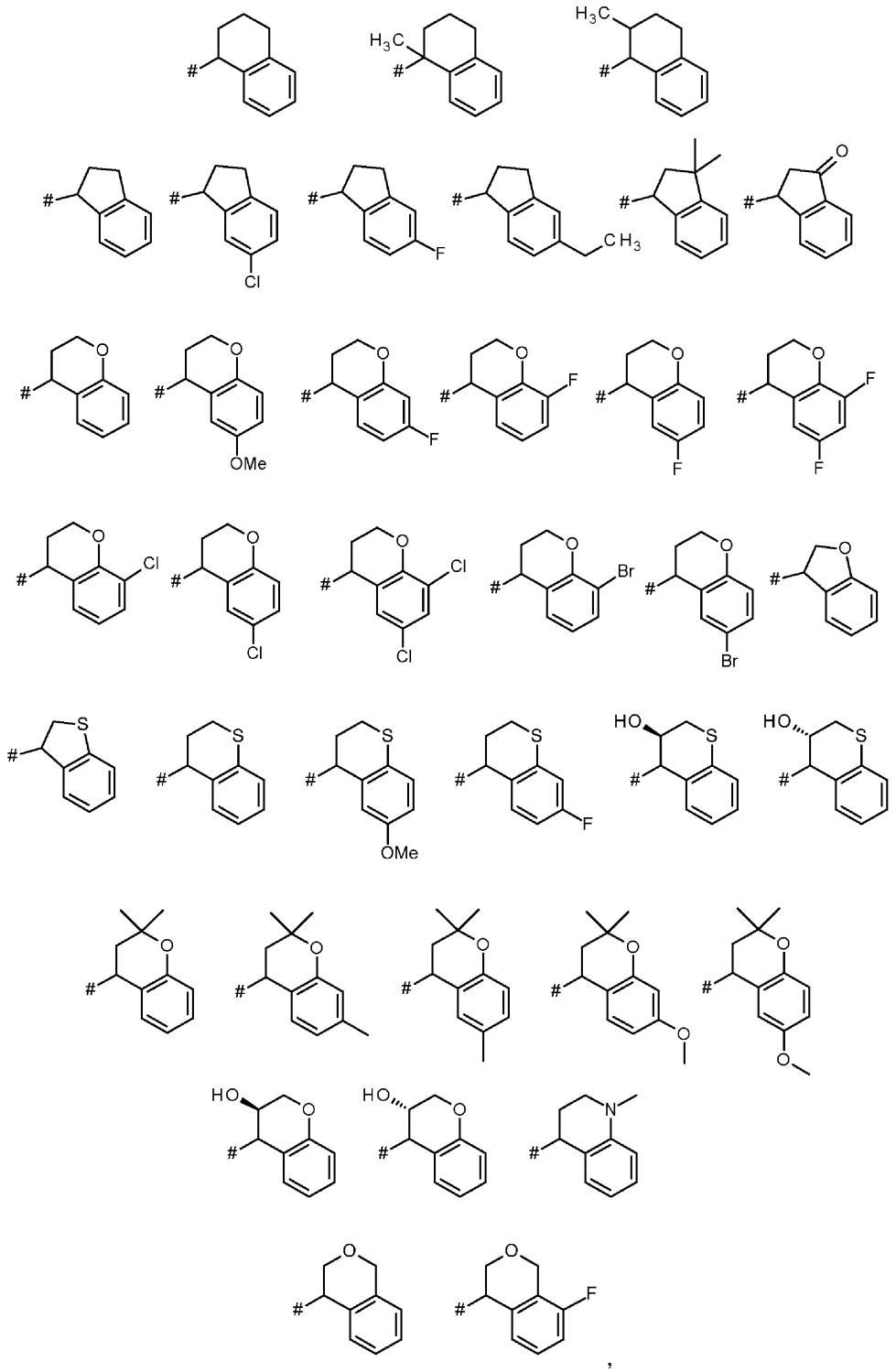
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、

【化５１】



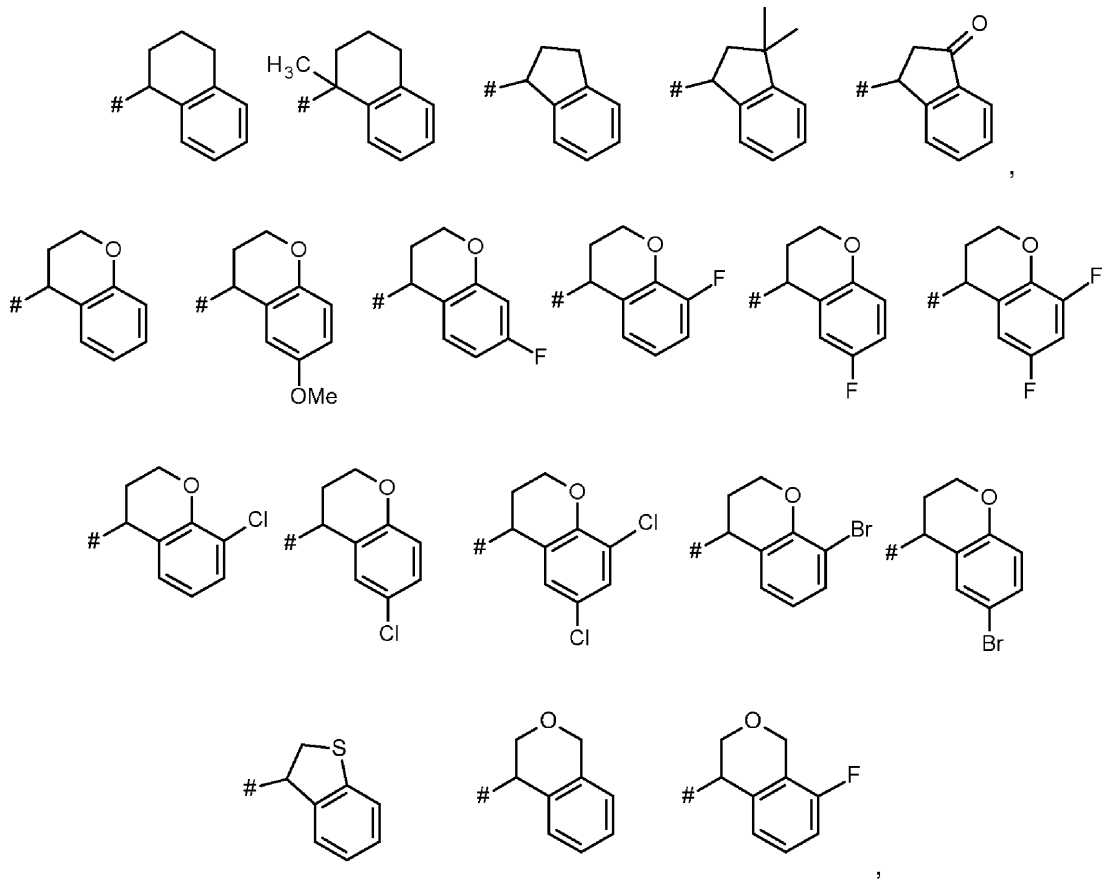
【０１４８】
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１４９】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、

【化５２】



【０１５０】
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１５１】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、

【化５３】



【０１５２】
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１５３】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ^{2}が、
水素、ハロゲン、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$；
－ＮＲ^{12}Ｒ^{13}；
－ＯＲ^{14}；
－ＳＲ^{15}、－Ｓ（Ｏ）Ｒ^{15}、－ＳＯ$_{2}$Ｒ^{15}；
Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルケニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルキニル又はフェニル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_{2}$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、－ＳＯ$_{2}$－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_{2}$－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ^{12}及びＲ^{13}が、独立に、

水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ；

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、フェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ$_2$、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）－（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、－ＮＨ$_2$、－ＮＨ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）$_2$、－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_2$－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル及び（Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル、ベンゾ－Ｃ$_5$－Ｃ$_6$－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ^{14}が、

Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、フェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_1$－Ｃ$_4$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルコキシ、１

～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；

Ｒ１５が、

水素；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１５４】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、

Ｒ２が、

水素、ハロゲン、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２；

－ＮＲ１２Ｒ１３；

－ＯＲ１４；

－ＳＲ１５、－Ｓ（Ｏ）Ｒ１５、－ＳＯ２Ｒ１５；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルケニル、Ｃ２－Ｃ４－アルキニル又はフェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキルからなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それ

らはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ１２及びＲ１３が、独立に、

水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）－（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及び（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ）２Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル、ベンゾ－Ｃ５－Ｃ６－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群からの単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、

Ｒ１４が、

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良

い。］；及び
　複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；
Ｒ１５が、
　水素；
　Ｃ１－Ｃ４－アルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
　複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１５５】
　第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ２が、
　水素、ハロゲン、
　－ＮＲ１２Ｒ１３；
　－ＯＲ１４；
　－ＳＲ１５、－Ｓ（Ｏ）Ｒ１５、－ＳＯ２Ｒ１５；
　Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル又はＣ３－Ｃ６－シクロアルケニル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－及び－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２からなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
　４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリール、及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
Ｒ１２及びＲ１３が、独立に、
　水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ；
　Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ

３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、及び（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ）２Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；

フェニル及びベンゾ－Ｃ５－Ｃ６－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］

からなる群から選択され、

Ｒ１４が、

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ及びＣ３－Ｃ６－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル

からなる群から選択され、

Ｒ１５が、

水素；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それは、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

６員ヘテロアリール

からなる群から選択される、

上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１５６】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、

Ｒ２が、

水素、ハロゲン、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２；

－ＮＲ１２Ｒ１３；

－ＯＲ１４；

－ＳＲ１５、－Ｓ（Ｏ）Ｒ１５、－ＳＯ２Ｒ１５；

Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル又はＣ３－Ｃ６－シクロアルケニル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－及び－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）（Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）からなる群から選択される１、２、３、４若しくは５個の置換基によって置換されていても良い。］；及び

４～１０員ヘテロシクロアルキル、ヘテロスピロシクロアルキル、５員ヘテロアリー

ル、及び６員ヘテロアリールからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル－、－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、及び４～１０員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
Ｒ１２及びＲ１３が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ；
Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ２、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、－ＮＨ２、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、－Ｓ－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、－ＳＯ２－Ｃ１－Ｃ４－アルキル、及び（Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ）２Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［当該複素環置換基は、４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、－ＯＨ、オキソ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル及びベンゾ－Ｃ５－Ｃ６－シクロアルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
４～１０員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール及び６員ヘテロアリールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、オキソ、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
Ｒ１４が、
Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、フェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それらはそれぞれ、独立にハロゲン、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ及びＣ３－Ｃ６－シクロアルキルからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
４～１０員ヘテロシクロアルキル
からなる群から選択され、
Ｒ１５が、
水素；
Ｃ１－Ｃ４－アルキル［それは、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
６員ヘテロアリール
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１５７】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^2が、
水素、塩素；
$-NR^{12}R^{13}$；
$-OR^{14}$；
$-SR^{15}$、$-S(O)R^{15}$、$-SO_2R^{15}$；
メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロヘキシル、プロペニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル［それらはそれぞれ、独立にシアノ、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、及び－Ｃ（Ｏ）－NH_2からなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
アゼチジン、ピロリジン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、テトラヒドロピリジン、ジヒドロ－２Ｈ－ピラン、１，２－オキサゾリジン、１，２－オキサジン、モルホリン、チオモルホリン、３，４－ジヒドロイソキノリン、２，３－ジヒドロ－インドール、１，３－ジヒドロ－イソインドール、３，９－ジオキサ－７－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、６－オキサ－３－アザビシクロ［３．１．１］ヘプタン、８－オキサ－３－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、イミダゾール、ピラゾール、１，２，４－トリアゾール、１，２，３－トリアゾール、４－オキサ－７－アザスピロ［２．５］オクタンからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、シアノ、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、メチル、メチル－Ｃ（Ｏ）－、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル－、メトキシメチル－、$-NH_2$、$-NMe_2$、ピロリジンからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
R^{12}及びR^{13}が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－メチル）、メトキシ；
メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、ベンジル、１－フェニルエチル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－NMe_2、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－メチル、メチル、メトキシ、シクロプロピル、$-NH_2$、NMe_2、Ｓ－メチル、Ｓ（Ｏ）－メチル、SO_2－メチル、及び$(EtO)_2P(=O)$－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－メチル、複素環－エチル［当該複素環置換基は、ピロリジン、モルホリン、ピラゾール、１，２，４－オキサジアゾール、ピリジンからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、－ＯＨ、オキソ及びメチルからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；
フェニル；
２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン、及び
オキセタン、チエタン、ピロリジン、モルホリン、テトラヒドロピラン、ピリジン及びピラゾールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、－ＯＨ、オキソ、メチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；
R^{14}が、
メチル、エチル、イソプロピル、ブチル、シクロペンチル、ベンジル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、メチル、メトキシ及びシクロペンチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
ピロリジン及びテトラヒドロピランからなる群から選択される単環式若しくは二環式

複素環
からなる群から選択され、
R^{15}が、
メチル及びエチル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
ピリジン
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１５８】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^{2}が、
水素、塩素、ヨウ素、－Ｃ（Ｏ）－Ｎ（CH_3）$_2$；
－$NR^{12}R^{13}$；
－OR^{14}；
－SR^{15}、－Ｓ（Ｏ）R^{15}、－SO_2R^{15}；
メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、エテニル、プロペニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル［それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ、シアノ、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、メトキシ、NH_2、Ｎ（CH_3）$_2$、Ｎ（CH_3）（Ｃ（Ｏ）CH_3）からなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
アゼチジン、オキセタン、ピロリジン、テトラヒドロフラン、ピラゾリジン、イミダゾリジン、１，２，４－トリアゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、テトラヒドロピリジン、ジヒドロ－２Ｈ－ピラン、１，２－オキサゾリジン、１，２－オキサジン、モルホリン、チオモルホリン、３，４－ジヒドロイソキノリン、２，３－ジヒドロ－インドール、１，３－ジヒドロ－イソインドール、３，９－ジオキサ－７－アザビシクロ［３．３．１］ノナン、６－オキサ－３－アザビシクロ［３．１．１］ヘプタン、８－オキサ－３－アザビシクロ［３．２．１］オクタン、チオフェン、イミダゾール、ピラゾール、１，２，４－トリアゾール、１，２，３－トリアゾール、１，２，３，４－テトラゾール、ピリジン、ジヒドロピリジン、ピリミジン、テトラヒドロピリミジン、４－オキサ－７－アザスピロ［２．５］オクタンからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、シアノ、－ＯＨ、オキソ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、メチル、メチル－Ｃ（Ｏ）－、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシメチル－、メトキシメチル－、－NH_2、－NMe_2、ピロリジンからなる群から選択される１、２、３若しくは４個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され、
R^{12}及びR^{13}が、独立に、
水素、－ＮＨ（－Ｃ（Ｏ）－メチル）、メトキシ；
メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、シクロプロピル、シクロブチル、ベンジル、１－フェニルエチル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、－ＣＯＯＨ、メトキシ－Ｃ（Ｏ）－、エトキシ－Ｃ（Ｏ）－、ｔｅｒｔ－ブトキシ－Ｃ（Ｏ）－、－Ｃ（Ｏ）－NH_2、－Ｃ（Ｏ）－NMe_2、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－メチル、メチル、メトキシ、シクロプロピル、－NH_2、NMe_2、Ｓ－メチル、Ｓ（Ｏ）－メチル、SO_2－メチル、及び（ＥｔＯ）$_2$Ｐ（＝Ｏ）－からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良い。］；
複素環－メチル、複素環－エチル［当該複素環置換基は、オキセタン、テトラヒドロフラン、テトラヒドロピラン、ピロリジン、モルホリン、ピラゾール、イミダゾール、１，２，４－オキサジアゾール、ピリジンからなる群から選択され、それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、－ＯＨ、オキソ及びメチルからなる群から選択される１個の置換基に

よって置換されていても良い。］；
　フェニル；
　２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン、及び
　オキセタン、チエタン、ピロリジン、モルホリン、テトラヒドロピラン、ピリジン及びピラゾールの群から選択される単環式若しくは二環式複素環［それらはそれぞれ、独立にフッ素、塩素、－ＯＨ、オキソ、メチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］
からなる群から選択され；
Ｒ^{14}が、
　メチル、エチル、イソプロピル、ブチル、シクロペンチル、ベンジル［それらはそれぞれ、独立にフッ素、－ＯＨ、メチル、メトキシ及びシクロペンチルからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］；及び
　ピロリジン及びテトラヒドロピランからなる群から選択される単環式若しくは二環式複素環
からなる群から選択され、
Ｒ^{15}が、
　メチル及びエチル、それらはそれぞれ、独立に－ＯＨ及び－ＣＯＯＨからなる群から選択される１個の置換基によって置換されていても良い。］及び
　ピリジン
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１５９】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ$_{p}$が、水素又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルである、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１６０】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ$_{p}$が、水素又はメチルである、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１６１】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ^{3}が、水素又はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルである、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１６２】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ^{3}が、水素又はメチルである、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１６３】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ^{4}が、水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１６４】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、

R^4が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシ、NH_2からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１６５】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^4が、水素、塩素、フッ素、シアノ、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１６６】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^4が、水素、塩素、フッ素、－ＯＨ、シアノ、メチル、メトキシ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ及びNH_2からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１６７】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^5が、水素、ハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１６８】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^5が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１６９】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^5が、水素、塩素、フッ素及びメチルからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１７０】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^5が、水素、塩素、フッ素、－ＯＨ、シアノ、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

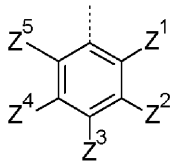
【０１７１】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^6が、水素、ハロゲン、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1－C_4－ハロゲノアルキル、C_1－C_4－アルコキシからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１７２】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
R^6が、水素、ハロゲン、－ＯＨ、シアノ、C_1－C_4－アルキル、１～５個のハロゲン

原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１７３】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ６が、水素、フッ素、塩素及びメチルからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１７４】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｒ６が、水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル及びメトキシからなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０１７５】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：
【化５４】



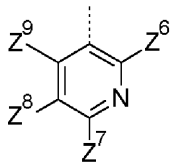
(Q1)

【０１７６】
であり、
式中、
Ｚ１、Ｚ２、Ｚ３、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、ヒドロキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、４～６員複素環［それは、フッ素、塩素、臭素、メチル及びシアノからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良い。］、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－ＳＯ２－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）からなる群から選択され、又は
Ｚ１及びＺ２が、それらが結合している炭素原子とともに、５員若しくは６員ヘテロシクロアルキル、５員ヘテロアリール、又は６員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及び
Ｚ３、Ｚ４、及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、又は
Ｚ２及びＺ３が、それらが結合している炭素原子とともに、５員若しくは６員の飽和若しくは部分飽和複素環、５員ヘテロアリール、又は６員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、及び

Ｚ^{1}、Ｚ^{4}、及びＺ^{5}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルコキシからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ２）のピリジン環：

【化５５】



(Q2)

【０１７７】

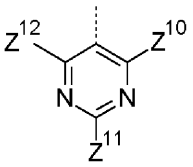
であり、

式中、

Ｚ^{6}、Ｚ^{7}、Ｚ^{8}及びＺ^{9}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ３）のピリミジン環：

【化５６】



(Q3)

【０１７８】

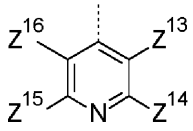
であり、

式中、

Ｚ^{10}、Ｚ^{11}及びＺ^{12}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：

【化５７】

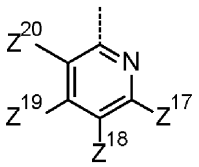


(Q4)

【０１７９】

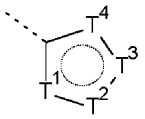
であり、

式中、
Z^{13}、Z^{14}、Z^{15}及びZ^{16}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、C_1-C_4－ヒドロキシアルキル、NH_2、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＣＯ－C_1-C_4－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環からなる群から選択され、これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3-C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1-C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1-C_4－アルキル、－SO_2－C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良く、又は
Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：
【化５８】



(Q5)

【０１８０】
であり、
式中、
Z^{17}、Z^{18}、Z^{19}及びZ^{20}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：
【化５９】



(Q6)

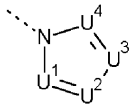
【０１８１】
であり、
式中、
T^1～T^4が、独立にＮ、Ｏ、Ｓ、Ｃ－Z^{21}及びＮ－Z^{22}からなる群から選択され、ここで、T^1～T^4のうちの１個以下がＯであり、T^1～T^4のうちの１個以下がＳであり、T^1～T^4のうちの１個以下がＮ－Z^{22}であり、及びここで、
各Z^{21}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロ

ゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、及び

各Ｚ２２が、独立に水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：

【化６０】



(Q7)

【０１８２】

であり、

式中、

Ｕ１～Ｕ４が、独立にＮ及びＣ－Ｚ２３からなる群から選択され、ここで、Ｕ１～Ｕ４のうちの３個以下がＮであり、及びここで、

各Ｚ２３が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択される、

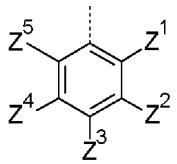
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１８３】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、

Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：

【化６１】



(Q1)

【０１８４】

であり、

式中、

Ｚ１及びＺ５が、独立に水素、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル及びＣ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、

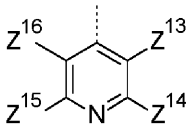
Ｚ２及びＺ４が、独立に水素、ハロゲン、－ＯＨ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ、－ＮＨ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）、－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルコキシ、－Ｓ－（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）及び４～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、及び

Ｚ３が、水素、ハロゲン、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ及び－Ｎ（Ｃ１－Ｃ４－アルキル）２からなる群から選択され、又は

Ｚ１及びＺ２が、それらが結合している炭素原子とともに、５員ヘテロシクロアルキル又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、

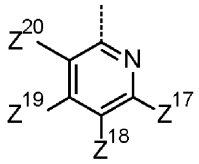
Ｚ３及びＺ５が水素であり、及び

Ｚ^{4}が、水素及びＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化６２】



(Q4)

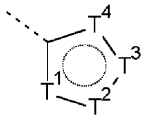
【０１８５】
であり、
式中、
Ｚ^{13}、Ｚ^{14}、Ｚ^{15}及びＺ^{16}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ヒドロキシアルキル、ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$、－ＮＨ－ＣＯ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環からなる群から選択され、これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルコキシ、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）、－Ｎ（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル）$_{2}$、－Ｓ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、－ＳＯ$_{2}$－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－ＳＯ$_{2}$－（Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良く、又は
Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：
【化６３】



(Q5)

【０１８６】
であり、
式中、
Ｚ^{17}、Ｚ^{18}、及びＺ^{19}が水素であり、及び
Ｚ^{20}が、ハロゲンであり、又は
Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：

【化６４】



(Q6)

【０１８７】

であり、

式中、

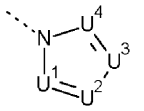
Ｔ^{1}～Ｔ^{4}が、独立にＮ、Ｏ、Ｓ、Ｃ－Ｚ^{21}及びＮ－Ｚ^{22}からなる群から選択され、ここで、Ｔ^{1}～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＯであり、Ｔ^{1}～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＳであり、Ｔ^{1}～Ｔ^{4}のうちの１個以下がＮ－Ｚ^{22}であり、及びここで、

各Ｚ^{21}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシからなる群から選択され、及び

各Ｚ^{22}が、独立に水素、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル－Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：

【化６５】



(Q7)

【０１８８】

であり、

式中、

Ｕ^{1}～Ｕ^{4}が、独立にＮ及びＣ－Ｚ^{23}からなる群から選択され、ここで、Ｕ^{1}～Ｕ^{4}のうちの３個以下がＮであり、

各Ｚ^{23}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－ハロゲノアルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシからなる群から選択される、

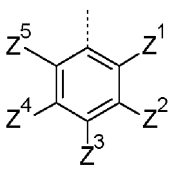
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１８９】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、

Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：

【化６６】



(Q1)

【０１９０】

であり、

Z^1及びZ^5が、独立に水素、ハロゲン、C_1-C_4－アルキル、C_1-C_4－アルコキシ及び１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキルからなる群から選択され、

Z^2及びZ^4が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、－ＯＨ、C_1-C_4－アルキル、C_1-C_4－アルコキシ、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、－Ｓ－（C_1-C_4－アルキル）及び４～６員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、及び

Z^3が、水素、ハロゲン、C_1-C_4－アルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ及び－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$からなる群から選択され、又は

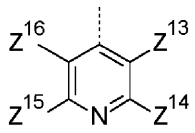
Z^1及びZ^2が、それらが結合している炭素原子とともに、５員ヘテロシクロアルキル又は５員ヘテロアリールを形成しており、それらはそれぞれ、メチル、フッ素及びオキソからなる群から選択される１個若しくは２個の置換基によって置換されていても良く、

Z^3及びZ^5が水素であり、及び

Z^4が、水素及びC_1-C_4－アルコキシ－Ｃ（Ｏ）－からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：

【化６７】



(Q4)

【０１９１】

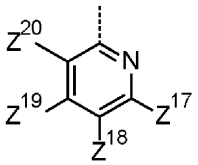
であり、

式中、

Z^{13}、Z^{14}、Z^{15}及びZ^{16}が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、C_1-C_4－アルキル、C_1-C_4－アルコキシ、C_1-C_4－ヒドロキシアルキル、NH_2、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$、－ＮＨ－ＣＯ－C_1-C_4－アルキル、及びヘテロアリール環をピリジン環に連結する少なくとも１個の窒素原子を有する５員ヘテロアリール若しくは４～７員ヘテロシクロアルキルの群から選択される単環式複素環からなる群から選択され、これらはそれぞれ、独立にハロゲン、シアノ、ニトロ、－ＯＨ、オキソ、チオノ、C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルキル、C_1-C_4－アルコキシ、１～５個のハロゲン原子を有するC_1-C_4－ハロゲノアルコキシ、C_3-C_6－シクロアルキル、－NH_2、－ＮＨ（C_1-C_4－アルキル）、－Ｎ（C_1-C_4－アルキル）$_2$、－Ｓ－C_1-C_4－アルキル、－Ｓ（Ｏ）－C_1-C_4－アルキル、－SO_2－C_1-C_4－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ－（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－Ｓ（Ｏ）－（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）、１～５個のハロゲン原子を有する－SO_2－（C_1-C_4－ハロゲノアルキル）からなる群から選択される１、２若しくは３個の置換基によって置換されていても良く、又は

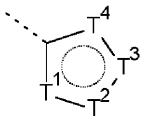
Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化６８】



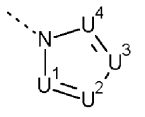
(Q5)

【０１９２】
であり、
式中、
Ｚ１７、Ｚ１８、及びＺ１９が水素であり、及び
Ｚ２０が、ハロゲンであり、又は
Ｑが、下記式（Ｑ６）の５員芳香族複素環：
【化６９】



(Q6)

【０１９３】
であり、
式中、
Ｔ１～Ｔ４が、独立にＮ、Ｏ、Ｓ、Ｃ－Ｚ２１及びＮ－Ｚ２２からなる群から選択され、ここで、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＯであり、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＳであり、Ｔ１～Ｔ４のうちの１個以下がＮ－Ｚ２２であり、及びここで、
各Ｚ２１が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択され、及び
各Ｚ２２が、独立に水素、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルキル－Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシ－Ｃ１－Ｃ４－アルキルからなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ７）の５員芳香族複素環：
【化７０】



(Q7)

【０１９４】
であり、
式中、
Ｕ１～Ｕ４が、独立にＮ及びＣ－Ｚ２３からなる群から選択され、ここで、Ｕ１～Ｕ４のうちの３個以下がＮであり、及びここで、
各Ｚ２３が、独立に水素、ハロゲン、シアノ、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、１～５個のハロゲン原子を有するＣ１－Ｃ４－ハロゲノアルキル、Ｃ１－Ｃ４－アルコキシからなる群から選択される、

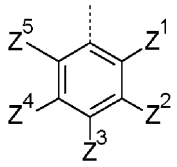
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０１９５】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、

Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：

【化７１】



(Q1)

【０１９６】

であり、

式中、

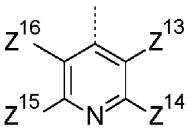
Z^1及びZ^5が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル及びメトキシからなる群から選択され、

Z^2及びZ^4が、独立に水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、メチル、エチル、－ＮＨＭｅ、－NMe_2、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、－ＳＭｅ及びモルホリニルからなる群から選択され、及び

Z^3が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ及び－NMe_2からなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：

【化７２】



(Q4)

【０１９７】

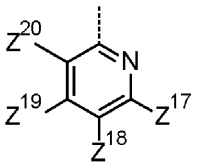
であり、

式中、

Z^{13}、Z^{14}、Z^{15}及びZ^{16}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ヒドロキシメチル、NH_2、－ＮＨＭｅ、－NMe_2、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｍｅ、モルホリニルからなる群から選択され、又は

Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：

【化７３】



(Q5)

【０１９８】

であり、

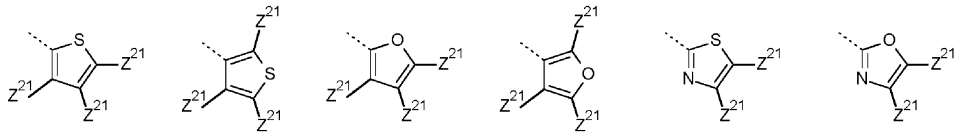
式中、

Ｚ１７、Ｚ１８、及びＺ１９が水素であり、及び

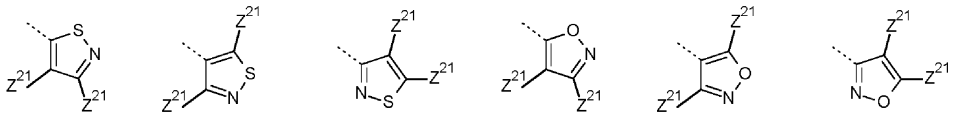
Ｚ２０が、フッ素、塩素であり、又は

Ｑが、

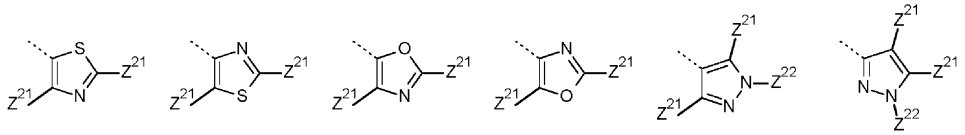
【化７４】



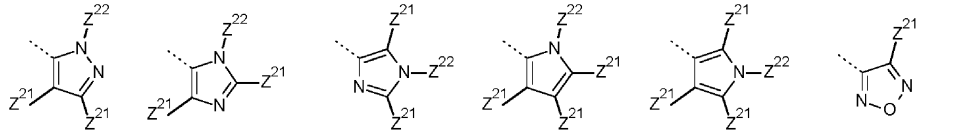
(Q6-1) (Q6-2) (Q6-3) (Q6-4) (Q6-5) (Q6-6)



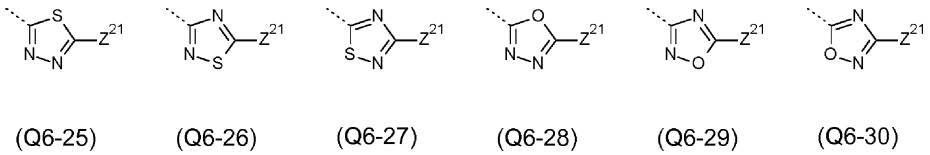
(Q6-7) (Q6-8) (Q6-9) (Q6-10) (Q6-11) (Q6-12)



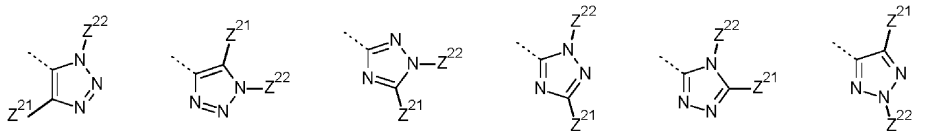
(Q6-13) (Q6-14) (Q6-15) (Q6-16) (Q6-17) (Q6-18)



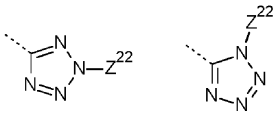
(Q6-19) (Q6-20) (Q6-21) (Q6-22) (Q6-23) (Q6-24)



(Q6-25) (Q6-26) (Q6-27) (Q6-28) (Q6-29) (Q6-30)



(Q6-31) (Q6-32) (Q6-33) (Q6-34) (Q6-35) (Q6-36)



(Q6-37) (Q6-38)

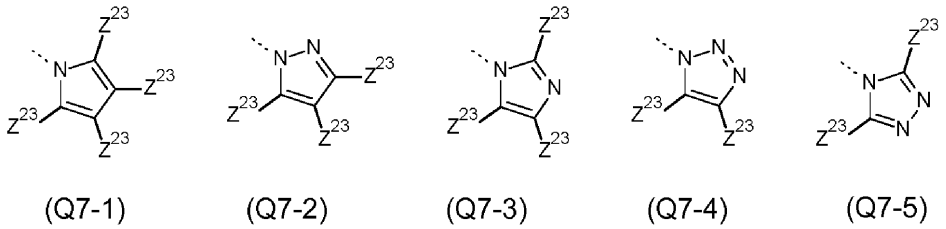
【０１９９】

からなる群から選択され、

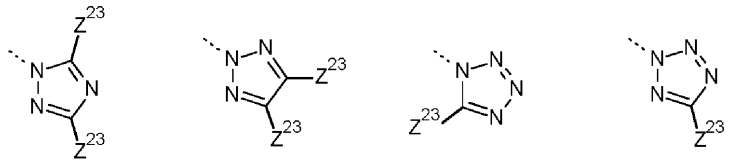
式中、

各Ｚ２１が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メ

トキシからなる群から選択され、
　Ｚ２２が、水素、メチルであり、又は
　Ｑが、
【化７５】

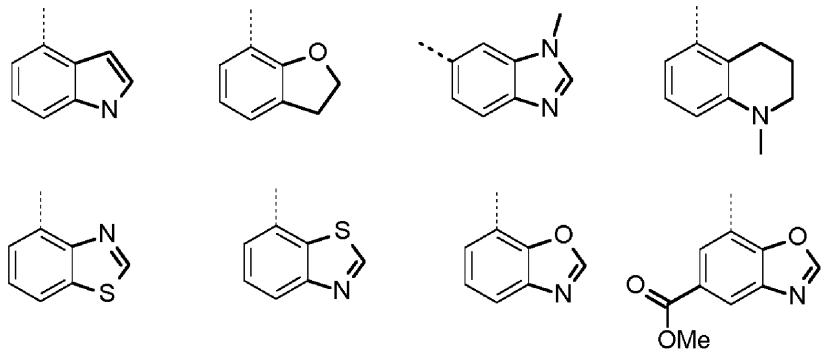


(Q7-1)　(Q7-2)　(Q7-3)　(Q7-4)　(Q7-5)



(Q7-6)　(Q7-7)　(Q7-8)　(Q7-9)

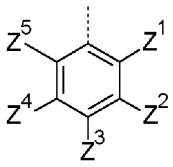
【０２００】
からなる群から選択され、
　式中、
　各Ｚ２３が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、又は
　Ｑが、
【化７６】



,

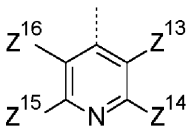
【０２０１】
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。
【０２０２】
　第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
　Ｑが、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：

【化７７】



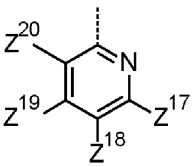
(Q1)

【０２０３】
であり、
式中、
Ｚ^{1}及びＺ^{5}が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、
Ｚ^{2}及びＺ^{4}が、独立に水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、エチル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＮＨＭｅ、－ＮＭｅ$_{2}$、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、－ＳＭｅ及びモルホリニルからなる群から選択され、及び
Ｚ^{3}が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ及び－ＮＭｅ$_{2}$からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化７８】



(Q4)

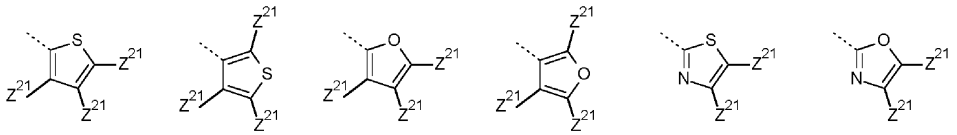
【０２０４】
であり、
式中、
Ｚ^{13}、Ｚ^{14}、Ｚ^{15}及びＺ^{16}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ヒドロキシメチル、ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＭｅ、－ＮＭｅ$_{2}$、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｍｅ、モルホリニルからなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ５）のピリジン環：
【化７９】



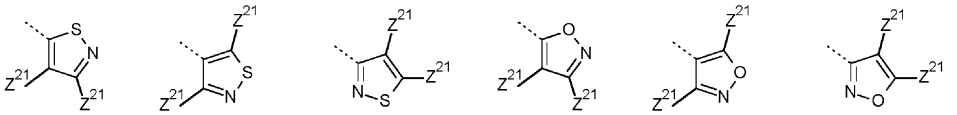
(Q5)

【０２０５】
であり、
式中、
Ｚ^{17}、Ｚ^{18}、及びＺ^{19}が水素であり、及び
Ｚ^{20}が、フッ素、塩素であり、又は
Ｑが、

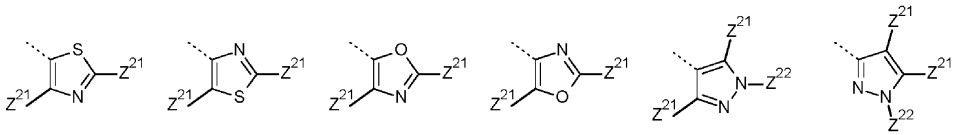
【化８０】



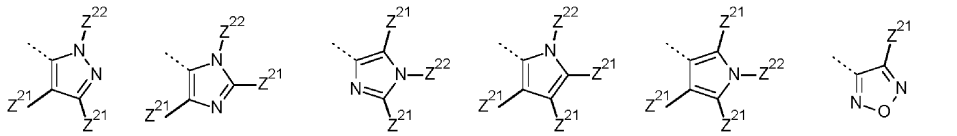
(Q6-1) (Q6-2) (Q6-3) (Q6-4) (Q6-5) (Q6-6)



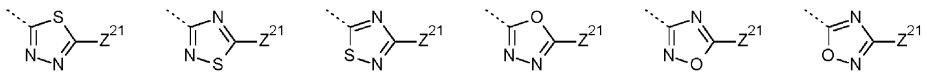
(Q6-7) (Q6-8) (Q6-9) (Q6-10) (Q6-11) (Q6-12)



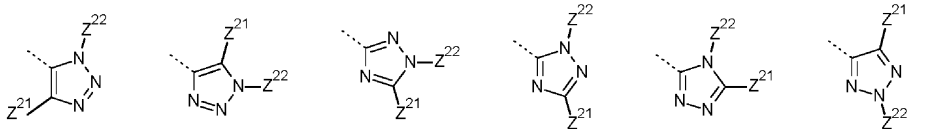
(Q6-13) (Q6-14) (Q6-15) (Q6-16) (Q6-17) (Q6-18)



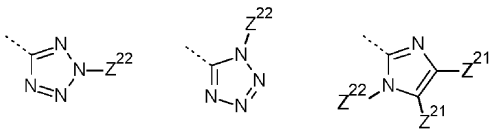
(Q6-19) (Q6-20) (Q6-21) (Q6-22) (Q6-23) (Q6-24)



(Q6-25) (Q6-26) (Q6-27) (Q6-28) (Q6-29) (Q6-30)



(Q6-31) (Q6-32) (Q6-33) (Q6-34) (Q6-35) (Q6-36)



(Q6-37) (Q6-38) および (Q6-39)

【０２０６】

からなる群から選択され、

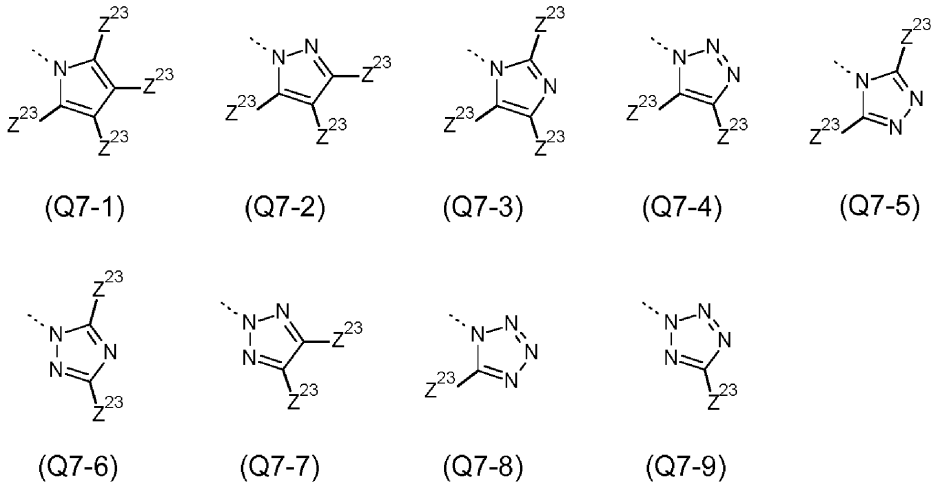
式中、

各Ｚ^{21}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、及び

Ｚ^{22}が、水素、メチルであり、又は

Ｑが、

【化８１】



【０２０７】

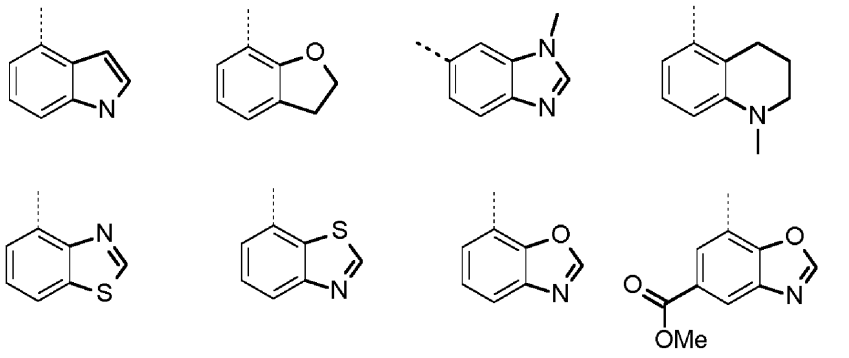
からなる群から選択され、

式中、

各Ｚ^{23}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、又は

Ｑが、

【化８２】



,

【０２０８】

からなる群から選択される、

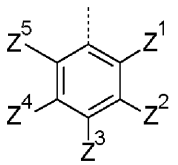
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０２０９】

第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、

Ｑは、下記式（Ｑ１）の置換されているフェニル環：

【化８３】

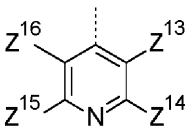


(Q1)

【０２１０】

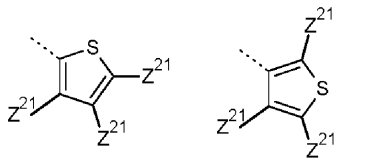
であり、

式中、
Z^1及びZ^5が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ及びトリフルオロメチルからなる群から選択され、
Z^2及びZ^4が、独立に水素、フッ素、塩素、－ＯＨ、シアノ、メチル、エチル、ｔｅｒｔ－ブチル、－ＮＨＭｅ、－NMe_2、トリフルオロメチル、メトキシ、トリフルオロメトキシ、－ＳＭｅ及びモルホリニルからなる群から選択され、及び
Z^3が、独立に水素、フッ素、塩素、メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ及び－NMe_2からなる群から選択され、又は
Ｑが、下記式（Ｑ４）のピリジン環：
【化８４】

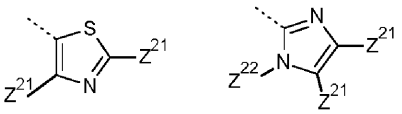


(Q4)

【０２１１】
であり、
式中、
Z^{13}、Z^{14}、Z^{15}及びZ^{16}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、ヒドロキシメチル、NH_2、－ＮＨＭｅ－NMe_2、－ＮＨ－Ｃ（Ｏ）－Ｍｅ、モルホリニルからなる群から選択され、又は
Ｑが、
【化８５】



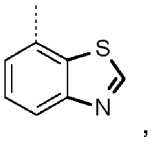
(Q6-1)　(Q6-2)



(Q6-13) および (Q6-39)

【０２１２】
からなる群から選択され、
式中、
各Z^{21}が、独立に水素、フッ素、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メトキシからなる群から選択され、及び
Z^{22}が、水素、メチルであり、又は
Ｑが、

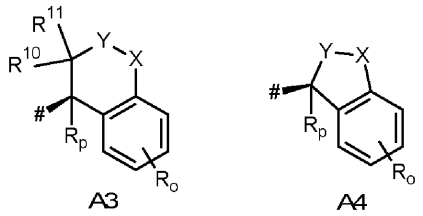
【化８６】



,

【０２１３】
からなる群から選択される、
上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０２１４】
第１の態様のさらなる実施形態において、本発明は、
Ａが、Ａ３又はＡ４：
【化８７】



【０２１５】
であり、
R_pが、水素、C_1－C_4－アルキルからなる群から選択され；好ましくは水素である、上記式（Ｉ）の化合物並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０２１６】
第１～第８の態様によるありとあらゆる実施形態（「本発明の第１の態様のさらなる実施形態」という表題下の実施形態を含む）における本発明のさらなる態様において、Ｘ及び／又はＹの定義で、上記で定義の「NR^9」は除外される。

【０２１７】
第１～第８の態様によるありとあらゆる実施形態（「本発明の第１の態様のさらなる実施形態」という表題下の実施形態を含む）における本発明のさらなる態様において、R^2の定義で、水素は除外される。

【０２１８】
第１の態様の特定のさらなる実施形態において、本発明は、頭書き「本発明の第１の態様のさらなる実施形態」下の上記実施形態の２以上の組み合わせを包含する。

【０２１９】
本発明は、上記一般式（Ｉ）の化合物の本発明のいずれかの実施形態又は態様内の下位組み合わせを包含する。

【０２２０】
本発明は、下記の本記述の実施例セクションで開示されている一般式（Ｉ）の化合物を包含する。

【０２２１】
一般式（Ｉ）の本発明による化合物は、本発明に至る実験の部に示した図式１ａ～ｅ、２、３及び４（一般手順）に従って製造することができる。記載の図式及び手順は、本発明の一般式（Ｉ）の化合物への合成経路を説明するものであり、限定的なものではない。図式１ａ～ｅ、２及び３で例示の変換の順序は多様な形で変えることが可能であることは、当業者には明らかである。従って、これらの図式で例示した変換の順序は、限定的なものではない。さらに、置換基Ｑ、Ａ、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5又はR^6のいずれかの

相互変換を、例示の変換の前及び／又は後に行うことができる。それらの変更は、例えば保護基の導入、保護基の開裂、官能基の還元若しくは酸化、ハロゲン化、金属化、置換又は当業者に公知の他の反応であることができる。これらの変換には、置換基のさらなる相互変換を可能とする官能性を導入するものが含まれる。適切な保護基並びにそれらの導入及び開裂は、当業者には公知である（例えば、Ｔ．Ｗ．　Ｇｒｅｅｎｅ　ａｎｄ　Ｐ．Ｇ．Ｍ．　Ｗｕｔｓ　ｉｎ　Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ　Ｇｒｏｕｐｓ　ｉｎ　Ｏｒｇａｎｉｃ　Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ，　３ｒｄ　ｅｄｉｔｉｏｎ，　Ｗｉｌｅｙ　１９９９を参照する。）。具体例を、以下の段落で記載する。

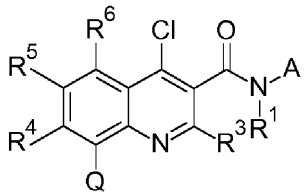
【０２２２】

以下において、一般式（Ｉ）の化合物の製造のためのいくつかの経路を、図式１ａ～ｅ及び２に記載している。

【０２２３】

第２の態様によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｎの中間体化合物：

【化８８】



1N,

【０２２４】

［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、

下記一般式１Ｆの化合物：

【化８９】

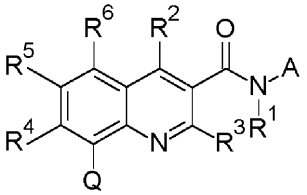
1F,

【０２２５】

［Ｒ^{2}は、ＮＲ^{12}Ｒ^{13}、ＯＲ^{14}、又はＳＲ^{15}であり、それらはそれぞれ上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］と反応させることで、

下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化９０】

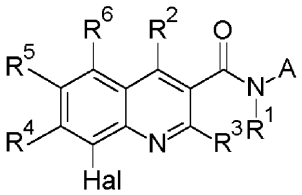


(I),

【０２２６】

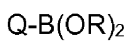
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは上記で定義の通りである。］を得る段階を含む方法を包含する。

【０２２７】
第２の態様の別の実施形態によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｔの中間体化合物：
【化９１】



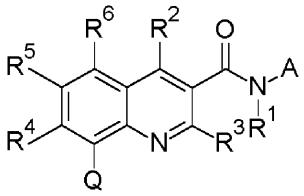
1T,

【０２２８】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、Ｈａｌは、ハロゲン、特には塩素、臭素又はヨウ素である。］
を、
下記一般式１Ｈの化合物：
【化９２】



1H,

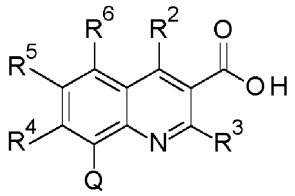
【０２２９】
［Ｑは、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、各Ｒは個々にＨ若しくはＭｅであることができるか、両方のＲがピナコレートである。］と反応させることで、
下記一般式（Ｉ）の化合物：
【化９３】



(I),

【０２３０】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは上記で定義の通りである。］を得る段階を含む方法を包含する。
【０２３１】
第２の態様の別の実施形態によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｗの中間体化合物：

【化９４】

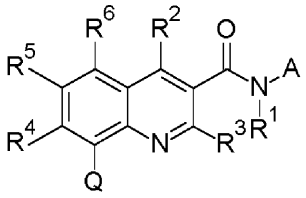


1W,

【０２３２】
［Ｑ、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、
下記一般式１Ｍの化合物：
【化９５】

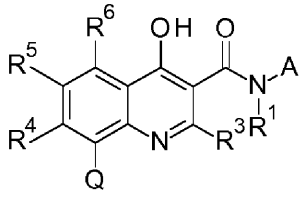
1M,

【０２３３】
［Ｒ^{1}及びＡは、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］と反応させることで、
下記一般式（Ｉ）の化合物：
【化９６】



(I),

【０２３４】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは上記で定義の通りである。］を得る段階を含む方法を包含する。
【０２３５】
第２の態様の別の実施形態によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｘの中間体化合物：
【化９７】

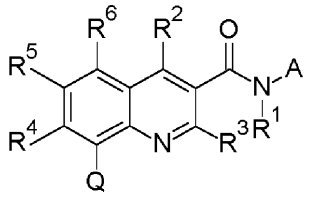


1X,

【０２３６】
［Ｑ、Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、
下記一般式１Ｙの化合物：
【化９８】

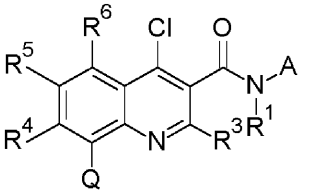
1Y,

【０２３７】
［Ｒ^{2}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義のＯＲ^{14}である。］と反応させることで、
下記一般式（Ｉ）の化合物：
【化９９】



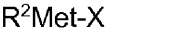
(I),

【０２３８】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは上記で定義の通りであり、Ｒ^{2}はＣ^{1}－Ｃ^{4}－アルコキシであり、それは上記で定義のように置換されていても良い。］を得る段階を含む方法を包含する。
【０２３９】
第２の態様の別の実施形態によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｎの中間体化合物：
【化１００】



1N,

【０２４０】
［Ｑ、Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、
下記一般式２Ａの化合物：
【化１０１】



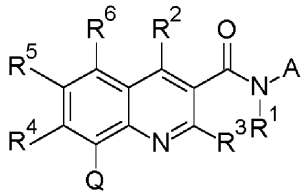
2A,

【０２４１】

［Ｒ２は、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルケニル、Ｃ２－Ｃ４－アルキニル又はフェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキルであり、それらはそれぞれ上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義のように置換されていても良く、Ｍｅｔはマグネシウム又は亜鉛であり、Ｘは塩素、臭素又はヨウ素である。］と反応させることで、

下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化１０２】



(I),

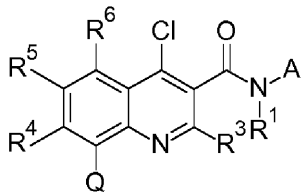
【０２４２】

［Ａ、Ｒ１、Ｒ３、Ｒ４、Ｒ５、Ｒ６、及びＱは上記で定義の通りであり、Ｒ２は、Ｃ１－Ｃ４－アルキル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルキル、Ｃ２－Ｃ４－アルケニル、Ｃ３－Ｃ６－シクロアルケニル、Ｃ２－Ｃ４－アルキニル又はフェニル－Ｃ１－Ｃ４－アルキルであり、それらはそれぞれ、上記で定義のように置換されていても良い。］を得る段階を含む方法を包含する。

【０２４３】

第３の態様によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｎの中間体化合物：

【化１０３】



1N,

【０２４４】

［Ａ、Ｒ１、Ｒ３、Ｒ４、Ｒ５、Ｒ６、及びＱは、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、

下記一般式１Ｆの化合物：

【化１０４】

R^2H

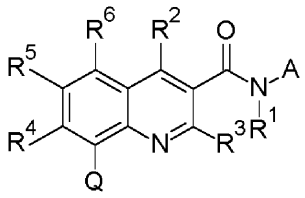
1F,

【０２４５】

［Ｒ２は、ＮＲ１２Ｒ１３、ＯＲ１４、又はＳＲ１５であり、それらはそれぞれ、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物でのように定義される。］と反応させることで、

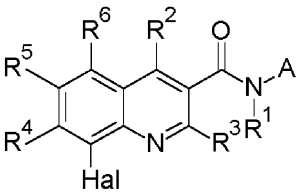
下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化１０５】



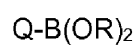
(I),

【０２４６】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは上記で定義の通りである。］を得て、
次に任意に、相当する（ｉ）溶媒及び／又は（ｉｉ）塩基若しくは酸を用いて、前記化合物を溶媒和物、塩及び／又はそのような塩の溶媒和物に変換する段階を含む方法を包含する。
【０２４７】
第３の態様の別の実施形態によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｔの中間体化合物：
【化１０６】



1T,

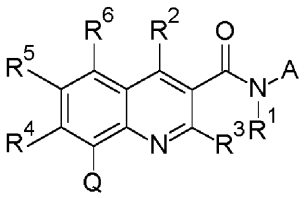
【０２４８】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、ＨａｌはハロゲンＦ、特には塩素、臭素又はヨウ素である。］を、
下記一般式１Ｈの化合物：
【化１０７】



1H,

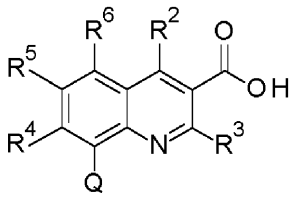
【０２４９】
［Ｑは、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、各Ｒは個別にＨ若しくはＭｅであるか、両方のＲがピナコレートである。］と反応させることで、
下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化１０８】



(I),

【０２５０】
［Ａ、Ｒ[1]、Ｒ[2]、Ｒ[3]、Ｒ[4]、Ｒ[5]、Ｒ[6]、及びＱは上記で定義の通りである。］を得て、
次に任意に、相当する（ｉ）溶媒及び／又は（ｉｉ）塩基若しくは酸を用いて、前記化合物を溶媒和物、塩及び／又はそのような塩の溶媒和物に変換する段階を含む方法を包含する。
【０２５１】
第３の態様の別の実施形態によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｗの中間体化合物：
【化１０９】



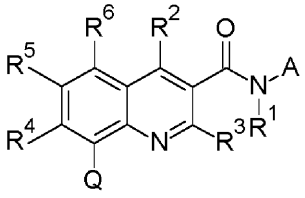
1W,

【０２５２】
［Ｑ、Ｒ[2]、Ｒ[3]、Ｒ[4]、Ｒ[5]及びＲ[6]は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、
下記一般式１Ｍの化合物：
【化１１０】

1M,

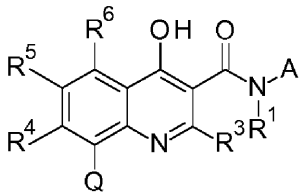
【０２５３】
［Ｒ[1]及びＡは、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］と反応させることで、
下記一般式（Ｉ）の化合物：

【化１１１】



(I),

【０２５４】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは上記で定義の通りである。］を得て、
次に任意に、相当する（ｉ）溶媒及び／又は（ｉｉ）塩基若しくは酸を用いて、前記化合物を溶媒和物、塩及び／又はそのような塩の溶媒和物に変換する段階を含む方法を包含する。
【０２５５】
第３の態様の別の実施形態によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｘの中間体化合物：
【化１１２】

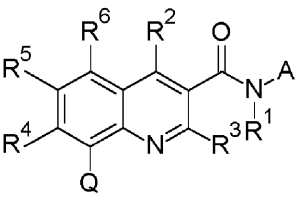


1X,

【０２５６】
［Ｑ、Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、
下記一般式１Ｙの化合物：
【化１１３】

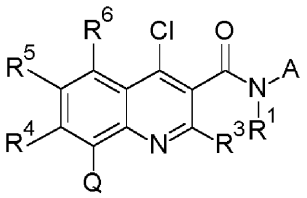
1Y,

【０２５７】
［Ｒ^{2}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義のＯＲ^{14}である。］と反応させることで、下記一般式（Ｉ）の化合物：
【化１１４】



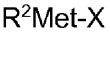
(I),

【０２５８】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは上記で定義の通りであり、Ｒ^{2}はＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシであり、それは上記で定義のように置換されていても良い。］を得て、
次に任意に、相当する（ｉ）溶媒及び／又は（ｉｉ）塩基若しくは酸を用いて、前記化合物を溶媒和物、塩及び／又はそのような塩の溶媒和物に変換する段階を含む方法を包含する。
【０２５９】
第３の態様の別の実施形態によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造方法であって、下記一般式１Ｎの中間体化合物：
【化１１５】



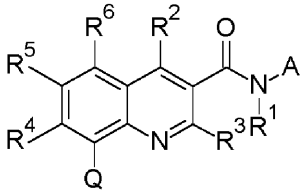
1N,

【０２６０】
［Ｑ、Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}及びＲ^{6}は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りである。］を、
下記一般式２Ａの化合物：
【化１１６】



2A,

【０２６１】
［Ｒ^{2}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルケニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルキニル又はフェニル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルであり、それらはそれぞれ、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義のように置換されていても良く、Ｍｅｔはマグネシウム又は亜鉛であり、Ｘは塩素、臭素又はヨウ素である。］を反応させることで、下記一般式（Ｉ）の化合物：
【化１１７】



(I),

【０２６２】
［Ａ、Ｒ^{1}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}、Ｒ^{5}、Ｒ^{6}、及びＱは上記で定義の通りであり、Ｒ^{2}は、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルケニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルキニル又はフェニル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキルであり、それらはそれぞれ、上記で定義のように置換されていても良い。］を得て、
次に任意に、相当する（ｉ）溶媒及び／又は（ｉｉ）塩基若しくは酸を用いて、前記化

合物を溶媒和物、塩及び／又はそのような塩の溶媒和物に変換する段階を含む方法を包含する。

【０２６３】

本発明は、一般式（Ｉ）の本発明の化合物の製造方法であって、本明細書の実験セクションに記載の段階を含む方法を包含する。

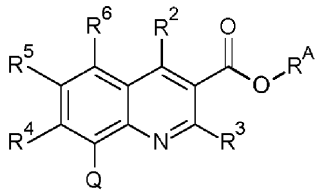
【０２６４】

第４の態様によれば、本発明は、上記の、一般式（Ｉ）の化合物の製造に有用な中間体化合物を包含する。

【０２６５】

特に、本発明は、下記一般式（ＩＩ）の中間体化合物：

【化１１８】



(II),

【０２６６】

［式中、

R^2は、－ＯＨであるか、上記一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

R^3、R^4、R^5、R^6、及びＱは、上記一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

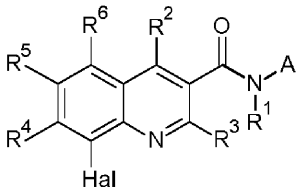
R^Aは、Ｈ又はC_1－C_4－アルキルである。］、

並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物を包含する。

【０２６７】

特に、本発明は、下記一般式（ＩＩＩ）の中間体化合物：

【化１１９】



(III),

【０２６８】

［式中、

R^2は、－ＯＨであるか、上記一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

Ａ、R^1、R^3、R^4、R^5、及びR^6は、上記一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

Ｈａｌは、ハロゲンである。］、

並びにそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、及びそれらの混合物も包含する。

【０２６９】

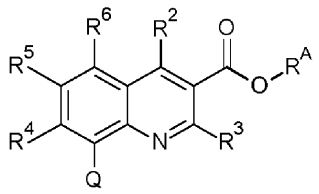
第５の態様によれば、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造のための前

記中間体化合物の使用を包含する。

【０２７０】

特に、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造のための、下記一般式（ＩＩ）の中間体化合物：

【化１２０】



(II),

【０２７１】

［式中、

R^2は、－ＯＨであるか、上記一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

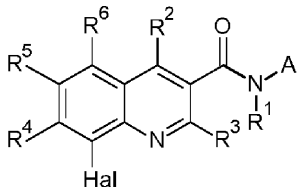
R^3、R^4、R^5、R^6、及びＱは、上記一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

R^Aは、Ｈ又はC_1－C_4－アルキルである。］の使用を包含する。

【０２７２】

特に、本発明は、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物の製造のための、下記一般式（ＩＩＩ）の中間体化合物：

【化１２１】



(III),

【０２７３】

［式中、

R^2は、上記一般式（Ｉ）の化合物について定義のように－ＯＨであり、

Ａ、R^1、R^3、R^4、R^5、及びR^6は、上記一般式（Ｉ）の化合物について定義の通りであり、

Ｈａｌは、ハロゲンである。］の使用も包含する。

【０２７４】

本発明は、下記の本記述の実施例セクションで開示されている中間体化合物を包含する。

【０２７５】

本発明の一般式（Ｉ）の化合物は、当業者に公知の方法によって、塩、好ましくは本明細書に記載の薬学的に許容される塩に変換することができる。同様に、本発明の一般式（Ｉ）の化合物の塩を、当業者に公知の方法によって、遊離化合物に変換することができる。

【０２７６】

本発明の一般式（Ｉ）の化合物は、予測することができなかった貴重な薬理的作用スペクトルを示す。驚くべきことに、本発明の化合物は、Ｓｌｏ－１と効果的に相互作用することが認められていることから、当該化合物を、ヒト及び動物における疾病、好ましくは蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の治療又は予防に用いることが可能である。

【０２７７】
本発明の化合物を用いて、蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染の防除、治療及び／又は予防を行うことができる。この方法は、処置を必要とする哺乳動物に対して、障害を治療する上で有効である量の本発明の化合物、又はそれの薬学的に許容される塩、異性体、多形体、代謝物、水和物、溶媒和物又はエステルを投与することを含む。
【０２７８】
別の態様において、この方法は、処置を必要とする鳥、すなわち飼育鳥又は特には家禽に対して、障害を治療する上で有効である量の本発明の化合物、又はそれの薬学的に許容される塩、異性体、多形体、代謝物、水和物、溶媒和物又はエステルを投与することを含む。
【０２７９】
具体的には、獣医学の分野において、本発明の化合物は、温血動物において好ましい毒性を有し、家畜動物、繁殖動物、動物園動物、研究室動物、実験動物及び家庭動物での動物育種及び畜産で生じる寄生生物、特には蠕虫の防除に好適である。それらの化合物は、全て又は特定の発達段階の寄生生物、特には蠕虫に対して活性である。
【０２８０】
農業家畜には、例えばヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、バッファロー、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、特にはウシ及びブタなどの哺乳動物；又はシチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、特にはニワトリなどの家禽、又は例えば水産養殖での魚若しくは甲殻類などがある。
【０２８１】
家庭動物には、例えばハムスター、モルモット、ラット、マウス、チンチラ、フェレットなどの哺乳動物、特にはイヌ、ネコ；愛玩鳥；は虫類；両生類又は観賞魚などがある。
【０２８２】
本発明はまた、蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の治療方法を提供する。
【０２８３】
これらの障害は、動物において特徴付けられており、本発明の医薬組成物を投与することによって治療することができる。
【０２８４】
本明細書で使用される「治療する」又は「治療」という用語は、従来のように使用され、例えば疾患若しくは障害、例えば線虫感染の状態と戦い、それを緩和し、軽減し、除き、改善するための対象者の管理若しくはケアである。特に、そして特に動物衛生又は獣医学の分野において、「治療する」又は「治療」という用語は、予防処置、集団感染予防（ｍｅｔａｐｈｙｌａｃｔｉｃ）処置又は治療処置を含む。
【０２８５】
ヒト又は動物に病原性である蠕虫には、例えば鉤頭動物門（ａｃａｎｔｈｏｃｅｐｈａｌａ）、線虫類、舌形動物門（ｐｅｎｔａｓｔｏｍａ）及び扁形動物門（ｐｌａｔｙｈｅｌｍｉｎｔｈａ）［例えば、単生類（ｍｏｎｏｇｅｎｅａ）、条虫類（ｃｅｓｔｏｄｅｓ）及び吸虫類（ｔｒｅｍａｔｏｄｅｓ）］などがある。
【０２８６】
蠕虫類の別の例には、下記のものなどがあるが、これらに限定されるものではない。
【０２８７】
単生類（Ｍｏｎｏｇｅｎｅａ）：例えば：ダクチロギルス属種（Ｄａｃｔｙｌｏｇｙｒｕｓ　ｓｐｐ．）、ギロダクチルス属種（Ｇｙｒｏｄａｃｔｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ミクロボツリウム属種（Ｍｉｃｒｏｂｏｔｈｒｉｕｍ　ｓｐｐ．）、ポリストマ属種（Ｐｏｌｙｓｔｏｍａ　ｓｐｐ．）、トログロセファルス属種（Ｔｒｏｇｌｏｃｅｐｈａｌｕｓ　ｓｐｐ．）。
【０２８８】
条虫類（Ｃｅｓｔｏｄｅｓ）：ギョウジョウチュウ目（Ｐｓｅｕｄｏｐｈｙｌｌｉｄｅ

ａ）の、例えば：ボトリジウム属種（Ｂｏｔｈｒｉｄｉｕｍ　ｓｐｐ．）、ジフィロボトリウム属種（Ｄｉｐｈｙｌｌｏｂｏｔｈｒｉｕｍ　ｓｐｐ．）、ジプロゴノポルス属種（Ｄｉｐｌｏｇｏｎｏｐｏｒｕｓ　ｓｐｐ．）、イクチオボツリウム属種（Ｉｃｈｔｈｙｏｂｏｔｈｒｉｕｍ　ｓｐｐ．）、リグラ属種（Ｌｉｇｕｌａ　ｓｐｐ．）、シストセファルス属種（Ｓｃｈｉｓｔｏｃｅｐｈａｌｕｓ　ｓｐｐ．）、スピロメトラ属種（Ｓｐｉｒｏｍｅｔｒａ　ｓｐｐ．）；

エンヨウジョウチュウ目（Ｃｙｃｌｏｐｈｙｌｌｉｄａ）の、例えば：アンジラ属種（Ａｎｄｙｒａ　ｓｐｐ．）、アノプロセファラ属種（Ａｎｏｐｌｏｃｅｐｈａｌａ　ｓｐｐ．）、アビテリナ属種（Ａｖｉｔｅｌｌｉｎａ　ｓｐｐ．）、ベルチエラ属種（Ｂｅｒｔｉｅｌｌａ　ｓｐｐ．）、シトタエニア属種（Ｃｉｔｔｏｔａｅｎｉａ　ｓｐｐ．）、ダバイネア属種（Ｄａｖａｉｎｅａ　ｓｐｐ．）、ジオルキス属種（Ｄｉｏｒｃｈｉｓ　ｓｐｐ．）、ジプロピリジウム属種（Ｄｉｐｌｏｐｙｌｉｄｉｕｍ　ｓｐｐ．）、ジピリジウム属種（Ｄｉｐｙｌｉｄｉｕｍ　ｓｐｐ．）、エキノコックス属種（Ｅｃｈｉｎｏｃｏｃｃｕｓ　ｓｐｐ．）、エキノコチレ属種（Ｅｃｈｉｎｏｃｏｔｙｌｅ　ｓｐｐ．）、エキノレピス属種（Ｅｃｈｉｎｏｌｅｐｉｓ　ｓｐｐ．）、ヒダチゲラ属種（Ｈｙｄａｔｉｇｅｒａ　ｓｐｐ．）、ヒメノレピス属種（Ｈｙｍｅｎｏｌｅｐｉｓ　ｓｐｐ．）、ジョイエウキシエラ属種（Ｊｏｙｅｕｘｉｅｌｌａ　ｓｐｐ．）、メソセストイデス属種（Ｍｅｓｏｃｅｓｔｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、モニエジア属種（Ｍｏｎｉｅｚｉａ　ｓｐｐ．）、パラノプロセファラ属種（Ｐａｒａｎｏｐｌｏｃｅｐｈａｌａ　ｓｐｐ．）、ライリエチナ属種（Ｒａｉｌｌｉｅｔｉｎａ　ｓｐｐ．）、スチレシア属種（Ｓｔｉｌｅｓｉａ　ｓｐｐ．）、タエニア属種（Ｔａｅｎｉａ　ｓｐｐ．）、チサニエジア属種（Ｔｈｙｓａｎｉｅｚｉａ　ｓｐｐ．）、チサノソマ属種（Ｔｈｙｓａｎｏｓｏｍａ　ｓｐｐ．）。

【０２８９】

吸虫類（Ｔｒｅｍａｔｏｄｅｓ）：二生亜綱（Ｄｉｇｅｎｅａ）の、例えば：アウストロビルハルジア属種（Ａｕｓｔｒｏｂｉｌｈａｒｚｉａ　ｓｐｐ．）、ブラキライマ属種（Ｂｒａｃｈｙｌａｉｍａ　ｓｐｐ．）、カリコホロン属種（Ｃａｌｉｃｏｐｈｏｒｏｎ　ｓｐｐ．）、カタトロピス属種（Ｃａｔａｔｒｏｐｉｓ　ｓｐｐ．）、クロノルキス属種（Ｃｌｏｎｏｒｃｈｉｓ　ｓｐｐ．）、コリリクルム属種（Ｃｏｌｌｙｒｉｃｌｕｍ　ｓｐｐ．）、コチロホロン属種（Ｃｏｔｙｌｏｐｈｏｒｏｎ　ｓｐｐ．）、シクロコエルム属種（Ｃｙｃｌｏｃｏｅｌｕｍ　ｓｐｐ．）、ジクロコエリウム属種（Ｄｉｃｒｏｃｏｅｌｉｕｍ　ｓｐｐ．）、ジプロストムム属種（Ｄｉｐｌｏｓｔｏｍｕｍ　ｓｐｐ．）、エキノカスムス属種（Ｅｃｈｉｎｏｃｈａｓｍｕｓ　ｓｐｐ．）、エキノパリフィウム属種（Ｅｃｈｉｎｏｐａｒｙｐｈｉｕｍ　ｓｐｐ．）、エキノストマ属種（Ｅｃｈｉｎｏｓｔｏｍａ　ｓｐｐ．）、エウリトレマ属種（Ｅｕｒｙｔｒｅｍａ　ｓｐｐ．）、ファシオラ属種（Ｆａｓｃｉｏｌａ　ｓｐｐ．）、ファシオリデス属種（Ｆａｓｃｉｏｌｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、ファシオロプシス属種（Ｆａｓｃｉｏｌｏｐｓｉｓ　ｓｐｐ．）、フィスコエデリウス属種（Ｆｉｓｃｈｏｅｄｅｒｉｕｓ　ｓｐｐ．）、ガストロチラクス属種（Ｇａｓｔｒｏｔｈｙｌａｃｕｓ　ｓｐｐ．）、ギガントビルハルジア属種（Ｇｉｇａｎｔｏｂｉｌｈａｒｚｉａ　ｓｐｐ．）、ギガントコチレ属種（Ｇｉｇａｎｔｏｃｏｔｙｌｅ　ｓｐｐ．）、ヘテロフィエス属種（Ｈｅｔｅｒｏｐｈｙｅｓ　ｓｐｐ．）、ヒポデラエウム属種（Ｈｙｐｏｄｅｒａｅｕｍ　ｓｐｐ．）、レウコクロリジウム属種（Ｌｅｕｃｏｃｈｌｏｒｉｄｉｕｍ　ｓｐｐ．）、メタゴニムス属種（Ｍｅｔａｇｏｎｉｍｕｓ　ｓｐｐ．）、メトルキス属種（Ｍｅｔｏｒｃｈｉｓ　ｓｐｐ．）、ナノフィエツス属種（Ｎａｎｏｐｈｙｅｔｕｓ　ｓｐｐ．）、ノトコチルス属種（Ｎｏｔｏｃｏｔｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、オピストルキス属種（Ｏｐｉｓｔｈｏｒｃｈｉｓ　ｓｐｐ．）、オルニトビルハルジア属種（Ｏｒｎｉｔｈｏｂｉｌｈａｒｚｉａ　ｓｐｐ．）、パラゴニムス属種（Ｐａｒａｇｏｎｉｍｕｓ　ｓｐｐ．）、パラムフィストムム属種（Ｐａｒａｍｐｈｉｓｔｏｍｕｍ　ｓｐｐ．）、プラギオルキス属種（Ｐｌａｇｉｏｒｃｈｉｓ　ｓｐｐ．）、ポストジプロストムム属種（Ｐｏｓｔｈｏｄｉｐｌｏｓｔｏｍｕｍ　ｓｐｐ．）、プロストゴニムス属種（Ｐｒｏｓｔｈｏｇｏｎｉｍｕｓ　ｓｐｐ．）、シストソマ属種（Ｓｃｈｉｓｔｏｓｏｍａ　ｓｐｐ．）、ト

リコビルハルジア属種（Ｔｒｉｃｈｏｂｉｌｈａｒｚｉａ　ｓｐｐ．）、トログロトレマ属種（Ｔｒｏｇｌｏｔｒｅｍａ　ｓｐｐ．）、チフロコエルム属種（Ｔｙｐｈｌｏｃｏｅｌｕｍ　ｓｐｐ．）。

【０２９０】

線虫類：ベンチュウ目（Ｔｒｉｃｈｉｎｅｌｌｉｄａ）からの、例えばカピラリア属種（Ｃａｐｉｌｌａｒｉａ　ｓｐｐ．）、エウコレウス属種（Ｅｕｃｏｌｅｕｓ　ｓｐｐ．）、パラカピラリア属種（Ｐａｒａｃａｐｉｌｌａｒｉａ　ｓｐｐ．）、トリキネラ属種（Ｔｒｉｃｈｉｎｅｌｌａ　ｓｐｐ．）、トリコモソイデス属種（Ｔｒｉｃｈｏｍｏｓｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、トリクリス属種（Ｔｒｉｃｈｕｒｉｓ　ｓｐｐ．）；

クキセンチュウ目（Ｔｙｌｅｎｃｈｉｄａ）からの、例えば：ミクロネマ属種（Ｍｉｃｒｏｎｅｍａ　ｓｐｐ．）、パラストロンギロイデス属種（Ｐａｒａｓｔｒｏｎｇｙｌｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、ストロンギロイデス属種（Ｓｔｒｏｎｇｙｌｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）；

カンセンチュウ目（Ｒｈａｂｄｉｔｉｎａ）からの、例えば：アエルロストロンギルス属種（Ａｅｌｕｒｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、アミドストムム属種（Ａｍｉｄｏｓｔｏｍｕｍ　ｓｐｐ．）、アンシロストマ属種（Ａｎｃｙｌｏｓｔｏｍａ　ｓｐｐ．）、アンギオストロンギルス属種（Ａｎｇｉｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ブロンコネマ属種（Ｂｒｏｎｃｈｏｎｅｍａ　ｓｐｐ．）、ブノストムム属種（Ｂｕｎｏｓｔｏｍｕｍ　ｓｐｐ．）、カベルチア属種（Ｃｈａｂｅｒｔｉａ　ｓｐｐ．）、クーペリア属種（Ｃｏｏｐｅｒｉａ　ｓｐｐ．）、クレノソマ属種（Ｃｒｅｎｏｓｏｍａ　ｓｐｐ．）、シアトストマ属種（Ｃｙａｔｈｏｓｔｏｍａ　ｓｐｐ．）、シクロコセルクス属種（Ｃｙｃｌｏｃｏｃｅｒｃｕｓ　ｓｐｐ．）、シリコステファヌス属種（Ｃｙｌｉｃｏｓｔｅｐｈａｎｕｓ　ｓｐｐ．）、シリンドロファリンキス属種（Ｃｙｌｉｎｄｒｏｐｈａｒｙｎｘ　ｓｐｐ．）、シストカウルス属種（Ｃｙｓｔｏｃａｕｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ジクチオカウルス属種（Ｄｉｃｔｙｏｃａｕｌｕｓ　ｓｐｐ．）、エラホストロンギルス属種（Ｅｌａｐｈｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、フィラロイデス属種（Ｆｉｌａｒｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、グロボセファルス属種（Ｇｌｏｂｏｃｅｐｈａｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ギアロセファルス属種（Ｇｙａｌｏｃｅｐｈａｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ハエモンクス属種（Ｈａｅｍｏｎｃｈｕｓ　ｓｐｐ．）、ヘリグモソモイデス属種（Ｈｅｌｉｇｍｏｓｏｍｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、ヒオストロンギルス属種（Ｈｙｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、マルシャラギア属種（Ｍａｒｓｈａｌｌａｇｉａ　ｓｐｐ．）、メタストロンギルス属種（Ｍｅｔａｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ムエレリウス属種（Ｍｕｅｌｌｅｒｉｕｓ　ｓｐｐ．）、ネカトール属種（Ｎｅｃａｔｏｒ　ｓｐｐ．）、ネマトジルス属種（Ｎｅｍａｔｏｄｉｒｕｓ　ｓｐｐ．）、ネオストロンギルス属種（Ｎｅｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ニッポストロンギルス属種（Ｎｉｐｐｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、オベリスコイデス属種（Ｏｂｅｌｉｓｃｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、オエソファゴドンツス属種（Ｏｅｓｏｐｈａｇｏｄｏｎｔｕｓ　ｓｐｐ．）、オエソファゴストムム属種（Ｏｅｓｏｐｈａｇｏｓｔｏｍｕｍ　ｓｐｐ．）、オルラヌス属種（Ｏｌｌｕｌａｎｕｓ　ｓｐｐ．）、オルニトストロンギルス属種（Ｏｒｎｉｔｈｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、オスレルス属種（Ｏｓｌｅｒｕｓ　ｓｐｐ．）、オステルタギア属種（Ｏｓｔｅｒｔａｇｉａ　ｓｐｐ．）、パラクレノソマ属種（Ｐａｒａｃｒｅｎｏｓｏｍａ　ｓｐｐ．）、パラフィラロイデス属種（Ｐａｒａｆｉｌａｒｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、パレラホストロンギルス属種（Ｐａｒｅｌａｐｈｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ニューモカウルス属種（Ｐｎｅｕｍｏｃａｕｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ニューモストロンギルス属種（Ｐｎｅｕｍｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ポテリオストムム属種（Ｐｏｔｅｒｉｏｓｔｏｍｕｍ　ｓｐｐ．）、プロトストロンギルス属種（Ｐｒｏｔｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、スピコカウルス属種（Ｓｐｉｃｏｃａｕｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ステファヌルス属種（Ｓｔｅｐｈａｎｕｒｕｓ　ｓｐｐ．）、ストロンギルス属種（Ｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、シンガムス属種（Ｓｙｎｇａｍｕｓ　ｓｐｐ．）、テラドルサギア属種（Ｔｅｌａｄｏｒｓａｇｉａ　ｓｐｐ．）、トリコネマ属種（Ｔｒｉｃｈｏｎｅｍａ　ｓｐｐ．

）、トリコストロンギルス属種（Ｔｒｉｃｈｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、トリオドントホルス属種（Ｔｒｉｏｄｏｎｔｏｐｈｏｒｕｓ　ｓｐｐ．）、トログロストロンギルス属種（Ｔｒｏｇｌｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ウンシナリア属種（Ｕｎｃｉｎａｒｉａ　ｓｐｐ．）；

センビセンチュウ目（Ｓｐｉｒｕｒｉｄａ）からの、例えば：アカントチェイロネマ属種（Ａｃａｎｔｈｏｃｈｅｉｌｏｎｅｍａ　ｓｐｐ．）、アニサキス属種（Ａｎｉｓａｋｉｓ　ｓｐｐ．）、アスカリジア属種（Ａｓｃａｒｉｄｉａ　ｓｐｐ．）、アスカリス属種（Ａｓｃａｒｉｓ　ｓｐｐ．）、アスカロプス属種（Ａｓｃａｒｏｐｓ　ｓｐｐ．）、アスピクルリス属種（Ａｓｐｉｃｕｌｕｒｉｓ　ｓｐｐ．）、バイリサスカリス属種（Ｂａｙｌｉｓａｓｃａｒｉｓ　ｓｐｐ．）、ブルギア属種（Ｂｒｕｇｉａ　ｓｐｐ．）、セルコピチフィラリア属種（Ｃｅｒｃｏｐｉｔｈｉｆｉｌａｒｉａ　ｓｐｐ．）、クラッシカウダ属種（Ｃｒａｓｓｉｃａｕｄａ　ｓｐｐ．）、ジペタロネマ属種（Ｄｉｐｅｔａｌｏｎｅｍａ　ｓｐｐ．）、ジロフィラリア属種（Ｄｉｒｏｆｉｌａｒｉａ　ｓｐｐ．）、ドラクンクルス属種（Ｄｒａｃｕｎｃｕｌｕｓ　ｓｐｐ．）、ドラスキア属種（Ｄｒａｓｃｈｉａ　ｓｐｐ．）、エンテロビウス属種（Ｅｎｔｅｒｏｂｉｕｓ　ｓｐｐ．）、フィラリア属種（Ｆｉｌａｒｉａ　ｓｐｐ．）、グナトストマ属種（Ｇｎａｔｈｏｓｔｏｍａ　ｓｐｐ．）、ゴンギロネマ属種（Ｇｏｎｇｙｌｏｎｅｍａ　ｓｐｐ．）、ハブロネマ属種（Ｈａｂｒｏｎｅｍａ　ｓｐｐ．）、ヘテラキス属種（Ｈｅｔｅｒａｋｉｓ　ｓｐｐ．）、リトモソイデス属種（Ｌｉｔｏｍｏｓｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）、ロア属種（Ｌｏａ　ｓｐｐ．）、オンコセルカ属種（Ｏｎｃｈｏｃｅｒｃａ　ｓｐｐ．）、オキシウリス属種（Ｏｘｙｕｒｉｓ　ｓｐｐ．）、パラブロネマ属種（Ｐａｒａｂｒｏｎｅｍａ　ｓｐｐ．）、パラフィラリア属種（Ｐａｒａｆｉｌａｒｉａ　ｓｐｐ．）、パラスカリス属種（Ｐａｒａｓｃａｒｉｓ　ｓｐｐ．）、パサルルス属種（Ｐａｓｓａｌｕｒｕｓ　ｓｐｐ．）、フィサロプテラ属種（Ｐｈｙｓａｌｏｐｔｅｒａ　ｓｐｐ．）、プロブスタマイリア属種（Ｐｒｏｂｓｔｍａｙｒｉａ　ｓｐｐ．）、シュードフィラリア属種（Ｐｓｅｕｄｏｆｉｌａｒｉａ　ｓｐｐ．）、セタリア属種（Ｓｅｔａｒｉａ　ｓｐｐ．）、スクジラビネマ属種（Ｓｋｊｒａｂｉｎｅｍａ　ｓｐｐ．）、スピロセルカ属種（Ｓｐｉｒｏｃｅｒｃａ　ｓｐｐ．）、ステファノフィラリア属種（Ｓｔｅｐｈａｎｏｆｉｌａｒｉａ　ｓｐｐ．）、ストロンギルリス属種（Ｓｔｒｏｎｇｙｌｕｒｉｓ　ｓｐｐ．）、シファシア属種（Ｓｙｐｈａｃｉａ　ｓｐｐ．）、テラジア属種（Ｔｈｅｌａｚｉａ　ｓｐｐ．）、トキサスカリス属種（Ｔｏｘａｓｃａｒｉｓ　ｓｐｐ．）、トキソカラ属種（Ｔｏｘｏｃａｒａ　ｓｐｐ．）、ウケレリア属種（Ｗｕｃｈｅｒｅｒｉａ　ｓｐｐ．）。

【０２９１】

鉤頭動物門（Ａｃａｎｔｏｃｅｐｈａｌａ）：ダイコウトウチュウ目（Ｏｌｉｇａｃａｎｔｈｏｒｈｙｎｃｈｉｄａ）からの、例えばマクラカントリンクス属種（Ｍａｃｒａｃａｎｔｈｏｒｈｙｎｃｈｕｓ　ｓｐｐ．）、プロステノルキス属種（Ｐｒｏｓｔｈｅｎｏｒｃｈｉｓ　ｓｐｐ．）；サジョウコウトウチュウ目（Ｍｏｎｉｌｉｆｏｒｍｉｄａ）からの、例えばモニリホルミス属種（Ｍｏｎｉｌｉｆｏｒｍｉｓ　ｓｐｐ．）；

ポリモルフス目（Ｐｏｌｙｍｏｒｐｈｉｄａ）からの、例えばフィリコリス属種（Ｆｉｌｉｃｏｌｌｉｓ　ｓｐｐ．）；コウトウチュウ目（Ｅｃｈｉｎｏｒｈｙｎｃｈｉｄａ）からの、例えばアカントセファルス属種（Ａｃａｎｔｈｏｃｅｐｈａｌｕｓ　ｓｐｐ．）、エキノリンクス属種（Ｅｃｈｉｎｏｒｈｙｎｃｈｕｓ　ｓｐｐ．）、レプトリンコイデス属種（Ｌｅｐｔｏｒｈｙｎｃｈｏｉｄｅｓ　ｓｐｐ．）。

【０２９２】

舌形動物門（Ｐｅｎｔａｓｔｏｍａ）：シタムシ目（Ｐｏｒｏｃｅｐｈａｌｉｄａ）からの、例えば：リングアツラ属種（Ｌｉｎｇｕａｔｕｌａ　ｓｐｐ．）。

【０２９３】

本発明の化合物は、特には、蠕虫感染、特に消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の治療及び防止、すなわち予防に用いることができる。

【０２９４】

本発明の化合物を動物寄生虫、特には蠕虫を防除するのに用いることで、病気、死亡症例及び性能低下（肉、牛乳、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）を低減若しくは予防することで、より経済的且つ簡単な動物保護が可能となり、より良好な動物福祉の達成が可能となる。

【０２９５】

獣医分野に関して本明細書において使用される場合の「防除」又は「防除する」という用語は、本発明の化合物がそのような寄生生物に感染した動物での個々の寄生生物の発生率を無害なレベルまで低下させる上で有効であることを意味する。より具体的には、本明細書において使用される場合の「防除する」とは、本発明の化合物が個々の寄生生物を死滅させ、その成長を阻害し、又はそれの増殖を阻害する上で有効であることを意味する。

【０２９６】

さらなる態様によれば、本発明は、疾患、特には蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の治療又は予防で使用される。上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、特にはそれの薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物を包含する。

【０２９７】

本発明による化合物の医薬活性は、Ｓｌｏ－１イオンチャンネルとの相互作用によって説明することができる。

【０２９８】

さらなる態様によれば、本発明は、疾患、特には蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の治療又は予防のための、上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、特にはそれの薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物の使用を包含する。

【０２９９】

さらなる態様によれば、本発明は、疾患、特には蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の治療又は予防方法での、上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、特にはそれの薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物の使用を包含する。

【０３００】

さらなる態様によれば、本発明は、疾患、特には蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の予防又は治療のための医薬組成物、好ましくは医薬を製造するための上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、特にはそれの薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物の使用を包含する。

【０３０１】

さらなる態様によれば、本発明は、有効量の上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、特にはそれの薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物を用いる、疾患、特には蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の治療又は予防方法を包含する。

【０３０２】

さらなる態様によれば、本発明は、抗内部寄生剤として使用される、上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、特にはそれの薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物を包含する。

【０３０３】

さらなる態様によれば、本発明は、駆虫薬として使用される、特には殺線虫剤、殺扁形動物剤、殺鉤頭虫剤、又は殺舌虫剤として使用される、上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、特にはそれの薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物を包含する。

【０３０４】

さらなる態様によれば、本発明は、上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物、塩、特には薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物、及び１以上の賦形剤、特には１以上の薬学的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物、特には動物薬製剤を包含する。適切な剤形でそのような医薬組成物を調製する従来の手順を用いることができる。

【０３０５】

さらなる態様によれば、本発明は、医薬組成物、特に動物薬製剤の製造方法であって、上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又は立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物、それの塩、特に薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物を、１以上の賦形剤、特には１以上の薬学的に許容される賦形剤を混合する段階を含む方法を包含する。

【０３０６】

さらなる態様によれば、本発明は、有効量の上記で記載の一般式（Ｉ）の化合物、又はそれの立体異性体、互変異体、Ｎ－オキサイド、水和物、溶媒和物及び塩、特にはそれの薬学的に許容される塩、又はそれらの混合物を含む、医薬組成物、特には動物薬製剤を用いる、疾患、特に蠕虫感染、特には消化管及び腸外蠕虫感染、詳細には線虫による消化管及び腸外感染の治療又は予防方法を包含する。

【０３０７】

本発明はさらに、従来のように１以上の薬学的に好適な賦形剤とともに少なくとも一つの本発明による化合物を含む医薬組成物、特には動物薬製剤、並びに上記目的のためのそれらの使用を包含する。

【０３０８】

本発明による化合物が、全身及び／又は局所活性を有することが可能である。それに関して、それらは好適な方法で、例えば、経口、非経口、経肺、経鼻、舌下、舌、口腔、直腸、経膣、皮膚、経皮、結膜、経耳経路を介して、又はインプラント若しくはステントとして投与することができる。そのような投与は、予防的に、集団予防的に（ｍｅｔｈａｐｈｙｌａｃｔｉｃａｌｌｙ）又は治療的に行うことができる。

【０３０９】

これらの投与経路に関して、本発明による化合物を、好適な投与形態で投与することが可能である。

【０３１０】

経口投与に関しては、本発明による化合物を、本発明の化合物を急速に及び／又は改変された形態で送達する当業界で公知の剤形、例えば錠剤（遅延しながら溶解するか不溶性である腸溶性若しくは徐放性コーティングを有する、非コート若しくはコート錠）、口腔内崩壊錠、フィルム／ウェハ、フィルム／凍結乾燥物、カプセル（例えば、硬若しくは軟ゼラチンカプセル）、糖衣錠、粒剤、ペレット、咀嚼剤（例えば、軟咀嚼剤）、粉剤、乳濁液、懸濁液、エアロゾル又は液剤に製剤することが可能である。本発明による化合物を、結晶型及び／又は非晶質型及び／又は溶解型で前記剤形に組み込むことが可能である。

【０３１１】

非経口投与は、吸収段階を回避して（例えば、静脈、動脈、心臓内、脊髄内又は腰内）、又は吸収を含めて（例えば、筋肉、皮下、皮内、経皮又は腹腔内）行うことができる。非経口投与に好適な投与形態は特には、液剤、懸濁液、乳濁液、凍結乾燥物又は無菌粉剤の形態での注射及び注入用製剤である。

【０３１２】

他の投与経路に好適な実施例は、吸入用の医薬形態［特に、粉末吸入装置、噴霧器］、点鼻剤、点鼻液、鼻内噴霧剤；舌、舌下若しくは口腔投与用の錠剤／フィルム／ウェハ／カプセル；坐剤；点眼液、眼軟膏、洗眼器、眼球インサート、点耳薬、耳噴霧剤、耳粉剤、耳洗浄液、耳タンポン；膣カプセル、水系懸濁液（ローション、振盪水剤（ｍｉｘｔｕｒａｅ　ａｇｉｔａｎｄａｅ））、親油性懸濁液、乳濁液、軟膏、クリーム、経皮的治療系（例えば貼付剤など）、乳液、ペースト、泡剤、スポット・オン剤（ｓｐｏｔ－ｏｎｓ）、散粉剤、インプラント又はステントである。

【０３１３】
本発明による化合物は、指定の投与形態中に組み入れることができる。それは、自体公知の方法で、薬学的に好適な賦形剤との混合によって行うことができる。薬学的に好適な賦形剤には特には、下記のものなどがある。
【０３１４】
・充填剤及び担体（例えばセルロース、微結晶性セルロース、例えばＡｖｉｃｅｌ（登録商標）など、乳糖、マンニトール、デンプン、リン酸カルシウム、例えばＤｉ－Ｃａｆｏｓ（登録商標）など）、
・軟膏基剤（例えばワセリン、パラフィン、トリグリセリド、ワックス、ウールワックス、ウールワックスアルコール、ラノリン、親水軟膏、ポリエチレングリコール）、
・坐剤用の基剤（例えばポリエチレングリコール、カカオバター、ハードファット（ｈａｒｄ　ｆａｔ））
・溶媒（例えば水、エタノール、イソプロパノール、グリセロール、プロピレングリコール、中鎖長トリグリセリド脂肪油、液体ポリエチレングリコール、パラフィン）、
・界面活性剤、乳化剤、分散剤又はウェッター（例えばドデシル硫酸ナトリウム）、レシチン、リン脂質、脂肪アルコール（例えばＬａｎｅｔｔｅ（登録商標）など）、ソルビタン脂肪酸エステル（例えばＳｐａｎ（登録商標）など）、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル（例えばＴｗｅｅｎ（登録商標）など）、ポリオキシエチレン脂肪酸グリセリド（例えばＣｒｅｍｏｐｈｏｒ（登録商標）など）、ポリオクスエチレン脂肪酸エステル（ｐｏｌｙｏｘｅｔｈｙｌｅｎｅ　ｆａｔｔｙ　ａｃｉｄ　ｅｓｔｅｒ）、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、グリセロール脂肪酸エステル、ポロキサマー（例えば、Ｐｌｕｒｏｎｉｃ（登録商標）など）、
・緩衝剤、酸及び塩基（例えばリン酸塩、炭酸塩、クエン酸、酢酸、塩酸、水酸化ナトリウム溶液、炭酸アンモニウム、トロメタモール、トリエタノールアミン）
・等張剤（例えばグルコース、塩化ナトリウム）、
・吸着剤（例えば高分散シリカ）、
・粘度上昇剤、ゲル形成剤、増粘剤及び／又はバインダー（例えばポリビニルピロリドン、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、カルボキシメチルセルロース－ナトリウム、デンプン、カルボマー、ポリアクリル酸（例えばＣａｒｂｏｐｏｌ（登録商標）など）、アルギネート、ゼラチン）、
・崩壊剤（例えば改質デンプン、カルボキシメチルセルロース－ナトリウム、グリコール酸デンプンナトリウム（例えばＥｘｐｌｏｔａｂ（登録商標）など）、架橋ポリビニルピロリドン、クロスカルメロース－ナトリウム（例えばＡｃＤｉＳｏｌ（登録商標）など））、
・流動調節剤、滑沢剤、滑剤及び離型剤（例えばステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸、タルク、高分散シリカ（例えばＡｅｒｏｓｉｌ（登録商標）など））、
・迅速に又は改変された形で溶解するコーティング材料（例えば糖、シェラック）及びフィルム又は拡散膜用のフィルム形成剤（例えばポリビニルピロリドン（例えばＫｏｌｌｉｄｏｎ（登録商標）など）、ポリビニルアルコール、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、エチルセルロース、フタル酸ヒドロキシプロピルメチルセルロース、酢酸セルロース、酢酸フタル酸セルロース、ポリアクリレート、ポリメタクリレート（例えばＥｕｄｒａｇｉｔ（登録商標）など））、
・カプセル材料（例えばゼラチン、ヒドロキシプロピルメチルセルロース）、
・合成ポリマー（例えばポリラクチド、ポリグリコリド、ポリアクリレート、ポリメタクリレート（例えばＥｕｄｒａｇｉｔ（登録商標）など）、ポリビニルピロリドン（例えばＫｏｌｌｉｄｏｎ（登録商標）など）、ポリビニルアルコール、ポリビニルアセテート、ポリエチレンオキシド、ポリエチレングリコール並びにそれらのコポリマー及びブロックコポリマー）、
・可塑剤（例えばポリエチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、トリアセチン、クエン酸トリアセチル、フタル酸ジブチル）、

・透過増強剤、
・安定剤（例えば抗酸化剤、例えばアスコルビン酸、アスコルビルパルミテート、アスコルビン酸ナトリウム、ブチルヒドロキシアニソール、ブチルヒドロキシトルエン、没食子酸プロピルなど）、
・保存剤（例えばパラベン、ソルビン酸、チオメルサール、塩化ベンザルコニウム、酢酸クロルヘキシジン、安息香酸ナトリウム）、
・着色料（例えば無機顔料、例えば酸化鉄、二酸化チタンなど）、
・香味料、甘味料、香味及び／又は臭気のマスキング剤。

【０３１５】

本発明はさらに、従来のように１以上の薬学的に好適な賦形剤とともに少なくとも一つの本発明による化合物を含む医薬組成物、及び本発明によるそれらの使用に関するものである。

【０３１６】

別の態様によれば、本発明は、特には内部寄生虫及び／又は外部寄生虫（ｅｃｔｏｐａｒａｓｉｔｉｃｉｄａｌ）感染に治療及び／又は予防のための、少なくとも一つの本発明の一般式（Ｉ）の化合物及び少なくとも１以上のさらなる有効成分を含む、医薬組み合わせ、特には医薬品を包含する。

【０３１７】

本発明における「内部寄生虫」という用語は、当業者に公知のように使用され、特には蠕虫を指す。本発明における「外部寄生虫」という用語は、当業者に公知のように使用され、特には節足動物、特には昆虫若しくはコナダニを指す。

【０３１８】

特に、本発明は、
・１以上の第１の有効成分、特には上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物、及び
・１以上のさらなる有効成分、特には１以上の殺内部寄生虫薬及び／又は殺外部寄生虫薬を含む、医薬組み合わせ、特には動物薬組み合わせを包含する。

【０３１９】

本発明における「組み合わせ」という用語は、当業者に公知のように使用され、前記組み合わせが、固定組み合わせ、非固定組み合わせ又は部品キットであることが可能である。

【０３２０】

本発明における「固定組み合わせ」は、当業者に公知のように使用され、例えば、１以上の本発明の一般式（Ｉ）の化合物などの第１の有効成分、及びさらなる有効成分が１単位用量で又は一つの単一体で一緒に存在する組み合わせと定義される。「固定組み合わせ」の一つの例は、第１の有効成分及びさらなる有効成分が、同時投与用の混合物中、例えば製剤中に存在する医薬組成物である。「固定組み合わせ」の別の例は、第１の有効成分及びさらなる有効成分が、混合されずに１単位中に存在する医薬組み合わせである。

【０３２１】

本発明における非固定組み合わせ又は「部品キット」は、当業者に公知のように使用され、第１の有効成分及びさらなる有効成分が複数単位に存在する組み合わせと定義される。非固定組み合わせ又は部品キットの１例は、第１の有効成分及びさらなる有効成分が離れて存在している組み合わせである。非固定組み合わせ又は部品キットの製造を、別個、順次、同時、同時点又は経時的に変えて投与することができる。

【０３２２】

本発明の化合物は、単一医薬として、又は１以上の他の医薬有効成分と組み合わせて投与することができ、その組み合わせは許容できない副作用を全く引き起こさない。本発明は、そのような医薬組み合わせも包含する。例えば、本発明の化合物は、公知の殺外寄生生物剤及び／又は殺内寄生生物剤と組み合わせることができる。

【０３２３】

一般名によって本明細書に記載されている他の又はさらなる有効成分は公知であり、例えば、農薬マニュアル（"Ｔｈｅ　Ｐｅｓｔｉｃｉｄｅ　Ｍａｎｕａｌ"　１６ｔｈ　Ｅｄ

．，Ｂｒｉｔｉｓｈ Ｃｒｏｐ Ｐｒｏｔｅｃｔｉｏｎ Ｃｏｕｎｃｉｌ ２０１２）に記載されているか、インターネットで検索することができる（例えば、ｈｔｔｐ：／／ｗｗｗ．ａｌａｎｗｏｏｄ．ｎｅｔ／ｐｅｓｔｉｃｉｄｅｓ）。その分類は、本特許出願の出願時点現在でのＩＲＡＣ作用機序分類法に基づくものである。

【０３２４】

殺外寄生生物剤及び／又は殺内寄生生物剤の例は、殺虫剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤であり、特に下記のものなどがある。

【０３２５】

（１）アセチルコリンエステラーゼ（ＡＣｈＥ）阻害薬、例えば、カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロポクスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、ＸＭＣ、及び、キシリルカルブ；又は、有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス－エチル、アジンホス－メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス－メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン－Ｓ－メチル、ダイアジノン、ジクロルボス／ＤＤＶＰ、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、ＥＰＮ、エチオン、エトプロホス、ファムフール、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、Ｏ－（メトキシアミノチオホスホリル）サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン－メチル、パラチオン－メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス－メチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、バミドチオン；

（２）ＧＡＢＡ依存性塩化物チャンネル遮断剤、例えば、シクロジエン有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、フェニルピラゾール系（フィプロール系）、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル；

（３）ナトリウムチャンネル調節剤、例えば、ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、ｄ－シス－トランスアレスリン、ｄ－トランスアレスリン、ビフェントリン、ビオアレスリン、ビオアレスリンｓ－シクロペンテニル異性体、ビオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベーター－シフルトリン、シハロトリン、ラムダ－シハロトリン、ガンマ－シハロトリン、シペルメトリン、アルファ－シペルメトリン、ベーター－シペルメトリン、シーター－シペルメトリン、ゼーター－シペルメトリン、シフェノトリン［（１Ｒ）－トランス異性体］、デルタメトリン、エムペントリン［（ＥＺ）－（１Ｒ）－異性体］、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ－フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン［（１Ｒ）－トランス異性体］、プラレトリン、ピレトリン類（除虫菊（ｐｙｒｅｔｈｒｕｍ））、レスメトリン、シラフルオフェン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン［（１Ｒ）異性体］、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、ＤＤＴ；又は、メトキシクロル；

（４）ニコチン性アセチルコリン受容体（ｎＡＣｈＲ）競争的調節剤、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及び、チアメトキサム；又は、ニコチン；又は、スルホキサフロル若しくはフルピラジフロン；

（５）ニコチン性アセチルコリン受容体（ｎＡＣｈＲ）アロステリック調節剤、例えば、スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド；

（６）グルタミン酸依存性塩化物チャンネル（ＧｌｕＣｌ）アロステリック調節剤、例えば、アベルメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン；

（７）幼若ホルモン模倣物質、例えば、幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロプレン、キノプレン、及び、メトプレン；又は、フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン；

（９）弦音器官の調節剤、例えば、ピメトロジン；又は、フロニカミド；

（１０）ダニ成長阻害薬、例えば、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロビダジン；又は、エトキサゾール；

（１１）昆虫腸管膜の微生物ディスラプター、例えば、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・イスラエレンシス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ ｓｕｂｓｐｅｃｉｅｓ ｉｓｒａｅｌｅｎｓｉｓ）、バシルス・スファエリクス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ ｓｐｈａｅｒｉｃｕｓ）、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・アイザワイ（Ｂａｃｉｌｌｕｓ ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ ｓｕｂｓｐｅｃｉｅｓ ａｉｚａｗａｉ）、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・クルスタキ（Ｂａｃｉｌｌｕｓ ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ ｓｕｂｓｐｅｃｉｅｓ ｋｕｒｓｔａｋｉ）、バシルス・ツリンギエンシス・亜種・テネブリオニス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｓ ｓｕｂｓｐｅｃｉｅｓ ｔｅｎｅｂｒｉｏｎｉｓ）、及び、ＢＴ植物タンパク質：Ｃｒｙ１Ａｂ、Ｃｒｙ１Ａｃ、Ｃｒｙ１Ｆａ、Ｃｒｙ２Ａｂ、ｍＣｒｙ３Ａ、Ｃｒｙ３Ａｂ、Ｃｒｙ３Ｂｂ、Ｃｒｙ３４／３５Ａｂ１；

（１２）ミトコンドリアＡＴＰ合成酵素の阻害剤、例えばＡＴＰディスラプター、例えば、ジアフェンチウロン；又は、有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、プロパルギット；又は、テトラジホン；

（１３）プロトン勾配の乱れを介して酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、クロルフェナピル、ＤＮＯＣ、及び、スルフルラミド；

（１４）ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシラム、及び、チオスルタップ－ナトリウム；

（１５）キチン生合成の阻害薬（タイプ０）、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン；

（１６）キチン生合成の阻害薬（タイプ１）、例えば、ブプロフェジン；

（１７）脱皮撹乱物質（特に、双翅目、すなわち双翅類に関する）、例えば、シロマジン；

（１８）エクジソン受容体作動薬、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド；

（１９）オクトパミン受容体作動薬、例えば、アミトラズ；

（２０）ミトコンドリア複合体ＩＩＩ電子伝達阻害薬、例えば、ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム；

（２１）ミトコンドリア複合体Ｉ電子伝達阻害薬、例えば、ＭＥＴＩ殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、ロテノン（Ｄｅｒｒｉｓ）の群からのもの；

（２２）電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン；

（２３）アセチルＣｏＡカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト；

（２５）ミトコンドリア複合体ＩＩ電子伝達阻害薬、例えば、β－ケトニトリル誘導体、例えばシエノピラフェン及びシフルメトフェン及びカルボキシアニリド類、例えばピフルブミド；

（２８）リアノジン受容体調節剤、例えば、ジアミド類、例えば、クロラントラニリプ

ロール、シアントラニルプロール及びフルベンジアミド、
さらなる有効成分、例えば、アフィドピロペン、アフォキソレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、ブロフラニリド、ブロモプロピレート、キノメチオナート、クロロプラレスリン（ｃｈｌｏｒｏｐｒａｌｌｅｔｈｒｉｎ）、氷晶石（Ｃｒｙｏｌｉｔｅ）、シクラニリプロール、シクロキサプリド、シハロジアミド（Ｃｙｈａｌｏｄｉａｍｉｄｅ）、ジクロロメゾチアズ、ジコホル、ε－メトフルトリン、ε－モムフルトリン（Ｍｏｍｆｌｕｔｈｒｉｎ）、フロメトキン、フルアザインドリジン、フルエンスルホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルヘキサホン（Ｆｌｕｈｅｘａｆｏｎ）、フルオピラム、フルララネル、フルキサメタミド、フフェノジド（Ｆｕｆｅｎｏｚｉｄｅ）、グアジピル、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、κ－ビフェントリン、κ－テフルトリン、ロチラネル、メペルフルトリン、パイコングディング（Ｐａｉｃｈｏｎｇｄｉｎｇ）、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、テトラメチルフルトリン、テトラニリプロール、テトラクロルアントラニリプロール（Ｔｅｔｒａｃｈｌｏｒａｎｔｒａｎｉｌｉｐｒｏｌｅ）、チオキサザフェン、チオフルオキシメート（Ｔｈｉｏｆｌｕｏｘｉｍａｔｅ）、トリフルメゾピリム（Ｔｒｉｆｌｕｍｅｚｏｐｙｒｉｍ）およびヨードメタン；バシルス・フィルムス（Ｂａｃｉｌｌｕｓ　ｆｉｒｍｕｓ）に基づくさらなる調製物（Ｉ－１５８２，ＢｉｏＮｅｅｍ，　Ｖｏｔｉｖｏ）、および以下の化合物：１－｛２－フルオロ－４－メチル－５－［（２，２，２－トリフルオロエチル）スルフィニル］フェニル｝－３－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－５－アミン（ＷＯ２００６／０４３６３５から公知）（ＣＡＳ８８５０２６－５０－６）、｛１′－［（２Ｅ）－３－（４－クロロフェニル）プロパ－２－エン－１－イル］－５－フルオロスピロ［インドール－３，４′－ピペリジン］－１（２Ｈ）－イル｝（２－クロロピリジン－４－イル）メタノン（ＷＯ２００３／１０６４５７から公知）（ＣＡＳ６３７３６０－２３－７）、２－クロロ－Ｎ－［２－｛１－［（２Ｅ）－３－（４－クロロフェニル）プロパ－２－エン－１－イル］ピペリジン－４－イル｝－４－（トリフルオロメチル）フェニル］イソニコチンアミド（ＷＯ２００６／００３４９４から公知）（ＣＡＳ８７２９９９－６６－１）、３－（４－クロロ－２，６－ジメチルフェニル）－４－ヒドロキシ－８－メトキシ－１，８－ジアザスピロ［４．５］デカ－３－エン－２－オン（ＷＯ２０１００５２１６１から公知）（ＣＡＳ１２２５２９２－１７－０）、３－（４－クロロ－２，６－ジメチルフェニル）－８－メトキシ－２－オキソ－１，８－ジアザスピロ［４．５］デカ－３－エン－４－イルエチルカーボネート（ＥＰ２６４７６２６から公知）（ＣＡＳ１４４０５１６－４２－６）、４－（ブタ－２－イン－１－イルオキシ）－６－（３，５－ジメチルピペリジン－１－イル）－５－フルオロピリミジン（ＷＯ２００４／０９９１６０から公知）（ＣＡＳ７９２９１４－５８－０）、ＰＦ１３６４（ＪＰ２０１０／０１８５８６から公知）（ＣＡＳ１２０４７７６－６０－２）、Ｎ－［（２Ｅ）－１－［（６－クロロピリジン－３－イル）メチル］ピリジン－２（１Ｈ）－イリデン］－２，２，２－トリフルオロアセトアミド（ＷＯ２０１２／０２９６７２から公知）（ＣＡＳ１３６３４００－４１－２）、（３Ｅ）－３－［１－［（６－クロロ－３－ピリジル）メチル］－２－ピリジリデン］－１，１，１－トリフルオロ－プロパン－２－オン（ＷＯ２０１３／１４４２１３から公知）（ＣＡＳ１４６１７４３－１５－６）、Ｎ－［３－（ベンジルカルバモイル）－４－クロロフェニル］－１－メチル－３－（ペンタフルオロエチル）－４－（トリフルオロメチル）－１Ｈ－ピラゾール－５－カルボキサミド（ＷＯ２０１０／０５１９２６から公知）（ＣＡＳ１２２６８８９－１４－０）、５－ブロモ－４－クロロ－Ｎ－［４－クロロ－２－メチル－６－（メチルカルバモイル）フェニル］－２－（３－クロロ－２－ピリジル）ピラゾール－３－カルボキサミド（ＣＮ１０３２３２４３１から公知）（ＣＡＳ１４４９２２０－４４－３）、４－［５－（３，５－ジクロロフェニル）－４，５－ジヒドロ－５－（トリフルオロメチル）－３－イソオキサゾリル］－２－メチル－Ｎ－（シス－１－オキシド－３－チエタニル）－ベンズアミド、４－［５－（３，５－ジクロロフェニル）－４，５－ジヒドロ－５－（トリフルオロメチル）－３－イソオキサゾリル］－２－メ

チル－Ｎ－（トランス－１－オキシド－３－チエタニル）－ベンズアミド及び４－［（５Ｓ）－５－（３，５－ジクロロフェニル）－４，５－ジヒドロ－５－（トリフルオロメチル）－３－イソオキサゾリル］－２－メチル－Ｎ－（シス－１－オキシド－３－チエタニル）ベンズアミド（ＷＯ２０１３／０５０３１７Ａ１から公知）（ＣＡＳ１３３２６２８－８３－７）、Ｎ－［３－クロロ－１－（３－ピリジニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－エチル－３－［（３，３，３－トリフルオロプロピル）スルフィニル］－プロパンアミド、（＋）－Ｎ－［３－クロロ－１－（３－ピリジニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－エチル－３－［（３，３，３－トリフルオロプロピル）スルフィニル］－プロパンアミド及び（－）－Ｎ－［３－クロロ－１－（３－ピリジニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－エチル－３－［（３，３，３－トリフルオロプロピル）スルフィニル］－プロパンアミド（ＷＯ２０１３／１６２７１５Ａ２、ＷＯ２０１３／１６２７１６Ａ２、ＵＳ２０１４／０２１３４４８Ａ１から公知）（ＣＡＳ１４７７９２３－３７－７）、５－［［（２Ｅ）－３－クロロ－２－プロペン－１－イル］アミノ］－１－［２，６－ジクロロ－４－（トリフルオロメチル）フェニル］－４－［（トリフルオロメチル）スルフィニル］－１Ｈ－ピラゾール－３－カルボニトリル（ＣＮ１０１３３７９３７Ａから公知）（ＣＡＳ１１０５６７２－７７－２）、３－ブロモ－Ｎ－［４－クロロ－２－メチル－６－［（メチルアミノ）チオキソメチル］フェニル］－１－（３－クロロ－２－ピリジニル）－１Ｈ－ピラゾール－５－カルボキサミド、（Ｌｉｕｄａｉｂｅｎｊｉａｘｕａｎａｎ、ＣＮ１０３１０９８１６Ａから公知）（ＣＡＳ１２３２５４３－８５－９）；Ｎ－［４－クロロ－２－［［（１，１－ジメチルエチル）アミノ］カルボニル］－６－メチルフェニル］－１－（３－クロロ－２－ピリジニル）－３－（フルオロメトキシ）－１Ｈ－ピラゾール－５－カルボキサミド（ＷＯ２０１２／０３４４０３Ａ１から公知）（ＣＡＳ１２６８２７７－２２－０）、Ｎ－［２－（５－アミノ－１，３，４－チアジアゾール－２－イル）－４－クロロ－６－メチルフェニル］－３－ブロモ－１－（３－クロロ－２－ピリジニル）－１Ｈ－ピラゾール－５－カルボキサミド（ＷＯ２０１１／０８５５７５Ａ１から公知）（ＣＡＳ１２３３８８２－２２－８）、４－［３－［２，６－ジクロロ－４－［（３，３－ジクロロ－２－プロペン－１－イル）オキシ］フェノキシ］プロポキシ］－２－メトキシ－６－（トリフルオロメチル）－ピリミジン（ＣＮ１０１３３７９４０Ａから公知）（ＣＡＳ１１０８１８４－５２－６）；（２Ｅ）－及び２（Ｚ）－２－［２－（４－シアノフェニル）－１－［３－（トリフルオロメチル）フェニル］エチリデン］－Ｎ－［４－（ジフルオロメトキシ）フェニル］－ヒドラジンカルボキサミド（ＣＮ１０１７１５７７４Ａから公知）（ＣＡＳ１２３２５４３－８５－９）；３－（２，２－ジクロロエテニル）－２，２－ジメチル－４－（１Ｈ－ベンゾイミダゾール－２－イル）フェニル－シクロプロパンカルボン酸エステル（ＣＮ１０３５２４４２２Ａから公知）（ＣＡＳ１５４２２７１－４６－４）；（４ａＳ）－７－クロロ－２，５－ジヒドロ－２－［［（メトキシカルボニル）［４－［（トリフルオロメチル）チオ］フェニル］アミノ］カルボニル］－インデノ［１，２－ｅ］［１，３，４］オキサジアジン－４ａ（３Ｈ）－カルボン酸メチルエステル（ＣＮ１０２３９１２６１Ａから公知）（ＣＡＳ１３７０３５８－６９－２）；６－デオキシ－３－Ｏ－エチル－２，４－ジ－Ｏ－メチル－、１－［Ｎ－［４－［１－［４－（１，１，２，２，２－ペンタフルオロエトキシ）フェニル］－１Ｈ－１，２，４－トリアゾール－３－イル］フェニル］カーバメート］－α－Ｌ－マンノピラノース（ＵＳ２０１４／０２７５５０３Ａ１から公知）（ＣＡＳ１１８１２１３－１４－８）；８－（２－シクロプロピルメトキシ－４－トリフルオロメチル－フェノキシ）－３－（６－トリフルオロメチル－ピリダジン－３－イル）－３－アザ－ビシクロ［３．２．１］オクタン（ＣＡＳ１２５３８５０－５６－４）、（８－アンチ）－８－（２－シクロプロピルメトキシ－４－トリフルオロメチル－フェノキシ）－３－（６－トリフルオロメチル－ピリダジン－３－イル）－３－アザ－ビシクロ［３．２．１］オクタン（ＣＡＳ９３３７９８－２７－７）、（８－シン）－８－（２－シクロプロピルメトキシ－４－トリフルオロメチル－フェノキシ）－３－（６－トリフルオロメチル－ピリダジン－３－イル）－３－アザ－ビシクロ［３．２．１］オクタン（ＷＯ２００７０４０２８０Ａ１、

ＷＯ２００７０４０２８２Ａ１から公知）（ＣＡＳ９３４００１－６６－８）、Ｎ－［３－クロロ－１－（３－ピリジニル）－１Ｈ－ピラゾール－４－イル］－Ｎ－エチル－３－［（３，３，３－トリフルオロプロピル）チオ］－プロパンアミド（ＷＯ２０１５／０５８０２１Ａ１、ＷＯ２０１５／０５８０２８Ａ１から公知）（ＣＡＳ１４７７９１９－２７－９）、Ｎ－［４－（アミノチオキソメチル）－２－メチル－６－［（メチルアミノ）カルボニル］フェニル］－３－ブロモ－１－（３－クロロ－２－ピリジニル）－１Ｈ－ピラゾール－５－カルボキサミド（ＣＮ１０３２６５５２７Ａから公知）（ＣＡＳ１４５２８７７－５０－７）、５－（１，３－ジオキサン－２－イル）－４－［［４－（トリフルオロメチル）フェニル］メトキシ］－ピリミジン（ＷＯ２０１３／１１５３９１Ａ１から公知）（ＣＡＳ１４４９０２１－９７－９）、３－（４－クロロ－２，６－ジメチルフェニル）－４－ヒドロキシ－８－メトキシ－１－メチル－１，８－ジアザスピロ［４．５］デカ－３－エン－２－オン（ＷＯ２０１０／０６６７８０Ａ１、ＷＯ２０１１／１５１１４６Ａ１から公知）（ＣＡＳ１２２９０２３－３４－０）、３－（４－クロロ－２，６－ジメチルフェニル）－８－メトキシ－１－メチル－１，８－ジアザスピロ［４．５］デカン－２，４－ジオン（ＷＯ２０１４／１８７８４６Ａ１から公知）（ＣＡＳ１６３８７６５－５８－８）、３－（４－クロロ－２，６－ジメチルフェニル）－８－メトキシ－１－メチル－２－オキソ－１，８－ジアザスピロ［４．５］デカ－３－エン－４－イル－炭酸エチルエステル（ＷＯ２０１０／０６６７８０Ａ１、ＷＯ２０１１１５１１４６Ａ１から公知）（ＣＡＳ１２２９０２３－００－０）、Ｎ－［１－［（６－クロロ－３－ピリジニル）メチル］－２（１Ｈ）－ピリジニリデン］－２，２，２－トリフルオロ－アセトアミド（ＤＥ３６３９８７７Ａ１、ＷＯ２０１２０２９６７２Ａ１から公知）（ＣＡＳ１３６３４００－４１－２）、［Ｎ（Ｅ）］－Ｎ－［１－［（６－クロロ－３－ピリジニル）メチル］－２（１Ｈ）－ピリジニリデン］－２，２，２－トリフルオロ－アセトアミド、（ＷＯ２０１６００５２７６Ａ１から公知）（ＣＡＳ１６８９５６６－０３－７）、［Ｎ（Ｚ）］－Ｎ－［１－［（６－クロロ－３－ピリジニル）メチル］－２（１Ｈ）－ピリジニリデン］－２，２，２－トリフルオロ－アセトアミド、（ＣＡＳ１７０２３０５－４０－５）、３－エンド－３－［２－プロポキシ－４－（トリフルオロメチル）フェノキシ］－９－［［５－（トリフルオロメチル）－２－ピリジニル］オキシ］－９－アザビシクロ［３．３．１］ノナン（ＷＯ２０１１／１０５５０６Ａ１、ＷＯ２０１６／１３３０１１Ａ１から公知）（ＣＡＳ１３３２８３８－１７－１）。

【０３２６】

未知若しくは非特異的作用機序を有する有効成分、例えばフェントリファニル、フェノキサクリム、シクロプレン、クロロベンジレート、クロルジメホルム、フルベンジミン、ジシクラニル、アミドフルメト、キノメチオネート、トリアラテン、クロチアゾベン、テトラスル、オレイン酸カリウム、石油、メトキサジアゾン、ゴシプルレ、フルテンジン、ブロモプロピレート、氷晶石；

他の種類からの有効成分、例えばブタカルブ、ジメチラン、クロエトカルブ、ホスホカルブ、ピリミホス（－エチル）、パラチオン（－エチル）、メタクリホス、ｏ－サリチル酸イソプロピル、トリクロルホン、スルプロホス、プロパホス、セブホス、ピリダチオン、プロトエート、ジクロフェンチオン、デメトン－Ｓ－メチルスルホン、イサゾホス、シアノフェンホス、ジアリホス、カルボフェノチオン、アウタチオホス、アロムフェンビンホス（－メチル）、アジンホス（－エチル）、クロルピリホス（－エチル）、ホスメチラン、ヨードフェンホス、ジオキサベンゾホス、ホルモチオン、ホノホス、フルピラゾホス、フェンスルホチオン、エトリムホス；

有機塩素類、例えばカンフェクロル、リンダン、ヘプタクロル；又はフェニルピラゾール類、例えばアセトプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、バニリプロール、シサプロニル；又はイソオキサゾリン類、例えばサロラネル、アフォキソラネル、ロチラネル、フルララネル；

ピレスロイド類、例えば（シス－、トランス－）、メトフルトリン、プロフルトリン、フルフェンプロックス、フルブロシトリネート、フブフェンプロックス、フェンフルトリ

ン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、ＲＵ１５５２５、テラレトリン、シス－レスメトリン、ヘプタフルスリン、ビオエタノメトリン、ビオペルメトリン、フェンピリトリン、シス－シペルメトリン、シス－ペルメトリン、クロシトリン、シハロトリン（λ－）、クロバポルトリン又はハロゲン化炭化水素化合物（ＨＣＨ類）；

ネオニコチノイド類、例えばニチアジン；

ジクロロメゾチアズ、トリフルメゾピリム；

大環状ラクトン類、例えばネマデクチン、イベルメクチン、ラチデクチン、モキシデクチン、セラメクチン、エプリノメクチン、ドラメクチン、エマメクチン安息香酸塩；ミルベマイシン・オキシム；

トリプレン、エポフェノナン、ジオフェノラン；

生物剤、ホルモン類又はフェロモン類、例えば天然物、例えばツリンギエンシン（ｔｈｕｒｉｎｇｉｅｎｓｉｎ）、コドレモン又はニーム成分；

ジニトロフェノール類、例えばジノカップ、ジノブトン、ビナパクリル；

ベンゾイル尿素類、例えばフルアズロン、ペンフルロン；

アミジン誘導体、例えばクロロメブホルム（ｃｈｌｏｒｍｅｂｕｆｏｒｍ）、シミアゾール、デミジトラズ；

ビー・ハイブ・バロア（Ｂｅｅ　ｈｉｖｅ　ｖａｒｒｏａ）殺ダニ剤、例えば有機酸、例えばギ酸、シュウ酸。

【０３２７】

動物衛生での使用に特に興味深い殺虫剤および殺ダニ剤の例には、特に下記のものなどがある［すなわち、Ｍｅｈｌｈｏｒｎ　ｅｔ　ａｌ　Ｅｎｃｙｃｌｐａｅｄｉｃ　Ｒｅｆｅｒｅｎｃｅ　ｏｆ　Ｐａｒａｓｉｔｏｌｏｇｙ　４th　ｅｄｉｔｉｏｎ（ＩＳＢＮ９７８－３－６６２－４３９７８－４）］。

【０３２８】

節足動物リガンド依存性クロライドチャンネルでのエフェクター：クロルダン、ヘプタクロル、エンドクルファン（ｅｎｄｏｃｕｌｆａｎ）。ジエルドリン、ブロモシクレン、トキサフェン、リンダン、フィプロニル、ピリプロール、シサプロニル、アフォキソラネル、フルララネル、サロラネル、ロチラネル、フルキサメタミド、ブロフラニリド、アベルメクチン、ドラメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチン、ミルベマイシン、モキシデクチン、セラメクチン；

節足動物オクトパミン作動性受容体の調節剤：アミトラズ、ＢＴＳ２７２７１、シミアゾール、デミディトラズ；

節足動物電圧依存性ナトリウムチャンネルでのエフェクター：ＤＤＴ、メトキシクロル、メタフルミゾン、インドキサカルブ、シネリンＩ、シネリンＩＩ、ジャスモリンＩ、ジャスモリンＩＩ、ピレトリンＩ、ピレトリンＩＩ、アレスリン、α－シペルメトリン、ビオアレトリン、β－シフルトリン、シフルトリン、シハロトリン、シペルメトリン、デルタメトリン、エトフェンプロックス、フェンバレレート、フルシトリナート、フルメトリン、ハルフェンプロックス、ペルメトリン、フェノトリン、レスメトリン、τ－フルバリネート、テトラメトリン；

節足動物ニコチン様コリン作動性シナプスでのエフェクター（アセチルコリンエステラーゼ、アセチルコリン受容体）：ブロモプリピレート（ｂｒｏｍｏｐｒｙｐｙｌａｔｅ）、ベンジオカルブ、カルバリル、メトミル、プロマシル、プロポキスル、アザメチホス、クロルフェンビンホス、プロルピリホス、クマホス、シチオアート、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、エチオン、ファムフール、フェニトロチオン、フェンチオン、ヘプテノホス、マラチオン、ナレド、ホスメット、ホキシム、フタロホス（ｐｈｔａｌｏｆｏｓ）、プロペタンホス、テメホス、テトラクロルビンホス、トリクロルホン、イミダクロプリド、ニテンピラム、ジノテフラン、スピノサド、スピネトラム；

節足動物発達プロセスに対するエフェクター：シロマジン、ジシクラニル、ジフルベンズロン、フルアズロン、ルフェヌロン、トリフルムロン、フェノキシカルブ、ヒドロプレン、メトプレン、ピリプロキシフェン、フェノキシカルブ、ヒドロプレン、Ｓ－メトプレ

ン、ピリプロキシフェン。

【０３２９】

本発明における更なる又は他の有効成分としての殺内寄生生物剤の群からの有効成分の例には、駆虫薬活性化合物及び抗原虫活性化合物などがあるが、これらに限定されるものではない。

【０３３０】

下記の殺線虫活性化合物、殺吸虫活性化合物及び／又は殺条虫活性化合物など（これらに限定されるものではない）の駆虫薬活性化合物：

大環状ラクトン類からのもの、例えば：エプリノメクチン、アバメクチン、ネマデクチン、モキシデクチン、ドラメクチン、セラメクチン、レピメクチン、ラチデクチン（ｌａｔｉｄｅｃｔｉｎ）、ミルベメクチン、イベルメクチン、エマメクチン、ミルベマイシン；

ベンゾイミダゾール類およびプロベンゾイミダゾール類からのもの、例えば：オキシベンダゾール（ｏｘｉｂｅｎｄａｚｏｌｅ）、メベンダゾール、トリクラベンダゾール（ｔｒｉｃｌａｂｅｎｄａｚｏｌｅ）、チオファネート（ｔｈｉｏｐｈａｎａｔｅ）、パルベンダゾール（ｐａｒｂｅｎｄａｚｏｌｅ）、オキシフェンダゾール（ｏｘｆｅｎｄａｚｏｌｅ）、ネトビミン（ｎｅｔｏｂｉｍｉｎ）、フェンベンダゾール、フェバンテル、チアベンダゾール（ｔｈｉａｂｅｎｄａｚｏｌｅ）、シクロベンダゾール、カムベンダゾール、アルベンダゾールスルホキシド、アルベンダゾール、フルベンダゾール；

デプシペプチド類（ｄｅｐｓｉｐｅｐｔｉｄｅｓ）、好ましくは環状デプシペプチド類、特には２４員環状デプシペプチド類からのもの、例えば：エモデプシド（ｅｍｏｄｅｐｓｉｄｅ）、ＰＦ１０２２Ａ；

テトラヒドロピリミジン類からのもの、例えば：モランテル、ピランテル、オキサンテル；

イミダゾチアゾール類からのもの、例えば：ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

アミノフェニルアミジン類からのもの、例えば：アミダンテル、脱アシル化アミダンテル（ｄＡＭＤ）、トリベンジミジン；

アミノアセトニトリル類からのもの、例えば：モネパンテル（ｍｏｎｅｐａｎｔｅｌ）；

パラヘルクアミド類からのもの、例えば：パラヘルクアミド、デルクアンテル；

サリチルアニリド類からのもの、例えば：トリブロムサラン、ブロモキサニド、ブロチアニド、クリオキサニド、クロサンテル、ニクロサミド、オキシクロザニド、ラフォキサニド；

置換フェノール類からのもの、例えば：ニトロキシニル、ビチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロホラン（ｍｅｎｉｃｌｏｐｈｏｌａｎ）；

有機リン酸エステル類からのもの、例えば：トリクロルホン、ナフタロホス（ｎａｐｈｔｈａｌｏｆｏｓ）、ジクロルボス／ＤＤＶＰ、クルホメート、クマホス、ハロキソン；

ピペラジノン類／キノリン類からのもの、例えば：プラジクアンテル、エプシプランテル；

ピペラジン類からのもの、例えば：ピペラジン、ヒドロキシジン；

テトラサイクリン類からのもの、例えば：テトラサイクリン、クロロテトラサイクリン、ドキシサイクリン、オキシテトラサイクリン、ロリテトラサイクリン；

多様な他の種類からのもの、例えば：ブナミジン、ニリダゾール、レソランテル、オムファロチン、オルチプラズ、ニトロスカネート、ニトロキシニル（ｎｉｔｒｏｘｙｎｉｌｅ）、オキサムニキン、ミラサン（ｍｉｒａｓａｎ）、ミラシル（ｍｉｒａｃｉｌ）、ルカントン、ヒカントン、ヘトリン（ｈｅｔｏｌｉｎ）、エメチン、ジエチルカルバマジン、ジクロロフェン、ジアンフェネチド、クロナゼパム、ベフェニウム、アモスカネート（ａｍｏｓｃａｎａｔｅ）、クロルスロン。

【０３３１】

下記の有効成分など（これらに限定されるものではない）の本発明における抗原虫有効

成分：
トリアジン類からのもの、例えば：ジクラズリル、ポナズリル、レトラズリル、トルトラズリル；
ポリエーテルイオノフォア類からのもの、例えば：モネンシン、サリノマイシン、マデュラマイシン、ナラシン；
大環状ラクトン類からのもの、例えば：ミルベマイシン、エリスロマイシン；
キノロン類からのもの、例えば：エンロフロキサシン、プラドフロキサシン（ｐｒａｄｏｆｌｏｘａｃｉｎ）；
キニーネ類からのもの、例えば：クロロキン；
ピリミジン類からのもの、例えば：ピリメタミン；
スルホンアミド類からのもの、例えば：スルファキノキサリン、トリメトプリム、スルファクロジン（ｓｕｌｆａｃｌｏｚｉｎ）；
チアミン類からのもの、例えば：アンプロリウム；
リンコサミド類からのもの、例えば：クリンダマイシン；
カルバニリド類からのもの、例えば：イミドカルブ；
ニトロフラン類からのもの、例えば：ニフルチモックス；
キナゾリノンアルカロイド類からのもの、例えば：ハロフギノン；
多様な他の種類からのもの、例えば：オキサムニキン、パロモマイシン；
ワクチン類又は微生物からの抗原類からのもの、例えば：バベシア・カニス・ロッシ（Ｂａｂｅｓｉａ ｃａｎｉｓ ｒｏｓｓｉ）、エイメリア・テネラ（Ｅｉｍｅｒｉａ ｔｅｎｅｌｌａ）、エイメリア・プラエコクス（Ｅｉｍｅｒｉａ ｐｒａｅｃｏｘ）、エイメリア・ネカトリクス（Ｅｉｍｅｒｉａ ｎｅｃａｔｒｉｘ）、エイメリア・ミチス（Ｅｉｍｅｒｉａ ｍｉｔｉｓ）、エイメリア・マキシマ（Ｅｉｍｅｒｉａ ｍａｘｉｍａ）、エイメリア・ブルネッティ（Ｅｉｍｅｒｉａ ｂｒｕｎｅｔｔｉ）、エイメリア・アセルブリナ（Ｅｉｍｅｒｉａ ａｃｅｒｖｕｌｉｎａ）、バベシア・カニス・ボゲリ（Ｂａｂｅｓｉａ ｃａｎｉｓ ｖｏｇｅｌｉ）、レイシュマニア・インファンツム（Ｌｅｉｓｈｍａｎｉａ ｉｎｆａｎｔｕｍ）、バベシア・カニス・カニス（Ｂａｂｅｓｉａ ｃａｎｉｓ ｃａｎｉｓ）、ジクチオカウルス・ビビパルス（Ｄｉｃｔｙｏｃａｕｌｕｓ ｖｉｖｉｐａｒｕｓ）。

【０３３２】
本発明において列記された他の又はさらなる有効成分は全て、それらの官能基によって可能である場合は、好適な塩基若しくは酸と適宜に塩を形成することができる。

【０３３３】
蠕虫感染の治療に有用な化合物を評価することが知られる標準的実験技術に基づき、標準的毒性試験によって及び動物における上記で確認した状態の治療の決定のための標準的薬理アッセイによって、及びこれらの結果とこれらの状態を治療するのに使用される既知の有効成分若しくは医薬の結果の比較によって、本発明の化合物の有効用量を各所望の適応症の治療のために容易に決定できる。これら状態の一つの治療で投与すべき有効成分の量は、用いられる特定の化合物及び用量単位、投与形態、治療期間、治療される対象者の年齢及び性別及び治療される状態の性質及び程度などを考慮して、広範囲で変動し得る。

【０３３４】
投与される有効成分の総量は、一般的に約０．００１ｍｇ／ｋｇ～約２００ｍｇ／ｋｇ体重／日、好ましくは約０．０１ｍｇ／ｋｇ～約２０ｍｇ／ｋｇ／日の範囲である。臨床的に有用な投与スケジュールは、１日１～３回の投与から４週間毎に１回の投与の範囲である。さらに、対象者が一定期間薬物を投与されない「休薬日」が、薬理効果と耐容性の全体的バランスのために有益であり得る。さらに、対象者が４週間より長い期間にわたり１回治療を受ける、長期作用処置を行うことが可能である。単位用量が約０．５ｍｇ～約１５００ｍｇの有効成分を含み、１日１回以上又は１日１回未満投与することが可能である。静脈注射、筋肉注射、皮下注射及び非経口注射及び点滴法などの注射による投与のための平均１日用量は、好ましくは０．０１～２００ｍｇ／ｋｇ総体重である。平均１日直

腸投与法は、好ましくは０．０１～２００ｍｇ／ｋｇ総体重である。平均１日膣投与法は、好ましくは０．０１～２００ｍｇ／ｋｇ総体重である。平均１日局所投与法は、好ましくは１日１から４回投与で０．１～２００ｍｇである。経皮濃度は、好ましくは０．０１～２００ｍｇ／ｋｇの１日用量を維持するのに必要なものである。平均１日吸入投与法は、好ましくは０．０１～１００ｍｇ／ｋｇ総体重である。

【０３３５】

当然のことながら、各対象者についての特定の開始及び連続投与法は、担当診断医によって決定される状態の性質及び重度、用いる特定の化合物の活性、対象者の年齢及び全身状態、投与時間、投与経路、薬物排泄速度、薬物併用などに従って変わる。所望の処置方法及び本発明の化合物又はその医薬として許容される塩又はエステル又は組成物の投与回数は、従来の治療試験を使用して当業者が決定できる。

【０３３６】

実験の部

略称：

【表１】

aq.	水溶液
DMF	ジメチルホルムアミド
DMSO	ジメチルスルホキシド
MTBE	メチル-t-ブチルエーテル
THF	テトラヒドロフラン

【０３３７】

本願に記載の発明の各種態様を、下記の実施例によって説明するが、それらの実施例はいかなる形でも当該発明を限定するものではない。

【０３３８】

本明細書に記載の試験実験例は、本発明を説明するものであり、本発明は提供される実施例に限定されるものではない。

【０３３９】

実験の部－一般的部分

実験の部に合成が記載されていない試薬はいずれも、市販されているか、公知の化合物であり、当業者によって公知の方法により、公知の化合物から形成することができる。

【０３４０】

本発明の方法に従って製造される化合物及び中間体は、精製を必要とする場合がある。有機化合物の精製は、当業者には公知であり、当化合物を精製する方法はいくつかあり得る。場合により、精製が必要ないことがある。場合により、その化合物は結晶化によって精製することができる。場合により、好適な溶媒を用いて、不純物を攪拌除去することができる。場合により、その化合物は、Ｂｉｏｔａｇｅ自動精製装置システム（ＳＰ４（登録商標）又はＩｓｏｌｅｒａ　Ｆｏｕｒ（登録商標））及びヘキサン／酢酸エチル又はジクロロメタン／メタノールの勾配などの溶離液と組み合わせた例えばプレパックシリカゲルカートリッジ、例えばＢｉｏｔａｇｅ　ＳＮＡＰカートリッジＫＰ－Ｓｉｌ（登録商標）又はＫＰ－ＮＨ（登録商標）を用いるクロマトグラフィー、特にはフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製することができる。場合により、化合物は、例えば、好適なプレパック逆相カラム及び水及びアセトニトリルの勾配などの溶離液（トリフルオロ酢酸、ギ酸又はアンモニア水などの添加物を含んでいても良い）と組み合わせたダイオード

アレイ検出器及び／又はオンラインエレクトロスプレーオン化質量分析装置を搭載したＷａｔｅｒｓ自動精製装置を用いる分取ＨＰＬＣによって精製することができる。

【０３４１】

場合により、上記の精製方法は、塩の形態での、十分に塩基性若しくは酸性官能性を有する本発明の化合物、例えば、十分に塩基性である本発明の化合物の場合は例えばトリフルオロ酢酸塩若しくはギ酸塩、又は十分に酸性である本発明の化合物の場合、例えばアンモニウム塩を提供することができる。この種類の塩は、当業者に公知の各種方法によって、それぞれそれの遊離塩基若しくは遊離酸に変換することができるか、その後の生物アッセイで塩として用いることができる。理解すべき点として、単離及び本明細書に記載の本発明の化合物の特定の形（例えば、塩、遊離塩基など）は、必ずしも、比生物活性を定量するために当該化合物を生物アッセイで用いることができる唯一の形態とは限らない。

【０３４２】

分析及びクロマトグラフィー法

分析及び分取液体クロマトグラフィー

分析（ＵＰ）ＬＣ－ＭＳを、下記のような異なる装置によって行った。質量（ｍ／ｚ）は、負モードが示されていない限り（ＥＳＩ－）、正モードエレクトロスプレーイオン化から報告される。

【０３４３】

方法Ｌ０：

ｌｏｇＰ値の測定は、ＥＥＣ指針７９／８３１添付書類Ｖ．Ａ８に従って、下記の方法を用いる逆相カラムでのＨＰＬＣ（高速液体クロマトグラフィー）によって行った。

【０３４４】

[a] ｌｏｇＰ値は、溶離液として０．１％ギ酸水溶液及びアセトニトリル（１０％アセトニトリルから９５％アセトニトリルの直線勾配）を使用し、酸性範囲でのＬＣ－ＵＶ測定によって求める。

【０３４５】

[b] ｌｏｇＰ値は、溶離液として０．００１Ｍ酢酸アンモニウム水溶液及びアセトニトリル（１０％アセトニトリルから９５％アセトニトリルの直線勾配）を使用し、中性範囲でのＬＣ－ＵＶ測定によって求める。

【０３４６】

較正は、ｌｏｇＰ値が既知である直鎖アルカン－２－オン類（３～１６個の炭素原子）を用いて実施した（連続するアルカノン間の線形補間を行って保持時間を用いてｌｏｇＰ値を測定）。ラムダマックス値は、２００ｎｍ～４００ｎｍのＵＶスペクトラム及びクロマトグラフィーシグナルのピーク値を用いて決定した。

【０３４７】

Ｍ＋１（又はＭ＋Ｈ）は、それぞれ、エレクトロスプレーオン化による質量分析において観察された、分子イオンピーク＋又は－１ａ．ｍ．ｕ．（原子質量単位）を意味する（ＥＳＩ＋又は－）。

【０３４８】

方法Ｌ１：

装置型：Ｗａｔｅｒｓ ＡＣＱＵＩＴＹ ＳＱＤ ＵＰＬＣシステム；カラム：Ｗａｔｅｒｓ Ａｃｑｕｉｔｙ ＵＰＬＣ ＨＳＳ Ｔ３ １．８μ ５０×１ｍｍ；溶離液Ａ：水１リットル＋ギ酸０．２５ｍＬ、溶離液Ｂ：アセトニトリル１リットル＋ギ酸０．２５ｍＬ；勾配：０．０分９０％Ａ→１．２分５％Ａ→２．０分５％Ａオーブン：５０℃；流量：０．４０ｍＬ／分；ＵＶ－検出：２０８－４００ｎｍ。

【０３４９】

方法Ｌ２：

ＭＳ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ ６１３０四重極ＬＣ－ＭＳ；ＨＰＬＣ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ １２６０ Ｉｎｆｉｎｉｔｙ；カラム：Ｗａｔｅｒｓ ＸＳｅｌｅｃｔ（Ｃ１８、５０×２．１ｍｍ、３．５μ）；

流量：０．８ｍＬ／分；カラム温度：３５℃；溶離液Ａ：０．１％ギ酸／アセトニトリル；溶離液Ｂ：０．１％ギ酸水溶液；直線勾配：ｔ＝０分５％Ａ、ｔ＝３．５分９８％Ａ、ｔ＝６分９８％Ａ；検出：ＤＡＤ（２２０－３２０ｎｍ）；検出：ＭＳＤ（ＥＳＩｐｏｓ／ｎｅｇ）質量範囲：１００－８００；検出：ＥＬＳＤ（ＰＬ－ＥＬＳ２１００）：ガス流量１．２ｍＬ／分、ガス温度：７０℃、ｎｅｂ：５０℃。

【０３５０】

方法Ｌ３：

ＭＳ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ ＬＣ／ＭＳＤ ＳＬ；ＨＰＬＣ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ １１００シリーズ；カラム：Ｗａｔｅｒｓ ＸＳｅｌｅｃｔ（Ｃ１８、５０×２．１ｍｍ、３．５μ；流量：０．８ｍＬ／分；カラム温度：２５℃；溶離液Ａ：９５％アセトニトリル＋５％１０ｍＭ重炭酸アンモニウム水溶液；溶離液Ｂ：１０ｍＭ重炭酸アンモニウム水溶液ｐＨ＝９．０；直線勾配：ｔ＝０分５％Ａ、ｔ＝３．５分９８％Ａ、ｔ＝６分９８％Ａ；検出：ＤＡＤ（２２０－３２０ｎｍ）；検出：ＭＳＤ（ＥＳＩｐｏｓ／ｎｅｇ）質量範囲：１００－８００。

【０３５１】

方法Ｌ４：

装置型：Ｗａｔｅｒｓ ＡＣＱＵＩＴＹ ＳＱＤ ＵＰＬＣシステム；カラム：Ｗａｔｅｒｓ Ａｃｑｕｉｔｙ ＵＰＬＣ ＨＳＳ Ｔ３ １．８μ ５０×１ｍｍ；溶離液Ａ：水１リットル＋９９％ギ酸０．２５ｍＬ、溶離液Ｂ：アセトニトリル１リットル＋９９％ギ酸０．２５ｍＬ；勾配：０．０分９５％Ａ→６．０分５％Ａ→７．５分５％Ａオーブン：５０℃；流量：０．３５ｍＬ／分；ＵＶ－検出：２１０－４００ｎｍ。

【０３５２】

方法Ｌ５：

ＭＳ装置型：Ｗａｔｅｒｓ ＳＱＤ；装置ＨＰＬＣ：Ｗａｔｅｒｓ ＵＰＬＣ；カラム：Ｚｏｒｂａｘ ＳＢ－Ａｑ（Ａｇｉｌｅｎｔ）、５０ｍｍ×２．１ｍｍ、１．８μｍ；溶離液Ａ：水＋０．０２５％ギ酸、溶離液Ｂ：アセトニトリル（ＵＬＣ）＋０．０２５％ギ酸；勾配：０．０分９８％Ａ－０．９分２５％Ａ－１．０分５％Ａ－１．４分５％Ａ－１．４１分９８％Ａ－１．５分９８％Ａ；オーブン：４０℃；流量：０．６００ｍＬ／分；ＵＶ－検出：ＤＡＤ；２１０ｎｍ。

【０３５３】

方法Ｌ６：

ＭＳ装置型：Ｔｈｅｒｍｏ Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ ＦＴ－ＭＳ；ＨＰＬＣ装置型：Ｔｈｅｒｍｏ Ｓｃｉｅｎｔｉｆｉｃ ＵｌｔｉＭａｔｅ ３０００；カラム：Ｗａｔｅｒｓ、ＨＳＳＴ３、２．１×７５ｍｍ、Ｃ１８ １．８μｍ；溶離液Ａ：水１リットル＋０．０１％ギ酸；溶離液Ｂ：アセトニトリル１リットル＋０．０１％ギ酸；勾配：０．０分１０％Ｂ→２．５分９５％Ｂ→３．５分９５％Ｂ；オーブン：５０℃；流量：０．９０ｍＬ／分；ＵＶ－検出：２１０ｎｍ／最適積分路２１０－３００ｎｍ。

【０３５４】

方法Ｌ７：

ＭＳ装置型：Ｗａｔｅｒｓ （Ｍｉｃｒｏｍａｓｓ） Ｑｕａｔｔｒｏ Ｍｉｃｒｏ；ＨＰＬＣ装置型：Ｗａｔｅｒｓ ＵＰＬＣ Ａｃｑｕｉｔｙ；カラム：Ｗａｔｅｒｓ ＢＥＨ Ｃ１８ １．７μ５０×２．１ｍｍ；溶離液Ａ：水１リットル＋０．０１ｍｏｌギ酸アンモニウム、溶離液Ｂ：アセトニトリル１リットル；勾配：０．０分９５％Ａ→０．１分９５％Ａ→２．０分１５％Ａ→２．５分１５％Ａ→２．５１分１０％Ａ→３．０分１０％Ａ；オーブン：４０℃；流量：０．５ｍＬ／分；ＵＶ－検出：２１０ｎｍ。

【０３５５】

方法Ｌ８：

ＭＳ装置型：Ｗａｔｅｒｓ ＳＱＤ２；装置ＨＰＬＣ：Ｗａｔｅｒｓ ＵＰＬＣ；カラム：Ｚｏｒｂａｘ ＳＢ－Ａｑ（Ａｇｉｌｅｎｔ）、５０ｍｍ×２．１ｍｍ、１．８μｍ；溶離液Ａ：水＋０．０２５％ギ酸、溶離液Ｂ：アセトニトリル（ＵＬＣ）＋０．０２５％

ギ酸；勾配：０．０分９８％Ａ－０．９分２５％Ａ－１．０分５％Ａ－１．４分５％Ａ－１．４１分９８％Ａ－１．５分９８％Ａ；オーブン：４０℃；流量：０．６００ｍＬ／分；ＵＶ－検出：ＤＡＤ；２１０ｎｍ。

【０３５６】

方法Ｌ９：

ＭＳ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ ＬＣ／ＭＳＤ ＳＬ；ＨＰＬＣ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ １１００シリーズ；カラム：Ｗａｔｅｒｓ ＸＳｅｌｅｃｔ（Ｃ１８、５０×２．１ｍｍ、３．５μ；流量：０．８ｍＬ／分；カラム温度：２５℃；溶離液Ａ：９５％アセトニトリル＋５％重炭酸アンモニウム水溶液；溶離液Ｂ：１０ｍｍＭ重炭酸アンモニウム水溶液ｐＨ＝９．０；直線勾配：ｔ＝０分５％Ａ、ｔ＝３．５分９８％Ａ、ｔ＝６分９８％Ａ；検出：ＤＡＤ（２２０－３２０ｎｍ）；検出：ＭＳＤ（ＥＳＩｐｏｓ／ｎｅｇ）質量範囲：１００～８００。

【０３５７】

方法Ｌ１０：

ＭＳ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ ６１３０四重極ＬＣ－ＭＳ；ＨＰＬＣ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ １２６０ Ｉｎｆｉｎｉｔｙ；カラム：Ｗａｔｅｒｓ ＸＳｅｌｅｃｔ（Ｃ１８、３０×２．１ｍｍ、３．５μ）；流量：１ｍＬ／分；カラム温度：３５℃；溶離液Ａ：０．１％ギ酸／アセトニトリル；溶離液Ｂ：０．１％ギ酸水溶液；直線勾配：ｔ＝０分５％Ａ、ｔ＝１．６分９８％Ａ、ｔ＝３分９８％Ａ；検出：ＤＡＤ（２２０－３２０ｎｍ）；検出：ＭＳＤ（ＥＳＩｐｏｓ／ｎｅｇ）質量範囲：１００－８００；検出：ＥＬＳＤ（ＰＬ－ＥＬＳ２１００）：ガス流量１．２ｍＬ／分、ガス温度：７０℃、ｎｅｂ：５０℃。

【０３５８】

方法Ｌ１１：

ＭＳ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ ＬＣ／ＭＳＤ ＳＬ；ＨＰＬＣ装置型：Ａｇｉｌｅｎｔ Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ １１００シリーズ；カラム：Ｐｈｅｎｏｍｅｎｅｘ Ｇｅｍｉｎｉ ＮＸ（Ｃ１８、５０×２．０ｍｍ、３．０μ；流量：０．８ｍＬ／分；カラム温度：２５℃；溶離液Ａ：９５％アセトニトリル＋５％１０ｍＭ重炭酸アンモニウム水溶液／アセトニトリルｐＨ＝９．０；溶離液Ｂ：１０ｍＭ重炭酸アンモニウム水溶液ｐＨ＝９．０；直線勾配：ｔ＝０分５％Ａ、ｔ＝３．５分９８％Ａ、ｔ＝６分９８％Ａ；検出：ＤＡＤ（２２０－３２０ｎｍ）；検出：ＭＳＤ（ＥＳＩｐｏｓ／ｎｅｇ）質量範囲：１００－８００。

【０３５９】

方法Ｌ１２：

ＭＡ装置：Ａｇｉｌｅｎｔ ＭＳ Ｑｕａｄ ６１５０；ＨＰＬＣ装置：Ａｇｉｌｅｎｔ １２９０；カラム：Ｗａｔｅｒｓ Ａｃｑｕｉｔｙ ＵＰＬＣ ＨＳＳ Ｔ３ １．８μｍ ５０×２．１ｍｍ；溶離液Ａ：水１リットル＋９９％ギ酸０．２５ｍＬ、溶離液Ｂ：アセトニトリル１リットル＋９９％ギ酸０．２５ｍＬ；勾配：０．０分９０％Ａ→０．３分９０％Ａ→１．７分５％Ａ→３．０分５％Ａオーブン：５０℃；流量：１，２０ｍＬ／分；ＵＶ－検出：２０５－３０５ｎｍ。

【０３６０】

方法Ｍ１：

使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、１．８０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．１０分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．２０ｍＬ／分であった。

【０３６１】

方法Ｍ２：

使用したカラムは、ＥＶＯ、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、４．２０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０

．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間４．５０分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３６２】

方法Ｍ３：

使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３６３】

方法Ｍ４：

使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８＋、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３６４】

方法Ｍ５：

使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３６５】

方法Ｍ６：

使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、２．６０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３６６】

方法Ｍ７：

使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、２．８０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．３０分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．２０ｍＬ／分であった。

【０３６７】

方法Ｍ８：

使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８＋、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３６８】

方法Ｍ９：

使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、４．２０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間４．５０分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３６９】

方法Ｍ１０：

使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３７０】
方法Ｍ１１：
使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８＋、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３７１】
方法Ｍ１２：
使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。
【０３７２】
方法Ｍ１３：
使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３７３】
方法Ｍ１４：
使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３７４】
方法Ｍ１５：
使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、７０％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮで終了し）、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３７５】
方法Ｍ１６：
使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３７６】
方法Ｍ１７：
使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８＋１００Ａ、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、１．６０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３７７】
方法Ｍ１８：
使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３７８】
方法Ｍ１９：

使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ ＥＶＯ Ｃ１８１００Ａ、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、１．６０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３７９】

方法Ｍ２０：

使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ Ｅｘｐｒｅｓｓ Ｃ１８、２．７μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。

【０３８０】

方法Ｍ２１：

使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ ＥＶＯ Ｃ１８、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。

【０３８１】

方法Ｍ２２：

使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ ＥＶＯ Ｃ１８、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。

【０３８２】

方法Ｍ２３：

使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ Ｅｘｐｒｅｓｓ Ｃ１８、２．７μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。

【０３８３】

方法Ｍ２４：

使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ Ｅｘｐｒｅｓｓ Ｃ１８、２．７μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。

【０３８４】

方法Ｍ２５：

使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ ＥＶＯ Ｃ１８、２．６μｍ、４．６×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：５ｍＭ NH_4HCO_3水溶液）から開始し、１．７５分かけて９５％Ｂ（Ｂ：ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．８０ｍＬ／分であった。

【０３８５】

方法Ｍ２６：

使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ Ｅｘｐｒｅｓｓ Ｃ１８、２．７μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、４．９０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間５．３０分であった。カラム温度は４５℃でであり、流量１．５０ｍＬ／分であった。

【０３８６】

方法Ｍ２７：

使用したカラムは、Ｐｏｒｏｓｈｅｌｌ ＨＰＨ－Ｃ１８、２．７μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、１．

７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３８７】

方法Ｍ２８：

使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８＋、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３８８】

方法Ｍ２９：

使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、４．６０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間５．３０分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．２０ｍＬ／分であった。

【０３８９】

方法Ｍ３０：

使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、２．８０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．３０分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．２０ｍＬ／分であった。

【０３９０】

方法Ｍ３１：

使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、４．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間５．００分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．２０ｍＬ／分であった。

【０３９１】

方法Ｍ３２：

使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８＋、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、５．２０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間５．７０分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３９２】

方法Ｍ３３：

使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、２．２０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．６０分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３９３】

方法Ｍ３４：

使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．２０ｍＬ／分であった。

【０３９４】

方法Ｍ３５：

使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８＋、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０３９５】
方法Ｍ３６：
使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８＋１００Ａ、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：０．１％ＦＡ水溶液）から開始し、２．６０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３９６】
方法Ｍ３７：
使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０９％ＦＡ水溶液）から開始し、２．６０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．１％ＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３９７】
方法Ｍ３８：
使用したカラムは、ＣＯＲＴＥＣＳ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、１．８０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３９８】
方法Ｍ３９：
使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、７０％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、５．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間６．５０分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０３９９】
方法Ｍ４０：
使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、６０％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、２．７０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０４００】
方法Ｍ４１：
使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８、２．６μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：５ｍＭ　NH_4HCO_3水溶液）から開始し、１．８０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。
【０４０１】
方法Ｍ４２：
使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、１．７０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．２０ｍＬ／分であった。
【０４０２】
方法Ｍ４３：
使用したカラムは、Ｋｉｎｅｔｅｘ　ＥＶＯ　Ｃ１８　１００Ａ、２．６μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：５ｍＭ　NH_4HCO_3水溶液）から開始し、２．６０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。
【０４０３】
方法Ｍ４４：

使用したカラムは、ＨＰＨ－Ｃ１８、２．７μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９０％Ａ（Ａ：５ｍＭ　NH_4HCO_3水溶液）から開始し、２．６０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．００分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。

【０４０４】

方法４５：

使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、３．１０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間３．６０分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０４０５】

方法Ｍ４６：

使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、２．１×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、２．１０分かけて１００％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間２．６０分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．００ｍＬ／分であった。

【０４０６】

方法Ｍ４７：

使用したカラムは、Ａｓｃｅｎｔｉｓ　Ｅｘｐｒｅｓｓ　Ｃ１８、２．７μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、９５％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、４．２０分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間４．５０分であった。カラム温度は４０℃であり、流量１．５０ｍＬ／分であった。

【０４０７】

方法Ｍ４８：

使用したカラムは、Ｓｈｉｍ－ｐａｋ　ＸＲ－ＯＤＳ、２．２μｍ、３．０×５０ｍｍであった。直線勾配を用い、８０％Ａ（Ａ：０．０５％ＴＦＡ水溶液）から開始し、５．００分かけて９５％Ｂ（Ｂ：０．０５％ＴＦＡ／ＭｅＣＮ）で終了し、合計運転時間５．６０分であった。カラム温度は４５℃であり、流量１．２０ｍＬ／分であった。

【０４０８】

^{1}Ｈ－ＮＭＲデータ

^{1}Ｈ－ＮＭＲデータは、Ｂｒｕｋｅｒ　Ａｖａｎｃｅ　４００（フローセル（６０μＬ体積）を搭載）、又は１．７ｍｍ　ｃｒｙｏ　ＣＰＴＣＩプローブヘッドを搭載したＢｒｕｋｅｒ　ＡＶＩＩＩ４００、又は５ｍｍプローブヘッドを搭載したＢｒｕｋｅｒ　ＡＶＩＩＩ４００（４００．１３ＭＨｚ）、又は５ｍｍ　ｃｒｙｏ　ＴＣＩプローブヘッドを搭載したＢｒｕｋｅｒ　ＡＶＩＩ６００（６００．１３ＭＨｚ）、又は５ｍｍ　ｃｒｙｏ　ＣＰＭＮＰプローブヘッドを搭載したＢｒｕｋｅｒ　ＡＶＩＩＩ６００（６０１．６ＭＨｚ）、又は５ｍｍブロードバンドヘッド若しくは５ｍｍ　Ｐｒｏｄｉｇｙ（商標名）プローブヘッドを搭載したＢｒｕｋｅｒ　ＡＶＩＩＩ５００（５００．１３ＭＨｚ）を用い、基準（０．０）としてのテトラメチルシラン及び溶媒CD_3CN、$CDCl_3$又はD_6－ＤＭＳＯを用いて測定した。別の^{1}Ｈ－及び^{13}Ｃ－ＮＭＲ装置型：Ｂｒｕｋｅｒ　ＤＭＸ３００（^{1}Ｈ－ＮＭＲ：３００ＭＨｚ；^{13}Ｃ　ＮＭＲ：７５ＭＨｚ）、Ｂｒｕｋｅｒ　Ａｖａｎｃｅ　ＩＩＩ４００（^{1}Ｈ－ＮＭＲ：４００ＭＨｚ；^{13}Ｃ　ＮＭＲ：１００ＭＨｚ）又はＢｒｕｋｅｒ　４００Ｕｌｔｒａｓｈｉｅｌｄ（^{1}Ｈ－ＮＭＲ：４００ＭＨｚ；^{13}Ｃ　ＮＭＲ：１００ＭＨｚ）。

【０４０９】

化学シフト（δ）は百万分率［ｐｐｍ］で示し；次の略称：ｓ＝一重線、ｄ＝二重線、ｔ＝三重線、ｑ＝四重線、ｍ＝多重線、ｂｒ．＝広い、を用い；カップリング定数はヘルツ［Ｈｚ］で示す。

【０４１０】

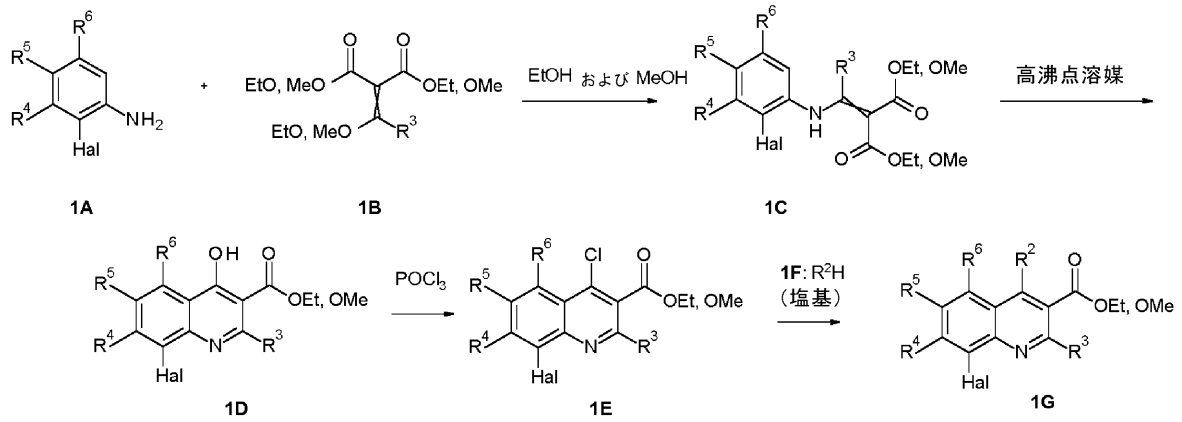
実験の部－一般手順

下記の図式（図式１ａ～ｅ、図式２及び図式３）に従って、又はそれと同様にして、式（Ｉ）の化合物の合成を行うことができる。

【０４１１】

図式１ａ

【化１２２】



【０４１２】

２－ハロゲン－置換されているアニリン１Ａ（Ｈａｌ＝ヨウ素、臭素、塩素）は市販されており、Ｍｏｎａｔｓｈｅｆｔｅ　ｆｕｅｒ　Ｃｈｅｍｉｅ，　２０１５，　１４６（２），　２９１－３０２に記載の方法に従って、又はＷＯ２００２００４４４４に記載の方法に従って無溶媒で、相当するアルコール溶媒に溶かしたマロン酸（アルコキシメチレン）１Ｂにより、好ましくは沸騰条件下に、容易にマロン酸（アニリノメチレン）１Ｃに変換することができる。ＷＯ２０１３１１８０７１に記載の方法に従い、高沸点溶媒中、好ましくはジフェニルエーテル又はキシロール中で閉環を行って、ヒドロキシキノリン１Ｄを得る。ＷＯ２０１３１１８０７１に記載の方法に従って、ヒドロキシキノリン１Ｄは、塩素化試薬、好ましくは還流ＰＯＣｌ$_3$により、相当する塩素化合物１Ｅに容易に変換することができる。

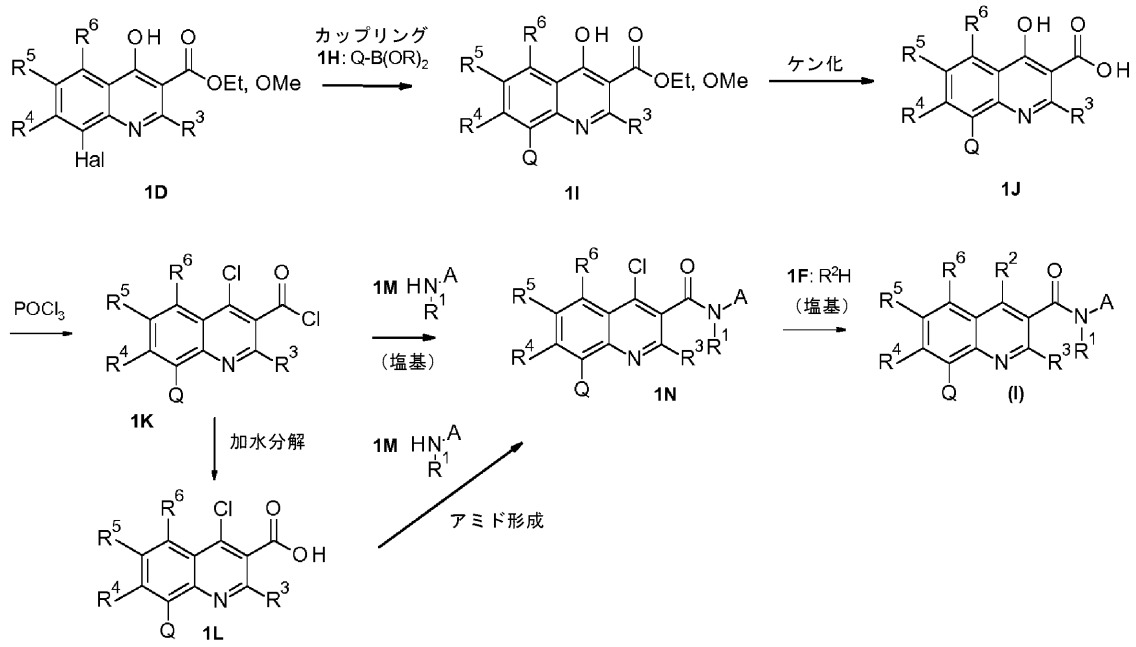
【０４１３】

求核剤Ｒ^{2}Ｈ（１Ｆ）の性質に応じて、塩基、例えばナトリウムエチレート、ナトリウムメチレート、カリウムｔ－ブチレート、トリエチルアミン、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン、ジアザビシクロウンデカン、水素化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの存在下に、クロロキノリン１Ｅを１Ｆと反応させて、エステル中間体１Ｇを得る。

【０４１４】

図式１ｂ

【化１２３】



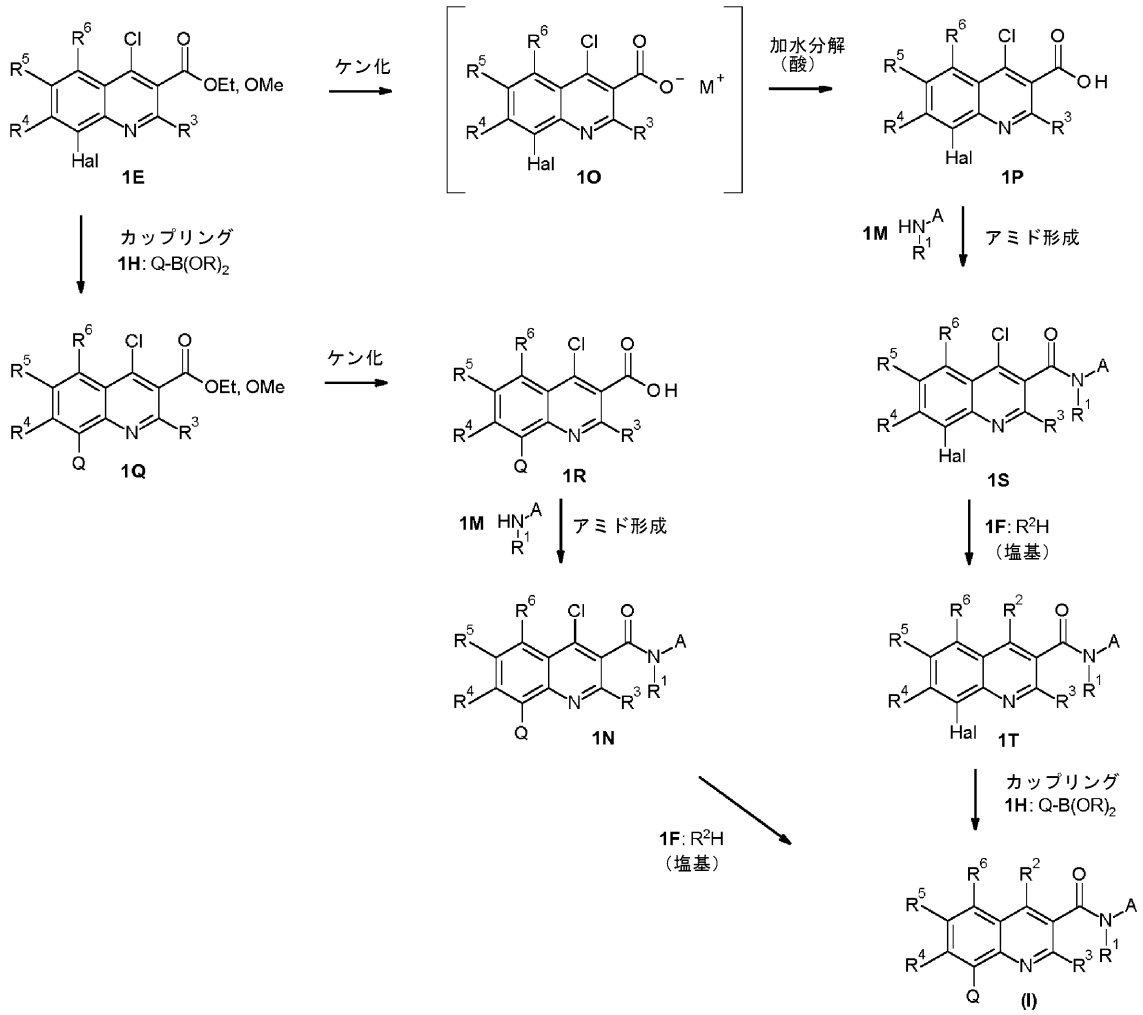
【０４１５】

別法として、Ｃｈｅｍ．　Ｓｏｃ．　Ｒｅｖ．　２０１４，　４３，　４１２－４４３又はＴｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ　２００２，　５８（４８），　９６３３－９６９５に記載の方法に従って、中間体１Ｄのボロン酸又はボロン酸エステル（１Ｈ）Ｑ－Ｂ（ＯＲ）$_2$（Ｒ＝Ｈ；Ｒ＝Ｍｅ又はＲ，Ｒ＝ピナコレート）のスズキ交差カップリング反応を行って、エステル中間体（１Ｉ）を得る。次に、エステル中間体１Ｉを、例えば水酸化リチウムによって円滑にケン化して相当するカルボン酸１Ｊを得ることができ、それを、ＷＯ２０１３０９６１５１に記載の方法に従って、塩素化試薬、好ましくは還流ＰＯＣｌ$_3$によって、相当するクロロカルボキシルクロライド１Ｋに容易に変換することができる。中間体１Ｋを加水分解条件下で反応させて、キノロンカルボン酸１Ｌを得て、それを、アミド形成試薬及び脱水試薬、例えばＮ－（３－ジメチルアミノイソプロピル）－Ｎ′－エチルカルボジイミド塩酸塩（ＥＤＣ）を介して市販のアミン１Ｍと組み合わせることで、アミド１Ｎを得る。同様の合成が、例えばＪｏｕｒｎａｌ　ｏｆ　Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ　２０１２，　５５，　３５６３－３５６７に記載されている。カルボン酸クロライド１ＫをＣｈｅｍｉｃａｌ　Ｂｉｏｌｏｇｙ　＆　Ｄｒｕｇ　Ｄｅｓｉｇｎ　２０１５，８５（５），５４９－５６４に記載の方法に従って、例えばピリジン、トリエチルアミン又はＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基性条件下にアミン１Ｍと組み合わせると、中間体１Ｋによって、アミド１Ｎを直接形成することができる。求核剤Ｒ^{2}Ｈ（１Ｆ）の性質に応じて、塩基、例えばナトリウムエチレート、ナトリウムメチレート、カリウムｔ－ブチレート、トリエチルアミンＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン、ジアザビシクロウンデカン、水素化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの存在下に、クロロキノリン１Ｎを１Ｆと反応させて、式（Ｉ）の標的化合物を得る。

【０４１６】

図式１ｃ

【化１２４】



【０４１７】

クロロキノリン１Ｅを、例えば水酸化リチウムによって円滑にケン化して、例えばリチウム塩として得られる相当するカルボキシレート１Ｏを得るか、酸加水分解後にカルボン酸１Ｐを得ることができる。次に、例えば、１Ｐから形成されたカルボン酸クロライドを、ピリジン、トリエチルアミン又はＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基性条件下にアミン１Ｍと組み合わせることによる、又はアミン１Ｍ及び脱水試薬、例えばＮ－（３－ジメチルアミノイソプロピル）－Ｎ′－エチルカルボジイミド塩酸塩（ＥＤＣ）と組み合わせたカルボン酸１Ｐからのアミド形成によるアミドカップリング条件により、中間体カルボキサミド１Ｓを得る。同様の合成が、例えばＪｏｕｒｎａｌ　ｏｆ　Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ　２０１２，５５，３５６３－３５６７に記載されている。求核剤Ｒ^{2}Ｈ（１Ｆ）の性質に応じて、塩基、例えばナトリウムエチレート、ナトリウムメチレート、カリウムｔ－ブチレート、トリエチルアミンＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン、ジアザビシクロウンデカン、水素化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの存在下に、クロロキノリン１Ｓを１Ｆと反応させて、中間体カルボキサミド１Ｔを得る。Ｃｈｅｍ．　Ｓｏｃ．　Ｒｅｖ．　２０１４，４３，４１２－４４３又はＴｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ　２００２，５８（４８），９６３３－９６９５に記載の方法による、中間体カルボキサミド１Ｔのボロン酸又はボロン酸エステル（１Ｈ）Ｑ－Ｂ（ＯＲ）$_{2}$（Ｒ＝Ｈ；Ｒ＝Ｍｅ又はＲ，Ｒ＝ピナコレート）とのスズキ交差カップリング反応によって、式（Ｉ）の最終生成物が得られる。

【０４１８】

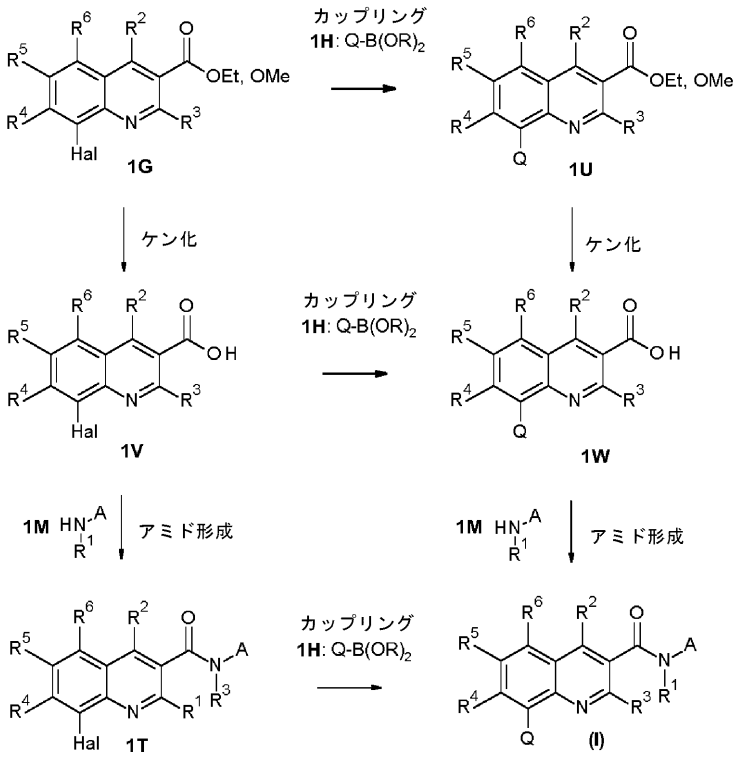
或いは、Ｃｈｅｍ．　Ｓｏｃ．　Ｒｅｖ．　２０１４，４３，４１２－４４３又はＴｅｔ

ｒａｈｅｄｒｏｎ ２００２，５８（４８），９６３３－９６９５に記載の方法に従って、クロロキノリン１Ｅを、ボロン酸又はボロン酸エステル（１Ｈ）Ｑ－Ｂ（ＯＲ）$_2$（Ｒ＝Ｈ；Ｒ＝Ｍｅ又はＲ，Ｒ＝ピナコレート）とのスズキ交差カップリング反応によって反応させて、キノリンカルボン酸エステル１Ｑを得て、それを、例えば水酸化リチウムで円滑にケン化して、相当するキノリンカルボン酸１Ｒを得ることができる。次に、例えば１Ｒから形成されるカルボン酸クロライドを例えばピリジン、トリエチルアミン又はＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミンの塩基性条件下に、アミン１Ｍと組み合わせることによる、又はアミン１Ｍ及び脱水試薬、例えばＮ－（３－ジメチルアミノイソプロピル）－Ｎ′－エチルカルボジイミド塩酸塩（ＥＤＣ）と組み合わせたカルボン酸１Ｒからのアミド形成によるアミドカップリング条件によって、中間体カルボキサミド１Ｎを得る。同様の合成が、例えばＪｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ２０１２，５５，３５６３－３５６７に記載されている。求核剤Ｒ^{2}Ｈ（１Ｆ）の性質に応じて、ナトリウムエチレート、ナトリウムメチレート、カリウムｔ－ブチレート、トリエチルアミンＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン、ジアザビシクロウンデカン、水素化ナトリウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの塩基の存在下に、クロロキノリン１Ｎを１Ｆと反応させて、同様に式（Ｉ）の最終生成物を得る。

【０４１９】

図式１ｄ

【化１２５】



【０４２０】

Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．Ｒｅｖ．２０１４，４３，４１２－４４３又はＴｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ ２００２，５８（４８），９６３３－９６９５に記載の方法に従って、ボロン酸又はボロン酸エステル（１Ｈ）Ｑ－Ｂ（ＯＲ）$_2$（Ｒ＝Ｈ；Ｒ＝Ｍｅ又はＲ，Ｒ＝ピナコレート）とのスズキ交差カップリング反応により、キノリンカルボン酸エステル１Ｇを変換してキノリンカルボン酸エステル１Ｕを得ることができ、それを、例えば水酸化リチウムで円滑にケン化することで、相当するキノリンカルボン酸１Ｗを得ることができる。次に、例えば１Ｗから形成したカルボン酸クロライドをピリジン、トリエチルアミン又はＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基性条件下にアミン１Ｍと組み合わせるこ

とによる、又はアミン１Ｍ及び脱水試薬、例えばＮ－（３－ジメチルアミノイソプロピル）－Ｎ′－エチルカルボジイミド塩酸塩（ＥＤＣ）と組み合わせたカルボン酸１Ｗからのアミド形成によるアミドカップリング条件により、式（Ｉ）の最終生成物を得る。同様の合成が、例えばＪｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ２０１２，５５，３５６３－３５６７に記載されている。

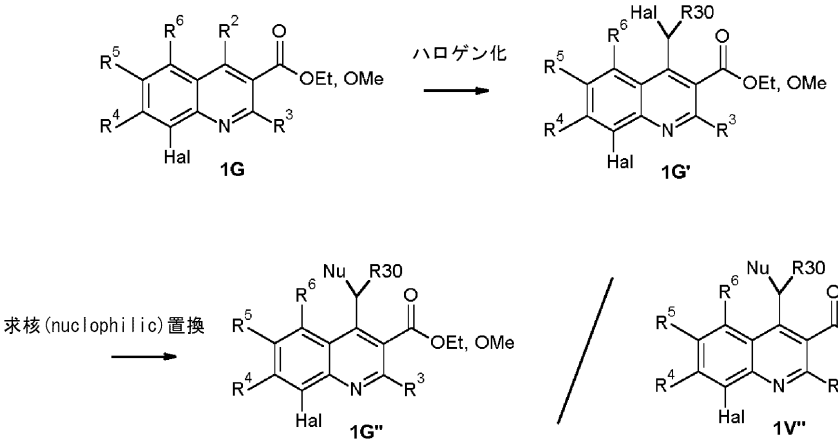
【０４２１】

或いは、キノリンカルボン酸エステル１Ｇを、最初にケン化し、次にボロン酸又はボロン酸エステル（１Ｈ）Ｑ－Ｂ（ＯＲ）$_2$（Ｒ＝Ｈ；Ｒ＝Ｍｅ又はＲ，Ｒ＝ピナコレート）とのスズキ交差カップリング反応によってキノリンカルボン酸１Ｗに変換するか、例えば１Ｖから形成されたキノリンカルボン酸クロライドをピリジン、トリエチルアミン若しくはＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基性条件下にアミン１Ｍと組み合わせることによる、又はアミン１Ｍ及び脱水試薬、例えばＮ－（３－ジメチルアミノイソプロピル）－Ｎ′－エチルカルボジイミド塩酸塩（ＥＤＣ）と組み合わせたキノロンカルボン酸１Ｖからのアミド形成によるアミドカップリング条件によって、キノリンカルボキサミド１Ｔに変換することができる。最後に、Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．Ｒｅｖ．２０１４，４３，４１２－４４３又はＴｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ ２００２，５８（４８），９６３３－９６９５に記載の方法に従って、ボロン酸又はボロン酸エステル（１Ｈ）Ｑ－Ｂ（ＯＲ）$_2$（Ｒ＝Ｈ；Ｒ＝Ｍｅ又はＲ，Ｒ＝ピナコレート）とのスズキ交差カップリング反応によって、キノリンカルボキサミド１Ｔを式（Ｉ）の最終生成物に変換することができる。

【０４２２】

図式１ｄ′

【化１２６】



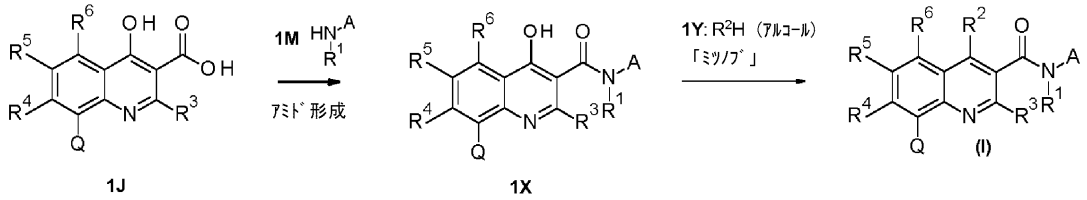
【０４２３】

例えばＪ．Ｈｅｔｅｒｏｃｙｃｌ．Ｃｈｅｍ．１９８１，ｖｏｌ．１８，９２５－９２８、Ｊ．Ｍｅｄ．Ｃｈｅｍ．，２００９，ｖｏｌ．５２，３０４７－３０６２又はＪ．Ａｍ．Ｃｈｅｍ．Ｓｏｃ．，１９４８，７０，４１７－４１８に記載の方法に従って、Ｒ^{2}がアルキル基、例えばメチル（Ｒ$_{30}$＝Ｈ）である１Ｇの下位群を、ハロゲン化、例えば臭素、Ｎ－ブロモ－コハク酸イミド、三臭化ピリジニウム又は三臭化フェニルトリメチルアンモニウムなどの臭素化剤によって臭素化することで、ブロモアルキル誘導体１Ｇ′とすることができる。そのようなブロモアルキル化合物１Ｇ′を、標準的な手順に従って、場合により塩基存在下にアミン類、アルコール類若しくはチオール類又はそれらの塩などの求核剤によって置換することで、置換されているアルキル－キノリン１Ｇ″を得ることができる。求核置換の反応条件下に、エステル１Ｇ″をさらに、相当する酸１Ｖ″に変換することができるか、それらを単離し、別段の加水分解段階で酸１Ｖ″に変換することができる。次に、図式１ｄに記載の方法によるアミド形成及び基Ｑのカップリングによって、酸１Ｖ″から最終生成物（Ｉ）を得ることができる。

【０４２４】

図式１ｅ（Ｒ^{2}＝置換されていても良いＣ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ）

【化１２７】



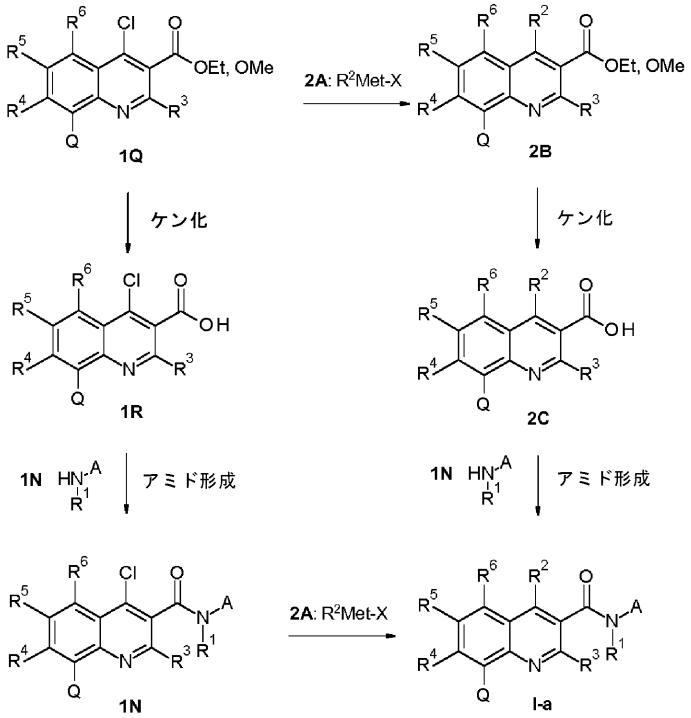
【０４２５】

１Ｊから形成されるカルボン酸クロライドをピリジン、トリエチルアミン又はＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基性条件下でアミン１Ｍと組み合わせることによる、又はアミン１Ｍ及び脱水試薬、例えばＮ－（３－ジメチルアミノイソプロピル）－Ｎ′－エチルカルボジイミド塩酸塩（ＥＤＣ）と組み合わせたカルボン酸１Ｊからのアミド形成によるアミドカップリング条件によって、ヒドロキシキノロン１Ｘを得る。同様の合成が、例えばＪｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ２０１２，５５，３５６３－３５６７に記載されている。Ｏｒｇａｎｉｃ ＆ Ｂｉｏｍｏｌｅｃｕｌａｒ Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ ２０１２，１０（３２），６５３７－６５４６に記載の方法に従って、脱水試薬、例えばジイソプロピル－（Ｅ）－ジアゼン－１，２－ジカルボキシレート及びトリフェニルホスフィンの存在下に、ヒドロキシキノロン１Ｘのアルコール１Ｙ（Ｒ^{2}＝Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルコキシ、置換されていても良い）とのミツノブ反応によって、式（Ｉ）の最終生成物を得る。

【０４２６】

図式２（Ｒ^{2}＝Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルキル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルケニル、Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{6}$－シクロアルケニル、Ｃ$_{2}$－Ｃ$_{4}$－アルキニル又はフェニル－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$－アルキル、それらはそれぞれ、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義のように置換されていても良い）

【化１２８】



【０４２７】

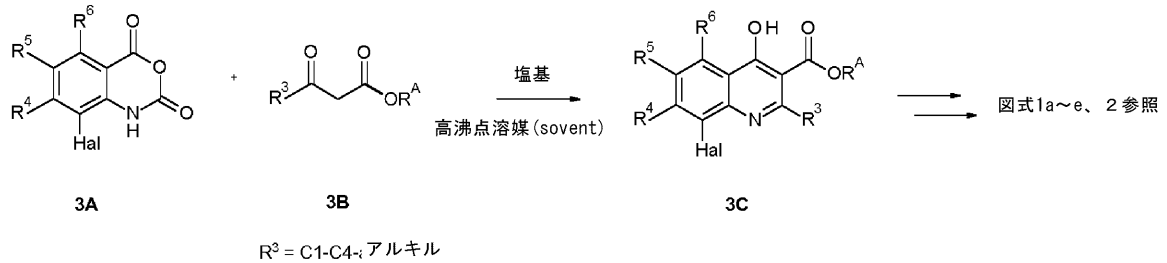
例えばＴｅｔｒａｈｅｄｒｏｎ Ｌｅｔｔｅｒｓ，２０００，４１（３３），６３８７

－６３９１に記載の方法に従って、ある種のグリニャル化合物又は金属有機化合物２Ａ：Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｍｅｔ－Ｘ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル－Ｍｅｔ－Ｘ、Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルケニル－Ｍｅｔ－Ｘ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルケニル－Ｍｅｔ－Ｘ、Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルキニル－Ｍｅｔ－Ｘ又はフェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｍｅｔ－Ｘ（Ｍｅｔ＝Ｍｇ、Ｚｎ；Ｘ＝Ｉ、Ｂｒ、Ｃｌ）によってＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルケニル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルケニル、Ｃ$_2$－Ｃ$_4$－アルキニル又はフェニル－Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル（それらはそれぞれ、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について記載のように置換されていても良い。）を導入することで、キノリンカルボン酸エステル中間体１Ｑ又はキノロンカルボキサミド中間体１Ｎを、エステル中間体２Ｂ又は最終化合物Ｉ－ａに変換することができる。

【０４２８】

図式３（Ｒ^3＝Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル）

【化１２９】



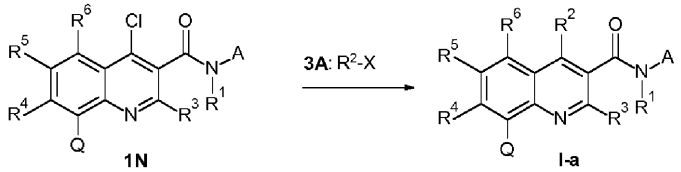
【０４２９】

ヒドロキシルエステル３Ｃ（Ｒ^3＝Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｒ^A＝メチル、エチル又はｔ－ブチル）を得るための別経路は、ＵＳ２００８０３０６０４８に記載の方法による、Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミドなどの極性高沸点溶媒中での、塩基、例えば水素化ナトリウム存在下でのケトエステル３Ｂ（Ｒ^3＝Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｒ^A＝メチル、エチル又はｔ－ブチル）による脱炭酸反応で、市販の２Ｈ－３，１－オキサジン－２，４（１Ｈ）－ジオン３Ａ（Ｈａｌ＝ヨウ素、臭素、塩素）を用いるものである。図式１ａ～ｅ又は図式２に従って、下記の段階を行うことができる。

【０４３０】

図式４

【化１３０】



【０４３１】

Ｊ．Ｏｒｇ．Ｃｈｅｍ．，２０１６，８１（１６），ｐｐ６８９８－６９２６又はＣｈｅｍ．Ｒｅｖ．，２０１３，１１３（７），ｐｐ５３２２－５３６３に記載の方法に従って、ある種のアルキル、シクロ（ｃｌｙｃｌｏ）アルキル及びヘテロシクロアルキルハライド又はカルボン酸３Ａ：Ｃ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル－Ｘ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル－Ｘ、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルケニル－Ｘ、ヘテロシクロアルキルＸ（Ｘ＝Ｂｒ、ＣＯＯＨ）による光酸化還元触媒反応によってＣ$_1$－Ｃ$_4$－アルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルキル、Ｃ$_3$－Ｃ$_6$－シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキル（それらはそれぞれ、上記で定義の一般式（Ｉ）の化合物について定義のように置換されていても良い。）を導入することで、キノロンカルボキサミド中間体１Ｎを変換することができる。

【０４３２】

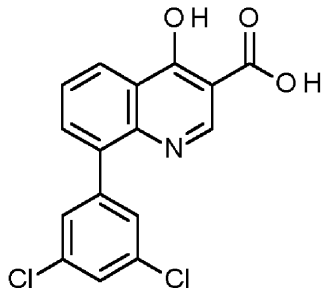
実験の部－実施例

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（Ｒ[2]）キノリン－３－カルボキサミド（実施例１３５、１３７、１５０、１８８、１８９、２４３、２６１、２６４、２７３）の合成

段階１

８－（３，５－ジクロロフェニル）－４－ヒドロキシキノリン－３－カルボン酸

【化１３１】



【０４３３】

アルゴン雰囲気下に、フラスコに、エチル８－ブロモ－４－ヒドロキシ－キノリン－３－カルボキシレート（１５．０ｇ、５０．７ｍｍｏｌ）（Ｇｈａｒａｔ，ａｌ，ＷＯ２０１３／１１８０７１）、３，５－ジクロロベンゼンボロン酸（１１．６ｇ、６０．８ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（１４．０ｇ、１０１ｍｍｏｌ）１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン－パラジウム（ＩＩ）ジクロライドジクロロメタン錯体（１．２４ｇ、１．５２ｍｍｏｌ）及び脱気ジオキサン及び水の５：１混合物（１９０ｍＬ）を入れた。懸濁液を７０℃で終夜撹拌した。次に、水酸化ナトリウムの水溶液（５Ｍ、１０１ｍＬ、５０５ｍｍｏｌ）を加え、暗色混合物を６時間還流させた。次に、熱水（１１０ｍＬ）、メタノール（７０ｍＬ）及び活性炭（２．５ｇ）を加え、還流を数分続けた。混合物を熱濾過し、フィルターケーキをメタノール／水（１：１）で洗浄した。５Ｍ酢酸（１５０ｍＬ、７５０ｍｍｏｌ）を、撹拌下に熱濾液にゆっくり加えて、ｐＨ範囲６～７とした。追加の水９０ｍＬを加え、溶媒を減圧下に部分除去した。懸濁液を撹拌下に冷却して室温とし、その後０℃とした。沈殿を濾去し、メタノール／水（２：１）で洗浄し、ＭＴＢＥ中で撹拌し、再度濾去し、真空乾燥した。

【０４３４】

収量：１７．５ｇ（純度９２％、理論値の９５％）。

【０４３５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．０２分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝３３４［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０４３６】

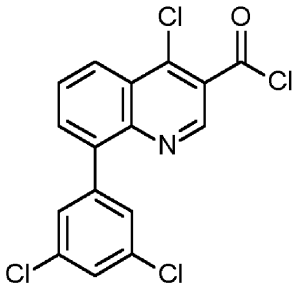
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００８（１．０６）、０．００８（０．９８）、１．９０９（９．５３）、２．５２４（１．２４）、２．６７０（０．４１）、３．１６２（０．８７）、３．１７５（０．８９）、３．５６８（５．５１）、７．６０９（２．０４）、７．６２８（３．４４）、７．６５０（１５．６１）、７．６５４（１６．００）、７．７６９（２．８３）、７．７７３（４．６２）、７．７７８（２．６６）、７．７８８（３．３８）、７．７９１（３．４６）、７．８０６（２．８４）、７．８０９（２．６６）、７．８７４（０．４４）、７．８７９（０．４２）、７．９４８（０．５１）、７．９５２（０．４８）、８．３６４（３．５２）、８．３６８（３．５４）、８．３８５（３．５０）、８．３８８（３．２６）、８．６０３（１０．１４）、１２．２０２（１．００）。

【０４３７】

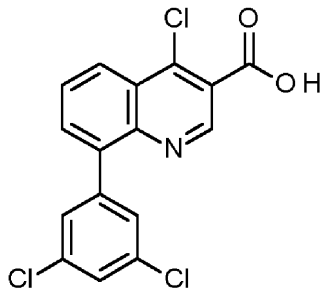
段階２

４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）キノリン－３－カルボニルクロライド

【化１３２】



【０４３８】
８－（３，５－ジクロロフェニル）－４－ヒドロキシキノリン－３－カルボン酸（段階１）（８．１０ｇ、２４．２ｍｍｏｌ）のクロロホルム（４８ｍＬ）中懸濁液に、撹拌下に環境温度で、ＤＭＦ（４滴）及びオキサリルクロライド（４０ｍＬ、４６０ｍｍｏｌ）を１時間かけてゆっくり加えたが、かなりの気体発生があった。次に、混合物をゆっくり加熱還流し、還流温度で３．５時間撹拌した。揮発分を減圧下に留去し、残留物を脱水ジクロロメタンで２回及び脱水ＴＨＦで１回共留去した。粗生成物（９．０ｇ、１００％）を次の段階で用いた。
【０４３９】
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、クロロホルム－ｄ）：δ［ｐｐｍ］＝９．４２（ｓ、１Ｈ）、８．５３（ｄｄ、１Ｈ）、７．８９－７．９５（ｍ、１Ｈ）、７．８０－７．８７（ｍ、１Ｈ）、７．５３（ｄ、２Ｈ）、７．４６（ｔ、１Ｈ）。
【０４４０】
段階３
４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）キノリン－３－カルボン酸
【化１３３】



【０４４１】
４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）キノリン－３－カルボニルクロライド（段階２）（５．４０ｇ、１４．６ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（１００ｍＬ）に懸濁させた。ｐＨ５が維持されるまで水（２５ｍＬ）及び炭酸水素ナトリウム（２．０ｇ、２３．８ｍｍｏｌ）を加え、反応混合物を環境温度で終夜撹拌した。ＴＨＦを、４０℃を超えない浴温で減圧下にかなり除去した。アセトニトリル（２０ｍＬ）を加え、有機溶媒を減圧下に再度除去した。この手順を繰り返し、懸濁液を冷却して０℃とした。沈殿を濾去し、少量ずつのアセトニトリル／水（２：１）及び石油エーテルで洗浄し、真空乾燥した。
【０４４２】
収量：５．１０ｇ（純度９３％、理論値の９２％）。
【０４４３】
ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．１６分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝３５２［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$。
【０４４４】
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００

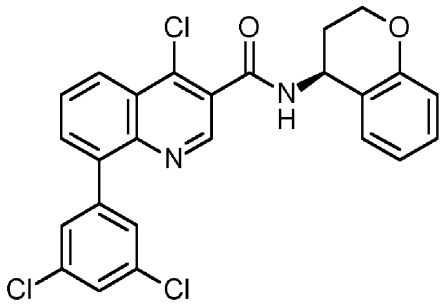
８（１．２９）、０．００８（１．２０）、１．７６０（０．４４）、２．３２９（０．６４）、２．３６７（０．４４）、２．５２４（２．３８）、２．６７１（０．６３）、２．７１１（０．４３）、３．６０１（０．５０）、７．６５４（１．７２）、７．６６０（４．３０）、７．６６４（６．７７）、７．６６９（１６．００）、７．６７３（７．６４）、７．８０４（１．９１）、７．８２３（３．４９）、７．８４３（３．２２）、７．８８７（３．５３）、７．８９０（３．７１）、７．９０４（２．７９）、８．３５４（３．０４）、８．３５７（３．１１）、８．３７５（２．８５）、８．３７８（２．７３）、８．９０７（６．３２）。

【０４４５】

段階４ａ

４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例４）

【化１３４】



【０４４６】

４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）キノリン－３－カルボン酸（段階３）（７．６０ｇ、２１．６ｍｍｏｌ）のＴＨＦ（１１０ｍＬ）中溶液に、撹拌下に、（４Ｓ）－クロマン－４－アミン塩酸塩（４．４ｇ、２３．７ｍｍｏｌ）、トリエチルアミン（１２ｍＬ、８６ｍｍｏｌ）を加え、環境温度で１０分後、２，４，６－トリプロピル－１，３，５，２，４，６－トリオキサトリホスフィナン２，４，６－トリオキサイドの酢酸エチル（１９ｍＬ、含有率５０％、３２ｍｍｏｌ）中溶液を加え、その後に、混合物の温度を上昇させて３６℃とした。環境温度で終夜撹拌後、追加の（４Ｓ）－クロマン－４－アミン塩酸塩（０．８ｇ、４．３ｍｍｏｌ）、トリエチルアミン（３ｍＬ、２１．５ｍｍｏｌ）及び２，４，６－トリプロピル－１，３，５，２，４，６－トリオキサトリホスフィナン２，４，６－トリオキサイドの酢酸エチル中溶液（３．８５ｍＬ、含有率５０％、６．５ｍｍｏｌ）を加え、撹拌を環境温度でさらに１晩続けた。次に、水を加え、ほとんどの有機溶媒を減圧下に溶媒留去した。生成した沈殿を濾去し、石油エーテルで洗浄し、真空乾燥した。

【０４４７】

収量：１０．０ｇ（純度９４％、理論値の９０％）。

【０４４８】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．３５分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４８３［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０４４９】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：１．３５６（１．３１）、１．７４３（２．４５）、１．７５２（３．１８）、１．７５９（６．７９）、１．７６８（３．２１）、１．７７６（２．５７）、１．９８８（０．５１）、２．０５９（０．９９）、２．０６６（１．０７）、２．０７６（１．２２）、２．０８４（１．２６）、２．０９３（１．５７）、２．１００（１．３８）、２．２０９（１．４５）、２．２２１（１．３３）、２．２２９（１．２７）、２．２４２（０．９０）、２．３６６（０．４７）、３．５８５（２．４７）、３．６０１（５．９３）、３．６１７

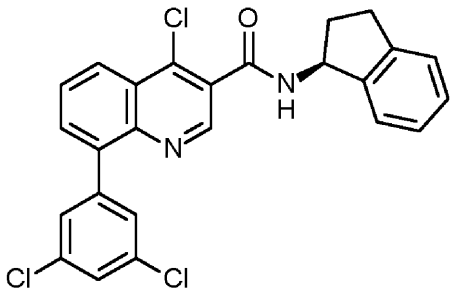
（２．４９）、４．２２１（０．８９）、４．２４１（２．２４）、４．２４９（１．８２）、４．２６２（２．１８）、４．２７０（２．８０）、４．２７９（２．２１）、４．２８７（１．８２）、４．２９６（１．９３）、４．３１５（０．７５）、５．２６７（０．９１）、５．２８２（２．０１）、５．３０１（２．０５）、５．３１５（０．８８）、６．７９１（３．６３）、６．８１１（４．０３）、６．９１７（１．８４）、６．９３６（３．８２）、６．９５５（２．２０）、７．１６１（２．０３）、７．１７９（３．２２）、７．１９９（１．５３）、７．３８０（３．３９）、７．３９９（３．１９）、７．６８０（１６．００）、７．８７９（０．４６）、７．８９３（２．１６）、７．９１２（３．９９）、７．９３２（３．４３）、８．００９（４．２６）、８．０２６（２．９４）、８．３８９（３．７５）、８．４１０（３．３３）、８．９６２（９．９７）、９．２５１（３．２３）、９．２７２（３．１６）。

【０４５０】

段階４ｂ

４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（１Ｓ）－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例３）

【化１３５】



【０４５１】

４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）キノリン－３－カルボニルクロライド（段階２）（４８０ｍｇ、１．２９ｍｍｏｌ）のＤＭＦ（４ｍＬ）中混合物を撹拌し、それにトリエチルアミン（０．３６ｍＬ、２．６ｍｍｏｌ）を加え、次に０℃で（１Ｓ）－インダン－１－アミン（０．１８ｍＬ、２．６ｍｍｏｌ）のジクロロメタン（１．２ｍＬ）中溶液を滴下した。反応混合物を０℃で１時間撹拌し、次に昇温させて環境温度とし、ｐＨを１Ｍ酢酸で５～６に調節し、次に水を加え、ジクロロメタンで抽出した。有機相を分離し、減圧下に溶媒留去し、残留物をシリカ（１００ｇ）でのカラムクロマトグラフィー、溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル（９％から４０％）によって精製した。

【０４５２】

収量：１４９ｍｇ（理論値の２５％）。

【０４５３】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．３７分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４６７［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０４５４】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：０．００８（１．３３）、１．２３４（２．２０）、１．３９７（０．８５）、１．９２４（１．６３）、１．９３５（０．８３）、１．９４６（１．７６）、１．９５６（１．９０）、１．９６７（０．７９）、１．９７７（１．８４）、１．９９８（０．６６）、２．５２４（２．１８）、２．５６７（０．８８）、２．５７５（０．７７）、２．８３８（０．７７）、２．８５９（１．２８）、２．８７８（２．２８）、２．８９８（２．５０）、２．９１８（１．１９）、２．９５１（１．５４）、２．９５９（１．６４）、２．９７３（１．７１）、２．９８０（１．８１）、２．９９０（０．９９）、２．９９９（０．８８）、３．０１２（０．８６）、３．０２０（０．７４）、３．０７０（１．９１）、５．５４２（１．０２）、５．５６２（２．８３）、５．５８２（２．７９）、５．６０２

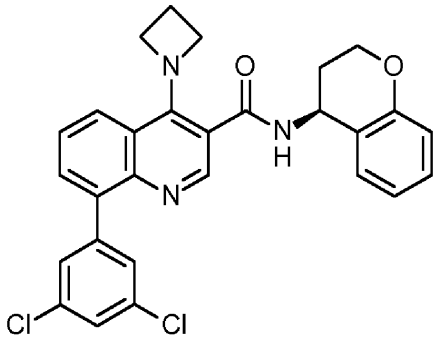
（０．９２）、７．２２３（０．９６）、７．２３２（４．００）、７．２４０（４．９５）、７．２４６（５．２４）、７．２５４（７．１５）、７．２６３（２．９６）、７．２７１（３．６７）、７．２８１（２．５０）、７．２９３（１．１７）、７．４３５（２．５５）、７．４４６（２．６１）、７．４５６（２．００）、７．６３５（１．１０）、７．６６５（０．９８）、７．６７８（１３．０８）、７．６８１（１６．００）、７．６８６（７．１０）、７．６８９（３．７３）、７．６９５（１．３７）、７．７００（０．８０）、７．８９５（２．０６）、７．９１３（４．２５）、７．９３４（３．０６）、８．００４（４．６６）、８．００８（３．２７）、８．０２２（３．２８）、８．０２６（２．０７）、８．３９３（４．１４）、８．３９６（２．７５）、８．４１４（３．７３）、８．４１７（２．３９）、８．９６２（１０．００）、９．１１８（３．３１）、９．１３９（３．２３）。

【０４５５】

段階５

４－（アゼチジン－１－イル）－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例１３５）

【化１３６】



【０４５６】

肉厚マイクロ波容器中、トリエチルアミン（８４μＬ、０．６ｍｍｏｌ）及びアゼチジン（４０μＬ、０．６ｍｍｏｌ）を、４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（段階４ａ）（１４５ｍｇ、０．３ｍｍｏｌ）のＮ－メチルピロリドン中溶液に加えた。容器にキャップを施し、撹拌下に加熱して１００℃として２．５時間経過させた。５Ｍギ酸（１８０μＬ、０．９ｍｍｏｌ）及び少量のＤＭＳＯを暗色混合物に加え、その溶液を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０４５７】

収量：９３ｍｇ（理論値の６２％）。

【０４５８】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝０．８９分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５０４［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０４５９】

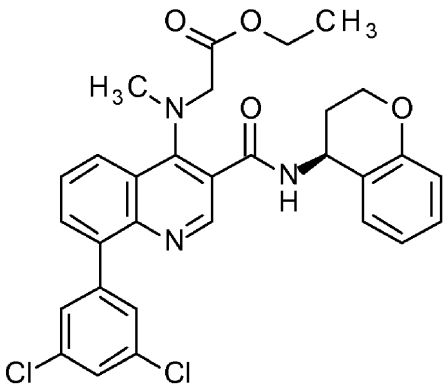
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００８（６．３０）、０．００８（２．９８）、２．００４（１．０２）、２．０１４（０．９４）、２．０２６（１．４３）、２．０４１（１．２８）、２．１２６（１．３１）、２．１４１（１．５６）、２．３７３（２．１５）、２．３９４（２．９２）、２．４１２（２．１６）、２．４３３（１．２５）、２．５１９（４．８０）、２．５２３（４．６７）、４．２４３（３．２８）、４．２５５（４．７５）、４．２６１（３．０１）、４．２７０（２．５８）、４．４２７（５．５０）、４．４４６（８．０６）、４．４６６（４．６２）、５．１６０（０．９２）、５．１７４（１．７５）、５．１９４（１．

６４）、５．７５４（２．４２）、６．７８１（３．０４）、６．７８５（３．１４）、６．８０２（３．３９）、６．８０５（３．２６）、６．８８７（１．７３）、６．８９０（１．６６）、６．９０６（３．３０）、６．９０９（２．９９）、６．９２４（１．９３）、６．９２７（１．７０）、７．１４２（１．７５）、７．１４６（１．７７）、７．１６３（２．６３）、７．１８０（１．３１）、７．１８５（１．２０）、７．２９１（２．８３）、７．３１１（２．５２）、７．４３４（２．４０）、７．４５２（３．１３）、７．４５５（２．９０）、７．４７３（２．６１）、７．５９２（２．６５）、７．５９７（４．８７）、７．６０２（５．８２）、７．６１１（１６．００）、７．６１６（８．４８）、７．６９８（３．６２）、７．７０１（３．６３）、７．７１６（３．０７）、７．７１９（２．８２）、８．０５８（３．０６）、８．０６１（３．０５）、８．０８０（２．７６）、８．０８３（２．４７）、８．４３０（１１．３４）、８．９４６（２．９４）、８．９６６（２．７４）。

【０４６０】

エチルＮ－｛８－（３，５－ジクロロフェニル）－３－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イルカルバモイル］キノリン－４－イル｝－Ｎ－メチルグリシネート（実施例１３７）

【化１３７】



【０４６１】

アルゴン雰囲気下に、肉厚マイクロ波容器に、１，４－ジアザビシクロ（２．２．２）オクタン（５６ｍｇ、０．５ｍｍｏｌ）、エチル－Ｎ－メチルグリシネート塩酸塩（１：１）（１５４ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（３５０μＬ、２．０ｍｍｏｌ）、Ｎ－メチルピロリドン（０．８ｍＬ）及び４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（段階４ａ）（２４２ｍｇ、０．５ｍｍｏｌ）を入れた。容器にキャップを施し、混合物を撹拌下に１００℃で３時間加熱した。追加量のエチル－Ｎ－メチルグリシネート塩酸塩（１：１）（７７ｍｇ、０．５ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（１７０μＬ、１．０ｍｍｏｌ）を加え、加熱を２時間続けた。５Ｍギ酸（０．７ｍＬ、３．５ｍｍｏｌ）及びＤＭＳＯ（３ｍＬ）を加え、その溶液を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０４６２】

収量：１５０ｍｇ（純度９８％、理論値の５２％）。

【０４６３】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．３８分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５６４［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０４６４】

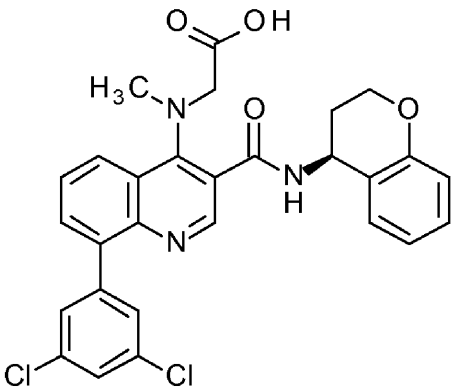
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００８（０．７８）、０．００８（０．７０）、１．１９９（４．３３）、１．２１７（９．

１３）、１．２３４（４．６２）、１．３５６（０．５２）、２．０６３（０．４３）、２．０７３（０．４８）、２．０８４（０．４７）、２．０９９（０．７１）、２．１０７（０．５９）、２．１１４（０．４５）、２．１９３（０．４９）、２．２０５（０．５９）、２．２１６（０．５９）、２．２２７（０．５２）、２．５２３（０．５２）、３．０４９（１２．８２）、４．０５２（６．６８）、４．１３４（１．３４）、４．１５２（４．１２）、４．１７０（４．０４）、４．１８７（１．２７）、４．２５５（１．０１）、４．２６７（１．２１）、４．２７８（１．６５）、４．２８２（１．７０）、４．２９３（０．９７）、５．２５７（０．４２）、５．２７１（０．９５）、５．２９１（０．９５）、５．３０５（０．４２）、６．７９２（１．７４）、６．８１２（１．９４）、６．９０１（０．８７）、６．９１９（１．８４）、６．９３７（１．０７）、７．１５４（０．８６）、７．１５７（０．９３）、７．１７５（１．４７）、７．１９３（０．７０）、７．１９６（０．７１）、７．３６２（１．５６）、７．３８０（１．４６）、７．６４５（１６．００）、７．６８８（１．２６）、７．７０７（１．７５）、７．７２８（１．５９）、７．８４０（１．８９）、７．８４２（２．０５）、７．８５７（１．５８）、７．８６０（１．５６）、８．３５４（１．７２）、８．３５７（１．８０）、８．３７６（１．６３）、８．３７９（１．６０）、８．７５７（６．０２）、９．１９７（１．６９）、９．２１７（１．６４）。

【０４６５】

Ｎ－｛８－（３，５－ジクロロフェニル）－３－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イルカルバモイル］キノリン－４－イル｝－Ｎ－メチルグリシン（実施例１５０）

【化１３８】



【０４６６】

エチルＮ－｛８－（３，５－ジクロロフェニル）－３－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イルカルバモイル］キノリン－４－イル｝－Ｎ－メチルグリシネート（実施例１３７から）（３５ｍｇ、６２μｍｏｌ）を、ＴＨＦ（０．３ｍＬ）、エタノール（０．３ｍＬ）及び５Ｍ水酸化ナトリウム水溶液（５０μＬ、２５０μｍｏｌ）中、環境温度で１．５時間攪拌した。反応混合物を、５Ｍギ酸を加えることでｐＨ３の酸性とし、溶媒の一部を減圧下に留去した。生成した沈殿を濾去し、水で洗浄し、真空乾燥した。

【０４６７】

収量：２７ｍｇ（理論値の８１％）。

【０４６８】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．１１分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５３６［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０４６９】

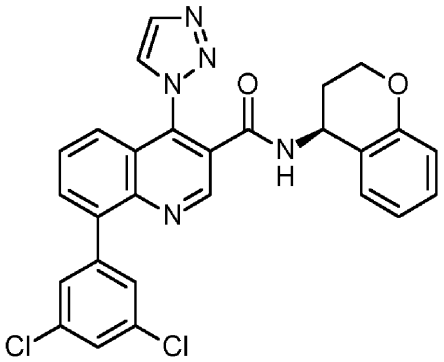
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：２．１３２（１．２８）、２．２０５（１．３７）、２．３２８（０．５９）、３．０４０（１６．

００）、３．９３１（０．６１）、３．９７５（４．５９）、３．９８４（４．７１）、４．２８１（３．４８）、５．３０９（１．６９）、５．３２６（１．６８）、６．７７９（２．７８）、６．７９９（３．０８）、６．８８３（１．４２）、６．９０１（２．８０）、６．９２０（１．７２）、７．１４０（１．５６）、７．１５９（２．５０）、７．１７５（１．２５）、７．３４８（２．６６）、７．３６５（２．４７）、７．６４３（１４．７６）、７．６６０（２．２５）、７．６７８（２．８２）、７．６９９（１．８８）、７．８２０（３．０２）、７．８３５（２．４２）、８．１３９（１．０５）、８．３０４（２．５６）、８．３２６（２．３３）、８．７５５（６．５６）。

【０４７０】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（１Ｈ－１，２，３－トリアゾール－１－イル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例１８８）

【化１３９】

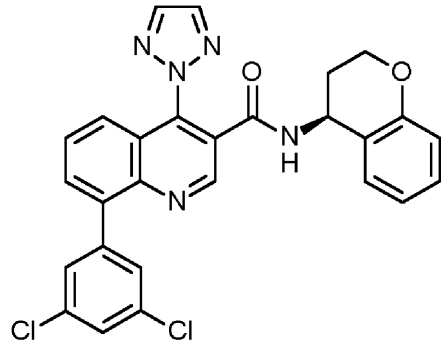


【０４７１】

及び

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例１８９）

【化１４０】



【０４７２】

肉厚マイクロ波容器に、４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（段階４ａ）（１４５ｍｇ、０．３ｍｍｏｌ）、１，２，３－トリアゾール（６２ｍｇ、０．９ｍｍｏｌ）、Ｎ－メチルピロリドン（０．５ｍＬ）、トリエチルアミン（８４μＬ、０．６ｍｍｏｌ）及び炭酸セシウム（９８ｍｇ、０．３ｍｍｏｌ）を入れた。容器にキャップを施し、混合物を撹拌下に１００℃で２時間加熱した。５Ｍギ酸（２４０μＬ、１．２ｍｍｏｌ）及び水（１．５ｍＬ）を加え、沈殿を濾去し、廃棄した。濾液を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０４７３】

収量（実施例１８８）：２３ｍｇ（理論値の１５％）。

【０４７４】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：Ｒｔ＝１．１８分；ＭＳ（ＥＳＩｎｅｇ）：ｍ／ｚ＝５１４［Ｍ－Ｈ］⁻。

【０４７５】

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）：δ［ｐｐｍ］＝９．２３（ｓ、１Ｈ）、９．１２（ｄ、１Ｈ）、８．６５（ｄ、１Ｈ）、８．１４（ｄ、１Ｈ）、８．０６（ｄｄ、１Ｈ）、７．８０－７．８８（ｍ、１Ｈ）、７．６８－７．７６（ｍ、３Ｈ）、７．３９－７．４６（ｍ、１Ｈ）、７．１０－７．２０（ｍ、１Ｈ）、７．０６（ｄ、１Ｈ）、６．８２－６．９２（ｍ、１Ｈ）、６．７６（ｄ、１Ｈ）、４．９８－５．０９（ｍ、１Ｈ）、４．１８（ｔｄ、１Ｈ）、４．００－４．１２（ｍ、１Ｈ）、２．０２（ｂｒｄｄ、１Ｈ）、１．７３－１．８６（ｍ、１Ｈ）。

【０４７６】

収量（実施例１８９）：７３ｍｇ（純度９７％、理論値の４６％）。

【０４７７】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：Ｒｔ＝１．２７分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５１６［Ｍ＋Ｈ］⁻。

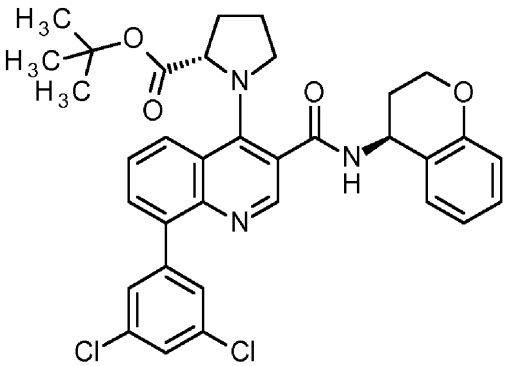
【０４７８】

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）：シフト［ｐｐｍ］＝９．１２－９．２２（ｍ、２Ｈ）、８．３５（ｓ、２Ｈ）、８．０３（ｄｄ、１Ｈ）、７．８７－７．９６（ｍ、１Ｈ）、７．７８－７．８７（ｍ、１Ｈ）、７．６６－７．７６（ｍ、２Ｈ）、７．２５（ｄ、１Ｈ）、７．１０－７．１９（ｍ、１Ｈ）、６．８８－６．９８（ｍ、１Ｈ）、６．７６（ｄ、１Ｈ）、４．９８－５．１４（ｍ、１Ｈ）、４．０７－４．２９（ｍ、２Ｈ）、２．０２－２．１４（ｍ、１Ｈ）、１．９４（ｄｔｄ、１Ｈ）。

【０４７９】

ｔｅｒｔ－ブチル１－｛８－（３，５－ジクロロフェニル）－３－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イルカルバモイル］キノリン－４－イル｝－Ｌ－プロリネート（実施例２４３）

【化１４１】



【０４８０】

実施例１３７の手順に従って、１００℃で３時間加熱することで、４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（段階４ａ）（２４２ｍｇ、０．５ｍｍｏｌ）及びｔｅｒｔ－ブチルＬ－プロリネート（１７１ｍｇ、１．０ｍｍｏｌ）から標題化合物を合成した。

【０４８１】

収量：１８５ｍｇ（理論値の６０％）。

【０４８２】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：Ｒｔ＝１．３９分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝６１８

［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$。

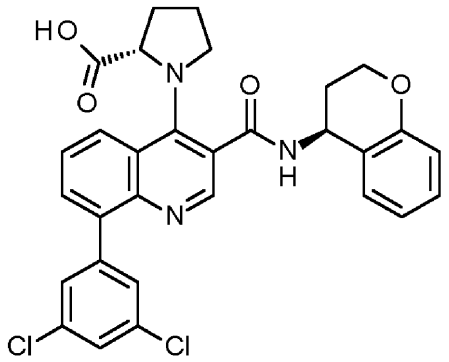
【０４８３】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ［ｐｐｍ］：１．１９８（１６．００）、１．９１８（０．６３）、１．９３２（０．８５）、１．９４５（０．５１）、４．２６０（０．４４）、６．７８８（０．６１）、６．８０８（０．６９）、６．９３９（０．６４）、７．１８６（０．５２）、７．３９４（０．５５）、７．４１２（０．５１）、７．６３８（５．７３）、７．６５５（０．６２）、７．６７６（０．５３）、７．８１５（０．７０）、７．８３２（０．５６）、８．３１５（０．６０）、８．３３４（０．５５）、８．６８４（２．０６）、９．２３６（０．５８）、９．２５７（０．５７）。

【０４８４】

１－｛８－（３，５－ジクロロフェニル）－３－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イルカルバモイル］キノリン－４－イル｝－Ｌ－プロリン（実施例２６１）

【化１４２】



【０４８５】

塩化水素のジオキサン中溶液（１ｍＬ、４Ｍ）を、ｔｅｒｔ－ブチル１－｛８－（３，５－ジクロロフェニル）－３－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イルカルバモイル］キノリン－４－イル｝－Ｌ－プロリネート（実施例２４３から）（１５５ｍｇ、０．２５ｍｍｏｌ）のジクロロメタン（０．８ｍＬ）中溶液に加え、環境温度で終夜攪拌した。揮発分を減圧下に除去し、残留物をジクロロメタン及び水とともに攪拌した。分離した水相をジクロロメタンで抽出し、合わせた有機相を脱水し、溶媒留去した。残留物を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０４８６】

収量：５２ｍｇ（理論値の３７％）。

【０４８７】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：Ｒ$_{t}$＝０．９１分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５６２［Ｍ＋Ｈ］$^{+}$。

【０４８８】

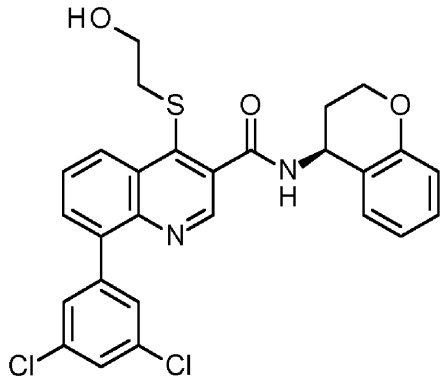
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（５００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ［ｐｐｍ］：－０．００７（３．０９）、０．００６（１．９９）、１．９０７（２．４２）、２．０２８（０．５８）、２．０３３（０．６０）、２．０４４（０．７１）、２．０５６（０．８３）、２．１６６（０．５２）、２．１７５（０．７１）、２．１８５（０．７５）、２．１９３（０．７７）、２．２０４（０．５０）、２．３５８（０．８９）、２．３６１（１．２２）、２．３６５（０．９３）、２．３６９（０．５８）、２．３９２（０．７０）、２．４０７（０．７１）、２．５１４（３．５０）、２．５１８（３．０１）、２．５２２（２．３４）、２．６３１（０．８７）、２．６３５（１．１４）、２．６３９（０．８１）、３．８６６（０．４６）、３．８７８（１．０６）、３．８９５（０．９１）、

４．１８３（０．４３）、４．１８８（０．４４）、４．２０５（１．１２）、４．２２４（０．８９）、４．２２９（０．７３）、４．２４３（０．７５）、４．２５０（１．０８）、４．２６２（０．９１）、４．２７７（０．４６）、４．６３８（０．８３）、４．６４９（１．０２）、４．６５４（１．３３）、４．６６５（１．０６）、５．２５４（０．５４）、５．２６４（１．１４）、５．２８０（１．１０）、５．２９１（０．５０）、６．７８６（２．２２）、６．７８８（２．１８）、６．８０２（２．４２）、６．８０４（２．３２）、６．９１９（１．１６）、６．９２１（１．０８）、６．９３３（２．２６）、６．９３５（２．１１）、６．９４８（１．３１）、６．９５０（１．１８）、７．１６９（１．１２）、７．１７２（１．１６）、７．１８６（１．７６）、７．２００（０．９３）、７．２０３（０．８９）、７．３８８（１．８０）、７．４０３（１．７０）、７．６２９（１．７２）、７．６３４（４．０２）、７．６３７（８．８９）、７．６３９（１６．００）、７．６４２（４．８７）、７．６５２（２．１８）、７．６５４（１．９１）、７．６６９（１．８２）、７．８０６（２．５１）、７．８０９（２．４２）、７．８２１（２．０５）、７．８２３（１．８６）、８．３０３（１．８６）、８．３２０（１．７２）、８．６８０（８．２５）、１２．５８６（０．９１）。

【０４８９】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－［（２－ヒドロキシエチル）スルファニル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例２６４）

【化１４３】



【０４９０】

肉厚容器に、４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（段階４ａ）（１２１ｍｇ、２５０μｍｏｌ）、ＤＭＳＯ（０．３ｍＬ）、２－スルファニルエタノール（３９ｍｇ、５００μｍｏｌ）及びトリエチルアミン（８７μＬ、６３０μｍｏｌ）を入れ、キャップを施し、１００℃で２時間加熱した。冷却して環境温度とした後、５Ｍギ酸（３００μＬ、１．５ｍｍｏｌ）を加え、アセトニトリルを加えることで混合物を溶解させ、分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０４９１】

収量：９５ｍｇ（理論値の７２％）。

【０４９２】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．２８分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５２５［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０４９３】

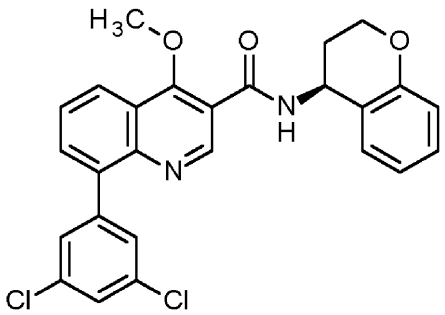
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００８（２．６６）、０．００８（２．５７）、２．１１９（１．０４）、２．１２８（０．８６）、２．３６６（０．８２）、２．７１０（０．８２）、３．０６０（２．７２）、

３．０７７（６．６４）、３．０９３（３．５０）、３．２８７（２．７０）、３．４３８（１．０４）、３．４５４（２．４８）、３．４６８（３．１６）、３．４８１（２．１０）、３．４９７（０．８９）、４．２５４（１．４６）、４．２６３（１．２６）、４．２７３（２．２４）、４．２８２（２．４３）、４．２９７（１．３５）、４．９４６（２．０６）、４．９６０（４．５６）、４．９７４（１．９９）、５．２９１（１．２８）、５．３１０（１．３１）、６．７８１（２．４１）、６．７８４（２．６１）、６．８０２（２．７４）、６．８０５（２．８８）、６．９１０（１．３３）、６．９１３（１．４６）、６．９２８（２．６３）、６．９３２（２．５７）、６．９４７（１．５９）、６．９５０（１．５３）、７．１５１（１．３１）、７．１５６（１．３５）、７．１７３（２．２１）、７．１９０（１．２４）、７．１９４（１．１３）、７．４４８（２．１７）、７．４６５（２．０６）、７．６２７（１．００）、７．６３２（１．０４）、７．６５８（５．７３）、７．６６２（１６．００）、７．６６６（６．６８）、７．６６９（３．４１）、７．６７５（１．２２）、７．８３８（１．９３）、７．８５６（２．９７）、７．８５９（２．３５）、７．８７７（２．９２）、７．９２９（３．２１）、７．９３２（３．５０）、７．９４６（２．２１）、７．９５０（２．０６）、８．６２４（２．９７）、８．６２７（２．９７）、８．６４５（２．７０）、８．６４９（２．５０）、８．８８１（１０．４５）、９．１５５（２．４８）、９．１７５（２．３７）。

【０４９４】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－メトキシキノリン－３－カルボキサミド（実施例３７３）

【化１４４】



【０４９５】

アルゴン雰囲気下に、ナトリウムメチレートのメタノール（１４０μＬ、５．４Ｍ、７８０μｍｏｌ）中溶液を、４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（段階４ａ）（１５０ｍｇ、３１０μｍｏｌ）のＮ－メチルピロリドン（１ｍＬ）中溶液に滴下し、混合物を環境温度で４０分間撹拌した。酢酸（２５０μＬ、５．０Ｍ、１．２ｍｍｏｌ）を加え、混合物を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０４９６】

収量：９４ｍｇ（理論値の６３％）。

【０４９７】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．３９分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４７９［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０４９８】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：４．１７２（１６．００）、４．２４５（０．９０）、４．２５４（１．０７）、４．２６９（１．４９）、４．２７３（１．５１）、４．２８３（０．８６）、５．２７４（０．８３）、５．２９３（０．８３）、５．７５４（１２．３５）、６．７９３（１．４０）、６．７

９６（１．５３）、６．８１４（１．５９）、６．８１６（１．６６）、６．９０９（０．７４）、６．９１２（０．７４）、６．９２８（１．５５）、６．９３０（１．５４）、６．９４６（０．９３）、６．９４９（０．９１）、７．１５９（０．７６）、７．１６３（０．８２）、７．１８０（１．２９）、７．３６３（１．３３）、７．３８０（１．２５）、７．６５０（０．８８）、７．６５５（２．０７）、７．６５９（２．３３）、７．６７０（７．４０）、７．６７５（４．３９）、７．７０２（１．２０）、７．７２０（１．６６）、７．７２３（１．５７）、７．７４１（１．４７）、７．８８６（１．６９）、７．８９０（１．８０）、７．９０４（１．４４）、７．９０８（１．４２）、８．２９６（１．６１）、８．２９９（１．６３）、８．３１７（１．５４）、８．３２０（１．４５）、８．８１１（５．５７）、９．１９２（１．３６）、９．２１２（１．３４）。

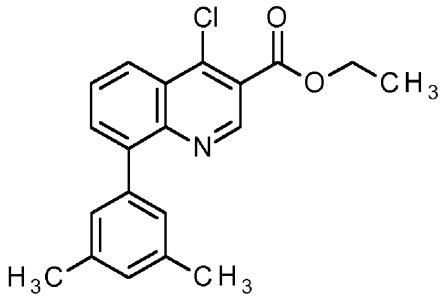
【０４９９】

４－クロロ－８－（３，５－ジメチルフェニル）－Ｎ－［（１Ｓ）－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例１）の合成

段階１

エチル－４－クロロ－８－（３，５－ジメチルフェニル）キノリン－３－カルボキシレート

【化１４５】



【０５００】

アルゴン雰囲気下に、フラスコに、エチル８－ブロモ－４－クロロキノリン－３－カルボキシレート（３３０ｍｇ、１．０５ｍｍｏｌ）（Ｚａｓｋ，ａｌ．　Ｂｉｏｏｒｇａｎｉｃ　ａｎｄ　Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ　Ｌｅｔｔｅｒｓ，２００３，１４８７－１４９０；Ｌａｘｍｉｋａｎｔ，ａｌ．　ＵＳ２０１３／２１０８４４）、３，５－ジメチルベンゼンボロン酸（１８９ｍｇ、１．２６ｍｍｏｌ）及び脱気ジオキサン（６．６ｍＬ）及び水（１．３ｍＬ）の混合物を入れた。次に、炭酸カリウム（２９０ｍｇ、２．１０ｍｍｏｌ）及び１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン－パラジウム（ＩＩ）ジクロライドジクロロメタン錯体（４２．８ｍｇ、５２．５μｍｏｌ）を加え、混合物を５０℃で終夜攪拌した。反応混合物をセライトで濾過し、酢酸エチル及び水で洗浄した。濾液の有機相を水及びブラインで洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水し、減圧下に溶媒留去した。残留物を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）及びシリカゲルクロマトグラフィー（シクロヘキサン／酢酸エチル－５：１）によって精製した。

【０５０１】

収量：７７．０ｍｇ（理論値の２１％）。

【０５０２】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．４３分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝３４０［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０５０３】

ＮＭＲ：^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）：δ［ｐｐｍ］＝９．１３（ｓ、１Ｈ）、８．４２（ｄｄ、１Ｈ）、７．８７－７．９６（ｍ、２Ｈ）、７．２０（ｓ、２Ｈ）、７．０７（ｓ、１Ｈ）、４．４４（ｑ、２Ｈ）、２．３５（ｓ、６Ｈ）、１．

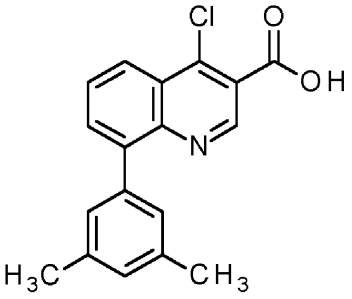
３８（ｔ、３Ｈ）。

【０５０４】

段階２

４－クロロ－８－（３，５－ジメチルフェニル）キノリン－３－カルボン酸

【化１４６】



【０５０５】

エタノール（０．５ｍＬ）及びＴＨＦ（０．５ｍＬ）中のエチル－４－クロロ－８－（３，５－ジメチルフェニル）キノリン－３－カルボキシレート（段階１）（８４．０ｍｇ、２４７μｍｏｌ）に、水酸化ナトリウム水溶液（５Ｍ、１５０μＬ、７４０μｍｏｌ）を加え、混合物を環境温度で終夜撹拌した。溶媒を減圧下に除去し、残留物をＤＭＳＯ及び５Ｍギ酸に溶かし、分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製して、オフホワイト固体を得た。

【０５０６】

収量：７５．０ｍｇ（理論値の９７％）。

【０５０７】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．１５分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝３１２［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０５０８】

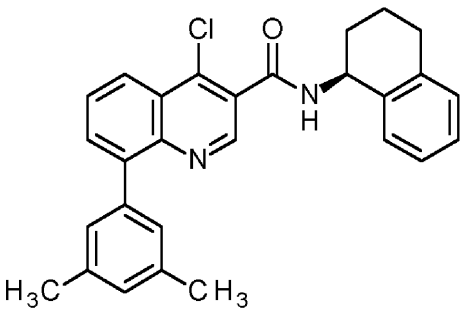
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：２．３４６（１６．００）、７．０６２（１．５２）、７．１８９（３．５２）、７．８８４（１．５２）、７．８９５（１．６８）、７．９０２（３．４９）、８．３９６（０．９９）、８．４０３（０．９２）、８．４１４（０．８８）、８．４２１（０．８７）、９．１１６（２．８３）。

【０５０９】

段階３

４－クロロ－８－（３，５－ジメチルフェニル）－Ｎ－［（１Ｓ）－１，２，３，４－テトラヒドロナフタレン－１－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例１）

【化１４７】



【０５１０】

ＴＨＦ（１．２ｍＬ）中の４－クロロ－８－（３，５－ジメチルフェニル）キノリン－３－カルボン酸（段階２）（７１．０ｍｇ、２２８μｍｏｌ）を、（１Ｓ）－１，２，３

，４－テトラヒドロナフタレン－１－アミン（３６．９ｍｇ、２５１μｍｏｌ）及びトリエチルアミン（１９０μＬ、１．４ｍｍｏｌ）で処理し、６０℃で１０分間撹拌した。次に、２，４，６－トリプロピル－１，３，５，２，４，６－トリオキサトリホスフィナン２，４，６－トリオキサイドの酢酸エチル（２００μＬ、含有率５０％、３４０μｍｏｌ）中溶液を加え、加熱を外し、混合物を環境温度で終夜撹拌した。水及び５Ｍギ酸（０．６ｍＬ）を加え、溶媒を減圧下に除去した。残留物を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０５１１】

収量：２０．０ｍｇ（理論値の２０％）。

【０５１２】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．４２分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４４１［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０５１３】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００８（４．４１）、０．００８（４．０６）、２．３４２（１６．００）、２．７５９（１．０７）、７．０５９（１．６０）、７．１１１（０．６６）、７．１２８（１．０５）、７．１８３（４．６１）、７．１９５（１．６９）、７．２０２（０．８２）、７．２０７（０．９６）、７．４２２（０．８９）、７．４３８（０．７５）、７．８５５（４．０２）、７．８６５（２．２４）、７．８６９（２．２６）、８．３０３（１．２６）、８．３１４（１．１０）、８．３１７（１．０７）、８．３２８（１．１０）、８．８７４（５．１１）、９．１０２（０．９６）、９．１２３（０．９６）。

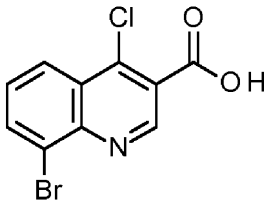
【０５１４】

８－（２，３－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（モルホリン－４－イル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例５２）の合成

段階１

８－ブロモ－４－クロロキノリン－３－カルボン酸

【化１４８】



【０５１５】

エチル－８－ブロモ－４－クロロキノリン－３－カルボキシレート（９．４４ｇ、３０．０ｍｍｏｌ）のＴＨＦ（６５ｍＬ）中懸濁液に、水酸化ナトリウム水溶液（１２ｍＬ、１０Ｍ、１２０ｍｍｏｌ）を加え、混合物を環境温度で高撹拌した。５時間後、水（１２ｍＬ）を加え、混合物を環境温度で終夜撹拌した。フラスコの壁面に生じていた非晶質沈殿から、上清を傾斜法で取り、廃棄した。沈殿を真空乾燥して、標題化合物のナトリウム塩を得た。

【０５１６】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝０．７０分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝２８５［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０５１７】

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）：δ［ｐｐｍ］＝８．９８（ｓ、１Ｈ）、８．２９（ｄｄ、１Ｈ）、８．１６－８．２３（ｍ、１Ｈ）、７．６４（ｔ、１Ｈ）。

【０５１８】

残った湿固体を、６０℃で水（２５０ｍＬ）に溶かし、高撹拌下にギ酸（５７ｍＬ、５

．０Ｍ、２８０ｍｍｏｌ）を加えて、ｐＨ値３とし、沈殿が生成した。混合物を冷却して環境温度とし、沈殿を濾去し、水で洗浄し、４０℃で真空乾燥した。

【０５１９】

収量：７．０ｇ（純度９８％、理論値の８０％）。

【０５２０】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝０．７０分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝２８５［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０５２１】

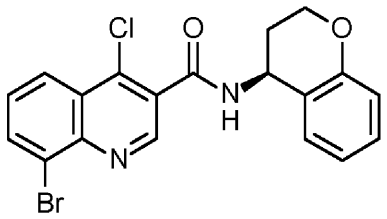
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）：δ［ｐｐｍ］＝１４．１２（ｂｒｓ、１Ｈ）、９．２５（ｓ、１Ｈ）、８．４２（ｄ、１Ｈ）、８．３６（ｄ、１Ｈ）、７．７５（ｔ、１Ｈ）。

【０５２２】

段階２

８－ブロモ－４－クロロ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド

【化１４９】



【０５２３】

５０℃の油浴で１０分間撹拌することで、８－ブロモ－４－クロロキノリン－３－カルボン酸（段階１）（７．００ｇ、２４．４ｍｍｏｌ）をＴＨＦに溶かした。加熱を外し、（４Ｓ）－クロマン－４－アミン塩酸塩（５．４４ｇ、２９．３ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピル－エチル－アミン（１７ｍＬ、９８ｍｍｏｌ）及び２，４，６－トリプロピル－１，３，５，２，４，６－トリオキサトリホスフィナン２，４，６－トリオキサイドの酢酸エチル中溶液（２３ｍＬ、含有率５０％、３９ｍｍｏｌ）を加え、それによって温度が上昇して４５℃となった。撹拌を３０分間続け、固体の沈殿を支援するための撹拌を続けながら、水（３００ｍＬ）を加えた。沈殿を回収し、水で洗浄し、真空乾燥した。

【０５２４】

収量：９．５０ｇ（理論値の９３％）。

【０５２５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．０１分；ＭＳ（ＥＳＩｎｅｇ）：ｍ／ｚ＝４１７［Ｍ＋Ｈ］$^-$。

【０５２６】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：２．０４７（０．７４）、２．０５４（０．９９）、２．０６３（１．５４）、２．０７０（１．６６）、２．０８１（１．８５）、２．０８８（１．８６）、２．０９７（２．４９）、２．１０４（２．１８）、２．１１３（１．４９）、２．１２０（１．０８）、２．１９７（１．０６）、２．２０６（１．６１）、２．２１８（２．４１）、２．２３１（２．１７）、２．２３９（２．１０）、２．２５２（１．５６）、２．２６４（１．０１）、２．２７３（０．７１）、２．３２８（０．４２）、２．６７０（０．４７）、４．２０５（１．１８）、４．２１２（１．４３）、４．２３３（３．７６）、４．２４０（２．８０）、４．２５３（３．０８）、４．２６１（２．４２）、４．２７７（２．４２）、４．２８５（３．１２）、４．２９３（２．７５）、４．３０２（３．１０）、４．３１３（１．３３）、４．３２１（１．４０）、４．３２９（１．０４）、５．２６６（１．５１）、５．２８１（３．３５）、５．３００（３．３５）、５．３１５（１．４７）、６

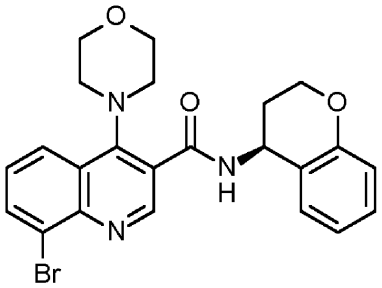
．７９３（５．６０）、６．８１４（６．３５）、６．９２２（２．９９）、６．９４０（６．４４）、６．９５９（３．７８）、７．１６２（３．０４）、７．１６５（３．１１）、７．１８３（５．１５）、７．２０１（２．４８）、７．３８２（５．４２）、７．４０１（５．０４）、７．７１３（４．６２）、７．７３３（８．０３）、７．７５４（５．２９）、８．３１２（６．７９）、８．３２４（８．２６）、８．３２７（８．６９）、８．３４５（６．６４）、９．０４２（１６．００）、９．２６４（４．７７）、９．２８５（４．６７）。

【０５２７】

段階３

８－ブロモ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（モルホリン－４－イル）キノリン－３－カルボキサミド

【化１５０】



【０５２８】

８－ブロモ－４－クロロ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（段階２）（９．５０ｇ、２２．７ｍｍｏｌ）のＴＨＦ（７０ｍＬ）中懸濁液に、モルホリン（６．０ｍＬ、６８ｍｍｏｌ）及び１，４－ジアザビシクロ［２．２．２］オクタン（２．５５ｇ、２２．７ｍｍｏｌ）を加え、浴温８０℃で１．５時間撹拌した。水（３０ｍＬ）を加え、ＴＨＦを減圧下に留去した。追加の水を加え、懸濁液を最初に５０℃で、次に環境温度で撹拌した。沈殿を濾去し、水で洗浄し、真空乾燥した。

【０５２９】

収量：１０．５ｇ（理論値の９８％）。

【０５３０】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝０．９２分；ＭＳ（ＥＳＩｎｅｇ）：ｍ／ｚ＝４６６［Ｍ－Ｈ］$^-$。

【０５３１】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．１４９（０．４１）、－０．００８（４．４２）、０．００８（３．１８）、２．０４１（０．５４）、２．０４８（０．７６）、２．０５６（１．１３）、２．０６３（１．１９）、２．０７６（１．３０）、２．０９１（１．８０）、２．０９８（１．５７）、２．１０６（１．１１）、２．１９７（０．７４）、２．２０６（１．１７）、２．２１８（１．７０）、２．２３１（１．５９）、２．２４０（１．５８）、２．２５３（１．１３）、２．２６２（０．７４）、２．２７４（０．５２）、２．３２７（０．６０）、２．３６６（０．４９）、２．５２３（２．３０）、２．６６９（０．６６）、２．７１０（０．４８）、３．２１７（０．６９）、３．２２８（１．１８）、３．２４８（４．７１）、３．２５８（１１．００）、３．２６９（１１．２８）、３．２７９（５．００）、３．８４２（８．９２）、３．８５３（１４．１３）、３．８６４（８．０７）、４．２１４（０．８０）、４．２２１（１．０１）、４．２４２（２．６８）、４．２４９（２．０３）、４．２６３（２．４１）、４．２７１（２．０８）、４．２７６（２．００）、４．２８６（２．４４）、４．２９３（２．０７）、４．３０２（２．１８）、４．３１４（０．８６）、４．３２１（０．９６）、４．３２９（０．６５）、５．２４５（１．

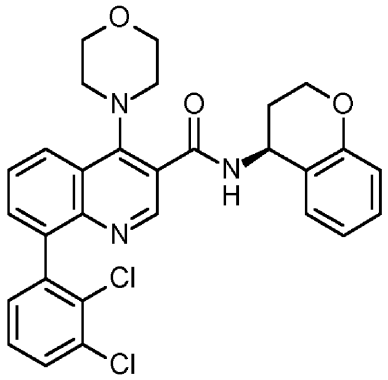
１０）、５．２５９（２．４５）、５．２７９（２．４４）、５．２９２（１．０６）、６．７９７（４．２９）、６．８１５（４．８４）、６．９２７（２．２６）、６．９２９（２．１６）、６．９４６（４．７５）、６．９６４（２．８７）、７．１６４（２．３３）、７．１６７（２．４０）、７．１８５（３．８５）、７．２０２（１．９１）、７．２０６（１．７９）、７．３８５（４．０５）、７．４０３（３．７７）、７．４９９（３．７４）、７．５１８（５．４０）、７．５３８（４．０６）、８．１２３（４．８０）、８．１２５（５．０４）、８．１４２（４．７１）、８．１４４（４．５１）、８．１９７（４．９２）、８．１９９（４．６４）、８．２１８（４．７１）、８．７５３（１６．００）、９．１７７（３．９９）、９．１９７（３．８９）。

【０５３２】

段階４

８－（２，３－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（モルホリン－４－イル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例５２）

【化１５１】



【０５３３】

アルゴン雰囲気下に、炭酸カリウム（１．２９ｇ、９．３１ｍｍｏｌ）を、超音波処理によって脱気ジオキサン及び水の５：１混合物（２１ｍＬ）に溶かした。１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン－パラジウム（ＩＩ）ジクロライドジクロロメタン錯体（１９０ｍｇ、０．２３ｍｍｏｌ）及び８－ブロモ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（モルホリン－４－イル）キノリン－３－カルボキサミド（段階３）（２．１８ｇ、４．６５ｍｍｏｌ）を加え、次に２，３－ジクロロベンゼンボロン酸（９７７ｍｇ、５．１２ｍｍｏｌ）を加えた。容器を閉じ、浴温８０℃で２．５時間撹拌した。水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出した。有機相を脱水し、減圧下に溶媒留去した。残留物を、シリカでの（１０ｇ）カラムクロマトグラフィー、溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル（１５％から３５％）によって精製した。得られた固体を、ＭＴＢＥ（３０ｍＬ）及びメタノール（１．５ｍＬ）の混合物中で撹拌し、濾去し、真空乾燥した。

【０５３４】

収量：２．０３ｇ（理論値の８２％）。

【０５３５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．１３分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５３４［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０５３６】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（６００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：２．０５６（０．４０）、２．１９９（０．４３）、２．２０８（０．４４）、２．２１４（０．４４）、３．２６９（０．６５）、３．２８０（１．０４）、３．２８９（１．１５）、３．３００（１．３６）、３．３０７（１．１７）、３．３２１（０．６１）、３．３３５（１６．００）、４．２３３（０．７８）、４．２３７（０．５３）、４．２４７（０．

５９）、４．２５１（０．４９）、４．２６１（０．４９）、４．２６７（０．６２）、４．２７２（０．５４）、４．２７８（０．６３）、５．２３９（０．４２）、５．２４６（０．５４）、５．２６０（０．４２）、６．７８１（１．２４）、６．７９４（１．３２）、６．９１１（０．７０）、６．９１５（０．７４）、６．９２８（０．４０）、７．１５０（０．５９）、７．１６２（０．９６）、７．１７５（０．４９）、７．３１０（０．４７）、７．３１２（０．４７）、７．３２３（０．５９）、７．３２４（０．５７）、７．３３６（０．５３）、７．３３８（０．５３）、７．３４８（０．７１）、７．３５０（０．７２）、７．３５７（１．０４）、７．３７０（０．９５）、７．４２０（０．４６）、７．４３２（１．０４）、７．４４５（１．０７）、７．４５７（０．４２）、７．６６４（０．７６）、７．６７６（１．５１）、７．６９０（２．５７）、７．６９３（１．６０）、７．７０４（２．４９）、７．７１６（０．６８）、８．２８１（１．１５）、８．２８３（１．１４）、８．２９５（１．０７）、８．２９７（１．０２）、８．５８８（１．７０）、８．５９５（１．８２）、９．１６６（０．５４）、９．１８０（１．０３）、９．１９５（０．５６）。

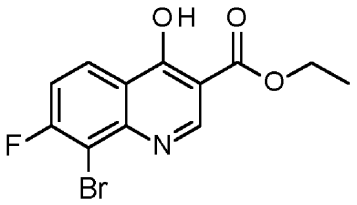
【０５３７】

８－（３－クロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（ジメチル－アミノ）－７－フルオロキノリン－３－カルボキサミド（実施例１４１）の合成

段階１

エチル８－ブロモ－７－フルオロ－４－ヒドロキシキノリン－３－カルボキシレート

【化１５２】



【０５３８】

２－ブロモ－３－フルオロアニリン（２４．８９ｇ、１３１ｍｍｏｌ）及びジエチルエトキシメチレンマロネート（２８．３３ｇ、１３１ｍｍｏｌ、２６ｍＬ）の混合物を室温で１６時間撹拌した。２５０℃で減圧（６０ｍｂａｒ）下に６時間にわたり、撹拌を続けた。反応混合物を放冷して室温とした。固体残留物を還流酢酸エチル（４００ｍＬ）中で撹拌した。沈殿を濾去し、酢酸エチルで洗浄した。固体を、還流エタノール（４００ｍＬ）及びメタノール（４０ｍＬ）の混合物中で撹拌した。得られた熱懸濁液を濾去した。固体をエタノールで洗浄し、風乾した。

【０５３９】

収量：２８．６０ｇ（８３ｍｍｏｌ、理論値の６３％）。

【０５４０】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ２）：R_t＝１．７３分、ｍ／ｚ＝３１４／３１６（Ｍ＋Ｈ）$^+$。

【０５４１】

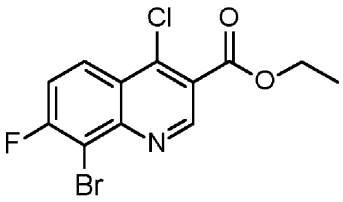
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ１１．７８（ｓ、１Ｈ）、８．４５（ｓ、１Ｈ）、８．２２（ｍ、１Ｈ）、７．５０－７．３９（ｍ、１Ｈ）、４．２３（ｄ、Ｊ＝７．１Ｈｚ、２Ｈ）、１．２８（ｔ、Ｊ＝７．１Ｈｚ、３Ｈ）。

【０５４２】

段階２

エチル８－ブロモ－４－クロロ－７－フルオロキノリン－３－カルボキシレート

【化１５３】



【０５４３】

オキシ塩化リン（３８．４ｇ、２５０ｍｍｏｌ、２３ｍＬ）を撹拌しながら、それにエチル８－ブロモ－７－フルオロ－４－ヒドロキシキノリン－３－カルボキシレート（段階１）（２３．６ｇ、７５ｍｍｏｌ）を加えた。得られた懸濁液を８０℃で１時間撹拌した。混合物を放冷して室温とし、高撹拌した氷水（１００ｍＬ）に投入した。得られた混合物を室温で２日間静置した。沈殿を濾過によって回収し、濾液が中性となるまで水で洗浄した。固体をジエチルエーテル及びジイソプロピルエーテルの混合物（１：１；１リットル）中で磨砕した。固体を濾去した。濾液を減圧下に２５℃で濃縮した。残留物をトルエンと共留去した後、標題化合物２１．３ｇ（６４ｍｍｏｌ、理論値の８５％）を得た。

【０５４４】

収量：２１．３ｇ（６４ｍｍｏｌ、理論値の８５％）。

【０５４５】

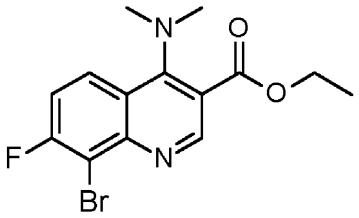
ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ２）：R_t＝２．１８分、ｍ／ｚ＝３３２／３３４（Ｍ＋Ｈ）$^+$。

【０５４６】

段階３

エチル８－ブロモ－４－（ジメチルアミノ）－７－フルオロキノリン－３－カルボキシレート

【化１５４】



【０５４７】

エチル８－ブロモ－４－クロロ－７－フルオロキノリン－３－カルボキシレート（段階２）（１４．３１ｇ、４３ｍｍｏｌ）の脱水テトラヒドロフラン（１５０ｍＬ）中溶液に、トリエチルアミン（８．７１ｇ、８６ｍｍｏｌ、１２ｍＬ）及びジメチルアミン（２Ｍテトラヒドロフラン中溶液；４８ｍｍｏｌ、２４ｍＬ）を加えた。反応混合物を室温で１６時間撹拌した。固体を濾去し、テトラヒドロフランで洗浄した。濾液を減圧下に濃縮して、標題化合物を得た。

【０５４８】

収量：１２．６６ｇ（３７ｍｍｏｌ、理論値の８６％）。

【０５４９】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ２）：R_t＝１．７５分、ｍ／ｚ＝３４１／３４３（Ｍ＋Ｈ）$^+$。

【０５５０】

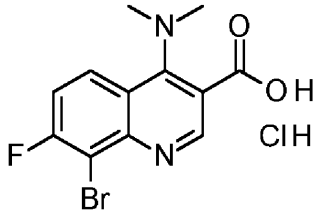
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ８．８６（ｓ、１Ｈ）、８．２８（ｄｄ、Ｊ＝９．４、６．１Ｈｚ、１Ｈ）、７．６３（ｄｄ、Ｊ＝９．４、８．２Ｈｚ、１Ｈ）、４．３９（ｑ、Ｊ＝７．１Ｈｚ、２Ｈ）、３．０７（ｓ、６Ｈ）、１．３６（ｔ、Ｊ＝７．１Ｈｚ、３Ｈ）。

【０５５１】

段階４

エチル８－ブロモ－４－（ジメチルアミノ）－７－フルオロキノリン－３－カルボキシレート塩酸塩

【化１５５】



【０５５２】

エチル８－ブロモ－４－（ジメチルアミノ）－７－フルオロキノリン－３－カルボキシレート（段階３）（１４．０ｇ、４１ｍｍｏｌ）のテトラヒドロフラン（１００ｍＬ）中溶液に、水酸化リチウム１水和物（１１．５ｇ、２７４ｍｍｏｌ）の水（１００ｍＬ）中溶液を加えた。混合物を７５℃で１６時間攪拌し、放冷して室温とした。層を分離し、水層をテトラヒドロフランで抽出した（１５０ｍＬで２回）。合わせた有機層を減圧下に濃縮し、塩酸（４Ｍ；１００ｍＬ）を加えた。固体を濾去し、水及びジエチルエーテルで洗浄し、風乾して、標題化合物を得た。

【０５５３】

収量：１０．６ｇ（３０ｍｍｏｌ、理論値の７４％）。

【０５５４】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ２）：R_t＝１．２１分、ｍ／ｚ＝３１３／３１５（Ｍ＋Ｈ）$^+$。

【０５５５】

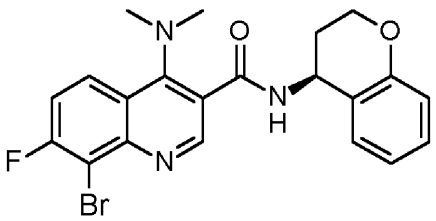
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ８．７３（ｓ、１Ｈ）、８．４１（ｄｄ、Ｊ＝９．４、５．７Ｈｚ、１Ｈ）、７．６６（ｄｄ、Ｊ＝９．４、８．１Ｈｚ、１Ｈ）、３．３５（ｓ、６Ｈ）［酸性プロトンは検出されなかった。］。

【０５５６】

段階５

８－ブロモ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（ジメチルアミノ）－７－フルオロキノリン－３－カルボキサミド

【化１５６】



【０５５７】

８－ブロモ－４－（ジメチルアミノ）－７－フルオロキノリン－３－カルボン酸塩酸塩（段階４）（２．００ｇ、５．７ｍｍｏｌ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（５０ｍＬ）中溶液に、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－オキサイド・ヘキサフルオロホスフェート（２．１８ｇ、５．７ｍｍｏｌ）及びＮ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（４．２１ｇ、３２．６ｍｍｏｌ、５．７ｍＬ）を加えた。混合物を室温で１時間攪拌した。（４Ｓ）－クロマン－４－アミン塩酸塩（１．０６ｇ、５．７ｍｍｏｌ）を加えた。反応混合物を室温で１６時間攪拌した。混合物を水（２００ｍＬ）に投入した。固体を濾去し、水で洗浄し、真空乾燥した。トルエン及び酢酸エチルで共留去後、標題化合物を得た。

【０５５８】

収量：１．９０ｇ（４．３ｍｍｏｌ、理論値の７５％）。

【０５５９】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ２）：R_t＝１．７８分、ｍ／ｚ＝４４４／４４６（Ｍ＋Ｈ）$^+$。

【０５６０】

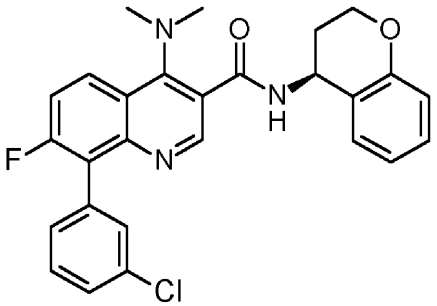
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ９．１２（ｄ、Ｊ＝８．１Ｈｚ、１Ｈ）、８．７０（ｓ、１Ｈ）、８．２３（ｄｄ、Ｊ＝９．４、６．１Ｈｚ、１Ｈ）、７．５９（ｄｄ、Ｊ＝９．３、８．３Ｈｚ、１Ｈ）、７．３７（ｄ、Ｊ＝６．８Ｈｚ、１Ｈ）、７．２２－７．１４（ｍ、１Ｈ）、６．９８－６．９０（ｍ、１Ｈ）、６．８１（ｄｄ、Ｊ＝８．２、１．０Ｈｚ、１Ｈ）、５．２９－５．２０（ｍ、１Ｈ）、４．３４－４．１９（ｍ、２Ｈ）、３．０６（ｓ、６Ｈ）、２．２７－２．１５（ｍ、１Ｈ）、２．１１－２．００（ｍ、１Ｈ）。

【０５６１】

段階６

８－（３－クロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（ジメチル－アミノ）－７－フルオロキノリン－３－カルボキサミド（実施例１４１）

【化１５７】



【０５６２】

８ｍＬスクリューキャップ式バイアル中、８－ブロモ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（ジメチルアミノ）－７－フルオロキノリン－３－カルボキサミド（１００ｍｇ、０．２２５ｍｍｏｌ）、（３－クロロフェニル）ボロン酸（４２ｍｇ、０．２７０ｍｍｏｌ）及び炭酸ナトリウム（７２ｍｇ、０．６７５ｍｍｏｌ）のテトラヒドロフラン（１．３０ｍＬ）及び水（０．２５ｍＬ）混合液中の脱気（１分、窒素）混合物に、１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロライド（３ｍｇ、０．００５ｍｍｏｌ）を加えた。反応混合物を６０℃で１６時間攪拌し、冷却して室温とした。水（５ｍＬ）を加え、水層を相分離器によってジクロロメタンで抽出した（３ｍＬで３回）。溶媒を減圧下に除去した。フラッシュカラムクロマトグラフィー（ヘプタン、５％から３５％酢酸エチル）による精製によって、標題化合物を得た。

【０５６３】

収量：５６ｍｇ（０．１１８ｍｍｏｌ、理論値の５２％）。

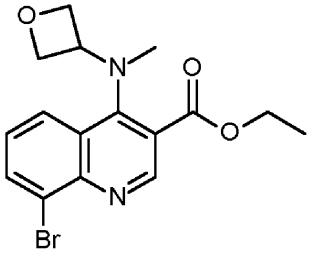
【０５６４】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ２）：R_t＝３．０３分、ｍ／ｚ＝４７６（Ｍ＋Ｈ）$^+$。

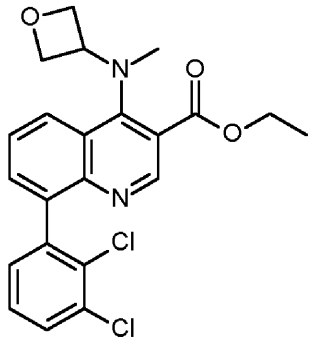
【０５６５】

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ９．０８（ｄ、Ｊ＝８．２Ｈｚ、１Ｈ）、８．５８（ｓ、１Ｈ）、８．２７（ｄｄ、Ｊ＝９．４、６．２Ｈｚ、１Ｈ）、７．６０（ｔ、Ｊ＝９．３Ｈｚ、１Ｈ）、７．５５－７．４５（ｍ、３Ｈ）、７．４３－７．３１（ｍ、２Ｈ）、７．２０－７．１２（ｍ、１Ｈ）、６．９５－６．８８（ｍ、１Ｈ）、６．８３－６．７６（ｍ、１Ｈ）、５．２８－５．１９（ｍ、１Ｈ）、４．３２－４．１９（ｍ、２Ｈ）、３．０７（ｓ、６Ｈ）、２．２５－２．１４（ｍ、１Ｈ）、２．０９－１．９８（ｍ、１Ｈ）。

【０５６６】
８－（２，３－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－［メチル（オキセタン－３－イル）アミノ］キノリン－３－カルボキサミド（実施例３３１）の合成
段階１
エチル８－ブロモ－４－［メチル（オキセタン－３－イル）アミノ］キノリン－３－カルボキシレート
【化１５８】



【０５６７】
フラスコに、アセトニトリル４０ｍＬ中のエチル８－ブロモ－４－クロロキノリン－３－カルボキシレート（１．２６ｇ、４ｍｍｏｌ）（Ｚａｓｋ，ａｌ．　Ｂｉｏｏｒｇａｎｉｃ　ａｎｄ　Ｍｅｄｉｃｉｎａｌ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ　Ｌｅｔｔｅｒｓ，２００３，１４８７－１４９０；Ｌａｘｍｉｋａｎｔ，ａｌ．　ＵＳ２０１３／２１０８４４）、１－メチル－３－オキセタンアミン（０．４２ｇ、４ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（０．６２ｇ、４．８ｍｍｏｌ）を入れた。反応混合物を２４時間還流させた。次に、溶媒を減圧下に除去し、残った取得物を酢酸エチルに溶かし、水で２回洗浄した。有機相を分離し、硫酸カルシウムで脱水し、濾過し、濾液を減圧下に除去した。得られた残留物を逆相カラムクロマトグラフィー（溶離液：水／アセトニトリル勾配）によって精製した。
【０５６８】
収量：１．２ｇ（３．２ｍｍｏｌ、理論値の８２％）。
【０５６９】
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ８．９４（ｓ、１Ｈ）、８．２０（ｄ、１Ｈ）、８．１４（ｄ、１Ｈ）、７．５５（ｄｄ、１Ｈ）、４．７２－４．６２（ｍ、５Ｈ、オキセタニル）、４．４３－４．３８（ｑ、２Ｈ）、３．１０（ｓ、３Ｈ）、１．３７（ｔ、３Ｈ）。
【０５７０】
段階２
エチル８－（２，３－ジクロロフェニル）－４－［メチル（オキセタン－３－イル）アミノ］キノリン－３－カルボキシレート
【化１５９】



【０５７１】

マイクロ波バイアル中、脱気（１分、アルゴン）したエチル８－ブロモ－４－［メチル（オキセタン－３－イル）アミノ］キノリン－３－カルボキシレート（段階１）（５００ｍｇ、１．３７ｍｍｏｌ）、（２，３－ジクロロフェニル）ボロン酸（２６１ｍｇ、１．３７ｍｍｏｌ）、炭酸セシウム水溶液（２Ｍ、１．３７ｍＬ、２．７４ｍｍｏｌ）及びジオキサン（１２．５ｍＬ）の混合物に、１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロライド（１１１ｍｇ、０．１４ｍｍｏｌ）を加えた。反応混合物を、Ｂｉｏｔａｇｅマイクロ波オーブン中、１００℃２５分間処理した。反応混合物を硫酸ナトリウム／シリカゲルカートリッジによって濾過し、逆相カラムクロマトグラフィー（溶離液：水／アセトニトリル勾配）によって精製した。

【０５７２】

収量：６００ｍｇ（理論値の９８％）。

【０５７３】

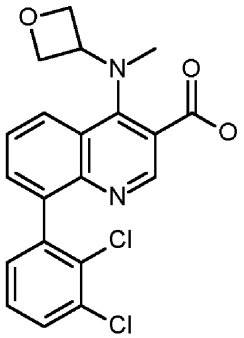
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ８．７７（ｓ、１Ｈ）、８．２１（ｔ、１Ｈ）、７．７４（ｄ、２Ｈ）、７．７１（ｄ、１Ｈ）、７．４５（ｔ、１Ｈ）、７．３６（ｄ、１Ｈ）、４．７６－４．６５（ｍ、５Ｈ、オキセタニル）、４．４０－４．３４（ｑ、２Ｈ）、３．１４（ｓ、３Ｈ）、１．３４（ｔ、３Ｈ）。

【０５７４】

段階３

８－（２，３－ジクロロフェニル）－４－［メチル（オキセタン－３－イル）アミノ］キノリン－３－カルボン酸

【化１６０】



【０５７５】

エチル８－（２，３－ジクロロフェニル）－４－［メチル（オキセタン－３－イル）アミノ］キノリン－３－カルボキシレート（段階２）（５８０ｍｇ、１．３４ｍｍｏｌ）をジオキサン２０ｍＬに溶かし、水５ｍＬ中のＬｉＯＨ（３５．４ｍｇ、１．４８ｍｍｏｌ）と混合した。反応混合物を６０℃で１６時間加熱した。ジオキサンを減圧下に除去し、残った溶液を酢酸エチル及び水の混合物に取った。水相を分離し、ｐＨ５となるまで１ＮＨＣｌで処理した。この酸性化溶液を酢酸エチルで２回抽出し、合わせた抽出液を脱水し、濾過し、溶媒を減圧下に除去した。得られた化合物を、それ以上精製せずに次の段階で用いた。

【０５７６】

収量：５７０ｍｇ（理論値の９９％）。

【０５７７】

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ１２．００（ｂｓ、１Ｈ、ＣＯＯＨ）、８．７３（ｓ、１Ｈ）、８．２４－８．２２（ｄｄ、１Ｈ）、７．２３－７．６８（ｍ、３Ｈ）、７．４４（ｔ、１Ｈ）、７．３７－７．３５（ｄｄ、１Ｈ）、４．７６－４．６５（ｍ、５Ｈ、オキセタニル）、３．１３（ｓ、３Ｈ）。

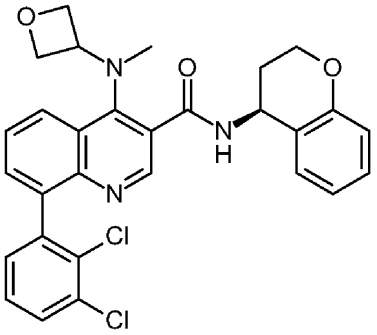
【０５７８】

段階４

８－（２，３－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロ

メン－４－イル］－４－［メチル（オキセタン－３－イル）アミノ］－キノリン－３－カルボキサミド（実施例３３１）

【化１６１】



【０５７９】

フラスコに、ジクロロメタン１０ｍＬ中の８－（２，３－ジクロロフェニル）－４－［メチル（オキセタン－３－イル）アミノ］キノリン－３－カルボン酸（段階３）（２６０ｍｇ、０．６４５ｍｍｏｌ）、（４Ｓ）－クロマン－４－アミン塩酸塩（１３１．７ｍｇ、０．７１ｍｍｏｌ）、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン（２５０ｍｇ、１．９３ｍｍｏｌ）、４－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ）ピリジン（３９．４ｍｇ、０．３２ｍｍｏｌ）、１－ヒドロキシ－１Ｈ－ベンゾトリアゾール（４３．５ｍｇ、０．３２ｍｍｏｌ）及び１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（１２３．６ｍｇ、０．６４５ｍｍｏｌ）を入れた。反応混合物を環境温度で終夜攪拌し、次に水と混合し、ジクロロメタン相を分離し、硫酸ナトリウム／シリカゲルカートリッジによって脱水し、溶媒を減圧下に除去した。残留物を逆相カラムクロマトグラフィー（溶離液：水／アセトニトリル勾配）によって精製して、標題化合物を得た。

【０５８０】

収量：１３０ｍｇ（０．２４ｍｍｏｌ、理論値の３７％）。

【０５８１】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（３９９，９５３２ＭＨｚ、ＤＭＳＯ）：δ＝９．１４０３（１．９４）；９．１２８８（２）；９．１２０８（２．３２）；９．１１０３（１．８５）；８．６０１２（１０．５４）；８．４７１５（０．５８）；８．３１５５（１．５７）；８．２１４３（２．２５）；８．１９７５（２．５６）；８．１７２９（１．０６）；７．７３２３（２．０７）；７．７１２７（５．３１）；７．６８９４（１０．４６）；７．６７３７（１．９５）；７．４６３５（１．６７）；７．４５２１（１．７４）；７．４４３３（２．９４）；７．４３３２（２．７７）；７．４２３５（２．０８）；７．４１４３（１．６５）；７．３８２４（１．８６）；７．３６１８（４．６３）；７．３４２８（４．４４）；７．３２２５（１．６３）；７．１８９５（１．８１）；７．１７１（３．６４）；７．１５３５（２．２７）；６．９４３３（２．６）；６．９２５５（４．３２）；６．９０８４（２．０２）；６．８０５９（４．７７）；６．７８４８（４．４５）；６．５７８２（０．９）；５．２４８８（１．９７）；５．２３７（２）；４．７２５（１．９１）；４．６９７（７．０４）；４．６７２２（５．４８）；４．６５７５（５．６）；４．５９５５（１．２２）；４．５８４４（１．６１）；４．２９２１（２．１７）；４．２７５２（３．９４）；４．２６７５（３．６４）；４．２５５２（２．２３）；４．２４７１（２．４１）；４．２２８１（０．８９）；３．３１８３（３１９．３４）；３．２７０１（０．８７）；３．２４９６（０．６１）；３．１７４７（０．７１）；３．０８１（１６）；３．０７５９（１５．５４）；２．９４９７（１．０８）；２．６７０３（８．９６）；２．５８９３（０．６３）；２．５０５１（１２３９．６）；２．５０１２（１５８３．２４）；２．４９７１（１２０４．２４）；２．３２７６（９．３）；２．２８３２（０．８８）；２．２４７５（１．３４）；２．２２８６（１．７２）；２．２２０５（１．７８）；２．１３１３（０．９６）；２．０７４（

５．９２）；２．０１６８（０．９６）；１．２６９４（０．８７）；１．１６９（４．４７）；１．００３４（０．７１）；０．９８８７（０．７５）；０．１４６３（２．９３）；－０．０００１（６４２．４７）；－０．０７９２（０．６７）；－０．１４９７（３．１３）；－３．３０８３（０．５５）。

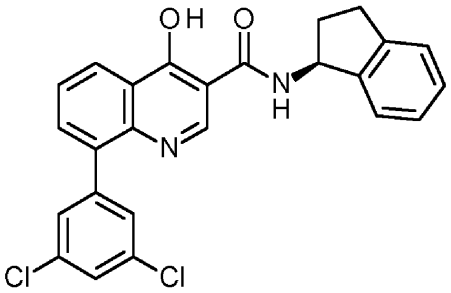
【０５８２】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（１Ｓ）－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル］－４－エトキシキノリン－３－カルボキサミド（実施例１３４）の合成

段階１

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（１Ｓ）－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル］－４－ヒドロキシキノリン－３－カルボキサミド

【化１６２】



【０５８３】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－４－ヒドロキシキノリン－３－カルボン酸（５．５０ｇ、１６．５ｍｍｏｌ）のＴＨＦ中溶液を、（１Ｓ）－インダン－１－アミン（２．５ｍＬ、２０ｍｍｏｌ）及びトリメチルアミン（９．２ｍＬ、６６ｍｍｏｌ）とともに環境温度で１０分間攪拌して処理した。次に、２，４，６－トリプロピル－１，３，５，２，４，６－トリオキサトリホスフィナン２，４，６－トリオキサイドの酢酸エチル中溶液（１９．６ｍＬ、含有率５０％、３３ｍｍｏｌ）を環境温度で加え、終夜攪拌した。水（１００ｍＬ）を加え、ＴＨＦを減圧下に留去した。追加の水及び酢酸エチルを加え、混合物を濾過によって透明化した。水相を酢酸エチルで抽出し、合わせた有機相を脱水し、減圧下に溶媒留去した。残留物を、シクロヘキサン／酢酸エチル（１５％から４０％）を用いるシリカ（３４０ｇ）でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。二つの分画を単離した。

【０５８４】

収量：３．０ｇ（純度９８％、理論値の４０％）及び０．６９ｇ（純度９４％、理論値の９％）。

【０５８５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．２７分；ＭＳ（ＥＳＩｎｅｇ）：ｍ／ｚ＝４４７［Ｍ＋Ｈ］$^-$。

【０５８６】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：１．８４９（１．８７）、１．８６８（２．３９）、１．８８０（２．５９）、１．９００（２．５０）、１．９２１（１．１６）、２．５７８（３．７４）、２．５８８（３．０８）、２．８４１（１．０３）、２．８６２（１．８２）、２．８８２（２．６５）、２．９０２（３．５４）、２．９２２（２．００）、２．９７７（２．５６）、２．９９０（２．７１）、２．９９９（２．７１）、３．０２９（１．７４）、５．４７４（１．１６）、５．４９３（３．５２）、５．５１２（３．７７）、５．５３１（１．６７）、７．１９７（１．２７）、７．２１４（３．９１）、７．２３３（６．１７）、７．２５６（５．５６）、７．２８０（７．００）、７．２９８（９．８９）、７．３１６（４．５２）、７．５２１（２．８３）、７．５４０（５．６１）、７．５６０（４．０６）、７．６２６（１４．５３）、７．６３１（１６．００）、７．６９５（５．８７）、７．７１３（５

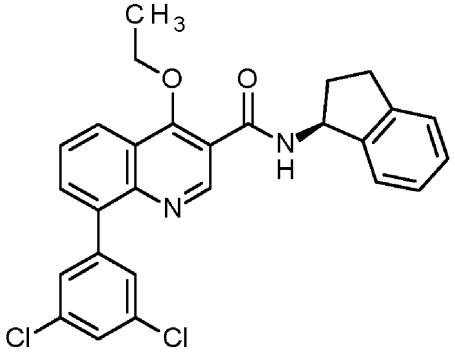
．０６）、７．８０４（５．４２）、８．２９７（４．５８）、８．３１８（４．６８）、８．６１１（４．３５）、８．６２４（４．６９）、１０．２８５（４．４４）、１０．３０４（４．７２）、１１．６３７（３．５３）。

【０５８７】

段階２

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（１Ｓ）－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル］－４－エトキシキノリン－３－カルボキサミド（実施例１３４）

【化１６３】



【０５８８】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（１Ｓ）－２，３－ジヒドロ－１Ｈ－インデン－１－イル］－４－ヒドロキシキノリン－３－カルボキサミド（段階１）（７０．０ｍｇ、１５６μｍｏｌ）、エタノール（２７μＬ、４７０μｍｏｌ）、トリフェニルホスフィン（６１．３ｍｇ、２３４μｍｏｌ）及びジイソプロピル－（Ｅ）－ジアゼン－１，２－ジカルボキシレート（４６μＬ、２３０μｍｏｌ）を、ＴＨＦ（１ｍＬ）中にて環境温度で６時間撹拌した。５Ｍギ酸（９３μＬ、４７０μｍｏｌ）を加え、溶媒留去し、残留物を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０５８９】

収量：４０ｍｇ（純度９２％、理論値の４９％）。

【０５９０】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ７）：R_t＝２．６０分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４７７［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０５９１】

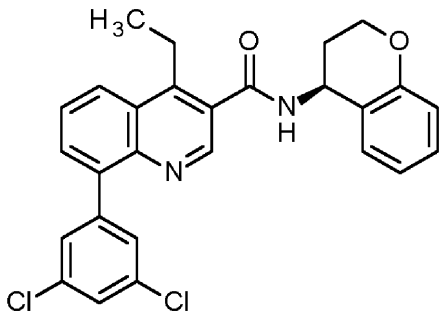
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（ピークリスト）（５００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００７（４．１５）、０．００７（３．６７）、１．２３５（１．２６）、１．３９５（７．５６）、１．４０９（１６．００）、１．４２３（７．７２）、１．９５０（１．１８）、１．９６６（１．２８）、１．９７５（１．３４）、１．９９１（１．３０）、２．５２２（１．９８）、２．８５３（１．２４）、２．８６９（１．５１）、２．８８５（１．９２）、２．９０１（０．８５）、２．９８１（１．０３）、２．９８９（１．０９）、２．９９９（１．１１）、３．００６（１．０７）、３．０１３（０．８１）、３．２８６（５．８４）、４．３５２（１．５１）、４．３５４（１．５３）、４．３６６（４．５６）、４．３６８（４．８３）、４．３８０（４．４６）、４．３８３（４．７９）、４．３９４（１．３８）、４．３９６（１．５１）、５．５３３（０．７８）、５．５４９（２．２９）、５．５６４（２．２７）、５．５８０（０．７８）、５．７５４（０．９１）、７．２２７（２．０２）、７．２３１（３．４９）、７．２３８（４．４６）、７．２４５（４．５２）、７．２４９（３．３４）、７．２６０（１．１１）、７．２７８（２．９９）、７．２９０（１．６５）、７．２９４（１．２０）、７．４００（２．１９）、７．４０６（２．３３）、７．４１７（２．００）、７．６５４（２．３５）、７．６５８（５．３５）、７．６６１（４．９８）、７．６７４（１５．７７）、

７．６７８（１０．５５）、７．７１４（２．５２）、７．７２９（３．３９）、７．７３１（３．３２）、７．７４５（２．９７）、７．８８９（３．４７）、７．８９１（３．８０）、７．９０３（３．０１）、７．９０６（３．０３）、８．３０４（３．３２）、８．３０７（３．５７）、８．３２１（３．１６）、８．３２４（３．１６）、８．８４２（１１．９３）、８．９９８（２．８３）、９．０１５（２．７７）。

【０５９２】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－エチルキノリン－３－カルボキサミド（実施例３５０）の合成

【化１６４】



【０５９３】

ジエチル亜鉛のヘプタン中溶液（４００μＬ、１．０Ｍ、４００μｍｏｌ）を、４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（段階４、実施例４）（９７ｍｇ、２００μｍｏｌ）及び１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン－パラジウム（ＩＩ）ジクロライドジクロロメタン錯体（３２．７ｍｇ、４０．０μｍｏｌ）のジオキサン（２ｍＬ）中混合物に滴下し、アルゴン雰囲気下に９０℃で終夜撹拌した。５Ｍギ酸（１６０μＬ、５．０Ｍ、８００μｍｏｌ）及びＤＭＳＯ（１ｍＬ）を加え、濾過した混合物を、分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって２回精製した。

【０５９４】

収量：５２ｍｇ（純度９８％、理論値の５３％）。

【０５９５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．３５分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４７７［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

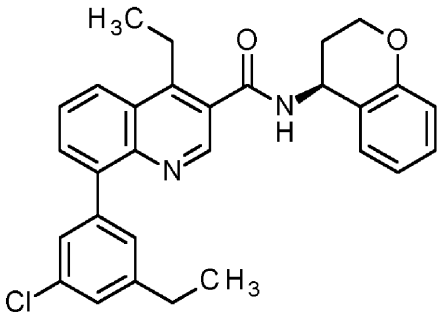
【０５９６】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：１．３０３（２．４３）、１．３２２（５．６１）、１．３４１（２．５０）、３．２５２（２．０９）、３．２７１（２．０６）、４．２５０（１．０６）、４．２５９（１．６２）、４．２６８（１．９５）、４．２７５（１．５４）、４．２８４（１．０６）、５．３０５（０．９２）、５．３２５（０．９２）、６．７８３（１．５３）、６．７８５（１．６６）、６．８０３（１．７５）、６．８０６（１．８３）、６．９１１（０．７８）、６．９１４（０．８３）、６．９３０（１．７２）、６．９３２（１．７１）、６．９４８（１．０３）、６．９５１（１．００）、７．１４９（０．８６）、７．１５３（０．８９）、７．１７０（１．４３）、７．３５０（１．４８）、７．３７０（１．４１）、７．６５２（１６．００）、７．７５２（１．０９）、７．７７０（１．６８）、７．７９１（１．４７）、７．８７１（１．９３）、７．８７４（２．０４）、７．８８９（１．４４）、７．８９２（１．４２）、８．３１９（１．５０）、８．３２２（１．５８）、８．３４０（１．４３）、８．３４３（１．３９）、８．８３９（５．７７）、９．１０２（１．６０）、９．１２３（１．５５）。

【０５９７】

８－（３－クロロ－５－エチルフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－エチルキノリン－３－カルボキサミド（実施例３５１）の単離

【化１６５】



【０５９８】

実施例３５０に記載の分取ＨＰＬＣ分離によって、標題化合物を副生成物として得た。

【０５９９】

収量：１２ｍｇ（純度１００％、理論値の１３％）。

【０６００】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．３６分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４７１［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

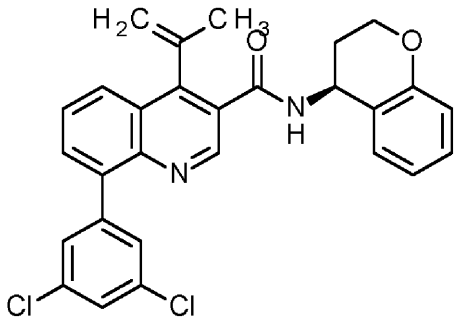
【０６０１】

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）：δ［ｐｐｍ］＝９．１０（ｄ、１Ｈ）、８．８１（ｓ、１Ｈ）、８．２９（ｄｄ、１Ｈ）、７．７２－７．８３（ｍ、２Ｈ）、７．４６（ｔ、１Ｈ）、７．３１－７．４０（ｍ、３Ｈ）、７．１７（ｔ、１Ｈ）、６．９３（ｔｄ、１Ｈ）、６．７９（ｄｄ、１Ｈ）、５．２７－５．３５（ｍ、１Ｈ）、４．２２－４．３１（ｍ、２Ｈ）、３．２１－３．２９（ｍ、２Ｈ）水シグナルと重なる、２．６４－２．７３（ｍ、２Ｈ）、２．１６－２．２６（ｍ、１Ｈ）、２．０１－２．１１（ｍ、１Ｈ）、１．３２（ｔ、３Ｈ）、１．２３（ｔ、３Ｈ）。

【０６０２】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（プロパ－１－エン－２－イル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例３１７）の合成

【化１６６】



【０６０３】

アルゴン雰囲気及び連続超音波処理下に、炭酸カリウム（５７１ｍｇ、４．１３ｍｍｏｌ）を、肉厚容器中、５：１脱気ジオキサン及び水（７．０ｍＬ）混合液に溶かした。１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン－パラジウム（ＩＩ）ジクロライドジクロロメタン錯体（８４．４ｍｇ、１０３μｍｏｌ）及び４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キ

ノリン－３－カルボキサミド（段階４、実施例４）（１．００ｇ、２．０７ｍｍｏｌ）を加え、次に４，４，５，５－テトラメチル－２－（プロパ－１－エン－２－イル）－１，３，２－ジオキサボロラン（０．４９ｍＬ、４．１ｍｍｏｌ）を加えた。容器にキャップを施し、８０℃で４時間攪拌した。５Ｍギ酸（１．３ｍＬ）及び水を加え、混合物を酢酸エチルで抽出した。有機相を脱水し、減圧下に溶媒留去した。残留物を、シリカ（５０ｇ）でのカラムクロマトグラフィー、溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル（７％から１６％）によって精製した。

【０６０４】

収量：８８５ｍｇ（理論値の８７％）。

【０６０５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．３９分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４８９［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

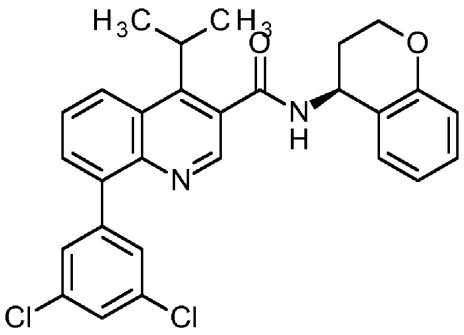
【０６０６】

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）：シフト［ｐｐｍ］＝８．８８－９．００（ｍ、２Ｈ）、８．０４（ｄｄ、１Ｈ）、７．９０（ｄｄ、１Ｈ）、７．７６（ｄｄ、１Ｈ）、７．６７（ｓ、３Ｈ）、７．３２（ｂｒｄ、１Ｈ）、７．１１－７．２２（ｍ、１Ｈ）、６．９２（ｔ、１Ｈ）、６．７８（ｄｄ、１Ｈ）、５．５４（ｓ、１Ｈ）、５．１８－５．３０（ｍ、１Ｈ）、５．０３（ｂｒｓ、１Ｈ）、４．１６－４．３３（ｍ、２Ｈ）、２．１２－２．２６（ｍ、４Ｈ）、１．９５－２．０６（ｍ、１Ｈ）。

【０６０７】

８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－イソプロピル－キノリン－３－カルボキサミド（実施例３５９）の合成

【化１６７】



【０６０８】

アルゴン雰囲気下に、８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（プロパ－１－エン－２－イル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例３１７から）（１５０ｍｇ、３０６μｍｏｌ）を酢酸エチル（７ｍＬ）及びエタノール（３．５ｍＬ）に溶かした。Ｐｄ／活性炭（４４ｍｇ、１０％）を加え、混合物を、常圧下に環境温度で１．５時間水素化した。触媒をセライトで濾去し、酢酸エチル／エタノール混合物（２：１）で洗浄し、濾液を減圧下に溶媒留去した。残留物を、分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって２回精製した。

【０６０９】

収量：６４ｍｇ（理論値の４２％）。

【０６１０】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．４１分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４９１［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６１１】

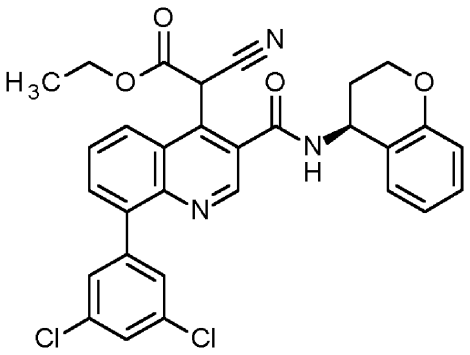
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）：シフト［ｐｐｍ］＝９．１２（ｄ、１

Ｈ）、８．７６（ｓ、１Ｈ）、８．４５（ｄ、１Ｈ）、７．８５（ｄ、１Ｈ）、７．７４（ｔ、１Ｈ）、７．６１－７．６６（ｍ、３Ｈ）、７．３６（ｄ、１Ｈ）、７．１７（ｔ、１Ｈ）、６．９３（ｔ、１Ｈ）、６．７９（ｄ、１Ｈ）、５．２５－５．３１（ｍ、１Ｈ）、４．２１－４．３１（ｍ、２Ｈ）、３．８２－３．９２（ｍ、１Ｈ）、２．２１（ｔｄ、１Ｈ）、２．０６（ｄｄｄ、１Ｈ）、１．５６（ｂｒｄ、３Ｈ）、１．５３（ｂｒｄ、３Ｈ）。

【０６１２】

エチルシアノ｛８－（３，５－ジクロロフェニル）－３－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イルカルバモイル］キノリン－４－イル｝アセテート（実施例３５４）の合成

【化１６８】



【０６１３】

アルゴン雰囲気下に、水素化ナトリウム（１６５ｍｇ、含有率６０％、４．１３ｍｍｏｌ）を、エチル－シアノアセテート（０．４４ｍＬ、４．１ｍｍｏｌ）の脱水Ｎ－メチルピロリドン中溶液に０℃で加え、ガス発生が停止するまで環境温度で１５分間攪拌した。次に、４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（１．００ｇ、２．０７ｍｍｏｌ）を加え、混合物を７０℃で３時間攪拌した。冷却して環境温度とした後、５Ｍギ酸（１．２ｍＬ、６．２ｍｍｏｌ）及び水を加え、混合物を酢酸エチルで２回抽出した。合わせた有機相を脱水し、減圧下に溶媒留去した。残留物を、シクロヘキサン／酢酸エチル（５％から５０％）を用いるシリカ（１００ｇ）でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。

【０６１４】

収量：６５０ｍｇ（純度９６％、理論値の５４％）。

【０６１５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ６）：R_t＝２．４６分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５６０［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６１６】

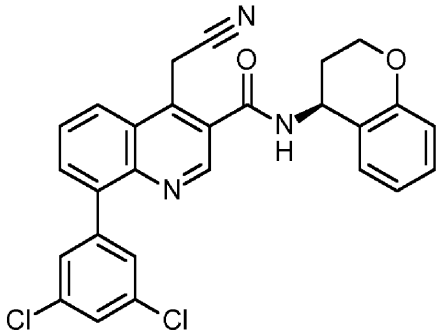
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００８（３．５５）、０．００８（３．２３）、０．１４６（０．４０）、０．８９０（０．４４）、１．１５７（２．４９）、１．１７５（７．５３）、１．１８８（４．４１）、１．１９３（９．２３）、１．２０５（８．２０）、１．２１１（４．２５）、１．２１５（２．５６）、１．２２３（４．２１）、１．２３３（２．０１）、１．２４５（１．５０）、１．２５０（２．１２）、１．２６４（０．７７）、１．２６８（１．０５）、１．９８８（９．００）、２．０８３（０．４５）、２．０９２（０．４８）、２．１０４（０．４６）、２．１１６（０．６５）、２．１２９（０．７０）、２．１６３（１．１４）、２．１７６（１．６０）、２．１８７（１．２６）、２．３２７（０．４７）、２．３６６（０．４１）、２．５２３（１．６７）、２．６６９（０．５４）、２．７１０（０．４６）、３．９９８（２．０３）、４．００２（０．８９）、４．０２１（２．

１４）、４．０３８（２．１４）、４．０５６（０．７９）、４．１３３（０．５１）、４．１５１（０．９８）、４．１６８（０．９３）、４．１７５（０．８３）、４．１８６（０．８４）、４．１９３（１．１１）、４．２０２（２．２１）、４．２１０（１．５１）、４．２１９（４．６６）、４．２２８（３．２０）、４．２３６（４．６６）、４．２４６（３．７３）、４．２５４（２．１５）、４．２６３（１．５３）、４．２７２（０．８５）、４．２８７（１．２１）、４．２９８（１．７２）、４．３０９（１．１６）、５．２２６（０．７８）、５．２４５（０．８３）、５．２６６（０．７９）、５．２８５（０．７３）、６．７９４（１．５６）、６．８０４（５．０５）、６．８１５（１．９１）、６．８２６（４．３０）、６．８３７（０．９２）、６．８５６（１．４２）、６．８６６（０．５２）、６．８７５（０．８７）、６．９１７（０．７１）、６．９３６（１．４５）、６．９５５（０．８６）、７．１４２（０．９６）、７．１４５（０．９５）、７．１６３（１．２８）、７．１７３（０．８３）、７．１７７（０．９３）、７．１９４（１．２０）、７．２１２（０．５８）、７．３８７（１．３４）、７．４０８（１．７９）、７．４２９（１．１４）、７．５９９（０．９９）、７．６０３（１．０４）、７．６８３（１６．００）、７．７０２（０．４３）、７．８７５（１．０５）、７．８７９（１．００）、７．８９７（２．３７）、７．９１４（１．６２）、７．９１８（１．５５）、８．００２（３．３０）、８．０１９（２．４１）、８．４０８（１．１８）、８．４２３（１．４８）、８．４４３（１．１５）、９．１１２（４．７２）、９．１２４（４．２９）、９．５１７（１．４９）、９．５２５（１．４４）、９．５３７（１．５１）、９．５４４（１．３４）。

【０６１７】

４－（シアノメチル）－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例３５５）の合成

【化１６９】



【０６１８】

エチルシアノ｛８－（３，５－ジクロロフェニル）－３－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イルカルバモイル］キノリン－４－イル｝アセテート（実施例３５４）（３００ｍｇ、０．５４ｍｍｏｌ）のＤＭＳＯ（２．４ｍＬ）中溶液を塩化ナトリウム（６３ｍｇ、１．１ｍｍｏｌ）及び水（０．２４ｍＬ）で処理し、撹拌下に９０℃で終夜加熱した。水（２．５ｍＬ）を加え、沈殿を濾去し、水で洗浄し、真空乾燥した。

【０６１９】

収量：２５０ｍｇ（純度９９％、理論値の９５％）。

【０６２０】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．２４分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４８８［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６２１】

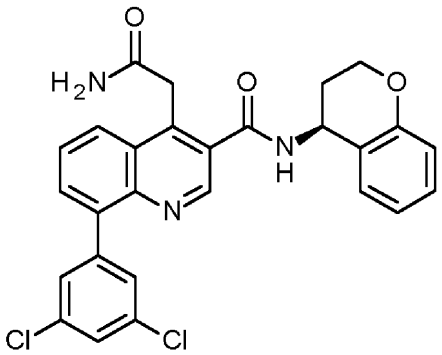
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：２．０９９（０．４３）、２．１３６（０．８０）、２．１４５（０．６９）、２．２０５（０．６４）、２．２２４（０．６７）、２．２３９（０．５４）、４．２６６（１．６８）、４

．２７７（２．２９）、４．７１１（６．９９）、５．２７８（０．４５）、５．２９４（１．０３）、５．３１２（１．０４）、５．３２６（０．４５）、６．７９８（２．０４）、６．８１８（２．３０）、６．８９９（１．０１）、６．９１７（２．０７）、６．９３６（１．１９）、７．１６３（１．０４）、７．１８２（１．６８）、７．２００（０．７９）、７．３８７（１．７６）、７．４０５（１．６２）、７．６７７（１６．００）、７．８８３（１．０６）、７．９０３（１．９２）、７．９２２（１．５６）、７．９８８（２．４６）、８．００６（１．６５）、８．４１７（１．９３）、８．４３７（１．７３）、９．０２９（５．７３）、９．３７９（１．６９）、９．３９９（１．６８）。

【０６２２】

４－（２－アミノ－２－オキソエチル）－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例３６０）の合成

【化１７０】



【０６２３】

４－（シアノメチル）－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例３５５）（１５０ｍｇ、３０７μｍｏｌ）の濃塩酸（０．７７ｍＬ、３７％）及びジオキサン（０．５ｍＬ）中懸濁液を、環境温度で３日間攪拌した。固体を濾去し、ジオキサンで洗浄し、真空乾燥した。

【０６２４】

収量：９０ｍｇ（純度９２％、理論値の５３％）。

【０６２５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．１３分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５０６［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６２６】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．１４９（０．４０）、０．００８（３．４２）、２．０６８（０．５５）、２．０８５（０．６１）、２．０９５（０．８０）、２．２０８（０．７４）、２．２２０（０．７０）、２．２２９（０．６８）、２．２４２（０．５１）、２．３２７（０．６１）、２．３６６（０．６１）、２．６７０（０．５７）、２．７１０（０．５４）、２．７９４（０．７７）、３．５６８（２．６０）、４．１７９（０．５６）、４．１９７（０．５６）、４．２１６（３．９４）、４．２２５（３．８６）、４．２３８（１．１９）、４．２６４（１．３２）、４．２８３（１．００）、５．２７０（０．４６）、５．２８５（１．０６）、５．３０４（１．０７）、５．３１９（０．５１）、６．７７９（１．９４）、６．８００（２．１５）、６．８８３（０．９８）、６．８９９（２．０２）、６．９１８（１．２０）、７．１４７（１．０２）、７．１６４（１．６７）、７．１８５（０．８１）、７．３４９（２．２８）、７．３６９（１．６７）、７．６５９（１６．００）、７．７６４（１．２３）、７．７８２（１．９３）、７．８０３（１．６７）、７．８

９４（２．３５）、７．９１０（１．７４）、７．９８９（１．５５）、８．３４９（１．８３）、８．３６８（１．６８）、８．９４９（６．３２）、９．４６８（１．７６）、９．４８８（１．７５）。

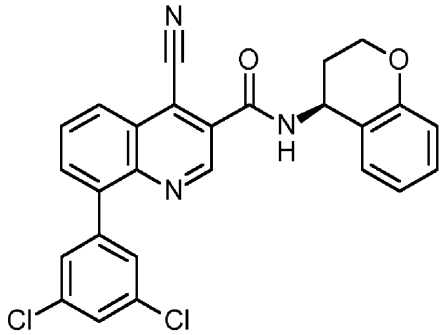
【０６２７】

重炭酸ナトリウム水溶液（７ｍＬ、１．５Ｍ）を加えることで、濾液をｐＨ６に調節し、酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を脱水し、溶媒留去し、残留物を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製して、第２の生成物塊を得た（４０ｍｇ、純度１００％、理論値の２６％）。

【０６２８】

４－シアノ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（実施例３６２）の合成

【化１７１】



【０６２９】

アルゴン雰囲気下、肉厚マイクロ波容器に、４－クロロ－８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］キノリン－３－カルボキサミド（１．００ｇ、２．０７ｍｍｏｌ）、シアン化銅（Ｉ）（１８５ｍｇ、２．０７ｍｍｏｌ）、炭酸ナトリウム（２１９ｍｇ、２．０７ｍｍｏｌ）、１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン－パラジウム（ＩＩ）ジクロライドジクロロメタン錯体（１６９ｍｇ、０．２１ｍｍｏｌ）及びＮ－メチルピロリドン（７．２ｍＬ）を入れ、キャップを施し、撹拌下に１２０℃で終夜加熱した。反応混合物を３：１飽和塩化アンモニウム水溶液／濃アンモニア水（１２０ｍＬ）及び酢酸エチル混合液に加え、３０分間撹拌し、セライトで濾過した。相を分離し、有機相を３：１飽和塩化アンモニウム水溶液／濃アンモニア水混合液で３回洗浄し、次にブラインで洗浄し、脱水した。残留物（１．０６ｇ）を、シクロヘキサン／酢酸エチル（３％から３０％）を用いるシリカ（１００ｇ）でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。

【０６３０】

収量：７６０ｍｇ（純度９３％、理論値の７２％）。

【０６３１】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．４４分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４７４［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６３２】

^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリスト（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：－０．００８（０．７０）、０．００８（０．４９）、１．３９８（１６．００）、１．９８８（０．４５）、２．５１９（０．４３）、６．７９０（０．４８）、６．８４９（０．４４）、６．８５１（０．４５）、６．８７０（０．５１）、６．８７２（０．４８）、６．９６６（０．４０）、７．６７３（０．４１）、７．６９６（４．１２）、７．９３３（０．４３）、７．９５１（０．６０）、７．９５３（０．５４）、７．９７２（０．５３）、８．０５４（０．６７）、８．０５７（０．６２）、８．０７１（０．４９）、８．０７５（０．４１）、９．２７９（０．９６）、９．３１１（０．５０）。

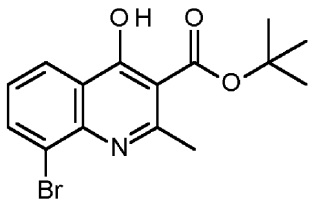
【０６３３】

８－（２，３－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（ジメチルアミノ）－２－メチルキノリン－３－カルボキサミド（実施例４８１）の合成

段階１

ｔｅｒｔ－ブチル８－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－メチルキノリン－３－カルボキシレート

【化１７２】



【０６３４】

三頸フラスコに、水素化ナトリウム（９１０ｍｇ、２２．７ｍｍｏｌ、鉱油中６０％分散品）及び脱水ＤＭＦ（５０ｍＬ）を入れた。３－ブロモイサト酸無水物（５ｇ、２０．６ｍｍｏｌ）をゆっくり加え（０．４２ｇ、４ｍｍｏｌ）、次にＤＭＦ　５０ｍＬに溶かしたｔｅｒｔ－ブチル３－オキソブタノエート（３．６ｇ、２２．７ｍｍｏｌ）を室温で滴下した。反応混合物を加熱して１２０℃として１０分間経過させた。次に、溶媒を減圧下に除去し、残った取得物を水に分散させ、ジクロロメタンで２回抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、真空下に減量した。得られた残留物をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル勾配）によって精製した。

【０６３５】

収量：１．０５ｇ（２．９６ｍｍｏｌ、理論値の１５％）。

【０６３６】

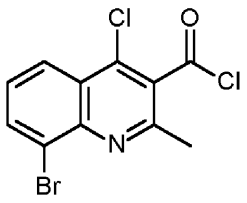
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ１０．４８（ｓ、１Ｈ）、８．１０－８．０８（ｄ、１Ｈ）、８．０２－７．９９（ｄ、１Ｈ）、７．３１－７．２７（ｔ、１Ｈ）、ＤＭＳＯシグナル下のメチル単重線、１．５１（ｓ、９Ｈ）。

【０６３７】

段階２

８－ブロモ－４－クロロ－２－メチルキノリン－３－カルボニルクロライド

【化１７３】



【０６３８】

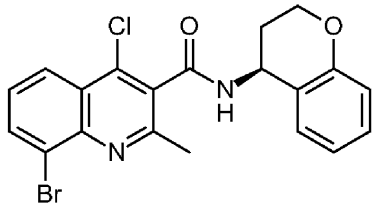
三頸フラスコに、ｔｅｒｔ－ブチル８－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－メチルキノリン－３－カルボキシレート（１．２ｇ、３，５４ｍｍｏｌ））及びオキシ塩化リン（４２ｇ、２７４ｍｍｏｌ）を入れ、１６時間加熱還流した。反応混合物を減圧下に減量し、そのまま次の段階で用いた。

【０６３９】

段階３

８－ブロモ－４－クロロ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－２－メチルキノリン－３－カルボキサミド

【化１７４】



【０６４０】

８－ブロモ－４－クロロ－２－メチルキノリン－３－カルボニルクロライド（段階２からの生の生成物）（１ｇ、３．１３ｍｍｏｌ）をアセトニトリル６０ｍＬに溶かし、（４Ｓ）－クロマン－４－アミン塩酸塩（５８２ｍｇ、３．１３ｍｍｏｌ）及びトリエチルアミン（９５１ｍｇ、９．４ｍｍｏｌ）と０℃で混合した。反応混合物を昇温させて室温とし、変換が完了するまで撹拌した。溶媒を減圧下に除去し、残った溶液をジクロロメタンで２回抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、減圧下に減量した。得られた残留物をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル勾配）によって精製した。

【０６４１】

収量：７６６ｍｇ（１．７７ｍｍｏｌ、理論値の５５％）。

【０６４２】

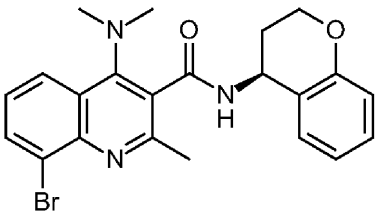
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_{6}$）δ９．２９（ｄ、１Ｈ、ＮＨ）、８．２６－８．２２（ｔ、２Ｈ）、７．６６－７．６２（ｄｄ、１Ｈ）、７．３８－７．３６（ｄ、１Ｈ）、７．２０－７．１６（ｔ、１Ｈ）、６．９７－６．９３（ｔ、１Ｈ）、６．８２－６．８０（ｄ、１Ｈ）、５．３２－５．２８（ｍ、１Ｈ）、４．３４－４．２９（ｍ、１Ｈ）、４．２３－４．１７（ｍ、１Ｈ）、２．７１（ｓ、３Ｈ）、２．２８－２．２２（ｍ、１Ｈ）、２．１０－２．０３（ｍ、１Ｈ）。

【０６４３】

段階４

８－ブロモ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（ジメチルアミノ）－２－メチルキノリン－３－カルボキサミド

【化１７５】



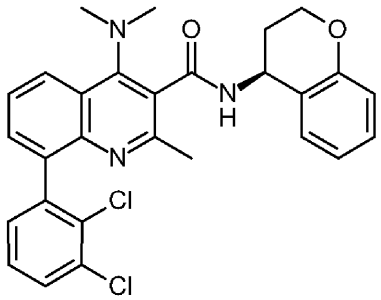
【０６４４】

ジオキサン３０ｍＬ中の８－ブロモ－４－クロロ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－２－メチルキノリン－３－カルボキサミド（段階３）（７６６ｍｇ、１．７７ｍｍｏｌ）を、３個のマイクロ波フラスコ（体積２０ｍＬ）に分配した。そのそれぞれに、ジメチルアミン水溶液３．７ｍＬ（４０％、合わせて８．８７ｍｍｏｌ）を入れた。反応混合物を、マイクロ波オーブン（Ａｎｔｏｎ　Ｐａａｒｓ　Ｍｏｎｏｗａｖｅ　４００）中、加熱して１００℃として４０分経過させた。反応混合物を合わせ、溶媒を減圧下に除去した。得られた残留物をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル勾配）によって精製した。

【０６４５】

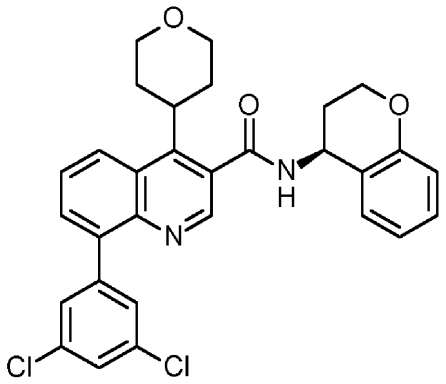
収量：６２５ｍｇ（１．４２ｍｍｏｌ、理論値の７３％）。

【０６４６】
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ９．０７（ｄ、１Ｈ、ＮＨ）、８．０８－８．０２（2ｄ、２Ｈ）、７．４１－７．３７（ｔ、１Ｈ）、７．３２－７．３１（ｄ、１Ｈ）、７．２０－７．１６（ｔ、１Ｈ）、６．９６－６．９２（ｔ、１Ｈ）、６．８２－６．７９（ｄ、１Ｈ）、５．２８－５．２６（ｍ、１Ｈ）、４．３５－４．２７（ｍ、１Ｈ）、４．２３－４．１６（ｍ、１Ｈ）、３．０１（ｓ、６Ｈ）、２．６１（ｓ、３Ｈ）、２．２８－２．１９（ｍ、１Ｈ）、２．１０－２．０２（ｍ、１Ｈ）。
【０６４７】
段階５
８－（２，３－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（ジメチルアミノ）－２－メチルキノリン－３－カルボキサミド（実施例４８１）
【化１７６】



【０６４８】
脱気（１分、アルゴン）した８－ブロモ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（ジメチルアミノ）－２－メチルキノリン－３－カルボキサミド（段階４）（２００ｍｇ、０．４５ｍｍｏｌ）、（２，３－ジクロロフェニル）ボロン酸（１３０ｍｇ、０．６８ｍｍｏｌ）、炭酸カリウム（１２５．５ｍｇ、０．９０ｍｍｏｌ）、水（３，５ｍＬ）及びジオキサン（１２ｍＬ）の混合物に、１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロライド（１８．５ｍｇ、０．０２ｍｍｏｌ）を加えた。反応混合物を８５℃で１６時間攪拌し、冷却して室温とし、水で希釈し、ジクロロメタンで２回抽出した。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで脱水し、濾過し、減圧下に減量した。得られた残留物をシリカゲルフラッシュクロマトグラフィー（溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル勾配）によって精製して、標題化合物を得た。
【０６４９】
収量：１５９ｍｇ（０．３１ｍｍｏｌ、理論値の６６％）。
【０６５０】
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ９．０６（ｄ、１Ｈ、ＮＨ）、８．１７－８．１５（ｄ、１Ｈ）、７．６８－７．６６（ｄ、１Ｈ）、７．５８－７．５５（ｍ、２Ｈ）、７．４２－７．４２（ｍ、１Ｈ）、７．３２－７．３０（ｍ、２Ｈ）、７．１７－７．１５（ｔ、１Ｈ）、６．９３－６．９１（ｔ、１Ｈ）、６．８０－６．７８（ｄ、１Ｈ）、５．２８－５．２４（ｍ、１Ｈ）、４．３２－４．２７（ｍ、１Ｈ）、４．２３－４．１７（ｍ、１Ｈ）、３．０４（ｓ、６Ｈ）、ＤＭＳＯシグナル下のメチル単重線、２．２４－２．１８（ｍ、１Ｈ）、２．０８－２．０２（ｍ、１Ｈ）。
【０６５１】
８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例５３９）の合成

【化１７７】



【０６５２】
アルゴン雰囲気下に、８－（３，５－ジクロロフェニル）－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（３，６－ジヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）キノリン－３－カルボキサミド（６０．０ｍｇ、１１３μｍｏｌ）を酢酸エチル／エタノール（２：１、６ｍＬ）に溶かした。触媒である１０％パラジウム／活性炭（２０ｍｇ）を加え、アルゴンを水素によって置換し、混合物を大気圧の水素下に４．５時間攪拌した。追加の１０％パラジウム／活性炭（２０ｍｇ）をアルゴン下に加え、大気圧下に水素化を６時間続けた。反応混合物をセライトで濾過し、酢酸エチルで洗い、減圧下に濃縮した。残留物（６６ｍｇ）を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０６５３】
収量：１１ｍｇ（理論値の１８％）。

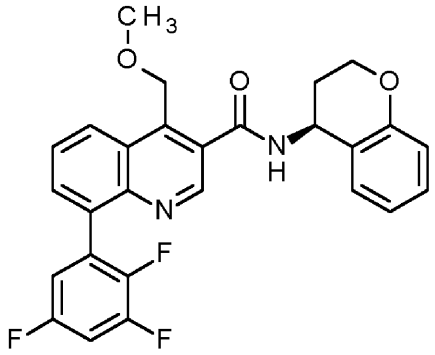
【０６５４】
ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．２８分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝５３３［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６５５】
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：０．００８（２．５１）、１．２３５（０．４３）、１．６７６（１．５４）、１．７１３（２．６０）、１．７５１（１．６７）、２．０５７（０．９７）、２．０７２（１．１１）、２．０８５（１．８７）、２．２１８（１．３３）、２．２３１（１．３１）、２．２４０（１．２６）、２．２５２（０．９２）、２．３２７（０．５６）、２．３６６（０．６０）、２．４２９（２．１４）、２．４６０（２．２５）、２．６７０（０．６９）、２．７１０（０．６７）、３．４６４（１．０７）、３．４９３（１．９７）、３．５２０（２．１４）、３．５４６（２．１５）、３．５７５（１．１８）、３．７３８（１．２６）、４．０１０（３．１７）、４．０２３（２．８１）、４．０３８（２．８５）、４．２１９（０．８２）、４．２４０（２．２１）、４．２４７（１．７８）、４．２６０（２．１５）、４．２６８（２．７０）、４．２７９（２．２１）、４．２９５（１．９７）、５．２９３（０．９４）、５．３０７（２．０８）、５．３２７（２．０８）、５．３４２（０．９０）、５．７５４（５．００）、６．７８５（３．９７）、６．８０４（４．３８）、６．９１８（１．９７）、６．９３７（４．０７）、６．９５６（２．４０）、７．１５８（２．１０）、７．１７６（３．３７）、７．１９３（１．６１）、７．４０５（３．５２）、７．４２３（３．２０）、７．６１３（１３．１５）、７．６１７（１６．００）、７．６４８（４．２０）、７．６５３（５．６８）、７．７４８（２．２９）、７．７６６（３．６５）、７．７８７（３．２０）、７．８５６（４．９５）、７．８７４（３．５２）、８．５１０（３．４３）、８．５３１（３．１７）、８．７７７（１２．６３）、９．１４０（３．５４）、９．１６１（３．５４）。

【０６５６】
Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（メトキシメ

チル）－８－（２，３，５－トリフルオロフェニル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例６８６）の合成

【化１７８】

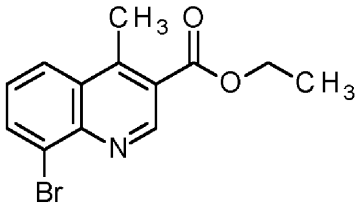


【０６５７】

段階1

エチル８－ブロモ－４－メチルキノリン－３－カルボキシレート

【化１７９】



【０６５８】

エチル８－ブロモ－４－ヒドロキシ－キノリン－３－カルボキシレート（３．００ｇ、９．５４ｍｍｏｌ）（Ｇｈａｒａｔ，　ａｌ．，　ＷＯ２０１３／１１８０７１）のＴＨＦ（４５ｍＬ）中溶液に、アルゴン下にアセチルアセトン酸コバルト（ＩＩ）（２．４５ｇ、９．５４ｍｍｏｌ）を加えた。混合物を、６０℃の油浴で加熱し、ジメチル亜鉛（トルエン中溶液、１．９ｍＬ、２．０Ｍ、３．８ｍｍｏｌ）を滴下し、この温度で１時間攪拌した。４．５時間の期間中、ほとんど全ての原料が消費されるまで（ＨＰＬＣモニタリング）、追加のジメチル亜鉛（トルエン中溶液、６．２ｍＬ、２．０Ｍ、１２．４ｍｍｏｌ）をこの温度で数回に分けて加えた。混合物を酢酸（１．８ｍＬ）を含む水（２５０ｍＬ）に投入し、減圧下に有機溶媒をかなり留去し、水相を酢酸エチルで抽出した。合わせた有機相を脱水し、溶媒留去して乾固させた。残留物（３．１ｇ）を、シリカ（１００ｇ）でのカラムクロマトグラフィー、溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル（３％から１０％）によって精製して、標題化合物を得た（１．２５ｇ、理論値の４５％）。

【０６５９】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ４）：R_t＝３．０６分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝２９４［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６６０】

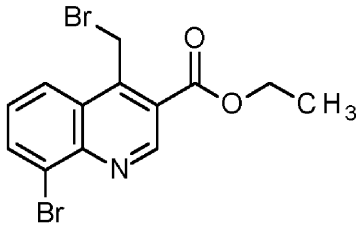
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：１．３６９（４．７６）、１．３８７（９．９８）、１．４０５（４．８９）、２．９３４（１６．００）、４．３９３（１．５７）、４．４１１（４．７７）、４．４２９（４．７１）、４．４４７（１．５１）、７．６１５（１．３０）、７．６３４（２．２３）、７．６５５（１．４６）、８．２５３（１．８５）、８．２７１（１．７６）、８．３４０（２．０９）、８．３６１（１．９９）、９．１８５（３．３２）。

【０６６１】

段階２

エチル８－ブロモ－４－（ブロモメチル）キノリン－３－カルボキシレート

【化１８０】



【０６６２】

エチル－８－ブロモ－４－メチルキノリン－３－カルボキシレート（１．５０ｇ、５．１０ｍｍｏｌ）をＴＨＦ（２３ｍＬ）に溶かした。三臭化フェニルトリメチルアンモニウム（３．０７ｇ、８．１６ｍｍｏｌ）及び酢酸（１．５ｍＬ、２５ｍｍｏｌ）を加え、混合物を環境温度で攪拌した。

【０６６３】

追加の三臭化フェニルトリメチルアンモニウム（０．９６ｇ、２．５ｍｍｏｌ）を加え、環境温度で３日間攪拌した。追加量の三臭化フェニルトリメチルアンモニウム（０．９６ｇ、２．５ｍｍｏｌ）及び酢酸（０．９ｍＬ、１５，３ｍｍｏｌ）を加え、攪拌を終夜続けた。反応混合物を水及びジクロロメタンで希釈した。水相をジクロロメタンで抽出し、合わせた有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、脱水し、減圧下に３０℃で濃縮した。

【０６６４】

残留物をＭＴＢＥ（８０ｍＬ）中で１時間攪拌した。固体を濾去し、ＭＴＢＥで洗浄し、真空乾燥した。粗取得物（３．２３ｇ）をカラムクロマトグラフィー、溶離液：シクロヘキサン／酢酸エチル（３％から２２％）によって精製した。

【０６６５】

収量：９８５ｍｇ（純度９０．５％、理論値の４７％）。

【０６６６】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．１１分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝３７１［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６６７】

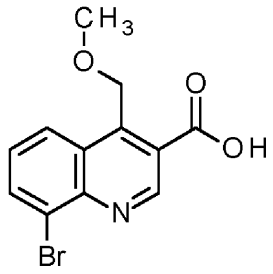
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（５００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：１．４０１（７．４１）、１．４１５（１６．００）、１．４２９（７．４２）、１．４３５（０．４１）、４．４４１（２．２６）、４．４５５（７．１２）、４．４７０（６．９８）、４．４８４（２．１３）、５．４７９（１１．９６）、５．７５８（１．３１）、７．７２１（２．２８）、７．７３６（２．７６）、７．７３８（２．６２）、７．７５３（２．４３）、８．３１１（２．９４）、８．３１４（３．０２）、８．３２６（２．８５）、８．３２９（２．６９）、８．４４６（２．６２）、８．４４８（２．５４）、８．４６３（２．５７）、８．４６５（２．２９）、９．３１１（８．５７）。

【０６６８】

段階３

８－ブロモ－４－（メトキシメチル）キノリン－３－カルボン酸

【化１８１】



【０６６９】

エチル８－ブロモ－４－（ブロモメチル）キノリン－３－カルボキシレート（１．１４ｇ、３．０６ｍｍｏｌ）のメタノール（１５ｍＬ）中懸濁液に、環境温度でナトリウムメトキシド（メタノール中溶液、５．４Ｍ）を滴下し、その間に溶解が起こり、後に固体が沈殿した。１．５時間後、ＴＨＦ（５ｍＬ）及び水（３ｍＬ）を加え、撹拌を環境温度で終夜続けた。溶液を水２０ｍＬで希釈し、酢酸（５Ｍ）を加えることでｐＨを４に調節した。減圧下に濃縮してほとんどの有機溶媒を除去した後、残った混合物を酢酸エチルと水との間で分配した。水層を酢酸エチルで数回抽出し、合わせた有機層を脱水し、減圧下に濃縮した。この取得物（３６３ｍｇ、純度９１％、理論値の３７％）は、それ以降の使用に適していた。水相を減圧下に濃縮して少量とし、ＤＭＳＯで希釈し、分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製して、第２の生成物塊を得た（２７０ｍｇ、純度１００％、理論値の３０％）。

【０６７０】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝０．６９分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝２９６［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６７１】

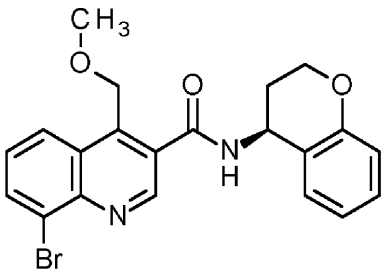
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（５００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：１．２２１（０．４７）、３．１８４（０．５２）、５．１９９（１６．００）、７．６１１（３．５４）、７．６２７（５．２８）、７．６４３（３．７６）、８．２３８（４．８１）、８．２５２（４．５６）、８．３５１（４．６１）、８．３６７（４．３８）、９．２１５（１０．０２）。

【０６７２】

段階４

８－ブロモ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（メトキシメチル）キノリン－３－カルボキサミド

【化１８２】



【０６７３】

８－ブロモ－４－（メトキシメチル）キノリン－３－カルボン酸（３６０ｍｇ、１．２２ｍｍｏｌ）のＴＨＦ（６ｍＬ）中溶液を（４Ｓ）－クロマン－４－アミン塩酸塩（１：１）及びトリメチルアミン（６８０μＬ、４．９ｍｍｏｌ）で処理した。混合物を昇温させて４５℃とし、２，４，６－トリプロピル－１，３，５，２，４，６－トリオキサトリ

ホスフィナン２，４，６－トリオキサイド（酢酸エチル中溶液、２３ｍＬ、含有率５０％、３９ｍｍｏｌ）を加え、加熱を外し、混合物を環境温度で終夜攪拌した。水（ｐＨ８～９）で希釈後、ＴＨＦを減圧下に除去した。沈殿を濾去し、温アセトン約１０ｍＬに溶かした。温水（１０ｍＬ）を加え、混合物を放冷して室温とした。固体を濾去し、アセトン／水（１：２）で洗浄し、真空乾燥した。

【０６７４】

収量：３９１ｍｇ（純度９５％、理論値の７２％）。

【０６７５】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝０．９６分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４２７［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

【０６７６】

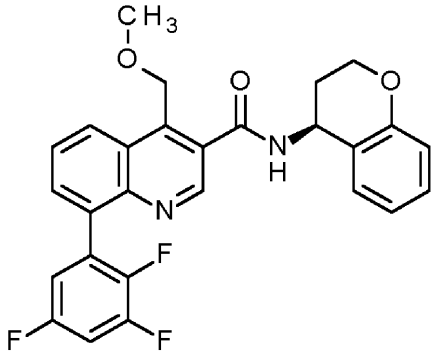
^{1}Ｈ－ＮＭＲ（６００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ［ｐｐｍ］：１．２３５（０．５２）、２．０９０（２．２０）、２．２３０（２．１５）、３．２８７（１６．００）、４．２４１（２．６６）、４．２９３（２．８３）、４．９９８（８．９２）、５．３１４（２．６８）、６．８００（２．８３）、６．８１１（３．１３）、６．９４３（３．０４）、７．１８３（３．０３）、７．３９７（３．０１）、７．６１２（３．０３）、８．２１１（２．９９）、８．２２１（３．０８）、８．３１１（２．８７）、８．３２４（２．９４）、８．９９８（４．４９）、９．２０７（２．８０）。

【０６７７】

段階５

Ｎ－[(４Ｓ)－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル]－４－（メトキシメチル）－８－（２，３，５－トリフルオロフェニル）キノリン－３－カルボキサミド

【化１８３】



【０６７８】

アルゴン下、容器に、８－ブロモ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（メトキシメチル）キノリン－３－カルボキサミド（９０ｍｇ、２１１μｍｏｌ）、２，３，５－トリフルオロベンゼンボロン酸（５５．６ｍｇ、３１６μｍｏｌ）、１，１′－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン－パラジウム（ＩＩ）ジクロライド・ジクロロメタン錯体（８．６０ｍｇ、１０．５μｍｏｌ）、炭酸カリウム（５８．２ｍｇ、４２１μｍｏｌ）を、脱気５：１ジオキサン及び水混合液（０．７３ｍＬ）とともに入れた。混合物を７０℃で終夜撹拌した。それを酢酸エチルで希釈し、硫酸ナトリウム層で濾過し、減圧下に濃縮した。粗取得物を分取ＨＰＬＣ（Ｃ１８、勾配：０．１％ギ酸水溶液／アセトニトリル）によって精製した。

【０６７９】

収量：３１ｍｇ（理論値の３１％）。

【０６８０】

ＬＣ－ＭＳ（方法Ｌ１）：R_t＝１．１４分；ＭＳ（ＥＳＩｐｏｓ）：ｍ／ｚ＝４７９［Ｍ＋Ｈ］$^+$。

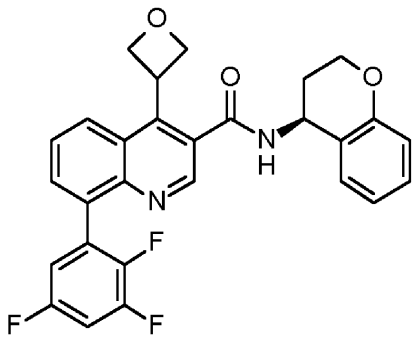
【０６８１】

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（６００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－ｄ$_6$）δ［ｐｐｍ］：０．００５（１．０４）、２．０４３（０．４７）、２．０４８（０．６０）、２．０５３（０．９６）、２．０５８（１．０４）、２．０６５（１．１２）、２．０６９（１．０７）、２．０７７（１．３７）、２．０８１（１．２０）、２．０８７（２．１１）、２．０９２（０．６３）、２．１９３（０．５８）、２．１９９（０．８６）、２．２０２（０．８１）、２．２０７（１．３２）、２．２１３（０．９７）、２．２１６（１．３１）、２．２２１（１．３２）、２．２３０（０．９９）、２．２３６（０．６４）、２．２３９（０．６２）、２．２４４（０．４６）、２．７９３（０．５５）、３．３４５（８．００）、４．２２０（０．７１）、４．２２５（０．８７）、４．２３４（０．９０）、４．２３９（２．３２）、４．２４４（１．６１）、４．２５３（１．７７）、４．２５８（１．４７）、４．２６８（１．４２）、４．２７３（１．８０）、４．２７９（１．５８）、４．２８５（１．９１）、４．２９２（０．７８）、４．２９８（０．８４）、４．３０３（０．６５）、５．０３７（１６．００）、５．２８７（０．９１）、５．２９７（１．９５）、５．３１０（１．９６）、５．３２０（０．９２）、６．７９０（３．６６）、６．７９１（３．７６）、６．８０３（４．００）、６．８０４（３．９９）、６．９１７（１．８５）、６．９１８（１．８４）、６．９２９（３．７５）、６．９３１（３．６８）、６．９４２（２．１４）、６．９４３（２．０５）、７．１５９（１．７８）、７．１６１（１．８０）、７．１７３（３．０１）、７．１８４（１．５６）、７．１８７（１．４９）、７．２５９（１．５１）、７．２６７（１．４９）、７．２７４（１．４９）、７．３７６（３．０８）、７．３８８（２．９５）、７．６０９（０．４９）、７．６１４（０．６３）、７．６１９（０．７５）、７．６２４（１．１８）、７．６２８（１．１４）、７．６３３（１．２３）、７．６３８（１．１８）、７．６４２（１．１８）、７．６４６（０．７４）、７．６５１（０．６５）、７．６５７（０．５６）、７．８００（２．６６）、７．８１２（３．８５）、７．８１４（３．１８）、７．８２６（３．６１）、７．８７３（４．１７）、７．８７５（４．２９）、７．８８５（３．０６）、７．８８７（２．９４）、８．４１６（３．６１）、８．４１８（３．６５）、８．４３０（３．４８）、８．４３２（３．２７）、８．８９０（１２．７４）、９．１８４（３．５２）、９．１９７（３．４３）。

【０６８２】

Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－４－（オキセタン－３－イル）－８－（２，３，５－トリフルオロフェニル）キノリン－３－カルボキサミド（実施例６６０）の合成

【化１８４】



【０６８３】

１００ｍＬ丸底フラスコ中、４－クロロ－Ｎ－［（４Ｓ）－３，４－ジヒドロ－２Ｈ－クロメン－４－イル］－８－（２，３，５－トリフルオロフェニル）キノリン－３－カルボキサミド（５００ｍｇ、１．０６６ｍｍｏｌ）、無水水酸化リチウム（５１ｍｇ、２．１３３ｍｍｏｌ）、３－ブロモオキセタン（０．１３３ｍＬ、１．６００ｍｍｏｌ）、［４，４′－ビス（１，１－ジメチルエチル）－２，２′－ビピリジン－Ｎ１，Ｎ１′］ビス［３，５－ジフルオロ－２－［５－（トリフルオロメチル）－２－ピリジニル－Ｎ］フ

ェニル－Ｃ］イリジウム（ＩＩＩ）ヘキサフルオロホスフェート（２４ｍｇ、０．０２１ｍｍｏｌ）及びトリス（トリメチルシリル）シラン（０．３２９ｍＬ、１．０６６ｍｍｏｌ）の１，２－ジメトキシエタン（２０ｍＬ）中混合物を、アルゴンパージによって脱気した。５０ｍＬ丸底フラスコ中、塩化ニッケル（ＩＩ）・エチレングリコールジメチルエーテル錯体（１４ｍｇ、０．０６４ｍｍｏｌ）及び４，４′－ジ－ｔｅｒｔ－ブチル－２，２′－ビピリジン（１７ｍｇ、０．０６４ｍｍｏｌ）の１，２－ジメトキシエタン（１０ｍＬ）中混合物をヒートガンによってゆるやかに昇温させ、アルゴンでパージし、５分間撹拌した。注射器により、このニッケル－触媒混合物の半量（５ｍＬ）を反応混合物に加えた。得られた懸濁液をアルゴンで５分間パージし、次に、ファンで冷却しながら、１８時間にわたり、青色ＬＥＤ灯での照射下に撹拌した。反応混合物をジクロロメタン（３０ｍＬ）で希釈した。水（１０ｍＬ）を加え、層を分離した。水層をジクロロメタンで抽出した（１０ｍＬで２回）。合わせた有機層を硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下に除去した。フラッシュカラムクロマトグラフィー（８０ｇ；ヘプタン、１０％－６０％酢酸エチル）及び分取ＨＰＬＣ（方法１１）による精製によって、標題化合物０．０５４ｇ（０．１１０ｍｍｏｌ；理論値の１０％）を得た。

【０６８４】

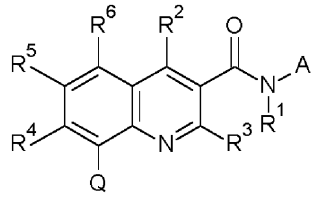
ＬＣ－ＭＳ（方法２）：R_t＝３．６５分；ｍ／ｚ＝４９１（Ｍ＋Ｈ）$^+$

^{1}Ｈ－ＮＭＲ（４００ＭＨｚ、ＤＭＳＯ－d_6）δ９．２６（ｄ、Ｊ＝８．１Ｈｚ、１Ｈ）、８．８７（ｓ、１Ｈ）、７．９１－７．８７（ｍ、１Ｈ）、７．８４－７．７３（ｍ、２Ｈ）、７．７０－７．５７（ｍ、１Ｈ）、７．３５（ｄ、Ｊ＝７．８Ｈｚ、１Ｈ）、７．３０－７．２３（ｍ、１Ｈ）、７．１９（ｔ、Ｊ＝７．８Ｈｚ、１Ｈ）、６．９３（ｔ、Ｊ＝７．５Ｈｚ、１Ｈ）、６．８１（ｄ、Ｊ＝８．２Ｈｚ、１Ｈ）、５．３１－５．１１（ｍ、４Ｈ）、４．８４－４．７０（ｍ、２Ｈ）、４．３４－４．２１（ｍ、２Ｈ）、２．２５－２．１５（ｍ、１Ｈ）、２．０８－２．０１（ｍ、１Ｈ）。

【０６８５】

表１：実施例

【化１８５】



(I)

【表２】

番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Q	A
1	H	ｸﾛﾛ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(1S)-1,2,3,4-ﾃﾄﾗﾋﾄﾞﾛﾅﾌﾀﾚﾝ-1-ｲﾙ
2	H	ｸﾛﾛ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-1,2,3,4-ﾃﾄﾗﾋﾄﾞﾛﾅﾌﾀﾚﾝ-1-ｲﾙ
3	H	ｸﾛﾛ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
4	H	ｸﾛﾛ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
5	H	ｸﾛﾛ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
6	H	ｸﾛﾛ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
7	H	ｸﾛﾛ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
8	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
9	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
10	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-6-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
11	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾒﾁﾙ	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
12	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾒﾁﾙ	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
13	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛ-4-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ

14	H	ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
15	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジメチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
16	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル
17	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
18	H	ジメチルアミノ	H	メチル	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
19	H	ジメチルアミノ	H	メチル	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
20	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル
21	H	ジメチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
22	H	ジメチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
23	H	メチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
24	H	メチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
25	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-クロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
26	H	1H-イミダゾール-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
27	H	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イルアミノ	H	H	H	H	3-クロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
28	H	(1S)-2,3-ジヒドロ	H	H	H	H	2,3-ジクロロ	(1S)-2,3-

		-1H-インデン-1-イルアミノ					フェニル	ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
29	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-クロロ-5-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
30	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,4-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
31	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	4-フルオロ-3-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
32	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
33	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-フルオロ-2-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
34	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
35	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-クロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
36	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-2-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
37	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
38	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,4,6-トリフルオロ-3-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
39	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
40	H	ジメチルアミノ	H	H	フルオロ	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
41	H	ジメチルアミノ	H	H	フルオロ	H	3,5-ジクロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
42	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

								クロメン-4-イル
43	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	3,5-ジクロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
44	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
45	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
46	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-5-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
47	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,4,5-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
48	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-フルオロ-3-(トリフルオロメトキシ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
49	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
50	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
51	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
52	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
53	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,4-ジフルオロ-3-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
54	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
55	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-フルオロ-4-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
56	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-4-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
57	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,4,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
58	H	ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
59	H	ﾍﾞﾝｼﾞﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
60	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-3-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
61	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-ﾌﾙｵﾛ-5-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
62	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-ﾌﾙｵﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-2-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
63	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ﾌﾙｵﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
64	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ﾒﾄｷｼﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
65	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
66	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,6-ｼﾞﾒﾁﾙﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
67	H	ｼﾞｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
68	H	4-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-1H-ﾋﾟﾗｿﾞｰﾙ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
69	H	1H-ﾋﾟﾗｿﾞｰﾙ-4-ｲﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
70	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-(ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ

71	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-6-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
72	H	1H-ピラゾール-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
73	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	1H-インドール-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
74	H	(2-ヒドロキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
75	H	(2-メトキシエチル)(メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
76	H	(2-メトキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
77	H	4-オキソイミダゾリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
78	H	ビス(2-メトキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
79	H	ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
80	H	(2S)-2-カルボキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
81	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3,4-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
82	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3,4-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
83	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2-フルオロ-3-(トリフルオロメトキシ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
84	H	(3R)-3-アミノピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル

85	H	3,4-ジヒドロイソキノリン-2(1H)-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
86	H	アニリノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
87	H	イソブチル(メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
88	H	[2-(ジメチルアミノ)エチル]アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
89	H	(2-メトキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
90	H	エチル(2-メトキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
91	H	(2S)-2-(メトキシメチル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
92	H	(2R)-2-(メトキシメチル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
93	H	ビス(2-メトキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
94	H	(3S)-3-(ジメチルアミノ)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
95	H	テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
96	H	[2-(ピロリジン-1-イル)エチル]アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
97	H	(3,3,3-トリフルオロプロピル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
98	H	モルホリン-4-イルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
99-	H	(ピリジン-2-イルメチル)ア	H	H	H	H	3,5-ジクロロ	(1S)-2,3-

1		ミノ					フェニル	ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
99-2	H	[(2R)-1-ヒドロキシブタン-2-イル]アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
100	H	(2-ヒドロキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
101	H	(3R)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
102	H	3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
103	H	3-(ピロリジン-1-イル)アゼチジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
104	H	シクロプロピル(エチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
105	H	シクロブチル(メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
106	H	(シクロプロピルメチル)(メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
107	H	2,2-ジメチルモルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
108	H	1,2-オキサゾリジン-2-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
109	H	(2S)-2-メチル-2,3-ジヒドロ-1H-インドール-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
110	H	メチル(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
111	H	1,3-ジヒドロ-2H-イソインドール-2-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
112	H	3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-

								ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
113	H	(2S)-2-ｶﾙﾊﾞﾓｲﾙﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
114	H	ﾒﾁﾙ(1-ﾌｪﾆﾙｴﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
115	H	(3-ｱﾐﾉ-3-ｵｷｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ)(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
116	H	4-ｱｾﾁﾙﾋﾟﾍﾟﾗｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
117	H	1,1-ｼﾞｵｷｼﾄﾞﾁｵﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
118	H	ﾍﾞﾝｼﾞﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
119	H	3-ﾌﾙｵﾛｱｾﾞﾁｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
120	H	3-ﾒﾁﾙｱｾﾞﾁｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
121	H	3,3-ｼﾞﾌﾙｵﾛｱｾﾞﾁｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
122	H	[3-(ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ)-3-ｵｷｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ]ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
123	H	[(5-ﾒﾁﾙ-1,2,4-ｵｷｻｼﾞｱｿﾞｰﾙ-3-ｲﾙ)ﾒﾁﾙ]ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
124	H	(3-ｱﾐﾉ-3-ｵｷｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
125	H	[2-(1H-ﾋﾟﾗｿﾞｰﾙ-1-ｲﾙ)ｴﾁﾙ]ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
126	H	(2-ｱｾﾄｱﾐﾄﾞｴﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ

127	H	[(2S)-1-アミノ-1-オキソプロパン-2-イル]アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
128	H	(2-メトキシ-2-オキソエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
129	H	(2-アミノ-2-オキソエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
130	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
131	H	メトキシアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
132	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
133	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
134	H	メチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
135	H	アゼチジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
136	H	ピリジン-4-イルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
137	H	(2-エトキシ-2-オキソエチル)(メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
138	H	(2-ヒドロキシエチル)(メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
139	H	ジメチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3,4-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
140	H	ジメチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3,4-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
141	H	ジメチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3-クロロフェニル	(4S)-3,4-

								ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
142	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3,5-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
143	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
144	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	3,4-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
145	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	3,4-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
146	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
147	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-6-ﾒﾄｷｼ-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
148	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-5-ﾒﾄｷｼ-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
149	H	ﾒﾁﾙ[2-(ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ)ｴﾁﾙ]ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
150	H	(ｶﾙﾎﾞｷｼﾒﾁﾙ)(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
151	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-(ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ)-2,4-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
152	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-7-ﾌﾙｵﾛ-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
153	H	ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
154	H	2-ｱｾﾁﾙﾋﾄﾞﾗｼﾞﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛ	(4S)-3,4-

							フェニル	ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
155	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	3-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
156	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	3,4-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
157	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	3,4-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
158	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	3,4-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
159	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	3-クロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
160	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	3-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
161	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	2-クロロ-3-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
162	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
163	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	3-クロロ-5-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
164	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
165	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	2-クロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
166	H	モルホリン-4-イル	H	H	フルオロ	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
167	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	3-クロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
168	H	ジメチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
169	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
170	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
171	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
172	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2-ｸﾛﾛ-4-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
173	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	3,4-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
174	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	3-ｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
175	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
176	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	2-ｸﾛﾛ-3-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
177	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	3,5-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
178	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	3-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
179	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
180	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾌﾙｵﾛ	H	2-ｸﾛﾛ-4-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
181	H	ﾁｵﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
182	H	(2-tert-ﾌﾞﾄｷｼ-2-ｵｷｿｴﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ

183	H	(2-tert-ブトキシ-2-オキソエチル)(メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
184	H	プロピルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
185	H	(2-アミノエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
186	H	(3R)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
187	H	(3S)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
188	H	1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
189	H	2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
190	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-クロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
191	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2,4-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
192	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
193	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
194	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
195	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2,4-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
196	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3-クロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
197	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-クロロ	(4S)-3,4-

							-2,4-ジフルオロフェニル	ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
198	メチル	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
199	H	メチル(フェニル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
200	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
201	H	3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
202	H	3-オキソピラゾリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
203	H	1,1-ジオキシドチオモルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
204	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジヒドロ-1-ベンゾフラン-7-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
205	H	モルホリン-4-イル	H	クロロ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
206	H	モルホリン-4-イル	H	クロロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
207	H	ジメチルアミノ	H	クロロ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
208	H	ジメチルアミノ	H	クロロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
209	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	フルオロ	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
210	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	フルオロ	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
211	H	モルホリン-4-イル	H	H	クロロ	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

								クロメン-4-イル
212	H	モルホリン-4-イル	H	H	クロロ	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
213	H	ジメチルアミノ	H	H	クロロ	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
214	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	メチル	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
215	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	メチル	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
216	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	5-(メトキシカルボニル)-1,3-ベンゾオキサゾール-7-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
217	H	ジメチルアミノ	H	H	H	メチル	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
218	H	ジメチルアミノ	H	H	H	メチル	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
219	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,4-ジフルオロ-3-ヒドロキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
220	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-フルオロ-2-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
221	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
222	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
223	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
224	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	1,3-ベンゾチアゾール-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
225	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-フルオロ-5-	(4S)-3,4-

							メチルフェニル	ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
226	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
227	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2-クロロ-5-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
228	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-クロロ-5-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
229	H	メチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
230	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,5-ジフルオロ-4-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
231	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2-フルオロ-4-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
232	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,4-ジフルオロ-2-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
233	H	モルホリン-4-イル	H	トリフルオロメチル	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
234	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
235	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
236	H	メチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
237	H	メチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
238	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2-クロロ-3-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
239	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2-フルオロ-3-メチル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

							フェニル	クロメン-4-イル
240	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-クロロ-2-フルオロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
241	H	(2S)-2-(tert-ブトキシカルボニル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
242	H	(2S)-2-(tert-ブトキシカルボニル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
243	H	(2R)-2-(tert-ブトキシカルボニル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
244	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3-フルオロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
245	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,4-ジフルオロ-2-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
246	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	2,5-ジフルオロ-4-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
247	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3,6-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
248	H	メトキシ(メチル)アミノ	H	H	H	H	2-クロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
249	H	メトキシ(メチル)アミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
250	H	メトキシ(メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
251	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	1,3-ベンゾチアゾール-7-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
252	H	シクロプロピル(メチル)アミノ	H	H	H	H	2-クロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
253	H	シクロプロピル(メチル)アミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル

254	H	ｼｸﾛﾌﾟﾛﾋﾟﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
255	H	(2S)-2-(ﾒﾄｷｼｶﾙﾎﾞﾆﾙ)ﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
256	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
257	H	(3rac)-3-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
258	H	(3rac)-3-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-3-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
259	H	(3rac)-3-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
260	H	(3rac)-3-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
261	H	(3rac)-3-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛ-5-ﾒﾄｷｼﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
262	H	(3rac)-3-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
263	H	(2R)-2-(ﾒﾄｷｼｶﾙﾎﾞﾆﾙ)ﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
264	H	2,2-ｼﾞﾒﾁﾙﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
265	H	ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
266	H	(2S)-2-ｶﾙﾎﾞｷｼﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
267	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾒﾄｷｼﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
268	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	5-ﾌﾙｵﾛ-2-	(4S)-3,4-

							メトキシフェニル	ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
269	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
270	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	5-フルオロ-2-メトキシフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
271	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
272	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2-フルオロ-3-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
273	H	シクロプロピルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
274	H	(2R)-2-カルボキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
275	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3-クロロ-2-フルオロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
276	H	(カルボキシラトメチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
277	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,6-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
278	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	2,6-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
279	H	ジメチルアミノ	H	フルオロ	H	H	2,6-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
280	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	1,3-ベンゾオキサゾール-7-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
281	H	(3S)-3-(メトキシカルボニル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
282	H	(3R)-3-(メトキシカルボニル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

								クロメン-4-イル
283	H	(3R)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
284	H	(3S)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
285	H	[(ジエトキシホスホリル)メチル](メチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
286	H	[2-(シクロプロピルアミノ)エチル] アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
287	H	(2R)-2-(ヒドロキシメチル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
288	H	(2S)-2-(ヒドロキシメチル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
289	H	[(1R,3S)-3-アミノ-2,2-ジメチルシクロプロピル]アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
290	H	(2S)-2-メチルモルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
291	H	(3rac,4rac)-3-アミノ-4-フルオロピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
292	H	(2rac)-2-カルボキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
293	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,4-ジクロロ-5-(ジメチルアミノ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
294	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-5-(ジメチルアミノ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
295	H	(3rac)-3-ヒドロキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2-フルオロ-4-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
296	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル

297	H	(2-ヒドロキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
298	H	(2-メトキシエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
299	H	(2R)-2-カルボキシラトピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
300	H	6-オキサ-3-アザビシクロ[3.1.1]ヘプタ-3-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
301	H	3,9-ジオキサ-7-アザビシクロ[3.3.1]ノナ-7-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
302	H	8-オキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタ-3-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
303	H	(2R,6S)-2,6-ジメチルモルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
304	H	(2R,6S)-2,6-ジメチルモルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
305	H	(2R,6S)-2,6-ジメチルモルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
306	H	(2R,6S)-2,6-ジメチルモルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
307	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	4-クロロ-3-(ジメチルアミノ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
308	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロ-4-(ジメチルアミノ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
309	H	モルホリン-4-イル	H	メチルオキシ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
310	H	モルホリン-4-イル	H	メチルオキシ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
311	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ	(4S)-3,4-

							-4-(ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ)ﾌｪﾆﾙ	ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
312	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-(ﾒﾁﾙｱﾐﾉ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
313	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	2,6-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
314	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
315	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
316	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ｸﾛﾛ	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
317	H	(3rac)-3-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
318	H	(3S)-3-(ﾋﾄﾞﾛｷｼﾒﾁﾙ)ﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
319	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
320	H	(2S)-2-(ｴﾄｷｼｶﾙﾎﾞﾆﾙ)ﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
321	H	2,4-ｼﾞﾒﾁﾙ-3,5-ｼﾞｵｷｿｰ1,2,4-ﾄﾘｱｿﾞﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
322	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾄｷｼ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
323	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛ-5-(ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
324	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-4-(ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
325	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛ	(4S)-3,4-

							-4-(ジメチルアミノ)-5-フルオロフェニル	ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
326	H	ジメチルアミノ	H	メチルオキシ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
327	H	ジメチルアミノ	H	メチルオキシ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
328	H	メチル[2-(2-オキソピロリジン-1-イル)エチル]アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
329	H	(3R)-3-(ヒドロキシメチル)ピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
330	H	ジメチルアミノ	H	フルオロ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
331	H	メチル(オキセタン-3-イル)アミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
332	H	(3R)-3-カルボキシピロリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
333	H	メチルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
334	H	エチルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
335	H	イソプロピルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
336	H	イソプロピルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
337	H	シクロペンチルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
338	H	(2-メトキシエチル)オキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
339	H	テトラヒドロ-2H-ピラン	H	H	H	H	3,5-ジクロロ	(4S)-3,4-

		-4-イルオキシ					フェニル	ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
340	H	(2-ヒドロキシエチル)オキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
341	H	エチルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
342	H	(3,3-ジメチルブチル)オキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
343	H	(3-フルオロベンジル)オキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
344	H	(2,3-ジフルオロベンジル)オキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
345	H	(3-メトキシベンジル)オキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
346	H	(3R)-ピロリジン-3-イルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
347	H	(3-メトキシ-3-メチルブチル)オキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
348	H	(シクロペンチルメチル)オキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
349	H	イソプロピルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
350	H	エチル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
351	H	エチル	H	H	H	H	3-クロロ-5-エチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
352	H	メチル	H	H	H	H	3-クロロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
353	H	メチル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

								クロメン-4-イル
354	H	1-シアノ-2-エトキシ-2-オキソエチル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
355	H	シアノメチル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
356	H	プロピル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
357	H	プロパ-1-エン-2-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
358	H	シクロプロピル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
359	H	イソプロピル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
360	H	2-アミノ-2-オキソエチル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
361	H	ニトリロメチル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
362	H	(2-ヒドロキシエチル)スルファニル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
363	H	ピリジン-2-イルスルファニル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
364	H	(2-ヒドロキシエチル)スルファニル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
365	H	メチルスルファニル	H	H	H	H	3-クロロ-5-(メチルスルファニル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
366	H	エチルスルファニル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
367	H	エチルスルファニル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル

368	H	エチルスルフィニル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
369	H	エチルスルホニル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
370	H	エチルスルフィニル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
371	H	エチルスルホニル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
372	H	(2-カルボキシエチル)スルファニル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
373	H	メチルオキシ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル

【表３】

番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Q	A
374	H	(2rac)-2-(トリフルオロメチル)モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
375	H	(2-メトキシ-2-オキソエチル)アミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
376	H	H	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
377	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-フルオロ-2-メトキシピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
378	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-シアノピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
379	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-アミノピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
380	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-メチルピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
381	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-メチルピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
382	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
383	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-フルオロピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
384	H	メチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
385	H	メチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
386	H	イソプロピル	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル

387	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-シアノ-4-メチル-2-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
388	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,5-ジメチル-3-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
389	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-シアノ-2-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
390	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-クロロ-2-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
391	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-メチル-2-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
392	H	3-フルオロアゼチジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
393	H	4-フルオロピペリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
394	H	3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
395	H	メチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
396	H	ピリジン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
397	H	2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-5-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
398	H	4,4-ジフルオロピペリジン-1-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
399	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-モルホリン-4-イルピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
400	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-クロロ-2-メトキシピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
401	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-メトキシピリ	(4S)-3,4-

							ｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
402	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-(ﾋﾄﾞﾛｷｼﾒﾁﾙ)ﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
403	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
404	H	ｼｸﾛﾌﾞﾁﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
405	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
406	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
407	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾄｷｼ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
408	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2-ﾌﾙｵﾛ-3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
409	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
410	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
411	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
412	H	2-ｱﾐﾉﾋﾟﾘﾐｼﾞﾝ-5-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
413	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,6-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
414	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-3-ﾌﾙｵﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
415	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,5-ｼﾞｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-

							ｲﾙ	ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
416	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	5-ﾌﾙｵﾛ-2-ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙｵｷｼﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
417	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ｴﾄｷｼ-5-ﾌﾙｵﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
418	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
419	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
420	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
421	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-3-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
422	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2,5-ｼﾞﾒﾁﾙ-3-ﾁｴﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
423	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2,5-ｼﾞｸﾛﾛ-3-ﾁｴﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
424	H	2-ｱﾐﾉｴﾁﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
425	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,5-ｼﾞﾒﾁﾙ-3-ﾁｴﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
426	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,5-ｼﾞｸﾛﾛ-3-ﾁｴﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
427	H	ﾒﾄｷｼ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
428	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ｼｱﾉ	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
429	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-

								クロメン-4-イル
430	H	イソプロピル	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
431	H	イソプロピル	H	H	H	H	3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
432	H	(ジメチルアミノ)メチル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
433	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
434	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
435	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-クロロ-5-シアノフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
436	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-フルオロ-2-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
437	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-フルオロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
438	H	イソプロピル	H	H	H	H	3,5-ジクロロ-4-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
439	H	3-フルオロ-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-5-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
440	H	アミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
441	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,5-ジクロロ-3-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
442	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3-クロロ-2-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
443	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	5-クロロ-2-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル

444	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛ-5-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
445	H	1,2-ｵｷｻｿﾞﾘｼﾞﾝ-2-ｲﾙ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
446	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3-ｸﾛﾛ-4-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
447	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2,5-ｼﾞﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
448	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3-ﾌﾙｵﾛ-5-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
449	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	3,4,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
450	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
451	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2-ﾒﾁﾙ-5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
452	H	ﾒﾄｷｼ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
453	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	H	H	H	2,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
454	H	1H-ﾋﾟﾗｿﾞｰﾙ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
455	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
456	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ﾒﾁﾙ-1,3-ﾁｱｿﾞｰﾙ-5-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
457	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	4-ｸﾛﾛ-2-ﾁｴﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
458	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	5-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛ	(4S)-3,4-

							メチル)-2-チエニル	ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
459	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	5-フルオロ-2-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
460	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
461	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
462	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
463	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	5-フルオロ-2-(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
464	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2-クロロ-5-シアノフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
465	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2-クロロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
466	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	5-フルオロ-2-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
467	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2-フルオロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
468	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,5-ジメチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
469	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
470	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-クロロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
471	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,5-ジメチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
472	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,6-ジメトキシピリジン	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

							-4-イル	クロメン-4-イル
473	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2-クロロ-6-メチルピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
474	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジメトキシピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
475	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3-クロロ-2-メトキシピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
476	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
477	H	イソプロピル	H	フルオロ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
478	H	ビニル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
479	H	イソプロピル	H	フルオロ	H	H	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
480	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,5-ジメチル-3-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
481	H	モルホリン-4-イル	メチル	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
482	H	2,2-ジフルオロエチル(メチル)アミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
483	H	モルホリン-4-イル	メチル	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
484	H	オキセタン-3-イルメチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
485	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
486	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	1,3-ベンゾチアゾール-7-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル

487	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
488	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
489	H	3-ﾁｴﾆﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
490	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,5-ｼﾞﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
491	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
492	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-1,2,3,4-ﾃﾄﾗﾋﾄﾞﾛﾅﾌﾀﾚﾝ-1-ｲﾙ
493	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(3rac)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1-ﾍﾞﾝｿﾞﾁｵﾌｪﾝ-3-ｲﾙ
494	H	ｼｸﾛﾍﾟﾝﾁﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
495	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛ-5-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
496	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ﾒﾄｷｼ	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
497	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ﾒﾄｷｼ	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
498	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	ﾒﾄｷｼ	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
499	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	ﾒﾄｷｼ	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
500	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	ﾒﾄｷｼ	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ

501	H	ジメチルアミノ	H	H	メトキシ	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
502	H	ジメチルアミノ	H	H	メトキシ	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
503	H	ジメチルアミノ	H	H	メトキシ	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
504	H	ジメチルアミノ	H	H	H	メトキシ	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
505	H	ジメチルアミノ	H	H	H	メトキシ	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
506	H	ジメチルアミノ	H	H	H	メトキシ	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
507	H	ジメチルアミノ	H	H	H	クロロ	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
508	H	ジメチルアミノ	H	H	H	クロロ	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
509	H	ジメチルアミノ	H	H	H	クロロ	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
510	H	ジメチルアミノ	H	H	トリフルオロメチル	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
511	H	ジメチルアミノ	H	H	トリフルオロメチル	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
512	H	モルホリン-4-イル	H	H	トリフルオロメチル	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
513	H	モルホリン-4-イル	H	H	トリフルオロメチル	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
514	H	モルホリン-4-イル	H	H	トリフルオロメチル	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
515	H	メチル(オキサン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロ	(4S)-3,4-

		ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ					ﾌｪﾆﾙ	ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
516	H	ﾒﾄｷｼ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
517	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
518	H	ｵｷｾﾀﾝ-3-ｲﾙﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
519	H	(3rac)-ﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-3-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
520	H	1-(ｼﾞﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)-1H-ﾋﾟﾗｿﾞｰﾙ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
521	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛ-5-ﾋﾄﾞﾛｷｼﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
522	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	ﾒﾁﾙ	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
523	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	ﾒﾁﾙ	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
524	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	ﾒﾁﾙ	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
525	H	ｴﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
526	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
527	H	ｴﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
528	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｱﾐﾉ	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
529	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｱﾐﾉ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
530	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ﾒﾄｷｼ	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
531	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ｸﾛﾛ	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
532	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ｸﾛﾛ	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
533	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ｸﾛﾛ	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
534	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
535	H	ﾒﾄｷｼ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	2,6-ｼﾞｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
536	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ｱﾐﾉ	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
537	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ｱﾐﾉ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
538	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ｱﾐﾉ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
539	H	ｵｷｻﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
540	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3,4,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
541	H	ﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
542	H	ﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
543	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,5-ｼﾞｸﾛﾛ-3-ﾁｴﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ

544	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	2,5-ジメチル-3-チエニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
545	H	メチルアミノ	H	フルオロ	H	H	2,6-ジクロロピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
546	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	4-(ジフルオロメトキシ)-3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
547	H	メチルアミノ	H	フルオロ	H	H	4-(ジフルオロメトキシ)-3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
548	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	2,3-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
549	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	2,3,4-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
550	H	モルホリン-4-イル	H	フルオロ	H	H	2,6-ジクロロピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
551	H	ジメチルアミノ	H	アミノ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
552	H	メチル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
553	H	モルホリン-4-イル	H	クロロ	H	H	2,6-ジクロロピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
554	H	メチル	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
555	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(1rac)-1-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ナフタレン-1-イル
556	H	モルホリン-4-イル	H	クロロ	H	H	3,5-ジフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
557	H	モルホリン-4-イル	H	クロロ	H	H	3-クロロ-5-フ	(4S)-3,4-

							ルオロフェニル	ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
558	H	モルホリン-4-イル	H	クロロ	H	H	3-(トリフルオロメチル)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
559	H	ジメチルアミノ	H	ヒドロキシ	H	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
560	H	ジメチルアミノ	H	ヒドロキシ	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
561	H	ジメチルアミノ	H	ヒドロキシ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
562	H	4-オキソイミダゾリジン-1-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
563	H	4-オキソイミダゾリジン-1-イル	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
564	H	モルホリン-4-イル	H	クロロ	H	H	3-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
565	H	モルホリン-4-イル	H	クロロ	H	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
566	H	2-ヒドロキシエチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
567	H	2-ヒドロキシエチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
568	H	2-ヒドロキシエチルアミノ	H	H	H	H	2,6-ジクロロピリジン-4-イル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
569	H	4-オキソイミダゾリジン-1-イル	H	H	H	H	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
570	H	エチル	H	H	H	H	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
571	H	メチル	H	H	H	H	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
572	H	ﾒﾁﾙ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
573	H	ｴﾁﾙ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
574	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｴﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
575	H	ｴﾁﾙ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
576	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ｸﾛﾛ	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
577	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
578	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
579	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
580	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-6-ﾌﾞﾛﾓｸﾛﾏﾝ-4-ｲﾙ
581	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲｿｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
582	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-3,5-ｼﾞｴﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
583	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-3,5-ｼﾞｴﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
584	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
585	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉｶﾙﾎﾞﾆﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
586	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-tert-ﾌﾞﾁﾙ-5-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
587	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3-tert-ﾌﾞﾁﾙ-5-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
588	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｴﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
589	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
590	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
591	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,6-ｼﾞｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
592	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼﾒﾁﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
593	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
594	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	3-ｼｱﾉ-5-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
595	H	ﾒﾁﾙ -[[-(3rac)-ｵｷｿﾗﾝ-3-ｲﾙ]ﾒﾁﾙ]ｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
596	H	2-(1H-ﾋﾟﾗｿﾞｰﾙ-1-ｲﾙ)ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
597	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,6-ｼﾞｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
598	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3-ｼｱﾉ-5-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
599	H	2-(1H-ｲﾐﾀﾞｿﾞｰﾙ-1-ｲﾙ)ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
600	H	ﾒﾁﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
601	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	5-tert-ﾌﾞﾁﾙ-2-ｸﾛﾛ-3-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
602	H	4-ｵｷｿｲﾐﾀﾞｿﾞﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
603	H	ｴﾁﾙ	H	H	H	H	2-ｸﾛﾛ-5-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
604	H	4-ｵｷｿｲﾐﾀﾞｿﾞﾘｼﾞﾝ-1-ｲﾙ	H	H	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
605	H	ﾒﾁﾙ	H	H	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
606	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
607	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	5-tert-ﾌﾞﾁﾙ-2-ｸﾛﾛ-3-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
608	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛ-5-ｼｱﾉﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
609	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛ-ﾒﾄｷｼ	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
610	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛ-ﾒﾄｷｼ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
611	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛ-ﾒﾄｷｼ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
612	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛ-ﾒﾄｷｼ	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
613	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛ-	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛ	(4S)-3,4-

				ﾒﾄｷｼ			ﾌｪﾆﾙ	ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
614	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾄﾘﾌﾙｵﾛ-ﾒﾄｷｼ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
615	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
616	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
617	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｼｱﾉ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
618	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
619	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
620	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-8-ﾌﾙｵﾛｸﾛﾏﾝ-4-ｲﾙ
621	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-6,8-ｼﾞｸﾛﾛｸﾛﾏﾝ-4-ｲﾙ
622	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-6-ｸﾛﾛｸﾛﾏﾝ-4-ｲﾙ
623	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-6-ﾌﾙｵﾛｸﾛﾏﾝ-4-ｲﾙ
624	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛ-5-ｼｱﾉﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
625	H	2-(1H-ｲﾐﾀﾞｿﾞｰﾙ-1-ｲﾙ)ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
626	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
627	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
628	H	ｴﾁﾙ	H	H	H	H	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
629	H	ﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
630	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ｸﾛﾛ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1rac)-3,3-ｼﾞﾒﾁﾙｲﾝﾀﾞﾝ-1-ｲﾙ
631	H	[ｱｾﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ]ﾒﾁﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
632	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-8-ｸﾛﾛｸﾛﾏﾝ-4-ｲﾙ
633	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-6,8-ｼﾞﾌﾙｵﾛｸﾛﾏﾝ-4-ｲﾙ
634	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-8-ﾌﾞﾛﾓｸﾛﾏﾝ-4-ｲﾙ
635	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ｸﾛﾛ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1rac)-3-ｵｷｿｲﾝﾀﾞﾝ-1-ｲﾙ
636	H	ﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
637	H	ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
638	H	ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
639	H	ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
640	H	ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,6-ｼﾞｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
641	H	2-ｱｾﾁﾙｵｷｼｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ

642	H	モルホリン-4-イル	H	シアノ	H	H	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
643	H	2-(ジメチルアミノ)エチル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
644	H	2-(1H-イミダゾール-1-イル)エチル-メチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
645	H	メチル	H	H	H	H	2-クロロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
646	H	エチル	H	H	H	H	2-クロロ-5-メチルフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
647	H	メチル(2-メチルスルホニルエチル)アミノ	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
648	H	3-フルオロアゼチジン-1-イル	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
649	H	2-ヒドロキシエチル(メチル)アミノ	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
650	H	(3-メトキシ-3-オキソプロピル)-メチルアミノ	H	フルオロ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
651	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	シアノ	5-クロロ-2-フルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
652	H	モルホリン-4-イル	H	シアノ	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
653	H	3,6-ジヒドロ-2H-ピラン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
654	H	1,3-ジメチル-2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロピリミジン-5-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
655	H	エチル	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
656	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	5-ｸﾛﾛ-1H-ｲﾐﾀﾞｿﾞｰﾙ-2-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
657	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ｼｱﾉ	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
658	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	ｼｱﾉ	5-ｸﾛﾛ-2-ﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
659	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	ｼｱﾉ	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
660	H	ｵｷｾﾀﾝ-3-ｲﾙ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
661	H	ﾒﾁﾙ(2-ﾒﾁﾙｽﾙﾎﾆﾙｴﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,6-ｼﾞｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
662	H	ﾖｰﾄﾞ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
663	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ｼｱﾉ	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
664	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	ｼｱﾉ	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
665	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4rac)-8-ﾌﾙｵﾛ-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲｿｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
666	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1S)-2,3-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-1H-ｲﾝﾃﾞﾝ-1-ｲﾙ
667	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(1rac)-3-ｵｷｿｲﾝﾀﾞﾝ-1-ｲﾙ
668	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	2,6-ｼﾞｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
669	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	3,5-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-

								ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
670	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	3-tert-ﾌﾞﾁﾙ-5-ﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
671	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	3-(ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾒﾁﾙ)ﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
672	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	3,5-ｼﾞﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
673	H	2-(1H-ﾋﾟﾗｿﾞｰﾙ-1-ｲﾙ)ｴﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,6-ｼﾞｸﾛﾛﾋﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
674	H	2-ﾋﾄﾞﾛｷｼｴﾁﾙ(ﾒﾁﾙ)ｱﾐﾉ	H	ｸﾛﾛ	H	H	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
676	H	ｴﾁﾙ	H	H	H	H	2,5-ｼﾞﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
677	H	(3rac)-ﾋﾟﾛﾘｼﾞﾝ-3-ｲﾙ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
678	H	(3rac)-ﾃﾄﾗﾋﾄﾞﾛﾌﾗﾝ-3-ｲﾙ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
679	H	1-ﾒﾁﾙ-ﾋﾟﾍﾟﾘｼﾞﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
680	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
681	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
682	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
683	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	H	H	ﾋﾄﾞﾛｷｼ	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
684	H	ｲｿﾌﾟﾛﾋﾟﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	H	2,5-ｼﾞﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ

685	H	ﾒﾁﾙ	H	H	H	H	2,5-ｼﾞﾒﾁﾙﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
686	H	ﾒﾄｷｼﾒﾁﾙ	H	H	H	H	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
687	H	ｴﾁﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
688	H	ｴﾁﾙ	H	H	H	H	2,3,4-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
689	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	ﾌﾙｵﾛ	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
690	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	ﾌﾙｵﾛ	2,3,5-ﾄﾘﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
691	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	ﾌﾙｵﾛ	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
692	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	ﾌﾙｵﾛ	3,5-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
693	H	ﾓﾙﾎﾘﾝ-4-ｲﾙ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	ﾌﾙｵﾛ	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
694	H	ｼﾞﾒﾁﾙｱﾐﾉ	H	ﾌﾙｵﾛ	H	ﾌﾙｵﾛ	2,3-ｼﾞｸﾛﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ
695	H	ﾒﾁﾙ	H	H	H	H	3,5-ｼﾞﾌﾙｵﾛﾌｪﾆﾙ	(4S)-3,4-ｼﾞﾋﾄﾞﾛ-2H-ｸﾛﾒﾝ-4-ｲﾙ

【０６８６】

表２：ＬＣ－ＭＳ及びＮＭＲデータ

ＮＭＲピーク型は、スペクトラム中で見られるように記載しており、可能な高次効果は考慮していない。

【０６８７】

ＮＭＲピークリスト

選択された実施例の^{1}Ｈ　ＮＭＲデータを、^{1}Ｈ　ＮＭＲピークのリストの形で記載する。各シグナルピークについて、ｐｐｍ単位でのδ値及び小括弧内のシグナル強度を列記している。δ値－シグナル強度値のペア間は、区切り文字としてセミコロン若しくはコンマがある。

【０６８８】

従って、一つの実施例についてのピークリストは、

δ_1（強度$_1$）；δ_2（強度$_2$）；．．．．．．；δ_i（強度$_i$）；．．．．．．；δ_n（強度$_n$）、又は

δ１（強度１）；δ２（強度２）；．．．．．．；δｉ（強度ｉ）；．．．．．．；δｎ（強度ｎ）
の形を取る。
【０６８９】
鋭いシグナルの強度は、ｃｍ単位でのＮＭＲスペクトラムの印刷例におけるシグナルの高さと相関しており、シグナル強度の真の関係を示すものである。広いシグナルからは、いくつかのピーク若しくはそのシグナルの中央並びにそのスペクトラム中の最も強いシグナルと比較したそれらの相対強度を示すことができる。
【０６９０】
^{1}Ｈスペクトラムについての化学シフトの較正を行うため、本発明者らは、テトラメチルシラン及び／又は特にＤＭＳＯ中で測定されるスペクトラムの場合には使用される溶媒の化学シフトを用いている。従って、ＮＭＲピークリストにおいては、テトラメチルシランピークが現れている可能性があるが、必ずしもそうではない。
【０６９１】
^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリストは、旧来の^{1}Ｈ－ＮＭＲ印刷と同様であることから、通常は、旧来のＮＭＲ解釈で列記される全てのピークを示す。
【０６９２】
さらに、それらは旧来の^{1}Ｈ－ＮＭＲ印刷のように、溶媒、標的化合物の立体異性体（やはり、本発明の目的である。）及び／又は不純物のピークのシグナルを示すことができる。
【０６９３】
溶媒及び／又は水のδ範囲で化合物シグナルを示すために、溶媒の通常のピーク、例えばＤＭＳＯ－Ｄ$_{6}$中のＤＭＳＯのピーク及び水のピークが本発明者らの^{1}Ｈ－ＮＭＲピークリストでは示されており、通常は、概して高強度を有する。
【０６９４】
標的化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常は概して、標的化合物のピークより低い強度を有する（例えば、純度＞９０％）。
【０６９５】
そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の製造方法に代表的なものであり得る。従って、それらのピークは、「副生成物フィンガープリント」を介して本発明者らの製造方法の再現性を確認する上で役立ち得る。
【０６９６】
公知の方法（ＭｅｓｔｒｅＣ、ＡＣＤシミュレーションで、さらに経験的に評価される期待値で）で標的化合物のピークを計算する専門家であれば、必要に応じて適宜に別の強度フィルターを用いて標的化合物のピークを分離することができる。この分離は、旧来の^{1}Ｈ－ＮＭＲ解釈での関連するピーク選択と同様であると考えられる。
【０６９７】
ピークリスト付きのＮＭＲデータのさらなる詳細が、刊行物ｔｈｅ　Ｒｅｓｅａｒｃｈ　Ｄｉｓｃｌｏｓｕｒｅ　Ｄａｔａｂａｓｅ　Ｎｕｍｂｅｒ　５６４０２５の「Ｃｉｔａｔｉｏｎ　ｏｆ　ＮＭＲ　Ｐｅａｋｌｉｓｔ　Ｄａｔａ　ｗｉｔｈｉｎ　Ｐａｔｅｎｔ　Ａｐｐｌｉｃａｔｉｏｎｓ」にある。

【表４】

実施例番号	logP（方法 L0）[a]	LC-MS（方法 L2-L5）	NMR 又は NMR ピークリスト
1		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.42 分；MS（ESIpos）：m/z = 440 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz, DMSO-d6）δ[ppm]：-0.008（4.41），0.008（4.06），2.342（16.00），2.759（1.07），7.059（1.60），7.111（0.66），7.128（1.05），7.183（4.61），7.195（1.69），7.202（0.82），7.207（0.96），7.422（0.89），7.438（0.75），7.855（4.02），7.865（2.24），7.869（2.26），8.303（1.26），8.314（1.10），8.317（1.07），8.328（1.10），8.874（5.11），9.102（0.96），9.123（0.96）.
2		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.47 分；MS（ESIpos）：m/z = 481 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz, DMSO-d6）δ[ppm]：-0.008（3.38），1.805（1.14），1.836（2.05），1.854（1.44），1.862（1.41），1.867（1.25），1.879（1.41），1.887（1.60），1.910（1.44），1.932（1.44），1.946（1.07），1.960（0.93），2.045（1.14），2.069（1.54），2.080（1.05），2.088（1.03），2.746（1.96），2.760（3.98），2.771（3.46），2.787（1.53），3.289（3.24），5.230（0.89），5.248（1.82），5.265（1.70），5.281（0.81），7.111（2.30），7.128（3.40），7.161（1.10），7.166（1.44），7.179（3.34），7.184（3.63），7.190（3.11），7.196（4.53），7.202（2.62），7.208（2.92），7.212（2.70），7.226（0.95），7.422（3.20），7.439（2.63），7.444（2.24），7.675（7.89），7.679（16.00），7.683（9.38），7.687（5.20），7.692（1.77），7.889（2.30），7.907（3.45），7.909（4.06），7.928（3.18），7.999（3.67），8.002（4.95），8.017（2.68），8.020（3.30），8.383（3.21），8.386（4.14），8.404（2.94），8.407（3.59），8.940（10.21），9.119（3.46），9.141（3.28）.
3		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.37 分；MS（ESIpos）：m/z = 467 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz, DMSO-d6）δ[ppm]：0.008（1.33），1.234（2.20），1.397（0.85），1.924（1.63），1.935（0.83），1.946（1.76），1.956（1.90），1.967（0.79），1.977（1.84），1.998（0.66），2.524（2.18），2.567（0.88），2.575（0.77），2.838（0.77），2.859（1.28），2.878（2.28），2.898（2.50），2.918（1.19），2.951（1.54），2.959（1.64），2.973（1.71），2.980（1.81），2.990（0.99），2.999（0.88），3.012（0.86），3.020（0.74），3.070（1.91），5.542（1.02），5.562（2.83），5.582（2.79），5.602（0.92），7.223（0.96），7.232（4.00），7.240（4.95），7.246（5.24），7.254（7.15），7.263（2.96），7.271（3.67），7.281（2.50），7.293（1.17），7.435（2.55），7.446（2.61），7.456（2.00），7.635（1.10），7.665（0.98），7.678（13.08），7.681（16.00），7.686（7.10），7.689（3.73），7.695（1.37），7.700（0.80），7.895

			(2.06), 7.913 (4.25), 7.934 (3.06), 8.004 (4.66), 8.008 (3.27), 8.022 (3.28), 8.026 (2.07), 8.393 (4.14), 8.396 (2.75), 8.414 (3.73), 8.417 (2.39), 8.962 (10.00), 9.118 (3.31), 9.139 (3.23).
4	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.33 分; MS (ESIpos): m/z = 483 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 0.008 (2.60), 0.833 (1.52), 0.839 (3.28), 0.855 (3.89), 0.859 (2.26), 0.871 (1.10), 0.876 (0.82), 1.106 (9.55), 1.157 (1.22), 1.175 (2.15), 1.193 (1.15), 1.988 (3.86), 2.058 (0.88), 2.066 (0.96), 2.076 (1.10), 2.086 (2.40), 2.093 (1.49), 2.100 (1.27), 2.109 (0.88), 2.196 (0.93), 2.208 (1.32), 2.221 (1.22), 2.229 (1.16), 2.243 (0.82), 3.076 (2.73), 3.288 (3.01), 4.021 (0.91), 4.038 (0.91), 4.221 (0.77), 4.241 (2.10), 4.249 (1.66), 4.261 (2.02), 4.270 (2.60), 4.279 (2.07), 4.287 (1.71), 4.296 (1.82), 5.266 (0.85), 5.281 (1.90), 5.301 (1.91), 5.315 (0.88), 6.789 (3.17), 6.791 (3.20), 6.809 (3.59), 6.812 (3.55), 6.916 (1.71), 6.918 (1.65), 6.934 (3.51), 6.937 (3.37), 6.953 (2.16), 6.956 (1.99), 7.157 (1.74), 7.162 (1.79), 7.179 (2.96), 7.196 (1.43), 7.200 (1.40), 7.379 (3.11), 7.398 (2.90), 7.676 (7.53), 7.680 (16.00), 7.685 (7.22), 7.688 (4.08), 7.694 (1.49), 7.893 (2.34), 7.911 (3.81), 7.914 (3.22), 7.932 (3.47), 8.006 (4.05), 8.010 (4.08), 8.024 (3.07), 8.027 (2.79), 8.387 (3.53), 8.390 (3.48), 8.408 (3.33), 8.411 (3.06), 8.962 (10.68), 9.251 (3.18), 9.272 (3.11).
5	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.24 分; MS (ESIpos): m/z = 449 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (3.48), 0.008 (3.53), 1.157 (0.87), 1.175 (1.69), 1.192 (0.90), 1.988 (2.96), 2.058 (0.97), 2.066 (1.02), 2.075 (1.14), 2.082 (1.14), 2.093 (1.62), 2.100 (1.34), 2.108 (0.97), 2.196 (1.00), 2.209 (1.44), 2.222 (1.34), 2.231 (1.27), 3.289 (3.14), 4.021 (0.70), 4.038 (0.70), 4.221 (0.87), 4.241 (2.39), 4.249 (1.84), 4.261 (2.26), 4.269 (2.89), 4.279 (2.24), 4.287 (1.79), 4.296 (2.04), 5.268 (0.95), 5.282 (2.07), 5.302 (2.07), 5.318 (0.95), 6.788 (3.63), 6.791 (4.03), 6.809 (4.26), 6.811 (4.43), 6.915 (2.02), 6.918 (2.07), 6.934 (4.08), 6.937 (4.13), 6.952 (2.54), 6.956 (2.41), 7.157 (2.04), 7.161 (2.19), 7.178 (3.28), 7.196 (1.67), 7.200 (1.59), 7.378 (3.31), 7.398 (3.16), 7.491 (1.37), 7.496 (1.05), 7.506 (3.83), 7.510 (10.25), 7.515 (4.63), 7.529 (6.47), 7.549 (2.34), 7.572 (3.11), 7.577 (5.20), 7.581 (2.86), 7.589 (1.84), 7.593 (2.59), 7.598 (1.67), 7.675 (2.91), 7.679 (6.05), 7.684 (3.38), 7.887 (2.84), 7.905 (4.85), 7.908 (3.73), 7.926 (5.13), 7.958

			(5.28), 7.962 (5.82), 7.976 (3.31), 7.979 (2.86), 8.362 (4.30), 8.366 (4.45), 8.383 (4.11), 8.387 (3.83), 8.934 (16.00), 9.244 (3.56), 9.265 (3.46).
6		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.31 分; MS (ESIpos): m/z = 433 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (3.23), 0.008 (3.14), 0.853 (0.88), 1.175 (2.40), 1.235 (4.21), 1.925 (1.92), 1.934 (0.91), 1.945 (1.99), 1.956 (2.12), 1.967 (0.92), 1.976 (2.11), 1.998 (0.79), 2.517 (2.33), 2.525 (2.38), 2.568 (0.89), 2.859 (1.26), 2.878 (1.91), 2.899 (2.60), 2.919 (1.22), 2.951 (1.61), 2.959 (1.75), 2.973 (1.77), 2.981 (1.65), 2.990 (0.94), 2.999 (0.87), 3.287 (2.04), 5.544 (1.02), 5.564 (3.03), 5.584 (3.00), 5.604 (0.98), 5.754 (7.31), 6.510 (1.69), 7.232 (5.18), 7.241 (5.18), 7.246 (6.49), 7.255 (9.27), 7.264 (2.87), 7.272 (3.87), 7.281 (2.34), 7.285 (1.99), 7.294 (1.18), 7.434 (2.78), 7.447 (2.68), 7.456 (2.20), 7.488 (0.77), 7.492 (1.58), 7.497 (1.25), 7.507 (4.17), 7.512 (9.71), 7.515 (6.13), 7.517 (5.24), 7.531 (6.56), 7.551 (2.46), 7.574 (3.40), 7.579 (5.63), 7.584 (3.06), 7.592 (1.94), 7.596 (2.78), 7.601 (1.72), 7.676 (3.20), 7.678 (3.96), 7.680 (6.36), 7.685 (3.54), 7.889 (3.03), 7.907 (5.37), 7.910 (3.81), 7.928 (5.57), 7.957 (5.81), 7.961 (6.39), 7.975 (3.50), 7.979 (2.97), 8.368 (4.68), 8.372 (4.77), 8.389 (4.45), 8.393 (4.06), 8.935 (16.00), 9.113 (3.64), 9.134 (3.51).
7		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.24 分; MS (ESIpos): m/z = 483 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 0.008 (3.31), 0.852 (0.82), 1.142 (0.91), 1.157 (1.29), 1.172 (2.28), 1.175 (2.52), 1.192 (1.46), 1.234 (5.59), 1.394 (15.65), 1.398 (16.00), 1.985 (3.80), 1.988 (4.30), 2.039 (2.93), 2.046 (3.13), 2.057 (3.86), 2.064 (3.92), 2.074 (5.03), 2.082 (7.46), 2.086 (6.64), 2.090 (3.57), 2.098 (2.57), 2.185 (3.22), 2.196 (4.56), 2.207 (4.45), 2.218 (4.15), 2.230 (3.16), 2.242 (2.40), 2.251 (1.61), 2.365 (0.76), 2.707 (0.88), 3.288 (5.56), 4.020 (1.05), 4.038 (1.02), 4.204 (2.11), 4.232 (5.79), 4.259 (7.69), 4.268 (7.31), 4.276 (6.03), 4.285 (6.49), 4.296 (2.90), 4.304 (2.52), 4.312 (1.99), 5.251 (2.66), 5.266 (6.52), 5.285 (7.14), 5.300 (3.71), 6.781 (12.26), 6.788 (2.84), 6.801 (13.54), 6.809 (3.01), 6.903 (5.41), 6.922 (11.79), 6.940 (7.05), 6.953 (1.43), 7.150 (6.38), 7.170 (10.21), 7.189 (4.94), 7.363 (10.65), 7.383 (15.97), 7.403 (10.71), 7.456 (7.17), 7.475 (11.58), 7.495 (5.62), 7.511 (3.80), 7.528 (2.19), 7.548 (0.88), 7.573 (1.93), 7.590 (1.14), 7.677 (2.72), 7.720 (7.52), 7.723 (13.02), 7.727 (7.34), 7.740 (6.82), 7.743 (11.14), 7.747 (6.20),

			7.845 (5.00), 7.849 (8.98), 7.852 (5.56), 7.863 (9.83), 7.866 (15.94), 7.870 (9.04), 7.883 (1.11), 7.898 (8.89), 7.902 (9.54), 7.919 (13.05), 7.923 (10.44), 7.937 (5.59), 7.940 (5.21), 7.958 (2.72), 7.976 (1.43), 8.362 (2.05), 8.383 (2.05), 8.397 (12.37), 8.418 (11.26), 8.854 (13.98), 8.860 (14.48), 8.932 (4.65), 9.245 (6.76), 9.254 (6.38), 9.266 (7.08), 9.275 (5.79).
8	2, 53	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.06 分; MS (ESIpos): m/z = 492 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (1.11), 0.008 (1.00), 3.066 (16.00), 3.071 (4.46), 3.287 (1.77), 3.926 (1.28), 4.269 (0.87), 6.785 (0.90), 6.788 (0.97), 6.805 (1.03), 6.808 (1.03), 6.925 (0.97), 6.928 (0.93), 6.944 (0.61), 6.947 (0.58), 7.171 (0.77), 7.359 (0.80), 7.378 (0.74), 7.629 (1.51), 7.634 (12.99), 7.647 (1.14), 7.650 (0.96), 7.668 (0.99), 7.790 (1.13), 7.793 (1.20), 7.807 (0.93), 7.811 (0.88), 8.229 (1.01), 8.233 (1.03), 8.251 (0.94), 8.254 (0.89), 8.632 (3.95), 9.084 (0.86), 9.105 (0.84).
9		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.04 分; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (2.94), 0.008 (2.72), 2.323 (0.52), 2.710 (0.57), 3.070 (16.00), 3.286 (4.49), 3.567 (0.42), 5.534 (0.73), 7.220 (1.05), 7.235 (1.05), 7.242 (1.91), 7.267 (0.89), 7.630 (1.27), 7.636 (12.76), 7.648 (1.00), 7.670 (0.93), 7.788 (1.11), 7.792 (1.16), 7.806 (0.97), 8.232 (1.08), 8.253 (0.95), 8.638 (4.07), 8.941 (0.86), 8.962 (0.79).
10		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.69 分; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (1.60), 0.008 (1.51), 2.326 (13.07), 3.055 (16.00), 3.288 (3.31), 6.784 (0.87), 6.787 (0.96), 6.804 (1.02), 6.807 (1.05), 6.922 (0.96), 6.925 (0.93), 6.940 (0.61), 6.943 (0.58), 7.009 (1.28), 7.147 (3.19), 7.584 (0.61), 7.601 (1.16), 7.604 (0.75), 7.622 (1.25), 7.640 (1.28), 7.645 (1.45), 7.658 (0.73), 8.150 (0.99), 8.154 (0.99), 8.170 (0.93), 8.175 (0.84), 8.581 (4.01), 9.069 (0.84), 9.090 (0.81).
11		LC-MS (方法 L7): R_t= 2.58 分; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.007 (1.04), 0.007 (1.04), 2.568 (6.31), 3.046 (16.00), 3.286 (1.53), 5.532 (0.72), 5.548 (0.72), 7.220 (1.16), 7.224 (0.84), 7.228 (1.19), 7.233 (1.07), 7.238 (1.68), 7.266 (0.89), 7.403 (0.73), 7.623 (0.69), 7.627 (1.62), 7.631 (1.75), 7.641 (5.09), 7.645 (3.28), 7.664 (1.62), 7.667 (1.70), 8.012 (1.49), 8.014 (1.50), 8.016 (1.25), 8.578 (3.50), 8.934 (0.95), 8.951 (0.93).
12		LC-MS (方法 L6):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (3.00), 0.008 (2.59), 2.566 (6.36), 3.042

	R_t= 2.18分; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H]+	(16.00), 3.287 (1.44), 4.270 (0.90), 5.754 (4.48), 6.785 (1.08), 6.806 (1.12), 6.923 (1.03), 6.942 (0.64), 7.168 (0.84), 7.351 (0.82), 7.371 (0.78), 7.621 (0.71), 7.626 (1.60), 7.630 (2.09), 7.639 (6.13), 7.644 (3.08), 7.665 (1.73), 7.670 (1.76), 8.012 (1.45), 8.572 (3.85), 9.076 (0.91), 9.096 (0.91).
13	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.05分; MS (ESIpos): m/z = 510 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (1.31), 0.008 (1.23), 3.065 (16.00), 4.270 (0.87), 6.785 (0.94), 6.788 (1.04), 6.806 (1.05), 6.809 (1.12), 6.926 (0.98), 6.929 (0.96), 6.944 (0.62), 7.171 (0.78), 7.377 (0.73), 7.628 (0.81), 7.646 (1.07), 7.650 (0.98), 7.668 (1.02), 7.802 (4.91), 7.806 (1.58), 7.818 (4.35), 7.824 (1.06), 8.227 (1.02), 8.231 (1.06), 8.249 (0.95), 8.252 (0.89), 8.636 (4.18), 9.087 (0.78), 9.108 (0.78).
14	LC-MS (方法 L7): R_t= 2.39分; MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d)δ[ppm]: -0.008 (1.09), 0.008 (1.14), 1.562 (5.12), 2.082 (1.48), 2.090 (1.98), 2.098 (3.67), 2.107 (2.27), 2.116 (1.78), 2.588 (16.00), 4.031 (2.54), 4.248 (1.04), 4.259 (1.53), 4.270 (1.04), 6.783 (0.82), 7.213 (0.97), 7.232 (0.93), 7.348 (4.36), 7.353 (5.19), 7.377 (0.81), 7.525 (1.06), 7.530 (1.97), 7.535 (1.20), 7.571 (0.87), 7.590 (1.42), 7.611 (1.29), 7.676 (1.58), 7.679 (1.69), 7.694 (1.17), 7.697 (1.10), 8.088 (1.16), 8.171 (1.22), 8.193 (1.14).
15	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.55分; MS (ESIpos): m/z = 452 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (1.60), 0.008 (1.51), 2.326 (13.07), 3.055 (16.00), 3.288 (3.31), 6.784 (0.87), 6.787 (0.96), 6.804 (1.02), 6.807 (1.05), 6.922 (0.96), 6.925 (0.93), 6.940 (0.61), 6.943 (0.58), 7.009 (1.28), 7.147 (3.19), 7.584 (0.61), 7.601 (1.16), 7.604 (0.75), 7.622 (1.25), 7.640 (1.28), 7.645 (1.45), 7.658 (0.73), 8.150 (0.99), 8.154 (0.99), 8.170 (0.93), 8.175
16	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.26分; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 2.756 (0.89), 2.770 (0.83), 3.070 (16.00), 7.124 (0.88), 7.173 (0.86), 7.177 (0.86), 7.190 (1.17), 7.202 (0.75), 7.207 (0.69), 7.389 (0.77), 7.627 (1.23), 7.632 (11.18), 7.645 (1.08), 7.648 (0.95), 7.666 (0.97), 7.783 (1.07), 7.787 (1.17), 7.801 (0.91), 7.805 (0.87), 8.228 (1.01), 8.232 (1.03), 8.250 (0.94), 8.253 (0.90), 8.608 (3.86), 8.972 (0.87), 8.993 (0.85).
17	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.24分; MS (ESIpos): m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (1.02), 0.008 (0.92), 1.169 (0.67), 3.268 (1.80), 3.280 (4.39), 3.287 (5.64), 3.865 (3.30), 3.877 (5.67), 3.889 (3.15), 4.244 (1.15), 4.252 (0.88), 4.265 (1.45), 4.276 (1.35), 4.283 (0.98), 4.292 (0.96), 5.255

	534 [M+H]+	(1.02), 5.275 (1.02), 6.786 (1.88), 6.789 (2.08), 6.807 (2.18), 6.810 (2.27), 6.915 (1.06), 6.918 (1.05), 6.934 (2.10), 6.937 (2.04), 6.952 (1.32), 6.955 (1.28), 7.153 (1.06), 7.158 (1.11), 7.175 (1.66), 7.192 (0.85), 7.196 (0.84), 7.380 (1.77), 7.399 (1.67), 7.633 (2.13), 7.636 (4.66), 7.639 (16.00), 7.643 (3.34), 7.682 (1.63), 7.699 (2.18), 7.703 (1.97), 7.721 (2.07), 7.830 (2.42), 7.834 (2.58), 7.848 (2.01), 7.851 (1.90), 8.276 (2.01), 8.280 (2.07), 8.297 (1.93), 8.301 (1.76), 8.699 (8.76), 9.164 (1.90), 9.184 (1.86).
18	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.77 分; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (2.30), 0.008 (2.10), 2.037 (0.83), 2.168 (0.72), 2.180 (0.72), 2.262 (16.00), 3.070 (2.04), 4.217 (0.95), 4.243 (1.45), 4.252 (1.36), 4.259 (1.09), 4.268 (1.06), 5.207 (0.94), 5.226 (0.92), 6.779 (1.82), 6.800 (1.99), 6.881 (1.11), 6.884 (1.13), 6.900 (2.29), 6.903 (2.22), 6.919 (1.39), 6.922 (1.31), 7.140 (0.97), 7.144 (1.05), 7.161 (1.67), 7.179 (0.84), 7.183 (0.82), 7.323 (2.16), 7.343 (1.95), 7.569 (0.80).
19	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.81 分; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (1.93), 0.008 (1.79), 1.879 (0.89), 1.899 (0.96), 1.908 (1.37), 1.930 (1.00), 2.261 (16.00), 2.832 (0.71), 2.851 (0.96), 2.871 (1.31), 2.940 (0.83), 2.949 (0.89), 2.962 (0.93), 2.971 (0.90), 3.081 (2.10), 5.500 (1.37), 5.520 (1.38), 7.201 (1.33), 7.207 (2.03), 7.215 (3.05), 7.223 (2.67), 7.230 (2.32), 7.243 (0.97), 7.248 (0.89), 7.258 (2.20), 7.274 (1.48), 7.280 (1.39), 7.361 (1.57), 7.368 (1.60), 7.383 (1.37), 7.546 (0.94), 7.568 (1.01).
20	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.32 分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 1.149 (1.09), 1.837 (2.38), 2.069 (1.99), 2.757 (4.80), 3.878 (12.72), 5.231 (2.34), 7.125 (3.98), 7.180 (3.90), 7.197 (4.92), 7.213 (3.63), 7.411 (3.59), 7.428 (3.24), 7.636 (16.00), 7.680 (2.42), 7.698 (3.79), 7.718 (2.69), 7.826 (4.25), 7.842 (3.43), 8.280 (3.71), 8.300 (3.40), 8.673 (8.04), 9.047 (3.28), 9.067 (3.16).
21	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.20 分; MS (ESIpos): m/z = 494 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 3.071 (16.00), 5.515 (0.74), 5.535 (0.74), 7.213 (1.11), 7.222 (1.33), 7.230 (1.61), 7.234 (1.34), 7.261 (0.99), 7.381 (0.72), 7.389 (0.77), 7.495 (2.53), 7.500 (2.65), 7.584 (0.68), 7.607 (1.36), 7.630 (0.72), 7.679 (0.71), 7.684 (1.25), 7.689 (0.68), 8.280 (0.72), 8.295 (0.78), 8.304 (0.76), 8.319 (0.70), 8.607 (3.29), 8.927 (0.97), 8.948 (0.95).

22	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.26 分；MS（ESIpos）：m/z = 510 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ[ppm]：3.067（16.00），4.249（0.91），4.258（0.94），6.779（0.92），6.782（1.01），6.800（1.06），6.803（1.10），6.912（1.02），6.915（1.03），6.931（0.61），7.165（0.86），7.339（0.87），7.358（0.82），7.494（2.71），7.499（2.71），7.584（0.72），7.607（1.42），7.630（0.77），7.677（0.88），7.682（1.54），7.687（0.82），8.278（0.75），8.294（0.81），8.302（0.81），8.318（0.73），8.600（3.49），9.066（0.94），9.087（0.93）.
23	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0:8/分；MS（ESIpos）：m/z = 496 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ[ppm]：−0.149（1.58），−0.008（15.27），0.008（13.12），0.146（1.58），2.154（1.98），2.367（2.04），2.709（1.98），3.054（12.95），3.067（11.82），3.288（8.82），4.260（5.48），5.250（2.09），6.782（4.01），6.803（4.13），6.895（1.92），6.910（3.67），6.928（2.37），7.160（2.83），7.308（3.11），7.325（2.94），7.517（2.49），7.535（3.73），7.556（3.00），7.732（4.18），7.746（3.45），7.784（14.53），7.801（16.00），8.339（3.17），8.360（3.05），8.453（11.82），8.966（3.17），8.987（3.22）.
24	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0:86 分；MS（ESIpos）：m/z = 478 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ[ppm]：−0.149（1.23），−0.008（10.75），0.008（11.29），0.146（1.26），0.850（1.36），0.868（0.82），2.046（1.11），2.061（1.08），2.140（1.17），2.154（1.33），3.055（9.80），3.067（9.17），3.287（3.23），4.246（2.43），4.259（4.02），4.274（2.37），5.230（1.36），5.250（1.39），6.778（2.53），6.781（2.78），6.799（2.91），6.802（3.04），6.891（1.39），6.894（1.42），6.909（2.75），6.912（2.81），6.928（1.71），6.931（1.74），7.140（1.36），7.144（1.49），7.161（2.21），7.179（1.14），7.183（1.17），7.305（2.15），7.324（2.09），7.516（2.06），7.534（2.62），7.537（2.50），7.555（2.43），7.595（1.71），7.599（3.98），7.604（4.93），7.615（16.00），7.620（9.01），7.713（3.07），7.716（3.35），7.730（2.69），7.734（2.59），7.792（1.55），7.805（1.49），8.336（2.21），8.340（2.40），8.358（2.25），8.362（2.18），8.446（9.01），8.968（2.50），8.989（2.43）.
25	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.08 分；MS（ESIpos）：m/z = 500 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ[ppm]：3.282（1.79），3.293（1.98），3.311（16.00），6.807（0.71），6.932（0.68），7.468（0.89），7.474（0.85），7.493（0.76），7.540（0.71），7.643（0.98），7.780（0.75），8.673（1.65）.
26	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.07 分；MS（ESIpos）：m/z =	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ[ppm]：−0.008（4.85），0.008（4.19），1.234（0.78），1.710（0.76），1.740（0.93），1.986（1.09），1.999（1.07），2.007（1.05），2.021（0.85），2.072（1.71），2.366（0.62），2.709（0.62），3.287（4.75），3.971（0.74），3.977（0.87），3.999

	515 [M+H]+	(1.86), 4.006 (1.18), 4.021 (1.22), 4.027 (0.93), 4.132 (0.93), 4.139 (1.24), 4.149 (1.14), 4.158 (1.40), 4.168 (0.85), 4.176 (0.89), 4.185 (0.68), 5.041 (0.74), 5.055 (1.65), 5.074 (1.65), 5.088 (0.72), 6.741 (3.06), 6.761 (3.39), 6.837 (1.45), 6.840 (1.45), 6.856 (3.14), 6.874 (1.94), 7.020 (2.31), 7.039 (1.88), 7.122 (1.63), 7.126 (1.53), 7.142 (2.64), 7.160 (1.30), 7.164 (1.22), 7.264 (5.35), 7.499 (5.93), 7.502 (6.65), 7.519 (3.45), 7.523 (3.34), 7.700 (5.90), 7.703 (16.00), 7.802 (2.44), 7.820 (3.22), 7.841 (2.46), 7.917 (3.72), 8.008 (3.14), 8.011 (3.53), 8.027 (2.79), 8.030 (2.85), 8.962 (2.87), 8.982 (2.79), 9.152 (10.38).
27	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.06 分; MS (ESIpos): m/z = 530 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 12.73 (brs, 1H), 9.01 (d, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.30 (brd, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.41 – 7.62 (m, 4H), 7.07 – 7.36 (m, 8H), 5.39 – 5.60 (m, 2H), 2.90 – 3.07 (m, 2H), 2.73 – 2.88 (m, 2H), 2.57 – 2.69 (m, 1H), 2.53 – 2.71 (m, 13H), 2.30 – 2.44 (m, 1H), 2.09 (dq, 1H), 1.93 (dq, 1H).
28	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.09 分; MS (ESIpos): m/z = 564 [M+H]+	
29	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.88 分; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 3.072 (16.00), 3.287 (1.21), 5.754 (0.68), 6.774 (0.89), 6.777 (0.93), 6.794 (1.01), 6.797 (0.99), 6.905 (0.97), 6.908 (0.91), 6.923 (0.62), 7.303 (0.79), 7.311 (0.71), 7.324 (0.64), 7.332 (1.23), 7.579 (0.65), 7.633 (3.39), 7.641 (1.60), 7.651 (1.51), 8.240 (1.01), 8.247 (0.94), 8.258 (0.82), 8.265 (0.85), 8.531 (4.23), 9.073 (0.80), 9.093 (0.77).
30	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.88 分; MS (ESIpos): m/z = 460 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (0.71), 3.063 (16.00), 4.262 (0.82), 4.270 (0.92), 6.784 (0.87), 6.787 (0.95), 6.805 (1.03), 6.808 (1.04), 6.924 (0.98), 6.927 (0.96), 6.943 (0.63), 6.946 (0.58), 7.171 (0.79), 7.351 (0.81), 7.370 (0.78), 7.496 (0.70), 7.523 (0.72), 7.620 (0.81), 7.637 (1.13), 7.641 (1.00), 7.659 (1.13), 7.751 (1.16), 7.754 (1.21), 7.768 (0.93), 7.772 (0.86), 8.201 (1.03), 8.205 (1.05), 8.222 (0.98), 8.226 (0.90), 8.613 (3.83), 9.077 (0.87), 9.097 (0.85).
31	LC-MS (方法 L1):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 3.059 (16.00), 3.287 (0.75), 3.855 (10.21), 4.263

	R_t= 0.83分; MS (ESIpos): m/z = 472 [M+H]+	(0.81), 4.271 (0.92), 6.785 (0.89), 6.788 (1.00), 6.806 (1.02), 6.808 (1.10), 6.923 (0.99), 6.926 (1.02), 6.942 (0.60), 7.143 (0.67), 7.149 (1.06), 7.154 (1.00), 7.171 (0.85), 7.244 (0.97), 7.265 (0.76), 7.273 (0.99), 7.294 (0.73), 7.344 (0.93), 7.349 (1.64), 7.366 (1.32), 7.370 (1.57), 7.607 (0.73), 7.625 (1.04), 7.628 (0.92), 7.646 (1.00), 7.731 (1.12), 7.735 (1.21), 7.749 (0.87), 7.752 (0.84), 8.176 (0.99), 8.180 (1.04), 8.197 (0.93), 8.201 (0.91), 8.600 (3.83), 9.082 (0.91), 9.103 (0.89).
32	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.87分; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (1.08), 0.008 (1.10), 3.069 (16.00), 3.944 (7.95), 4.253 (0.96), 4.262 (1.04), 6.777 (1.03), 6.781 (1.18), 6.798 (1.20), 6.801 (1.26), 6.894 (0.57), 6.897 (0.59), 6.912 (1.14), 6.915 (1.14), 6.931 (0.70), 6.934 (0.68), 7.116 (0.62), 7.131 (0.71), 7.134 (0.70), 7.146 (0.75), 7.163 (0.92), 7.186 (0.84), 7.213 (0.89), 7.339 (0.92), 7.358 (0.88), 7.623 (0.67), 7.641 (1.36), 7.643 (0.86), 7.661 (1.47), 7.675 (1.33), 7.679 (1.50), 7.692 (0.67), 8.235 (1.06), 8.239 (1.07), 8.255 (1.01), 8.260 (0.92), 8.549 (4.05), 9.070 (1.00), 9.091 (0.97).
33	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.84分; MS (ESIpos): m/z = 456 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 1.819 (1.63), 1.835 (1.55), 3.072 (16.00), 4.248 (0.89), 4.257 (0.93), 6.777 (0.92), 6.798 (1.00), 6.904 (0.81), 7.160 (1.13), 7.181 (0.99), 7.184 (0.91), 7.328 (0.83), 7.347 (0.76), 7.558 (0.73), 7.562 (0.79), 7.576 (1.27), 7.579 (1.20), 7.618 (1.09), 7.635 (0.76), 7.639 (1.15), 7.656 (0.69), 8.216 (1.00), 8.220 (1.05), 8.237 (0.92), 8.241 (0.89), 8.521 (3.83).
34	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.93分; MS (ESIpos): m/z = 492 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (0.91), 0.008 (0.91), 3.074 (16.00), 3.287 (1.06), 4.248 (0.91), 4.255 (1.07), 6.771 (1.09), 6.774 (1.20), 6.792 (1.29), 6.795 (1.32), 6.903 (1.12), 6.922 (0.67), 7.140 (0.60), 7.156 (0.93), 7.324 (1.17), 7.328 (1.10), 7.343 (1.08), 7.347 (1.14), 7.426 (0.79), 7.437 (0.86), 7.628 (1.83), 7.632 (3.18), 7.651 (1.79), 7.669 (0.69), 7.675 (1.55), 7.679 (1.60), 7.695 (1.35), 7.699 (1.26), 8.240 (1.22), 8.246 (1.24), 8.259 (1.08), 8.265 (1.09), 8.520 (2.86).
35	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.12分; MS (ESIpos): m/z = 484 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (3.10), 0.008 (2.86), 1.147 (0.97), 1.920 (1.70), 1.930 (0.91), 1.940 (1.83), 1.952 (1.95), 1.961 (0.97), 1.971 (1.89), 1.993 (0.73), 2.366 (2.43), 2.525 (6.69), 2.566 (2.62), 2.710 (2.49), 2.831 (0.79), 2.852 (1.52), 2.871 (2.01), 2.891 (2.68), 2.911 (1.22), 2.963 (1.58), 2.972 (1.70), 2.985 (1.70), 2.994 (1.64), 3.002 (1.03), 3.012 (0.91), 3.024 (0.91), 3.033 (0.79), 3.288

		(15.21), 3.297 (13.02), 3.859 (8.40), 3.871 (12.35), 3.882 (7.85), 5.524 (1.03), 5.543 (3.04), 5.563 (3.04), 5.582 (1.03), 7.226 (5.23), 7.234 (5.60), 7.240 (6.14), 7.248 (9.06), 7.258 (2.62), 7.270 (4.02), 7.279 (2.43), 7.292 (1.40), 7.420 (2.92), 7.429 (2.92), 7.442 (2.56), 7.451 (2.31), 7.456 (1.58), 7.466 (3.71), 7.471 (6.39), 7.476 (4.68), 7.479 (4.87), 7.497 (6.69), 7.516 (3.10), 7.538 (3.41), 7.542 (5.84), 7.547 (3.29), 7.556 (1.89), 7.560 (3.10), 7.565 (1.64), 7.640 (4.26), 7.644 (6.69), 7.649 (3.89), 7.675 (2.92), 7.693 (4.50), 7.696 (3.83), 7.714 (4.26), 7.777 (5.05), 7.781 (5.23), 7.795 (3.71), 7.799 (3.35), 8.255 (4.14), 8.258 (4.14), 8.276 (3.95), 8.279 (3.65), 8.675 (16.00), 9.020 (4.02), 9.041 (3.89).
36	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.86 分; MS (ESIpos): m/z = 472 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.149 (0.70), −0.008 (6.82), 0.008 (6.40), 0.146 (0.83), 1.147 (1.53), 1.926 (4.03), 1.947 (3.76), 2.328 (1.25), 2.366 (2.09), 2.665 (1.11), 2.670 (1.25), 2.710 (2.09), 3.072 (16.00), 3.289 (10.16), 4.248 (1.11), 5.225 (0.56), 6.775 (1.11), 6.796 (1.25), 6.903 (0.83), 7.131 (1.11), 7.159 (1.11), 7.263 (0.83), 7.328 (0.97), 7.346 (0.83), 7.461 (1.25), 7.481 (0.97), 7.564 (0.97), 7.578 (1.39), 7.582 (1.39), 7.619 (1.11), 7.640 (1.25), 7.658 (0.70), 8.216 (1.11), 8.518 (4.31), 9.058 (0.56).
37	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.90 分; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (3.91), 0.008 (3.78), 1.147 (0.96), 2.019 (0.89), 2.028 (1.03), 2.047 (0.96), 2.055 (1.51), 2.062 (1.30), 2.070 (0.89), 2.170 (0.96), 2.182 (1.30), 2.194 (1.30), 2.204 (1.17), 2.327 (0.69), 2.366 (1.44), 2.665 (0.55), 2.669 (0.76), 2.674 (0.55), 2.710 (1.51), 3.081 (16.00), 4.212 (0.69), 4.232 (2.20), 4.240 (1.85), 4.252 (3.50), 4.261 (3.64), 4.268 (2.06), 4.277 (1.99), 4.295 (0.69), 5.218 (0.89), 5.232 (1.92), 5.252 (1.85), 5.266 (0.82), 6.778 (3.50), 6.781 (3.85), 6.799 (4.05), 6.802 (4.26), 6.894 (2.06), 6.897 (2.06), 6.912 (3.98), 6.915 (3.98), 6.931 (2.61), 6.934 (2.40), 7.143 (1.99), 7.147 (2.06), 7.164 (3.09), 7.182 (1.65), 7.186 (1.58), 7.319 (1.65), 7.341 (6.59), 7.364 (4.74), 7.480 (1.51), 7.487 (2.06), 7.495 (1.72), 7.502 (2.27), 7.518 (1.72), 7.528 (1.30), 7.540 (1.30), 7.636 (2.33), 7.654 (3.71), 7.657 (2.95), 7.675 (3.57), 7.730 (3.16), 7.745 (2.06), 8.257 (2.47), 8.277 (2.33), 8.550 (5.15), 9.077 (2.61), 9.097 (2.61).
38	LC-MS (方法 L6):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.149 (1.49), −0.008 (13.57), 0.008 (12.78), 0.146

	R_t= 1.80 分; MS (ESIpos): m/z = 508 [M+H]+	(1.49), 1.147 (1.73), 2.199 (0.78), 2.327 (1.25), 2.366 (1.88), 2.669 (1.41), 2.710 (1.88), 3.043 (1.65), 3.079 (16.00), 3.287 (12.86), 3.611 (0.63), 3.906 (4.16), 3.922 (4.16), 4.249 (0.78), 5.247 (0.71), 6.777 (1.10), 6.798 (1.18), 6.911 (0.94), 7.160 (0.86), 7.355 (1.18), 7.651 (0.71), 7.669 (1.02), 7.690 (1.18), 7.752 (1.25), 8.280 (1.02), 8.302 (0.94), 8.544 (4.00).
39	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.94 分; MS (ESIpos): m/z = 526 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (0.97), 0.008 (0.99), 3.043 (0.70), 3.071 (16.00), 3.289 (2.25), 4.241 (0.92), 4.250 (0.99), 6.769 (1.02), 6.772 (1.12), 6.789 (1.19), 6.792 (1.24), 6.877 (0.58), 6.896 (1.12), 6.914 (0.70), 7.137 (0.61), 7.154 (0.92), 7.318 (0.87), 7.339 (1.14), 7.361 (0.68), 7.374 (0.75), 7.394 (0.75), 7.597 (1.38), 7.604 (2.28), 7.624 (1.55), 7.641 (0.61), 7.776 (0.75), 7.894 (0.85), 7.899 (0.85), 7.904 (0.85), 7.910 (0.73), 8.233 (1.09), 8.239 (1.09), 8.253 (0.97), 8.258 (0.95), 8.473 (2.47), 8.476 (2.79), 9.074 (0.75), 9.094 (0.70).
40	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.28 分; MS (ESIpos): m/z = 510 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (1.20), 0.008 (1.12), 3.036 (16.00), 3.287 (1.15), 4.256 (0.82), 4.265 (0.81), 6.785 (0.91), 6.788 (1.01), 6.805 (1.04), 6.808 (1.09), 6.923 (0.98), 6.926 (0.95), 6.942 (0.61), 7.171 (0.77), 7.355 (0.79), 7.374 (0.75), 7.674 (1.45), 7.677 (3.02), 7.681 (6.87), 7.684 (2.17), 7.687 (1.35), 7.794 (0.76), 7.801 (1.01), 7.816 (0.76), 7.823 (0.93), 7.884 (0.86), 7.892 (0.85), 7.910 (0.84), 7.917 (0.75), 8.627 (3.52), 9.120 (0.88), 9.140 (0.86).
41	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.29 分; MS (ESIpos): m/z = 528 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 3.035 (16.00), 3.287 (1.06), 4.256 (0.95), 4.266 (0.97), 6.788 (1.08), 6.808 (1.19), 6.924 (1.08), 7.173 (0.90), 7.355 (0.95), 7.374 (0.86), 7.810 (0.67), 7.817 (0.87), 7.833 (0.70), 7.840 (0.82), 7.861 (3.09), 7.878 (3.15), 7.884 (0.99), 7.891 (0.79), 7.910 (0.83), 7.917 (0.71), 8.631 (3.37), 9.121 (1.00), 9.142 (0.97).
42	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.31 分; MS (ESIpos): m/z = 552 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 2.084 (0.98), 2.091 (0.83), 2.207 (0.87), 2.219 (0.85), 2.229 (0.81), 3.239 (2.45), 3.250 (5.46), 3.261 (5.61), 3.272 (2.65), 3.288 (1.94), 3.860 (4.44), 3.872 (7.25), 3.883 (4.20), 4.238 (1.42), 4.245 (1.11), 4.259 (1.49), 4.266 (1.84), 4.275 (1.47), 4.281 (1.19), 4.290 (1.20), 5.250 (1.36), 5.269 (1.34), 6.787 (2.49), 6.807 (2.79), 6.913 (1.30), 6.916 (0.97), 6.932 (2.70), 6.950 (1.60), 7.154 (1.30), 7.175 (2.09), 7.193 (1.03), 7.377 (2.28), 7.395 (2.06), 7.684

			(12.45), 7.686 (16.00), 7.839 (1.47), 7.843 (1.61), 7.846 (1.80), 7.861 (1.53), 7.869 (1.65), 7.892 (1.84), 7.899 (1.55), 7.917 (1.79), 7.924 (1.38), 8.694 (6.98), 9.201 (2.39), 9.221 (2.33).
43		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.31 分; MS (ESIpos): m/z = 570 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.149 (0.62), −0.008 (6.95), 0.008 (6.61), 0.146 (0.77), 1.146 (1.05), 1.235 (0.81), 2.085 (1.58), 2.208 (1.53), 2.327 (0.77), 2.366 (1.29), 2.670 (0.91), 2.709 (1.39), 3.249 (9.34), 3.260 (9.68), 3.287 (9.96), 3.861 (7.43), 3.872 (12.12), 3.883 (7.23), 4.238 (2.40), 4.266 (3.02), 4.275 (2.49), 4.292 (2.01), 5.250 (2.25), 5.269 (2.25), 6.790 (4.07), 6.808 (4.50), 6.916 (2.01), 6.932 (4.26), 6.954 (2.49), 7.159 (2.20), 7.176 (3.50), 7.197 (1.72), 7.377 (3.69), 7.396 (3.50), 7.856 (2.83), 7.863 (5.37), 7.868 (13.51), 7.884 (16.00), 7.891 (4.55), 7.898 (2.97), 7.916 (3.26), 7.923 (2.54), 8.700 (13.03), 9.202 (3.83), 9.222 (3.78).
44		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.90 分; MS (ESIpos): m/z = 472 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (2.21), 0.008 (2.14), 2.301 (2.93), 2.377 (7.46), 3.062 (16.00), 4.263 (0.86), 4.270 (0.99), 6.785 (1.06), 6.788 (1.15), 6.805 (1.22), 6.808 (1.26), 6.905 (0.56), 6.908 (0.59), 6.924 (1.13), 6.927 (1.11), 6.943 (0.70), 6.946 (0.67), 7.153 (0.60), 7.170 (0.91), 7.286 (1.86), 7.333 (1.69), 7.335 (1.73), 7.358 (0.93), 7.374 (0.87), 7.417 (1.07), 7.421 (1.60), 7.610 (0.86), 7.627 (1.27), 7.631 (1.03), 7.648 (1.23), 7.712 (1.31), 7.716 (1.44), 7.730 (0.99), 7.734 (0.91), 8.169 (2.71), 8.193 (1.12), 8.196 (1.15), 8.214 (1.07), 8.218 (1.00), 8.609 (4.09), 9.077 (0.98), 9.098 (0.96).
45		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.89 分; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (2.87), 0.008 (2.38), 3.066 (16.00), 4.242 (0.72), 4.261 (1.05), 4.269 (1.17), 6.785 (1.14), 6.788 (1.20), 6.805 (1.30), 6.808 (1.32), 6.906 (0.63), 6.909 (0.64), 6.924 (1.28), 6.928 (1.24), 6.943 (0.82), 6.946 (0.75), 7.149 (0.62), 7.153 (0.66), 7.171 (1.01), 7.352 (0.99), 7.371 (1.02), 7.477 (0.90), 7.498 (1.55), 7.521 (1.34), 7.580 (0.77), 7.586 (0.81), 7.593 (0.84), 7.598 (0.88), 7.602 (0.64), 7.607 (0.63), 7.614 (0.57), 7.622 (1.17), 7.639 (1.40), 7.643 (1.20), 7.661 (1.36), 7.754 (1.52), 7.758 (1.56), 7.772 (1.24), 7.776 (1.13), 7.788 (1.17), 7.794 (1.08), 7.807 (1.15), 7.812 (1.07), 8.205 (1.23), 8.208 (1.27), 8.226 (1.17), 8.230 (1.10), 8.278 (0.69), 8.614 (3.82), 9.077 (1.08), 9.098 (1.06).
46		LC-MS (方法 L1):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.149 (0.83), −0.008 (7.27), 0.008 (6.79), 0.146

	R_t= 0.94 分; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H]+	(0.83), 2.033 (0.69), 2.041 (0.72), 2.053 (0.69), 2.068 (1.10), 2.076 (0.89), 2.083 (0.66), 2.176 (0.69), 2.189 (0.92), 2.201 (0.92), 2.211 (0.83), 2.236 (0.60), 2.366 (0.98), 2.710 (1.04), 3.074 (16.00), 4.241 (1.55), 4.249 (1.37), 4.261 (2.38), 4.269 (2.62), 4.285 (1.40), 5.226 (0.60), 5.241 (1.40), 5.260 (1.40), 5.275 (0.63), 6.785 (2.53), 6.788 (2.68), 6.806 (2.92), 6.809 (2.95), 6.906 (1.43), 6.909 (1.46), 6.924 (2.86), 6.928 (2.74), 6.943 (1.82), 6.946 (1.67), 7.150 (1.52), 7.154 (1.49), 7.171 (2.23), 7.189 (1.16), 7.193 (1.13), 7.356 (2.32), 7.374 (2.20), 7.429 (1.13), 7.432 (1.46), 7.435 (2.47), 7.438 (2.26), 7.446 (1.31), 7.453 (2.06), 7.457 (2.41), 7.459 (2.77), 7.463 (2.86), 7.468 (1.43), 7.473 (1.61), 7.478 (1.13), 7.515 (3.04), 7.519 (4.35), 7.523 (2.26), 7.625 (0.72), 7.631 (2.68), 7.649 (2.86), 7.652 (2.59), 7.670 (2.77), 7.790 (2.95), 7.794 (3.10), 7.809 (2.47), 7.812 (2.32), 8.232 (2.15), 8.235 (2.18), 8.253 (2.06), 8.256 (1.97), 8.418 (1.28), 8.623 (3.81), 9.088 (2.12), 9.108 (2.06).
47	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.92 分; MS (ESIpos): m/z = 478 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.149 (0.98), −0.011 (6.35), −0.008 (14.61), 0.008 (8.04), 0.146 (1.09), 1.147 (0.63), 2.033 (1.06), 2.041 (1.06), 2.052 (1.09), 2.068 (1.50), 2.075 (1.28), 2.083 (0.90), 2.176 (1.09), 2.189 (1.39), 2.201 (1.31), 2.211 (1.20), 2.669 (0.60), 3.079 (16.00), 4.220 (0.82), 4.240 (2.37), 4.249 (2.02), 4.260 (3.57), 4.269 (3.60), 4.275 (2.15), 4.285 (1.88), 4.304 (0.65), 5.228 (0.95), 5.240 (1.99), 5.261 (1.91), 5.275 (0.82), 6.787 (3.71), 6.790 (3.68), 6.807 (4.17), 6.810 (3.93), 6.906 (2.15), 6.909 (2.07), 6.924 (4.01), 6.928 (3.68), 6.943 (2.53), 6.947 (2.18), 7.152 (2.07), 7.156 (2.10), 7.173 (3.11), 7.190 (1.58), 7.194 (1.53), 7.352 (3.08), 7.371 (3.03), 7.558 (4.31), 7.575 (4.63), 7.581 (5.34), 7.599 (4.61), 7.608 (0.93), 7.632 (2.81), 7.650 (3.84), 7.653 (3.35), 7.671 (3.43), 7.791 (4.03), 7.795 (4.09), 7.809 (3.35), 7.813 (2.94), 8.233 (2.78), 8.254 (2.40), 8.444 (1.55), 8.617 (4.03), 9.093 (2.64), 9.113 (2.53).
48	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.98 分; MS (ESIpos): m/z = 526 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.149 (1.64), −0.008 (16.00), 0.008 (12.95), 0.146 (1.58), 1.147 (1.58), 2.025 (1.87), 2.033 (2.09), 2.045 (2.32), 2.060 (3.17), 2.068 (2.71), 2.169 (2.04), 2.181 (2.94), 2.195 (2.83), 2.203 (2.83), 2.217 (1.87), 2.327 (1.02), 2.366 (2.15), 2.669 (1.30), 2.709 (2.20), 3.193 (6.61), 4.195 (1.58), 4.216

			(4.24), 4.237 (3.56), 4.253 (3.34), 4.262 (4.35), 4.269 (3.79), 4.278 (3.96), 4.289 (1.70), 4.297 (1.92), 5.198 (1.70), 5.212 (3.84), 5.232 (3.84), 6.786 (7.41), 6.789 (7.75), 6.807 (8.54), 6.810 (8.59), 6.888 (4.13), 6.891 (4.18), 6.907 (8.65), 6.910 (8.37), 6.925 (5.37), 6.928 (4.98), 7.149 (4.18), 7.153 (4.35), 7.171 (6.78), 7.188 (3.34), 7.192 (3.39), 7.341 (7.24), 7.360 (6.90), 7.446 (3.39), 7.466 (2.77), 7.516 (4.01), 7.681 (4.47), 7.699 (5.88), 7.720 (4.01), 7.798 (2.94), 8.345 (2.37), 8.479 (3.11), 9.124 (3.00), 9.144 (3.05).
49	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.86 分; MS (ESIpos): m/z = 460 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.149 (1.77), −0.008 (16.00), 0.008 (13.79), 0.146 (1.77), 1.147 (1.47), 2.040 (1.77), 2.067 (2.73), 2.073 (2.21), 2.189 (2.43), 2.201 (2.36), 2.211 (2.29), 2.327 (1.40), 2.366 (2.73), 2.669 (1.40), 2.710 (2.65), 3.179 (6.34), 4.207 (1.25), 4.228 (3.47), 4.249 (3.02), 4.259 (3.32), 4.270 (3.61), 4.276 (3.02), 4.286 (3.10), 4.304 (1.33), 5.225 (3.17), 5.245 (3.10), 6.420 (0.59), 6.443 (0.59), 6.792 (6.34), 6.795 (6.64), 6.813 (7.37), 6.816 (7.30), 6.900 (3.39), 6.903 (3.47), 6.918 (6.93), 6.922 (6.78), 6.937 (4.50), 6.940 (4.35), 7.156 (3.54), 7.160 (3.61), 7.178 (5.46), 7.195 (3.24), 7.199 (2.80), 7.217 (0.66), 7.241 (1.11), 7.265 (0.74), 7.319 (9.07), 7.324 (9.73), 7.345 (12.90), 7.366 (6.05), 7.377 (1.84), 7.382 (1.92), 7.398 (1.62), 7.404 (1.33), 7.653 (3.10), 7.671 (4.87), 7.692 (3.76), 7.820 (4.87), 7.836 (3.98), 8.132 (1.25), 8.280 (2.36), 8.538 (1.62), 9.132 (2.51).
50	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.96 分; MS (ESIpos): m/z = 510 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.149 (1.73), −0.008 (16.00), 0.008 (14.73), 0.146 (1.80), 1.147 (1.73), 2.033 (2.47), 2.045 (2.87), 2.060 (3.80), 2.075 (2.47), 2.167 (2.47), 2.180 (3.53), 2.192 (3.47), 2.201 (3.33), 2.214 (2.40), 2.327 (1.33), 2.366 (2.40), 2.669 (1.53), 2.710 (2.40), 3.162 (9.07), 4.196 (1.80), 4.217 (5.20), 4.238 (4.73), 4.250 (4.93), 4.260 (5.33), 4.267 (4.60), 4.275 (4.67), 4.295 (2.07), 5.197 (2.00), 5.213 (4.67), 5.232 (4.67), 5.245 (2.20), 6.784 (9.40), 6.786 (10.33), 6.804 (10.73), 6.807 (11.13), 6.887 (5.20), 6.890 (5.40), 6.906 (10.73), 6.909 (10.67), 6.924 (6.47), 6.928 (6.20), 7.147 (5.13), 7.151 (5.33), 7.168 (8.33), 7.185 (4.13), 7.189 (4.07), 7.347 (8.87), 7.363 (8.33), 7.540 (4.60), 7.680 (3.40), 7.698 (6.33), 7.719 (4.87), 7.790 (8.33), 7.878 (3.47), 8.132 (1.13), 8.342 (3.00), 8.498 (4.40), 9.120 (3.87), 9.138 (3.87).

51	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.89 分；MS（ESIpos）：m/z = 476 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ[ppm]：−0.149（1.69），−0.008（16.00），0.008（14.14），0.146（1.86），1.147（1.52），2.032（1.78），2.060（2.62），2.183（2.37），2.196（2.29），2.205（2.20），2.218（1.61），2.328（1.27），2.332（1.02），2.366（2.88），2.670（1.44），2.710（3.05），3.203（4.99），4.196（1.27），4.217（3.30），4.237（2.88），4.263（3.56），4.271（3.05），4.280（3.13），5.211（3.13），5.231（3.13），6.787（6.26），6.790（6.52），6.808（7.20），6.811（7.11），6.889（3.64），6.892（3.64），6.908（7.53），6.911（6.94），6.927（4.49），6.930（4.23），7.151（3.56），7.155（3.56），7.172（5.59），7.189（2.79），7.193（2.96），7.346（7.28），7.364（8.30），7.436（3.30），7.697（5.67），7.718（4.06），7.778（2.46），8.132（1.69），8.336（1.86），8.478（2.12），9.127（2.37）。
52	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.17 分；MS（ESIpos）：m/z = 534 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ[ppm]：−0.150（0.80），−0.008（7.08），0.008（6.23），0.146（0.85），1.147（0.94），1.234（1.04），1.401（0.66），2.061（1.98），2.184（1.46），2.196（1.94），2.208（1.84），2.218（1.84），2.327（0.66），2.366（1.32），2.669（0.76），2.710（1.37），3.288（16.00），3.336（2.41），3.866（9.35），3.876（15.01），3.888（8.54），4.211（1.09），4.231（3.26），4.239（2.55），4.252（4.48），4.262（4.25），4.270（2.78），4.279（2.83），4.298（0.94），5.241（2.45），5.256（2.41），5.754（5.00），6.777（5.57），6.794（5.95），6.797（6.14），6.893（2.17），6.912（4.63），6.930（2.69），7.140（2.64），7.161（4.58），7.178（2.08），7.304（1.84），7.307（1.98），7.323（2.88），7.327（3.59），7.333（2.45），7.352（7.69），7.370（4.44），7.413（2.17），7.424（2.55），7.432（3.73），7.444（4.11），7.451（2.08），7.463（2.03），7.655（2.12），7.659（2.93），7.672（7.74），7.677（7.17），7.684（14.35），7.687（8.73），7.704（12.93），7.707（7.46），7.722（3.26），8.277（5.38），8.282（5.47），8.297（4.91），8.302（4.67），8.583（8.50），8.590（9.39），9.143（2.27），9.158（3.16），9.178（2.55）。
53	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.02 分；MS（ESIpos）：m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ[ppm]：−0.011（3.43），−0.008（7.74），0.008（4.34），0.146（0.57），1.157（2.48），1.175（4.93），1.193（2.43），1.988（8.75），2.057（0.67），2.072（0.90），2.080（0.75），2.204（0.82），2.216（0.77），2.225（0.77），3.272（2.97），3.285（6.13），3.297（8.04），3.863（4.09），3.875（6.63），3.887（3.55），3.945（16.00），4.003（0.72），4.021（2.03），4.038（2.03），4.056（0.67），4.236（1.36），4.244（1.09），4.257（1.56），4.270（1.44），4.277（1.09），4.286（1.09），5.250（1.24），5.269（1.16），6.780（2.31），6.783（2.38），6.800（2.55），6.803（2.50），6.902（1.27），6.906（1.27），6.921

		(2.43), 6.924 (2.23), 6.940 (1.54), 6.943 (1.36), 7.100 (0.70), 7.115 (1.01), 7.121 (1.41), 7.128 (0.80), 7.137 (1.63), 7.140 (1.61), 7.146 (1.99), 7.151 (1.98), 7.156 (1.37), 7.166 (2.21), 7.168 (2.40), 7.186 (1.12), 7.190 (1.14), 7.195 (1.44), 7.199 (1.34), 7.216 (1.04), 7.221 (2.01), 7.226 (1.29), 7.243 (0.85), 7.247 (0.80), 7.353 (0.64), 7.356 (0.82), 7.361 (2.01), 7.374 (1.09), 7.377 (1.11), 7.381 (1.86), 7.391 (0.57), 7.465 (0.90), 7.485 (0.60), 7.676 (1.27), 7.694 (3.10), 7.714 (4.29), 7.717 (3.84), 7.722 (3.60), 7.734 (1.24), 7.739 (0.70), 8.095 (0.60), 8.278 (2.26), 8.283 (2.09), 8.298 (2.13), 8.303 (1.81), 8.615 (10.00), 9.154 (2.23), 9.175 (2.11).
54	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.24 分；MS (ESIpos)：m/z = 552 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]：−0.149 (1.29), −0.008 (12.61), 0.008 (10.72), 0.146 (1.29), 1.147 (0.91), 1.235 (0.73), 1.988 (0.80), 2.087 (1.68), 2.210 (1.47), 2.231 (1.33), 2.366 (1.33), 2.710 (1.40), 3.267 (4.16), 3.278 (9.96), 3.287 (15.97), 3.864 (7.30), 3.876 (12.16), 3.888 (7.06), 4.224 (0.73), 4.244 (2.38), 4.252 (1.92), 4.265 (3.14), 4.276 (3.00), 4.292 (2.06), 5.255 (2.20), 5.275 (2.24), 6.789 (4.37), 6.810 (4.72), 6.916 (1.99), 6.919 (2.06), 6.934 (4.26), 6.953 (2.59), 7.154 (2.24), 7.158 (2.17), 7.175 (3.49), 7.192 (1.71), 7.381 (3.70), 7.399 (3.42), 7.681 (3.00), 7.699 (4.19), 7.702 (3.95), 7.720 (3.84), 7.806 (14.46), 7.822 (14.43), 7.843 (4.61), 7.846 (4.93), 7.861 (3.77), 7.864 (3.67), 8.273 (3.95), 8.277 (4.12), 8.295 (3.81), 8.298 (3.67), 8.704 (16.00), 9.165 (3.98), 9.186 (3.91).
55	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.44 分；MS (ESIpos)：m/z = 472 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]：−0.008 (1.58), 0.008 (1.48), 3.056 (16.00), 3.065 (1.61), 3.289 (1.47), 3.903 (10.43), 3.909 (1.22), 4.271 (0.85), 6.785 (0.92), 6.788 (1.00), 6.805 (1.06), 6.808 (1.08), 6.926 (1.03), 6.929 (0.97), 6.945 (0.63), 7.171 (0.82), 7.220 (0.62), 7.242 (1.22), 7.264 (0.82), 7.354 (0.82), 7.374 (1.35), 7.376 (1.39), 7.382 (0.75), 7.475 (0.94), 7.480 (0.83), 7.507 (0.90), 7.513 (0.86), 7.597 (0.76), 7.615 (1.05), 7.618 (0.89), 7.636 (1.04), 7.717 (1.17), 7.721 (1.25), 7.735 (0.90), 7.739 (0.84), 8.156 (1.01), 8.160 (1.04), 8.177 (0.96), 8.181 (0.89), 8.608 (4.20), 9.075 (0.90), 9.096 (0.86).
56	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.79 分；MS (ESIpos)：m/z =	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]：2.403 (6.76), 3.060 (16.00), 3.164 (0.79), 3.174 (0.80), 4.261 (0.74), 6.787 (0.91), 6.789 (0.97), 6.803 (1.01), 6.806 (1.01), 6.925 (0.96), 6.927 (0.92), 6.940 (0.58), 7.170 (0.76), 7.355 (0.76), 7.370 (0.74), 7.431

	472 [M+H]+	(1.71), 7.447 (1.38), 7.451 (1.32), 7.614 (0.78), 7.629 (1.13), 7.631 (1.04), 7.636 (1.77), 7.639 (1.64), 7.646 (1.03), 7.721 (1.15), 7.724 (1.19), 7.735 (0.90), 7.738 (0.83), 8.185 (1.00), 8.188 (1.01), 8.202 (0.95), 8.205 (0.87), 8.601 (3.95), 9.077 (0.87), 9.094 (0.83).
57	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.92 分; MS (ESIpos): m/z = 478 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 3.070 (16.00), 6.781 (0.93), 6.783 (1.06), 6.797 (1.06), 6.799 (1.13), 6.915 (0.96), 6.917 (1.03), 6.932 (0.60), 7.165 (0.83), 7.344 (0.86), 7.358 (0.80), 7.637 (0.80), 7.652 (1.06), 7.654 (0.90), 7.669 (1.03), 7.716 (1.03), 7.718 (1.16), 7.730 (0.77), 7.732 (0.77), 8.251 (0.96), 8.254 (1.06), 8.268 (0.93), 8.271 (0.93), 8.559 (3.79), 9.074 (0.90), 9.090 (0.86).
58	2, 11	^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 8.8706 (0.51); 8.8451 (2.08); 8.4185 (0.68); 8.4155 (0.7); 8.3974 (0.66); 8.3942 (0.64); 8.3138 (0.34); 7.7984 (0.62); 7.7955 (0.67); 7.7805 (0.77); 7.7776 (0.75); 7.664 (3.27); 7.6592 (3.77); 7.602 (0.98); 7.5971 (1.58); 7.5922 (0.8); 7.5884 (0.66); 7.5699 (0.62); 7.5674 (0.69); 7.5491 (0.53); 7.2426 (0.53); 7.2249 (0.57); 7.1558 (0.53); 7.1387 (0.34); 6.8988 (0.39); 6.896 (0.43); 6.8801 (0.66); 6.8773 (0.7); 6.8616 (0.34); 6.8587 (0.35); 6.806 (0.78); 6.8035 (0.77); 6.7857 (0.73); 6.7829 (0.66); 5.3292 (0.33); 4.3233 (0.33); 4.2445 (0.35); 3.315 (36.45); 2.6749 (0.48); 2.6702 (0.67); 2.6656 (0.48); 2.5236 (1.77); 2.5187 (2.78); 2.5102 (37.2); 2.5056 (77.48); 2.501 (107.64); 2.4965 (79.14); 2.492 (37.03); 2.3325 (0.44); 2.3279 (0.63); 2.3234 (0.47); 1.9882 (0.43); 1.398 (16); 0.008 (1.74); −0.0001 (52.5); −0.0085 (1.57)
59	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.42 分; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (3.35), 0.008 (3.16), 2.093 (0.79), 2.366 (0.71), 2.710 (0.67), 2.925 (16.00), 3.287 (2.93), 4.247 (1.14), 4.254 (1.00), 4.266 (1.71), 4.274 (1.91), 4.289 (1.02), 4.422 (6.70), 5.298 (1.04), 5.319 (1.04), 6.784 (2.02), 6.787 (2.18), 6.804 (2.31), 6.807 (2.37), 6.889 (1.10), 6.893 (1.06), 6.908 (2.16), 6.911 (2.08), 6.927 (1.37), 6.930 (1.31), 7.145 (1.10), 7.150 (1.10), 7.167 (1.66), 7.184 (0.83), 7.188 (0.85), 7.302 (0.69), 7.319 (1.89), 7.333 (0.81), 7.337 (1.46), 7.341 (0.81), 7.389 (2.00), 7.405 (3.56), 7.408 (5.68), 7.421 (2.41), 7.427 (4.85), 7.444 (4.93), 7.461 (2.10), 7.465 (1.46), 7.642 (1.14), 7.646 (2.04), 7.647 (2.98), 7.651 (5.53), 7.656 (14.31), 7.660 (4.91), 7.690 (1.73), 7.708 (2.27), 7.711

			(1.98), 7.729 (2.16), 7.835 (2.54), 7.838 (2.66), 7.853 (2.02), 7.857 (1.91), 8.318 (2.18), 8.321 (2.23), 8.339 (2.06), 8.343 (1.85), 8.752 (9.09), 9.153 (2.02), 9.174 (1.98).
60		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.85 分; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.988 (0.48), 2.044 (0.43), 2.085 (0.43), 3.066 (2.26), 3.075 (16.00), 3.169 (2.25), 4.230 (0.60), 4.249 (0.92), 4.257 (1.04), 4.271 (0.62), 5.227 (0.50), 5.244 (0.54), 6.775 (1.07), 6.793 (1.18), 6.884 (0.51), 6.903 (1.06), 6.922 (0.68), 7.141 (0.56), 7.158 (0.91), 7.175 (0.50), 7.214 (0.55), 7.331 (0.84), 7.351 (0.82), 7.438 (1.23), 7.449 (1.52), 7.460 (1.03), 7.467 (1.28), 7.625 (0.51), 7.638 (2.53), 7.642 (1.75), 7.657 (1.45), 7.674 (0.45), 8.228 (0.46), 8.248 (0.96), 8.254 (0.96), 8.266 (0.84), 8.273 (0.82), 8.522 (3.66), 9.072 (0.54), 9.091 (0.52).
61		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.62 分; MS (ESIpos): m/z = 456 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (4.15), 0.008 (3.77), 2.366 (1.07), 2.386 (6.43), 2.710 (1.00), 3.060 (16.00), 3.287 (5.91), 3.681 (0.59), 4.270 (0.79), 6.787 (0.97), 6.805 (1.00), 6.808 (1.04), 6.923 (0.93), 6.942 (0.66), 7.187 (0.86), 7.221 (1.56), 7.355 (0.76), 7.372 (0.76), 7.608 (0.76), 7.626 (1.07), 7.629 (0.93), 7.647 (1.04), 7.717 (1.14), 7.720 (1.21), 7.734 (0.90), 7.738 (0.79), 8.188 (1.00), 8.192 (1.04), 8.210 (0.93), 8.214 (0.90), 8.606 (3.97), 9.077 (0.83), 9.097 (0.79).
62		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.27 分; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, ジクロロメタン-d2) δ [ppm]: 3.078 (16.00), 4.203 (0.84), 5.308 (0.97), 5.320 (1.31), 5.341 (0.74), 5.356 (0.72), 6.815 (1.16), 6.831 (1.27), 6.913 (1.20), 6.927 (0.69), 7.165 (0.71), 7.179 (1.10), 7.297 (0.77), 7.305 (0.99), 7.315 (1.75), 7.331 (1.10), 7.446 (0.67), 7.463 (1.09), 7.554 (0.91), 7.569 (1.18), 7.571 (1.18), 7.586 (0.87), 7.726 (1.17), 7.728 (1.20), 7.740 (1.02), 7.741 (1.01), 8.152 (1.65), 8.166 (1.87), 8.673 (2.52).
63		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.57 分; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.362 (0.64), 2.635 (0.64), 3.075 (16.00), 6.787 (0.94), 6.790 (1.04), 6.804 (1.04), 6.806 (1.09), 6.925 (0.94), 6.927 (0.99), 6.942 (0.59), 7.171 (0.79), 7.355 (0.84), 7.369 (0.79), 7.422 (1.78), 7.603 (0.74), 7.612 (0.79), 7.670 (0.79), 7.684 (0.99), 7.687 (0.99), 7.702 (0.89), 7.857 (1.04), 7.859 (1.19), 7.871 (0.99), 7.873 (1.04), 8.279 (0.99), 8.282 (1.09), 8.296 (0.99), 8.301 (1.88), 8.311 (1.39), 8.626 (3.76), 9.094 (0.84), 9.110 (0.84).

64	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.48 分；MS（ESIpos）：m/z = 455 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (1.17), 3.065 (16.00), 3.909 (9.18), 4.260 (0.93), 4.268 (0.99), 5.752 (2.29), 6.786 (1.02), 6.803 (1.15), 6.806 (1.15), 6.923 (1.06), 6.941 (0.64), 7.014 (1.90), 7.016 (2.04), 7.169 (0.88), 7.194 (1.22), 7.197 (1.12), 7.207 (1.15), 7.210 (1.10), 7.349 (0.91), 7.368 (0.83), 7.632 (0.74), 7.650 (1.07), 7.653 (0.90), 7.671 (0.98), 7.768 (1.17), 7.772 (1.15), 7.785 (0.90), 7.789 (0.83), 8.205 (1.69), 8.218 (1.63), 8.232 (1.04), 8.236 (1.05), 8.254 (0.98), 8.257 (0.90), 8.602 (3.69), 9.076 (0.93), 9.097 (0.90).
65	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.69 分；MS（ESIpos）：m/z = 459 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：2.362 (0.80), 2.635 (0.74), 3.074 (16.00), 4.264 (0.74), 6.790 (1.04), 6.804 (1.04), 6.806 (1.16), 6.926 (0.98), 6.928 (1.04), 6.941 (0.55), 7.173 (0.80), 7.358 (0.86), 7.372 (0.80), 7.654 (1.04), 7.657 (1.16), 7.667 (1.66), 7.680 (0.98), 7.683 (0.98), 7.697 (0.92), 7.752 (1.90), 7.753 (1.96), 7.849 (1.04), 7.852 (1.16), 7.864 (0.98), 7.866 (0.98), 8.277 (0.98), 8.280 (1.10), 8.294 (0.92), 8.297 (0.98), 8.479 (1.53), 8.489 (1.53), 8.630 (3.74), 9.093 (0.92), 9.109 (0.92).
66	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.08 分；MS（ESIpos）：m/z = 453 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.007 (3.16), 0.007 (2.43), 2.085 (0.91), 2.479 (16.00), 3.063 (15.53), 3.290 (1.71), 4.259 (0.73), 5.753 (4.07), 6.787 (0.96), 6.789 (1.08), 6.805 (1.15), 6.923 (1.01), 6.925 (1.05), 6.938 (0.58), 6.940 (0.59), 7.170 (0.86), 7.229 (4.94), 7.355 (0.90), 7.369 (0.82), 7.626 (0.70), 7.640 (1.04), 7.643 (0.94), 7.657 (0.96), 7.718 (1.11), 7.721 (1.23), 7.732 (0.83), 7.735 (0.84), 8.141 (0.84), 8.219 (0.97), 8.222 (1.05), 8.236 (0.90), 8.239 (0.91), 8.601 (3.53), 9.079 (0.94), 9.095 (0.92).
67	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.42 分；MS（ESIpos）：m/z = 520 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (1.73), 0.008 (1.62), 1.083 (7.08), 1.101 (16.00), 1.119 (7.35), 2.523 (1.15), 3.360 (2.01), 3.378 (5.98), 3.395 (5.74), 3.413 (1.81), 4.238 (1.03), 4.246 (0.84), 4.259 (1.48), 4.269 (1.39), 4.277 (0.92), 4.286 (0.88), 5.239 (0.96), 5.259 (0.94), 6.786 (1.61), 6.789 (1.77), 6.807 (1.84), 6.809 (1.93), 6.913 (0.87), 6.916 (0.88), 6.931 (1.76), 6.934 (1.80), 6.950 (1.09), 6.953 (1.08), 7.152 (0.90), 7.156 (0.98), 7.174 (1.49), 7.191 (0.74), 7.195 (0.72), 7.362 (1.54), 7.378 (1.43), 7.628 (0.85), 7.634 (2.10), 7.638 (4.21), 7.644 (9.24), 7.649 (4.32), 7.657 (2.01), 7.660 (1.75), 7.678 (1.75), 7.797 (1.98), 7.800 (2.12), 7.815

68	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.36 分；MS (ESIpos)：m/z = 583 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：1.845 (0.84), 2.040 (0.83), 2.050 (0.89), 2.057 (0.88), 2.068 (0.71), 4.052 (0.72), 4.064 (0.80), 4.069 (1.50), 4.075 (0.94), 4.087 (0.97), 4.092 (0.74), 4.167 (0.77), 4.172 (0.97), 4.180 (0.89), 4.187 (1.11), 5.072 (1.29), 5.088 (1.26), 5.753 (0.58), 6.752 (2.43), 6.754 (2.55), 6.768 (2.63), 6.771 (2.67), 6.844 (1.23), 6.846 (1.20), 6.859 (2.46), 6.861 (2.43), 6.874 (1.49), 6.876 (1.41), 7.069 (2.20), 7.082 (1.84), 7.134 (1.29), 7.138 (1.18), 7.151 (2.04), 7.165 (1.14), 7.168 (0.92), 7.593 (2.44), 7.595 (2.47), 7.610 (2.69), 7.612 (2.56), 7.680 (0.95), 7.709 (1.44), 7.711 (2.27), 7.713 (4.04), 7.716 (8.15), 7.718 (16.00), 7.721 (5.44), 7.831 (2.20), 7.845 (2.64), 7.848 (2.23), 7.863 (2.06), 8.037 (2.79), 8.039 (2.83), 8.051 (2.40), 8.054 (2.29), 8.418 (6.05), 8.870 (4.59), 8.961 (0.63), 9.079 (2.41), 9.095 (2.29), 9.192 (9.46).
69	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.86 分；MS (ESIpos)：m/z = 514 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]：-0.008 (4.56), 0.008 (2.59), 1.234 (0.95), 1.880 (1.58), 1.890 (0.87), 1.901 (1.75), 1.912 (1.84), 1.923 (0.87), 1.933 (1.74), 2.350 (0.80), 2.361 (1.45), 2.369 (1.79), 2.381 (1.55), 2.392 (1.49), 2.401 (1.25), 2.775 (0.78), 2.797 (1.46), 2.816 (1.81), 2.837 (2.31), 2.858 (1.06), 2.937 (1.44), 2.945 (1.55), 2.959 (1.61), 2.966 (1.48), 2.976 (1.06), 2.985 (0.97), 2.998 (0.95), 3.005 (0.79), 5.345 (0.97), 5.365 (2.65), 5.384 (2.58), 5.405 (0.85), 5.754 (15.35), 7.164 (0.99), 7.182 (3.03), 7.195 (4.52), 7.200 (5.02), 7.215 (3.94), 7.230 (2.07), 7.247 (4.63), 7.264 (2.46), 7.277 (3.90), 7.293 (2.68), 7.402 (2.41), 7.420 (3.40), 7.441 (2.65), 7.539 (4.31), 7.610 (2.91), 7.615 (5.39), 7.620 (4.00), 7.646 (16.00), 7.651 (11.73), 7.738 (4.35), 7.756 (3.85), 8.133 (12.50), 8.155 (3.28), 8.795 (9.42), 8.838 (3.65), 8.858 (3.47), 9.979 (4.48), 12.732 (2.72).
70	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.42 分；MS (ESIneg)：m/z = 465 [M-H]-	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：2.912 (16.00), 3.056 (8.85), 3.304 (1.27), 5.751 (0.73), 6.786 (0.85), 6.788 (0.88), 6.802 (0.93), 6.805 (0.92), 6.832 (0.77), 6.848 (0.83), 6.883 (0.92), 6.887 (1.01), 6.888 (1.00), 6.921 (0.87), 6.923 (0.83), 7.219 (0.72), 7.235 (1.00), 7.251 (0.60), 7.591 (0.61), 7.605 (0.91), 7.608 (0.71), 7.622 (0.84), 7.675 (0.96), 7.678 (0.97), 7.689 (0.69), 8.132 (0.85), 8.150 (0.79), 8.153 (0.78), 8.168 (0.74), 8.567 (2.33), 9.079 (0.74).
71	LC-MS（方法 L6）：	^{1}H-NMR (500 MHz, クロロホルム-d) δ [ppm]：3.144 (16.00), 3.851 (8.34), 4.212 (0.71),

	R_t= 0.97 分; MS (ESIneg): m/z = 476 [M-H]-	6.859 (1.08), 6.861 (1.16), 6.875 (1.18), 6.877 (1.26), 6.908 (0.59), 6.910 (0.57), 6.923 (1.17), 6.925 (1.11), 6.938 (0.69), 6.940 (0.64), 7.204 (0.94), 7.302 (0.98), 7.318 (0.92), 7.590 (0.88), 7.604 (1.17), 7.607 (1.08), 7.621 (1.12), 7.653 (1.78), 7.757 (1.31), 7.760 (1.38), 7.772 (1.15), 7.774 (1.07), 7.886 (0.77), 8.127 (1.09), 8.130 (1.10), 8.144 (1.04), 8.147 (0.99), 9.040 (1.35).
72	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.34 分; MS (ESIpos): m/z = 515 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.934 (0.65), 0.951 (1.40), 0.969 (0.72), 1.815 (0.91), 1.825 (1.04), 1.842 (1.24), 1.859 (0.77), 2.014 (1.18), 2.027 (1.17), 2.035 (1.12), 2.049 (0.88), 2.694 (1.05), 4.031 (0.92), 4.052 (1.96), 4.059 (1.36), 4.073 (1.35), 4.080 (1.05), 4.158 (1.43), 4.168 (1.30), 4.176 (1.62), 4.186 (0.92), 4.196 (0.91), 5.044 (0.78), 5.058 (1.79), 5.077 (1.81), 5.092 (0.82), 6.686 (3.38), 6.691 (5.17), 6.696 (3.37), 6.736 (3.20), 6.754 (3.60), 6.845 (1.55), 6.864 (3.34), 6.883 (2.11), 7.082 (3.20), 7.102 (2.64), 7.117 (1.82), 7.122 (1.57), 7.138 (2.83), 7.156 (1.43), 7.665 (2.79), 7.668 (2.76), 7.686 (3.87), 7.689 (3.76), 7.710 (16.00), 7.714 (7.25), 7.776 (2.70), 7.794 (3.62), 7.815 (2.25), 7.938 (5.43), 7.942 (5.37), 7.987 (3.52), 7.990 (3.35), 8.005 (3.05), 8.008 (2.74), 8.147 (5.19), 8.153 (5.21), 8.914 (3.01), 8.935 (2.93), 9.116 (10.01).
73	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.71 分; MS (ESIpos): m/z = 463 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.06), 0.008 (1.57), 2.133 (0.74), 2.366 (0.70), 2.524 (2.87), 2.710 (0.70), 3.079 (16.00), 4.252 (0.87), 4.260 (0.94), 5.753 (3.02), 5.955 (1.19), 6.777 (1.02), 6.794 (1.11), 6.881 (0.59), 6.900 (1.22), 6.902 (1.13), 6.918 (0.70), 7.029 (0.98), 7.031 (1.06), 7.047 (1.44), 7.135 (1.44), 7.156 (2.13), 7.174 (1.26), 7.248 (1.09), 7.254 (1.43), 7.262 (1.04), 7.308 (1.02), 7.322 (0.96), 7.342 (0.81), 7.404 (1.37), 7.424 (1.15), 7.629 (0.83), 7.647 (1.07), 7.650 (0.89), 7.668 (1.04), 7.733 (1.26), 7.737 (1.35), 7.751 (0.94), 7.754 (0.87), 8.192 (1.00), 8.196 (1.04), 8.214 (0.98), 8.217 (0.87), 8.469 (3.80), 9.059 (0.93), 9.080 (0.89), 11.099 (0.85).
74	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.42 分; MS (ESIpos): m/z = 508 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.169 (16.00), 3.645 (1.14), 3.658 (1.38), 6.782 (0.83), 6.799 (0.91), 6.803 (0.87), 6.899 (0.86), 7.602 (1.31), 7.607 (1.19), 7.622 (4.81), 7.627 (2.96), 8.133 (2.91), 8.546 (2.19).

75	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.54 分；MS（ESIpos）：m/z = 536 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：-0.008（0.97），0.008（0.95），2.085（1.49），3.061（10.00），3.173（16.00），3.455（2.24），3.469（1.54），3.554（0.89），3.567（1.31），3.585（1.41），6.788（1.20），6.791（1.37），6.809（1.39），6.812（1.48），6.926（1.31），6.929（1.31），6.944（0.78），6.947（0.77），7.174（1.05），7.357（1.04），7.372（1.00），7.637（2.10），7.641（10.04），7.645（3.82），7.663（1.38），7.667（1.27），7.685（1.30），7.805（1.45），7.809（1.59），7.823（1.19），7.827（1.19），8.299（1.28），8.303（1.36），8.320（1.23），8.324（1.19），8.712（5.32），9.065（1.22），9.086（1.19）。
76	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.92 分；MS（ESIpos）：m/z = 522 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：-0.008（2.51），0.008（2.41），2.063（1.06），2.073（1.60），2.143（0.95），2.157（1.15），2.327（0.87），2.523（2.45），2.670（0.84），3.334（4.14），3.356（4.85），3.567（2.37），3.581（5.84），3.593（3.89），3.684（3.13），3.697（2.74），4.269（3.13），4.278（2.53），4.286（1.74），5.247（1.52），5.266（1.51），6.783（2.84），6.786（3.12），6.804（3.25），6.807（3.39），6.884（1.49），6.887（1.55），6.903（3.11），6.906（3.03），6.921（1.86），6.924（1.77），7.143（1.48），7.148（1.63），7.165（2.50），7.182（1.18），7.186（1.20），7.294（2.53），7.314（2.37），7.531（1.18），7.551（1.97），7.569（1.32），7.609（3.49），7.614（3.76），7.624（16.00），7.628（9.17），7.750（2.78），7.766（2.37），8.381（1.85），8.402（1.76），8.558（5.29），9.023（1.39），9.042（1.36）。
77	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.88 分；MS（ESIpos）：m/z = 533 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：2.063（0.91），3.712（0.91），4.023（3.89），4.028（3.96），4.242（1.32），4.251（1.33），4.261（1.86），4.270（2.06），4.282（1.19），4.674（1.12），4.887（1.03），4.916（1.04），4.929（2.17），4.947（2.17），4.961（1.00），5.241（1.16），5.261（1.09），5.754（5.20），6.794（2.03），6.814（2.13），6.905（0.96），6.907（1.01），6.923（1.92），6.926（1.96），6.942（1.13），6.945（1.13），7.156（1.19），7.160（1.25），7.177（1.78），7.195（0.88），7.199（0.81），7.327（1.71），7.346（1.58），7.626（1.09），7.630（1.31），7.640（16.00），7.647（1.70），7.659（2.46），7.664（2.09），7.681（1.56），7.839（1.82），7.842（2.20），7.857（1.59），7.860（1.81），8.138（2.43），8.305（1.86），8.309（2.07），8.327（1.68），8.330（1.74），8.711（2.71），8.734（6.72），8.846（0.69），9.226（1.85），9.246（1.78）。
78	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.41 分；MS	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：1.356（0.92），3.007（16.00），3.407（0.85），3.421（1.08），3.473（1.23），3.486（0.97），3.552（1.13），3.559（1.40），3.565（1.84），3.573

	(ESIpos): m/z = 580 [M+H]+	(1.77), 5.754 (2.61), 6.794 (0.83), 6.813 (0.96), 6.927 (0.88), 7.329 (0.75), 7.638 (0.93), 7.643 (1.08), 7.652 (3.47), 7.657 (2.11), 7.666 (0.89), 7.687 (0.67), 7.810 (0.96), 7.827 (0.77), 8.237 (0.79), 8.240 (0.79), 8.258 (0.74), 8.764 (3.04), 8.881 (0.82), 8.901 (0.79).
79	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.67 分; MS (ESIpos): m/z = 502 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.20), 0.008 (2.00), 1.091 (1.05), 1.157 (1.00), 1.175 (2.17), 1.193 (1.28), 1.234 (2.13), 1.391 (1.14), 1.908 (3.71), 1.916 (4.42), 1.924 (10.00), 1.932 (4.39), 1.941 (3.75), 1.956 (1.50), 1.988 (1.88), 2.462 (0.91), 2.472 (1.20), 2.689 (7.43), 2.825 (0.94), 2.845 (1.20), 2.865 (1.56), 2.965 (0.92), 2.977 (0.96), 3.288 (1.30), 3.650 (3.10), 3.666 (7.98), 3.682 (2.94), 5.489 (1.79), 5.509 (1.80), 7.211 (2.58), 7.215 (2.00), 7.221 (3.24), 7.228 (2.98), 7.231 (3.71), 7.233 (3.97), 7.245 (1.09), 7.259 (2.43), 7.271 (1.46), 7.356 (1.78), 7.365 (1.99), 7.377 (1.40), 7.477 (1.97), 7.495 (2.48), 7.498 (2.33), 7.516 (2.30), 7.604 (1.42), 7.610 (3.39), 7.614 (5.27), 7.620 (16.00), 7.624 (6.54), 7.709 (2.80), 7.713 (3.02), 7.727 (2.49), 7.731 (2.42), 8.263 (2.41), 8.266 (2.49), 8.284 (2.32), 8.288 (2.22), 8.452 (9.01), 8.878 (2.24), 8.899 (2.20).
80	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.91 分; MS (ESIpos): m/z = 546 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.90), −0.008 (7.64), 0.008 (7.69), 0.146 (0.95), 1.175 (0.44), 1.236 (2.24), 1.879 (1.70), 1.916 (1.03), 1.936 (0.98), 1.950 (0.87), 1.968 (0.77), 1.988 (0.87), 2.327 (1.36), 2.366 (1.49), 2.523 (5.17), 2.670 (1.57), 2.710 (1.16), 2.815 (0.49), 2.835 (0.85), 2.855 (1.11), 2.874 (1.26), 2.893 (0.67), 2.959 (0.72), 2.972 (0.87), 2.981 (0.80), 2.993 (0.90), 3.021 (0.54), 3.798 (0.87), 3.816 (0.93), 4.640 (1.05), 4.654 (1.23), 4.662 (1.13), 5.511 (0.54), 5.530 (1.39), 5.549 (1.36), 5.567 (0.54), 7.231 (2.24), 7.240 (2.39), 7.248 (3.68), 7.253 (2.98), 7.271 (2.68), 7.285 (1.05), 7.446 (1.44), 7.453 (1.57), 7.467 (1.34), 7.629 (1.65), 7.640 (16.00), 7.667 (1.67), 7.801 (2.32), 7.816 (1.85), 8.282 (1.65), 8.301 (1.57), 8.695 (6.92), 12.590 (0.62).
81	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.92 分; MS (ESIpos): m/z = 478 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (1.26), 0.008 (1.50), 3.074 (16.00), 4.253 (0.86), 4.262 (0.91), 5.754 (4.63), 6.778 (0.85), 6.781 (0.95), 6.799 (0.99), 6.801 (1.02), 6.913 (0.95), 6.917 (0.94), 6.932 (0.59), 7.164 (0.79), 7.343 (0.82), 7.648 (0.69), 7.665 (1.10), 7.669 (0.79), 7.687 (1.14), 7.721 (1.10), 7.725 (1.20), 7.739

		(0.70), 7.743 (0.63), 8.265 (0.99), 8.269 (1.00), 8.286 (0.94), 8.290 (0.86), 8.566 (3.67), 9.075 (0.84), 9.096 (0.82).
82	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.08 分; MS (ESIpos): m/z = 520 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.288 (1.60), 3.300 (2.14), 3.311 (16.00), 3.865 (1.20), 3.877 (2.00), 3.888 (1.13), 6.780 (0.66), 6.783 (0.71), 6.800 (0.74), 6.803 (0.77), 6.922 (0.70), 6.925 (0.69), 7.385 (0.70), 7.720 (0.80), 7.741 (0.83), 7.764 (0.84), 7.768 (0.91), 8.304 (0.65), 8.308 (0.66), 8.325 (0.62), 8.635 (2.82), 9.161 (0.64).
83	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.26 分; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (3.64), 0.008 (3.64), 1.988 (0.96), 2.038 (0.93), 2.045 (0.98), 2.057 (1.02), 2.073 (1.49), 2.080 (1.22), 2.189 (0.93), 2.203 (1.36), 2.215 (1.27), 2.224 (1.27), 3.259 (1.29), 3.277 (3.60), 3.290 (8.31), 3.334 (2.18), 3.610 (5.58), 3.867 (6.16), 3.880 (11.07), 3.892 (6.04), 4.234 (2.20), 4.241 (1.69), 4.254 (2.29), 4.261 (2.71), 4.269 (2.31), 4.275 (1.84), 4.285 (1.84), 5.232 (0.89), 5.247 (2.02), 5.267 (2.02), 5.281 (0.89), 6.685 (0.98), 6.706 (1.07), 6.779 (3.53), 6.782 (3.93), 6.800 (4.02), 6.803 (4.29), 6.901 (1.93), 6.904 (1.98), 6.919 (3.93), 6.922 (3.96), 6.938 (2.44), 6.941 (2.38), 7.146 (1.98), 7.150 (2.13), 7.167 (3.18), 7.185 (1.62), 7.189 (1.60), 7.363 (3.33), 7.380 (3.22), 7.384 (3.18), 7.389 (2.04), 7.409 (4.31), 7.426 (3.07), 7.429 (3.18), 7.466 (2.24), 7.471 (2.76), 7.482 (2.33), 7.486 (3.64), 7.490 (1.80), 7.502 (1.51), 7.506 (1.38), 7.602 (1.44), 7.620 (2.38), 7.640 (1.22), 7.704 (2.67), 7.722 (4.38), 7.725 (3.36), 7.742 (4.40), 7.779 (4.49), 7.783 (5.00), 7.797 (2.96), 7.800 (2.76), 8.308 (3.76), 8.312 (3.84), 8.329 (3.56), 8.333 (3.38), 8.612 (16.00), 9.161 (3.69), 9.182 (3.62).
84	LC-MS (方法 L5): R_t= 0.69 分; MS (ESIpos): m/z = 517 [M+H]+	
85	LC-MS (方法 L5): R_t= 1.38 分; MS (ESIpos): m/z = 564 [M+H]+	

86		LC-MS（方法 L5）：R_t= 1.20 分；MS（ESIpos）：m/z = 524 [M+H]+
87		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.25 分；MS（ESIpos）：m/z = 519 [M+H]+
88	1,3	LC-MS（方法 L5）：R_t=0.71 分；MS（ESIpos）：m/z = 519 [M+H]+
89	2,2	LC-MS（方法 L5）：R_t=0.95 分；MS（ESIpos）：m/z = 506 [M+H]+
90	4,9	LC-MS（方法 L5）：R_t=1.33 分；MS（ESIpos）：m/z = 534 [M+H]+
91	2,9	LC-MS（方法 L5）：R_t=1.12 分；MS（ESIpos）：m/z = 546 [M+H]+
92	2,9	LC-MS（方法 L5）：R_t=1.12 分；MS（ESIpos）：m/z = 546 [M+H]+
93		LC-MS（方法 L5）：

			R_t=1.33分; MS (ESIpos): m/z = 564 [M+H]+
94			LC-MS (方法 L5): R_t=0.72分; MS (ESIpos): m/z = 545 [M+H]+
95			LC-MS (方法 L5): R_t=0.96分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+
96	1,4		LC-MS (方法 L5): R_t=0.74分; MS (ESIpos): m/z = 545 [M+H]+
97			LC-MS (方法 L5): R_t=1.01分; MS (ESIpos): m/z = 544 [M+H]+
98			LC-MS (方法 L5): R_t=0.90分; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H]+
99-1	2,2		LC-MS (方法 L5): R_t=0.97分; MS (ESIpos): m/z = 539 [M+H]+
99-2	2,1		LC-MS (方法 L5): R_t=0.93分; MS

			(ESIpos)：m/z = 520 [M+H]+
100	1,9	LC-MS（方法 L5）：R_t=0.87 分；MS (ESIpos)：m/z = 492 [M+H]+	
101	1,8	LC-MS（方法 L5）：R_t=0.85 分；MS (ESIpos)：m/z = 518 [M+H]+	
102		LC-MS（方法 L5）：R_t=0.85 分；MS (ESIpos)：m/z = 504 [M+H]+	
103		LC-MS（方法 L5）：R_t=0.71 分；MS (ESIpos)：m/z = 557 [M+H]+	
104		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.26 分；MS (ESIpos)：m/z = 516 [M+H]+	
105		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.27 分；MS (ESIpos)：m/z = 516 [M+H]+	
106	3,7	LC-MS（方法 L5）：R_t=1.24 分；MS (ESIpos)：m/z =	

		516 [M+H]+	
107		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.31 分；MS（ESIpos）：m/z = 546 [M+H]+	
108		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.03 分；MS（ESIpos）：m/z = 504 [M+H]+	
109		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.42 分；MS（ESIpos）：m/z = 564 [M+H]+	
110		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.38 分；MS（ESIpos）：m/z = 544 [M+H]+	
111		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.00 分；MS（ESIpos）：m/z = 550 [M+H]+	
112	2,6	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.10 分；MS（ESIpos）：m/z = 538 [M+H]+	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：-0.008（3.14），0.008（2.96），0.146（0.46），1.917（0.92），1.937（0.96），1.949（1.08），1.968（0.98），2.328（0.72），2.568（1.52），2.587（2.01），2.605（1.54），2.624（0.91），2.640（0.62），2.670（0.64），2.849（0.85），2.868（1.12），2.887（1.37），2.908（0.64），2.974（0.91），2.988（0.95），3.707（1.26），3.726（2.13），3.736（2.13），3.753（1.19），3.841（2.10），3.873（4.31），3.905（2.01），5.508（0.54），5.528（1.68），5.549（1.67），7.224（2.73），7.233（3.15），7.241（3.80），7.271（2.34），7.414（1.68），7.429（1.43），7.640（16.00），7.665（1.81），7.684（2.39），7.705（2.19），7.835（2.72），7.850（2.23），8.239（2.35），8.258（2.17），8.695（9.00），9.086

			(2.09), 9.106 (2.05).
113		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.04 分；MS（ESIpos）：m/z = 545 [M+H]+	
114		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.40 分；MS（ESIpos）：m/z = 566 [M+H]+	
115		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.05 分；MS（ESIpos）：m/z = 533 [M+H]+	
116	3,4	LC-MS（方法 L5）：R_t=1.25 分；MS（ESIpos）：m/z = 559 [M+H]+	
117		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.25 分；MS（ESIpos）：m/z = 565 [M+H]+	
118		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.33 分；MS（ESIpos）：m/z = 552 [M+H]+	
119		LC-MS（方法 L5 方法 L5）：R_t=0.92 分；MS（ESIpos）：m/z = 506 [M+H]+	

120		LC-MS（方法 L5）：R_t=0.94 分；MS（ESIpos）：m/z = 502 [M+H]+	
121		LC-MS（方法 L5）：R_t=1.00 分；MS（ESIpos）：m/z = 524 [M+H]+	
122	2	LC-MS（方法 L5）：R_t=0.90 分；MS（ESIpos）：m/z = 547 [M+H]+	
123		LC-MS（方法 L5）：R_t=0.98 分；MS（ESIpos）：m/z = 544 [M+H]+	
124		LC-MS（方法 L8）：R_t= 0.82 分；MS（ESIneg）：m/z = 518 [M-H]-	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.007 (0.42), 1.234 (0.43), 1.937 (0.49), 1.954 (1.37), 1.962 (0.72), 1.971 (1.46), 1.979 (1.53), 1.988 (0.69), 1.996 (1.47), 2.013 (0.54), 2.446 (0.68), 2.453 (0.82), 2.462 (1.42), 2.469 (1.84), 2.478 (2.17), 2.518 (7.50), 2.809 (0.67), 2.826 (1.25), 2.842 (1.48), 2.858 (1.88), 2.874 (0.85), 2.960 (1.13), 2.967 (1.21), 2.978 (1.24), 2.984 (1.18), 2.992 (0.89), 2.998 (0.84), 3.009 (0.81), 3.016 (0.70), 3.316 (1.98), 3.664 (0.52), 3.675 (1.21), 3.689 (2.49), 3.701 (2.76), 3.715 (2.35), 3.729 (1.06), 3.740 (0.44), 5.503 (0.84), 5.519 (2.36), 5.535 (2.35), 5.551 (0.79), 6.929 (2.26), 7.192 (0.72), 7.206 (4.09), 7.213 (4.86), 7.220 (5.20), 7.224 (3.60), 7.235 (1.11), 7.255 (3.09), 7.266 (1.77), 7.271 (1.27), 7.362 (2.40), 7.368 (2.53), 7.379 (2.23), 7.400 (2.23), 7.534 (2.37), 7.548 (3.14), 7.550 (2.96), 7.565 (2.60), 7.599 (3.07), 7.603 (6.46), 7.607 (4.90), 7.627 (16.00), 7.631 (11.94), 7.739 (3.66), 7.741 (3.78), 7.754 (3.17), 7.755 (3.13), 7.917 (1.31), 7.928 (2.35), 7.938 (1.20), 8.157 (3.18), 8.334 (3.01), 8.350 (2.81), 8.562 (10.41), 8.850

			(3.16), 8.866 (3.04).
125	2,1	LC-MS (方法 L5): R_t=0.95 分; MS (ESIpos): m/z = 542 [M+H]+	
126		LC-MS (方法 L5): R_t=0.87 分; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H]+	
127	1,9	LC-MS (方法 L5): R_t=0.90 分; MS (ESIpos): m/z = 519 [M+H]+	
128	2,1	LC-MS (方法 L5): R_t=0.97 分; MS (ESIpos): m/z = 520 [M+H]+	
129	1,8	LC-MS (方法 L5): R_t=0.85 分; MS (ESIpos): m/z = 505 [M+H]+	
130		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.85 分; MS (ESIpos): m/z = 458 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.066 (16.00), 4.262 (0.81), 4.270 (0.92), 5.754 (1.15), 6.784 (0.98), 6.787 (1.02), 6.805 (1.10), 6.807 (1.10), 6.923 (0.99), 6.926 (0.97), 7.169 (0.81), 7.353 (0.82), 7.373 (0.79), 7.455 (0.88), 7.460 (1.48), 7.464 (1.00), 7.469 (1.06), 7.487 (1.54), 7.506 (0.70), 7.532 (0.80), 7.536 (1.38), 7.540 (0.75), 7.554 (0.76), 7.623 (0.73), 7.643 (2.49), 7.648 (1.12), 7.662 (1.03), 7.739 (1.15), 7.743 (1.22), 7.757 (0.88), 7.761 (0.82), 8.204 (1.00), 8.208 (1.02), 8.225 (0.96), 8.229 (0.88), 8.611 (3.90), 9.078 (0.87), 9.098 (0.85).
131		LC-MS (方法 L1):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.45), 0.008 (2.01), 2.031 (0.91), 2.038

	R_t= 1.40 分; MS (ESIpos): m/z = 494 [M+H]+	(0.84), 2.086 (1.12), 2.199 (0.70), 3.673 (16.00), 3.742 (5.31), 4.174 (1.20), 4.181 (0.78), 4.195 (0.87), 4.203 (0.99), 4.287 (0.82), 4.296 (0.76), 4.304 (0.93), 5.125 (1.08), 5.142 (1.08), 6.796 (1.69), 6.816 (1.95), 6.878 (0.99), 6.881 (0.91), 6.897 (1.97), 6.916 (1.18), 6.957 (0.91), 6.972 (0.89), 7.152 (1.31), 7.157 (1.12), 7.166 (1.84), 7.171 (2.18), 7.185 (2.45), 7.196 (1.01), 7.206 (1.77), 7.283 (0.80), 7.287 (0.91), 7.294 (1.69), 7.314 (1.54), 7.387 (2.01), 7.391 (1.99), 7.406 (1.77), 7.409 (1.59), 7.445 (2.22), 7.449 (2.24), 7.501 (6.85), 7.506 (6.87), 7.717 (0.85), 7.736 (1.54), 7.741 (2.47), 7.746 (1.27), 7.935 (2.81), 7.951 (2.83), 8.166 (0.63), 8.903 (1.69), 8.921 (1.69), 9.904 (1.94), 9.922 (2.56), 9.934 (1.42).
132	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.15 分; MS (ESIpos): m/z = 526 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (1.84), 0.008 (1.78), 3.075 (16.00), 4.248 (0.91), 4.256 (1.05), 6.774 (1.08), 6.777 (1.18), 6.794 (1.23), 6.797 (1.29), 6.889 (0.56), 6.905 (1.13), 6.908 (1.14), 6.924 (0.71), 6.926 (0.68), 7.142 (0.63), 7.160 (0.95), 7.335 (0.74), 7.468 (0.66), 7.474 (0.64), 7.633 (0.61), 7.650 (1.67), 7.669 (2.82), 7.900 (2.22), 7.906 (2.18), 8.257 (1.14), 8.263 (1.06), 8.276 (1.03), 8.282 (1.00), 8.537 (3.81).
133	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.40 分; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.91), −0.008 (7.68), 0.008 (7.18), 0.146 (0.91), 2.027 (1.24), 2.035 (1.27), 2.046 (1.34), 2.062 (1.88), 2.070 (1.58), 2.078 (1.17), 2.085 (0.81), 2.184 (1.24), 2.196 (1.71), 2.209 (1.71), 2.218 (1.64), 2.230 (1.07), 2.366 (0.70), 2.710 (0.64), 3.247 (1.24), 3.289 (8.35), 3.334 (1.81), 3.866 (8.18), 3.876 (13.05), 3.888 (7.51), 3.906 (0.97), 4.204 (0.74), 4.212 (0.97), 4.224 (0.91), 4.232 (2.85), 4.240 (2.28), 4.252 (3.66), 4.264 (3.52), 4.271 (2.52), 4.280 (2.52), 4.299 (0.94), 5.241 (2.11), 5.255 (2.08), 5.753 (4.53), 6.776 (4.49), 6.779 (5.00), 6.796 (5.20), 6.799 (5.50), 6.896 (2.21), 6.915 (4.70), 6.933 (2.78), 7.142 (2.55), 7.147 (2.72), 7.164 (4.13), 7.181 (2.11), 7.186 (2.01), 7.357 (4.19), 7.374 (3.96), 7.444 (2.25), 7.450 (2.42), 7.476 (2.68), 7.482 (2.58), 7.686 (1.38), 7.703 (7.55), 7.711 (6.74), 7.720 (16.00), 7.728 (1.71), 7.909 (7.31), 7.915 (7.11), 8.282 (0.91), 8.291 (4.49), 8.300 (3.82), 8.307 (3.66), 8.316 (3.89), 8.325 (0.74), 8.606 (7.01), 8.610 (7.75), 9.160 (2.82), 9.181 (2.72).
134	1, 9	LC-MS (方法 L1): ^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 8.99 (d, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.36 (d, 1H), 8.13 (s,

		R_t= 0.84 分; MS (ESIpos): m/z = 578[M+H]+	1H), 7.83 (brs, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.60 – 7.63 (m, 3H), 7.54 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.91 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.21 – 5.27 (m, 1H), 4.22 – 4.30 (m, 2H), 3.07 (d, 3H), 2.52 – 2.55 (m, 4H), 2.12 – 2.20 (m, 1H), 2.00 – 2.08 (m, 1H).
135	1,9	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.89 分; MS (ESIpos): m/z = 504 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (6.30), 0.008 (2.98), 2.004 (1.02), 2.014 (0.94), 2.026 (1.43), 2.041 (1.28), 2.126 (1.31), 2.141 (1.56), 2.373 (2.15), 2.394 (2.92), 2.412 (2.16), 2.433 (1.25), 2.519 (4.80), 2.523 (4.67), 4.243 (3.28), 4.255 (4.75), 4.261 (3.01), 4.270 (2.58), 4.427 (5.50), 4.446 (8.06), 4.466 (4.62), 5.160 (0.92), 5.174 (1.75), 5.194 (1.64), 5.754 (2.42), 6.781 (3.04), 6.785 (3.14), 6.802 (3.39), 6.805 (3.26), 6.887 (1.73), 6.890 (1.66), 6.906 (3.30), 6.909 (2.99), 6.924 (1.93), 6.927 (1.70), 7.142 (1.75), 7.146 (1.77), 7.163 (2.63), 7.180 (1.31), 7.185 (1.20), 7.291 (2.83), 7.311 (2.52), 7.434 (2.40), 7.452 (3.13), 7.455 (2.90), 7.473 (2.61), 7.592 (2.65), 7.597 (4.87), 7.602 (5.82), 7.611 (16.00), 7.616 (8.48), 7.698 (3.62), 7.701 (3.63), 7.716 (3.07), 7.719 (2.82), 8.058 (3.06), 8.061 (3.05), 8.080 (2.76), 8.083 (2.47), 8.430 (11.34), 8.946 (2.94), 8.966 (2.74).
136	2,1	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.93 分; MS (ESIpos): m/z = 541 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ [ppm]: -0.008 (1.56), 0.008 (1.98), 0.069 (0.62), 1.256 (1.23), 1.582 (16.00), 2.171 (1.20), 2.177 (0.59), 5.299 (1.83), 6.997 (0.57), 7.429 (0.69), 7.519 (1.23).
137	4,8	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.42 分; MS (ESIpos): m/z = 564 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.04), 0.008 (1.38), 1.199 (3.32), 1.216 (7.07), 1.234 (3.34), 2.086 (1.65), 3.048 (8.16), 4.052 (4.09), 4.134 (0.95), 4.152 (2.94), 4.169 (2.79), 4.187 (0.86), 4.283 (1.07), 6.790 (1.19), 6.793 (1.25), 6.810 (1.31), 6.813 (1.32), 6.917 (1.20), 6.920 (1.17), 7.175 (0.96), 7.378 (0.94), 7.645 (16.00), 7.689 (0.97), 7.707 (1.22), 7.710 (1.08), 7.728 (1.19), 7.840 (1.33), 7.843 (1.41), 7.858 (1.10), 7.861 (1.03), 8.354 (1.21), 8.358 (1.23), 8.375 (1.10), 8.379 (1.01), 8.756 (4.67), 9.196 (1.08), 9.217 (1.02).
138	2,7	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.12 分; MS (ESIpos): m/z = 522 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.087 (0.95), 2.095 (0.79), 2.206 (0.84), 2.218 (0.81), 2.228 (0.77), 3.056 (16.00), 3.516 (1.41), 3.529 (3.23), 3.541 (2.52), 3.601 (1.41), 3.614 (2.77), 3.628 (2.42), 3.641 (0.85), 4.245 (1.32), 4.253 (1.18), 4.265 (2.15), 4.274 (2.23), 4.290 (1.20), 5.100 (1.14), 5.115 (2.39), 5.130 (1.09), 5.279

			(1.29), 5.298 (1.29), 5.752 (1.32), 5.754 (1.27), 6.792 (2.55), 6.813 (2.83), 6.910 (1.24), 6.928 (2.57), 6.947 (1.49), 7.159 (1.29), 7.176 (2.06), 7.197 (0.97), 7.357 (2.18), 7.376 (1.99), 7.625 (2.25), 7.628 (2.63), 7.631 (3.12), 7.634 (5.58), 7.638 (12.01), 7.640 (9.99), 7.643 (5.84), 7.646 (4.00), 7.665 (1.93), 7.801 (2.81), 7.819 (2.22), 8.275 (2.37), 8.296 (2.15), 8.673 (7.74), 9.303 (2.25), 9.323 (2.20).
139		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.33 分，m/z = 510/512 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.29 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.77 - 7.68 (m, 2H), 7.61 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.47 - 7.41 (m, 1H), 7.37 - 7.31 (m, 1H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.77 (m, 1H), 5.27 - 5.19 (m, 1H), 4.30 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.27 - 2.12 (m, 1H), 2.07 - 1.99 (m, 1H).
140		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.98 分，m/z = 478 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.27 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.64 - 7.48 (m, 3H), 7.34 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.31 - 7.23 (m, 1H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.28 - 5.20 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.22 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.99 (m, 1H).
141		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.03 分，m/z = 476 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.27 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.60 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.55 - 7.45 (m, 3H), 7.43 - 7.31 (m, 2H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.83 - 6.76 (m, 1H), 5.28 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).
142		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.68 分，m/z = 520 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.34 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.66 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.40 - 7.28 (m, 2H), 7.22 - 7.13 (m, 3H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.29 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.88 (q, J = 5.8, 4.5 Hz, 4H), 3.28 (q, J = 4.5 Hz, 4H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 2.00 (m, 1H).
143		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.86 分，m/z = 536 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.34 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.66 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.55 - 7.49 (m, 1H), 7.40 - 7.29 (m, 3H), 7.21 - 7.13 (m, 1H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.29 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.87 (t, J = 4.5 Hz, 4H), 3.28 (q, J = 4.6 Hz, 4H), 2.26 - 2.18 (m, 1H), 2.11 - 2.02 (m, 1H).
144		LC-MS（方法 L2）：	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.85 (s, 1H), 7.83 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.72

	R_t= 4.14分; m/z = 552/554 (M+H)+	(d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 8.3, 2.0 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 – 7.17 (m, 1H), 6.94 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 5.38 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 4.36 (dq, J = 9.2, 3.4, 2.9 Hz, 1H), 4.20 (ddd, J = 11.6, 9.6, 2.7 Hz, 1H), 3.97 – 3.84 (m, 4H), 3.44 – 3.33 (m, 4H), 2.47 – 2.35 (m, 1H), 2.29 – 2.19 (m, 1H).	
145	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.82分; m/z = 510/512 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.89 (s, 1H), 7.76 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.49 – 7.43 (m, 2H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 – 7.18 (m, 1H), 7.08 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.88 – 6.84 (m, 1H), 5.40 – 5.33 (m, 1H), 4.38 – 4.31 (m, 1H), 4.23 – 4.16 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.44 – 2.34 (m, 1H), 2.25 – 2.16 (m, 1H).	
146	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.55分; m/z = 510/512 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.85 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.81 (dd, J = 10.0, 2.8 Hz, 1H), 7.54 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.3, 2.8 Hz, 1H), 7.34 – 7.15 (m, 4H), 7.07 – 6.97 (m, 1H), 6.91 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, 1H), 5.40 – 5.29 (m, 1H), 4.37 – 4.30 (m, 1H), 4.22 – 4.14 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.43 – 2.32 (m, 1H), 2.23 – 2.14 (m, 1H).	
147	2, 76	^{1}H-NMR(399, 9532 MHz, DMSO): δ= 9.121 (0.91); 9.1007 (0.93); 8.634 (3.89); 8.3134 (0.72); 8.2547 (0.98); 8.2517 (1.05); 8.2336 (1.09); 8.2306 (1.1); 7.805 (1.01); 7.7903 (1.21); 7.7874 (1.21); 7.6694 (1.03); 7.6485 (1.18); 7.6304 (12.69); 6.8945 (1.38); 6.8875 (1.57); 6.7982 (0.58); 6.7911 (0.47); 6.7761 (1.29); 6.7688 (1.22); 6.7441 (2.53); 6.7219 (1.02); 5.2287 (0.58); 5.2095 (0.58); 4.2178 (0.58); 4.2045 (1.04); 4.1982 (0.85); 4.1864 (0.55); 4.1782 (0.56); 3.6948 (11.21); 3.3162 (70.62); 3.2923 (0.36); 3.0725 (16); 2.6745 (0.55); 2.6703 (0.76); 2.6659 (0.57); 2.5055 (89.32); 2.5011 (123.65); 2.4967 (94.57); 2.3324 (0.52); 2.328 (0.71); 2.3236 (0.52); 2.1952 (0.33); 2.185 (0.35); 2.1736 (0.35); 2.0579 (0.35); 2.0505 (0.41); 1.3981 (6.55); 0.1458 (0.5); 0.008 (4.19); -0.0001 (108.21); -0.0083 (4.43); -0.1497 (0.5)	
148	2, 84	^{1}H-NMR(399, 9532 MHz, DMSO): δ= 8.8981 (0.68); 8.8777 (0.7); 8.6125 (3.39); 8.3132 (0.55); 8.2499 (0.74); 8.2465 (0.82); 8.2286 (0.85); 8.2252 (0.85); 7.805 (0.71); 7.8016 (0.8); 7.7871 (0.96); 7.7838 (0.98); 7.6657 (0.85); 7.6476 (0.82); 7.6444	

			(0.97); 7.6324 (11.7); 7.3105 (0.9); 7.2897 (1); 6.8463 (0.92); 6.8409 (1.09); 6.7994 (0.64); 6.7934 (0.54); 6.7787 (0.58); 6.7727 (0.53); 5.4719 (0.54); 5.4526 (0.54); 3.7345 (9.41); 3.3174 (129.06); 3.0587 (12.87); 3.0247 (0.38); 2.8426 (0.45); 2.8226 (0.35); 2.6747 (0.57); 2.6702 (0.79); 2.6658 (0.58); 2.5368 (0.56); 2.5237 (2.21); 2.5101 (44.34); 2.5056 (94.37); 2.5011 (132.67); 2.4965 (99.85); 2.4921 (48.15); 2.3324 (0.55); 2.3281 (0.77); 2.3234 (0.56); 1.398 (16); 0.1459 (0.57); 0.008 (4.36); -0.0002 (135.3); -0.0084 (4.88); -0.1496 (0.56)
149	2,2	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.94 分; MS (ESIneg): m/z = 589 [M-H]-	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ [ppm]: 2.171 (1.43), 2.631 (16.00), 3.229 (12.71), 3.305 (1.03), 3.313 (1.03), 4.269 (0.86), 6.828 (1.34), 6.830 (1.40), 6.848 (1.53), 6.851 (1.54), 6.950 (1.41), 6.953 (1.37), 6.969 (0.85), 6.972 (0.79), 7.198 (1.15), 7.327 (1.22), 7.346 (1.12), 7.390 (1.53), 7.395 (2.99), 7.400 (1.71), 7.512 (6.31), 7.517 (5.89), 7.551 (0.97), 7.569 (1.53), 7.572 (1.24), 7.590 (1.44), 7.661 (1.63), 7.665 (1.74), 7.679 (1.23), 7.683 (1.12), 8.058 (1.46), 8.062 (1.45), 8.079 (1.31), 8.083 (1.23), 8.983 (5.10).
150	3,1	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.11 分; MS (ESIpos): m/z = 536 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.132 (1.28), 2.205 (1.37), 2.328 (0.59), 3.040 (16.00), 3.931 (0.61), 3.975 (4.59), 3.984 (4.71), 4.281 (3.48), 5.309 (1.69), 5.326 (1.68), 6.779 (2.78), 6.799 (3.08), 6.883 (1.42), 6.901 (2.80), 6.920 (1.72), 7.140 (1.56), 7.159 (2.50), 7.175 (1.25), 7.348 (2.66), 7.365 (2.47), 7.643 (14.76), 7.660 (2.25), 7.678 (2.82), 7.699 (1.88), 7.820 (3.02), 7.835 (2.42), 8.139 (1.05), 8.304 (2.56), 8.326 (2.33), 8.755 (6.56).
151		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.55 分; MS (ESIpos): m/z = 503 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.73), 0.008 (0.73), 2.827 (5.86), 2.831 (9.97), 2.836 (5.88), 3.063 (16.00), 4.234 (0.56), 4.253 (0.85), 4.262 (0.92), 6.778 (0.94), 6.781 (1.01), 6.799 (1.07), 6.801 (1.08), 6.894 (0.49), 6.897 (0.49), 6.912 (1.00), 6.915 (0.97), 6.931 (0.61), 6.934 (0.57), 7.026 (0.55), 7.043 (0.90), 7.055 (1.02), 7.060 (0.67), 7.082 (0.74), 7.142 (0.50), 7.146 (0.54), 7.164 (0.80), 7.339 (0.78), 7.359 (0.78), 7.606 (0.49), 7.623 (1.27), 7.643 (1.95), 7.650 (1.53), 7.663 (0.52), 8.214 (0.96), 8.220 (0.91), 8.234 (0.91), 8.240 (0.83), 8.542 (4.00), 9.073 (0.89), 9.093 (0.86).
152	3		^{1}H-NMR(399,9532 MHz, DMSO): δ= 9.0892 (0.94); 9.0691 (0.96); 8.6414 (4.26); 8.2521

			(0.97); 8.2488 (1.02); 8.2308 (1.12); 8.2275 (1.08); 7.8117 (0.96); 7.8084 (1.01); 7.7939 (1.28); 7.7906 (1.21); 7.6681 (1.04); 7.65 (1.06); 7.6469 (1.19); 7.633 (11.43); 7.4321 (0.64); 7.4139 (0.79); 7.411 (0.8); 7.3933 (0.66); 6.7953 (0.48); 6.7887 (0.52); 6.774 (0.91); 6.7673 (0.95); 6.7527 (0.46); 6.746 (0.48); 6.6796 (0.98); 6.673 (0.85); 6.6532 (1.02); 6.6466 (0.82); 5.7538 (9.65); 5.2288 (0.51); 5.2099 (0.52); 4.315 (0.48); 4.3057 (0.46); 4.2996 (0.54); 4.2881 (0.57); 4.2791 (0.52); 4.2653 (0.45); 4.2581 (0.58); 3.3173 (12.38); 3.0582 (16); 2.5238 (0.61); 2.5104 (12.16); 2.5059 (24.77); 2.5014 (33.92); 2.4969 (25.2); 2.4926 (12.16); 2.1993 (0.33); 2.1898 (0.34); 2.177 (0.37); 2.078 (0.34); 2.0714 (0.39); 0.008 (1.15); -0.0002 (30.44); -0.0084 (1.11)
153	2, 1	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.92 分; MS (ESIpos): m/z = 492 [M+H]+	^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.241 (8.09), 1.253 (15.76), 1.265 (7.87), 2.024 (1.23), 2.030 (1.43), 2.037 (1.48), 2.046 (1.79), 2.053 (1.70), 2.146 (1.59), 2.157 (1.87), 2.166 (1.55), 3.508 (1.58), 3.519 (4.30), 3.530 (5.43), 3.540 (4.15), 3.552 (1.33), 4.266 (5.31), 4.273 (4.37), 4.292 (0.68), 5.238 (1.23), 5.248 (2.59), 5.260 (2.52), 5.270 (1.13), 6.788 (4.52), 6.802 (4.77), 6.899 (2.30), 6.912 (4.55), 6.924 (2.56), 7.152 (2.32), 7.165 (3.89), 7.177 (1.93), 7.302 (4.05), 7.315 (3.75), 7.522 (2.63), 7.535 (4.17), 7.548 (2.83), 7.606 (6.74), 7.620 (16.00), 7.662 (0.48), 7.731 (4.94), 7.743 (4.36), 7.808 (2.02), 7.816 (3.34), 8.412 (4.22), 8.426 (4.01), 8.509 (10.45), 9.013 (4.02), 9.027 (3.89).
154		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.97 分; MS (ESIpos): m/z = 521 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.40), -0.008 (3.14), 0.008 (2.78), 0.833 (0.80), 0.851 (1.18), 1.028 (0.44), 1.103 (0.60), 1.118 (0.70), 1.235 (1.90), 1.874 (16.00), 1.914 (1.00), 2.063 (0.78), 2.108 (1.12), 2.163 (0.90), 2.366 (0.68), 2.518 (4.57), 2.523 (3.14), 2.709 (0.54), 3.508 (0.82), 4.232 (0.58), 4.249 (1.20), 4.258 (1.14), 4.275 (1.58), 4.293 (0.98), 4.302 (1.16), 5.233 (0.52), 5.249 (1.04), 5.266 (1.08), 6.776 (2.22), 6.794 (2.46), 6.877 (1.16), 6.893 (2.38), 6.911 (1.44), 7.135 (1.28), 7.155 (2.02), 7.174 (1.06), 7.340 (1.82), 7.359 (1.74), 7.574 (1.36), 7.592 (1.96), 7.617 (4.01), 7.622 (5.21), 7.628 (11.15), 7.633 (5.41), 7.726 (0.58), 7.789 (2.38), 7.805 (2.08), 8.516 (1.20), 8.538 (1.18), 8.604 (3.14), 9.016 (1.62), 9.036 (1.58), 9.575 (0.84), 10.034 (0.98).

155	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.77 分，m/z = 536 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (dd, J = 8.1, 4.5 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.37 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.74 – 7.64 (m, 2H), 7.47 – 7.32 (m, 3H), 7.20 – 7.12 (m, 1H), 6.95 – 6.88 (m, 1H), 6.82 – 6.76 (m, 1H), 5.29 – 5.20 (m, 1H), 4.32 – 4.18 (m, 2H), 3.93 – 3.83 (m, 4H), 3.31 – 3.22 (m, 4H), 2.27 – 2.16 (m, 1H), 2.10 – 2.01 (m, 1H).
156	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.96 分，m/z = 552/554 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.33 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.79 – 7.62 (m, 3H), 7.47 – 7.42 (m, 1H), 7.40 – 7.34 (m, 1H), 7.21 – 7.13 (m, 1H), 6.96 – 6.89 (m, 1H), 6.83 – 6.76 (m, 1H), 5.29 – 5.21 (m, 1H), 4.33 – 4.19 (m, 2H), 3.91 – 3.83 (m, 4H), 3.30 – 3.23 (m, 4H), 2.25 – 2.19 (m, 1H), 2.10 – 2.02 (m, 1H).
157	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.61 分，m/z = 520 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.36 – 8.28 (m, 1H), 7.65 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.54 (q, J = 8.7 Hz, 2H), 7.41 – 7.25 (m, 2H), 7.21 – 7.13 (m, 1H), 6.92 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 4.33 – 4.19 (m, 2H), 3.93 – 3.82 (m, 4H), 3.31 – 3.21 (m, 4H), 2.21 (dt, J = 8.6, 4.4 Hz, 1H), 2.11 – 2.00 (m, 1H).
158	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.85 分；m/z = 520 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.86 (s, 1H), 7.82 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.52 – 7.44 (m, 2H), 7.36 – 7.19 (m, 4H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.89 – 6.80 (m, 2H), 5.43 – 5.34 (m, 1H), 4.41 – 4.32 (m, 1H), 4.24 – 4.15 (m, 1H), 3.96 – 3.84 (m, 4H), 3.44 – 3.33 (m, 4H), 2.46 – 2.36 (m, 1H), 2.28 – 2.19 (m, 1H).
159	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.95 分；m/z = 518 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.85 (s, 1H), 7.81 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.62 – 7.59 (m, 1H), 7.52 – 7.38 (m, 4H), 7.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 – 7.18 (m, 1H), 6.96 – 6.83 (m, 3H), 5.43 – 5.30 (m, 1H), 4.40 – 4.31 (m, 1H), 4.25 – 4.15 (m, 1H), 3.96 – 3.83 (m, 4H), 3.44 – 3.31 (m, 4H), 2.45 – 2.34 (m, 1H), 2.28 – 2.17 (m, 1H).
160	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.91 分；m/z = 536 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.83 (s, 1H), 7.87 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.53 – 7.46 (m, 2H), 7.34 – 7.26 (m, 2H), 7.24 – 7.17 (m, 2H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.89 – 6.80 (m, 2H), 5.40 – 5.33 (m, 1H), 4.39 – 4.31 (m, 1H), 4.23 – 4.12 (m, 1H), 3.96 – 3.84 (m, 4H), 3.44 – 3.33 (m, 4H), 2.44 – 2.34 (m, 1H), 2.26 – 2.18 (m, 1H).
161	LC-MS（方法 L2）：	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.82 (s, 1H), 7.89 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.45

	R_t= 3.83分; m/z = 536 (M+H)+	(dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 7.37 – 7.18 (m, 4H), 7.14 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 6.79 (s, 1H), 5.41 – 5.34 (m, 1H), 4.39 – 4.31 (m, 1H), 4.22 – 4.14 (m, 1H), 3.97 – 3.87 (m, 4H), 3.47 – 3.34 (m, 4H), 2.45 – 2.35 (m, 1H), 2.26 – 2.18 (m, 1H).
162	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.89分; m/z = 520 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.86 (s, 1H), 7.84 (dd, J = 9.7, 2.9 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 – 7.12 (m, 3H), 6.97 – 6.78 (m, 4H), 5.42 – 5.34 (m, 1H), 4.40 – 4.32 (m, 1H), 4.24 – 4.15 (m, 1H), 3.96 – 3.85 (m, 4H), 3.44 – 3.33 (m, 4H), 2.46 – 2.36 (m, 1H), 2.29 – 2.19 (m, 1H).
163	LC-MS (方法 L2): R_t= 4.05分; m/z = 536 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.85 (s, 1H), 7.84 (dd, J = 9.7, 2.8 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.5, 2.8 Hz, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.32 – 7.13 (m, 4H), 6.94 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.80 (m, 2H), 5.42 – 5.34 (m, 1H), 4.41 – 4.32 (m, 1H), 4.24 – 4.15 (m, 1H), 3.96 – 3.84 (m, 4H), 3.44 – 3.32 (m, 4H), 2.46 – 2.35 (m, 1H), 2.29 – 2.19 (m, 1H).
164	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.94分; m/z = 536 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.83 (s, 1H), 7.86 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.3, 2.7 Hz, 1H), 7.44 – 7.36 (m, 2H), 7.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.23 – 7.18 (m, 1H), 7.14 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.89 – 6.81 (m, 2H), 5.41 – 5.32 (m, 1H), 4.39 – 4.30 (m, 1H), 4.23 – 4.14 (m, 1H), 3.95 – 3.84 (m, 4H), 3.44 – 3.33 (m, 4H), 2.45 – 2.33 (m, 1H), 2.27 – 2.16 (m, 1H).
165	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.82分; m/z = 536 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.83 (s, 1H), 7.87 (dd, J = 9.9, 2.8 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 8.3, 2.8 Hz, 1H), 7.34 – 7.26 (m, 3H), 7.24 – 7.18 (m, 1H), 7.10 (td, J = 8.2, 2.5 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.43 – 5.30 (m, 1H), 4.39 – 4.31 (m, 1H), 4.22 – 4.14 (m, 1H), 3.96 – 3.86 (m, 4H), 3.46 – 3.34 (m, J = 3.8 Hz, 4H), 2.45 – 2.35 (m, 1H), 2.27 – 2.17 (m, 1H).
166	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.95分; m/z = 552/554 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.80 (s, 1H), 7.87 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.2, 2.8 Hz, 1H), 7.33 – 7.17 (m, 4H), 6.94 – 6.77 (m, 3H), 5.41 – 5.30 (m, 1H), 4.37 – 4.31 (m, 1H), 4.21 – 4.14 (m, 1H), 3.95 – 3.85 (m, 4H), 3.45 – 3.33 (m, 4H), 2.44 – 2.34 (m, 1H), 2.25 – 2.16 (m, 1H).
167	LC-MS (方法 L2):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.32 (dd, J = 9.4,

	R_t= 3.68 分, m/z = 518 (M+H)+	6.2 Hz, 1H), 7.65 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.56 – 7.47 (m, 3H), 7.43 – 7.34 (m, 2H), 7.21 – 7.14 (m, 1H), 6.97 – 6.89 (m, 1H), 6.80 (d, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 5.30 – 5.22 (m, 1H), 4.33 – 4.19 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.6 Hz, 4H), 3.32 – 3.22 (m, 4H), 2.28 – 2.17 (m, 1H), 2.11 – 1.98 (m, 1H).
168	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.07 分, m/z = 478 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.33 – 8.25 (m, 1H), 7.60 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.38 – 7.27 (m, 2H), 7.22 – 7.12 (m, 3H), 6.95 – 6.88 (m, 1H), 6.82 – 6.76 (m, 1H), 5.27 – 5.19 (m, 1H), 4.32 – 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 – 2.14 (m, 1H), 2.09 – 1.98 (m, 1H).
169	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.26 分, m/z = 494 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.33 – 8.26 (m, 1H), 7.61 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.54 – 7.49 (m, 1H), 7.39 – 7.28 (m, 3H), 7.20 – 7.13 (m, 1H), 6.95 – 6.88 (m, 1H), 6.82 – 6.76 (m, 1H), 5.27 – 5.19 (m, 1H), 4.32 – 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 – 2.14 (m, 1H), 2.09 – 1.99 (m, 1H).
170	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.82 分, m/z = 536 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (dd, J = 8.1, 3.6 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.37 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.68 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 7.63 – 7.49 (m, 2H), 7.46 – 7.34 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.30 – 5.21 (m, 1H), 4.33 – 4.19 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.3 Hz, 4H), 3.32 – 3.23 (m, 4H), 2.21 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 2.06 (d, J = 6.4 Hz, 1H).
171	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.23 分, m/z = 494 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (dd, J = 8.1, 4.3 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.34 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.74 – 7.59 (m, 2H), 7.46 – 7.31 (m, 3H), 7.16 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 – 5.18 (m, 1H), 4.32 – 4.18 (m, 2H), 3.08 (s, 6H), 2.19 (dd, J = 9.0, 4.8 Hz, 1H), 2.09 – 2.00 (m, 1H).
172	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.05 分, m/z = 494 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.07 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.53 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.31 (dd, J = 9.5, 6.3 Hz, 1H), 7.64 – 7.56 (m, 2H), 7.47 – 7.38 (m, 1H), 7.38 – 7.29 (m, 2H), 7.19 – 7.12 (m, 1H), 6.94 – 6.86 (m, 1H), 6.81 – 6.75 (m, 1H), 5.22 (q, J = 6.8, 6.3 Hz, 1H), 4.31 – 4.18 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.24 – 2.13 (m, 1H), 2.07 – 1.98 (m, 1H).
173	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.40 分; m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.91 (s, 1H), 7.75 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.52 – 7.44 (m, 2H), 7.36 – 7.18 (m, 4H), 7.11 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.93 (td, J = 7.5,

	478 (M+H)+	1.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 5.40 – 5.33 (m, 1H), 4.39 – 4.31 (m, 1H), 4.23 – 4.15 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.44 – 2.35 (m, 1H), 2.25 – 2.17 (m, 1H).
174	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.46 分; m/z = 476 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.93 (s, 1H), 7.75 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.62 – 7.59 (m, 1H), 7.52 – 7.46 (m, 2H), 7.44 – 7.39 (m, 2H), 7.30 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 – 7.18 (m, 1H), 7.12 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 5.41 – 5.34 (m, 1H), 4.39 – 4.31 (m, 1H), 4.23 – 4.16 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.44 – 2.35 (m, 1H), 2.25 – 2.17 (m, 1H).
175	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.59 分; m/z = 494 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.88 (s, 1H), 7.81 (dd, J = 10.0, 2.9 Hz, 1H), 7.51 – 7.45 (m, 2H), 7.34 – 7.27 (m, 2H), 7.23 – 7.17 (m, 2H), 7.04 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.40 – 5.33 (m, 1H), 4.38 – 4.31 (m, 1H), 4.22 – 4.15 (m, 1H), 3.11 (s, 6H), 2.43 – 2.34 (m, 1H), 2.24 – 2.16 (m, 1H).
176	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.40 分; m/z = 494 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.86 (s, 1H), 7.82 (dd, J = 10.0, 2.9 Hz, 1H), 7.42 (dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 1H), 7.29 – 7.12 (m, 4H), 7.02 (s, 1H), 6.91 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 5.40 – 5.32 (m, 1H), 4.37 – 4.30 (m, 1H), 4.22 – 4.14 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.42 – 2.33 (m, 1H), 2.23 – 2.15 (m, 1H).
177	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.51 分; m/z = 478 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.91 (s, 1H), 7.78 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 – 7.13 (m, 3H), 7.04 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.94 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.91 – 6.84 (m, 2H), 5.41 – 5.34 (m, 1H), 4.39 – 4.32 (m, 1H), 4.24 – 4.16 (m, 1H), 3.11 (s, 6H), 2.44 – 2.35 (m, 1H), 2.25 – 2.17 (m, 1H).
178	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.73 分; m/z = 494 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.90 (s, 1H), 7.77 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.32 – 7.24 (m, 2H), 7.24 – 7.18 (m, 1H), 7.15 (dt, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 0.9 Hz, 1H), 5.40 – 5.33 (m, 1H), 4.38 – 4.31 (m, 1H), 4.23 – 4.16 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.44 – 2.34 (m, 1H), 2.25 – 2.16 (m, 1H).
179	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.63 分; m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.88 (s, 1H), 7.80 (dd, J = 10.0, 2.9 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.3, 2.8 Hz, 1H), 7.44 – 7.35 (m, 2H), 7.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.23 – 7.17

		494 (M+H)+	(m, 1H), 7.13 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 5.39 – 5.33 (m, 1H), 4.38 – 4.30 (m, 1H), 4.22 – 4.14 (m, 1H), 3.11 (s, 6H), 2.43 – 2.34 (m, 1H), 2.24 – 2.16 (m, 1H).
180		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.34 分; m/z = 494 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.87 (s, 1H), 7.81 (dd, J = 10.0, 2.9 Hz, 1H), 7.41 (dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 7.34 – 7.26 (m, 3H), 7.23 – 7.18 (m, 1H), 7.12 – 7.00 (m, 2H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.1 Hz, 1H), 5.40 – 5.33 (m, 1H), 4.38 – 4.30 (m, 1H), 4.22 – 4.14 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.43 – 2.34 (m, 1H), 2.24 – 2.15 (m, 1H).
181		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.37 分; MS (ESIpos): m/z = 550 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.14), 0.008 (1.84), 1.356 (0.66), 2.056 (0.64), 2.064 (0.68), 2.075 (0.73), 2.091 (1.03), 2.099 (0.87), 2.106 (0.63), 2.192 (0.43), 2.201 (0.68), 2.213 (0.94), 2.225 (0.91), 2.235 (0.85), 2.247 (0.57), 2.255 (0.46), 2.523 (1.40), 2.899 (3.69), 3.449 (0.46), 3.461 (0.72), 3.480 (2.72), 3.492 (5.13), 3.504 (4.92), 3.515 (2.44), 3.535 (0.65), 4.230 (0.50), 4.251 (1.50), 4.259 (1.25), 4.272 (2.17), 4.281 (2.06), 4.298 (1.28), 4.317 (0.47), 5.241 (0.65), 5.255 (1.41), 5.274 (1.39), 5.288 (0.61), 6.792 (2.63), 6.810 (2.75), 6.812 (2.85), 6.918 (1.30), 6.921 (1.35), 6.937 (2.66), 6.939 (2.66), 6.955 (1.62), 6.958 (1.57), 7.156 (1.35), 7.160 (1.44), 7.177 (2.18), 7.194 (1.07), 7.198 (1.05), 7.389 (2.31), 7.407 (2.12), 7.632 (5.83), 7.636 (16.00), 7.638 (8.92), 7.689 (1.90), 7.707 (2.69), 7.710 (2.47), 7.728 (2.42), 7.832 (3.00), 7.835 (3.26), 7.850 (2.42), 7.853 (2.35), 8.260 (2.52), 8.263 (2.63), 8.281 (2.36), 8.284 (2.26), 8.718 (9.84), 9.157 (2.51), 9.177 (2.41).
182	3,3	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.08 分; MS (ESIpos): m/z = 578 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (0.74), 0.008 (0.62), 1.407 (16.00), 2.086 (0.51), 2.523 (0.47), 4.258 (0.40), 4.268 (1.03), 4.283 (0.99), 4.289 (0.91), 4.297 (0.51), 4.305 (0.58), 6.787 (0.59), 6.806 (0.68), 6.893 (0.65), 7.167 (0.52), 7.328 (0.53), 7.347 (0.50), 7.578 (0.54), 7.599 (0.48), 7.611 (0.71), 7.615 (0.79), 7.626 (2.75), 7.631 (1.63), 7.769 (0.69), 7.787 (0.59), 8.210 (0.42), 8.334 (0.53), 8.355 (0.50), 8.579 (1.74), 9.051 (0.51), 9.072 (0.50).
183	6	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.49 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.431 (16.00), 3.042 (4.04), 3.948 (2.03), 4.284 (0.56), 6.792 (0.61), 6.811 (0.68), 6.911 (0.63), 7.173 (0.49), 7.354 (0.52), 7.373

		(ESIpos): m/z = 592 [M+H]+	(0.48), 7.644 (7.05), 7.683 (0.45), 7.701 (0.62), 7.722 (0.55), 7.837 (0.68), 7.840 (0.68), 7.855 (0.56), 7.858 (0.51), 8.350 (0.60), 8.353 (0.58), 8.371 (0.56), 8.374 (0.52), 8.763 (2.16), 9.234 (0.57), 9.254 (0.55).
184	3	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.95 分; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H]+	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (1.32), 0.912 (7.39), 0.931 (16.00), 0.949 (7.79), 1.634 (0.73), 1.652 (2.85), 1.670 (5.25), 1.688 (5.08), 1.706 (2.51), 1.725 (0.52), 2.008 (0.45), 2.024 (0.86), 2.033 (1.06), 2.042 (1.11), 2.058 (1.52), 2.068 (1.52), 2.086 (3.21), 2.126 (0.70), 2.138 (1.27), 2.155 (1.51), 2.167 (1.10), 2.178 (0.76), 2.328 (0.44), 2.523 (2.24), 2.670 (0.48), 3.451 (1.52), 3.468 (3.30), 3.476 (3.00), 3.482 (2.99), 3.489 (3.03), 3.506 (1.25), 4.235 (0.77), 4.253 (2.65), 4.268 (4.11), 4.278 (3.48), 4.286 (2.21), 4.306 (0.49), 5.236 (1.01), 5.251 (2.08), 5.269 (1.99), 5.284 (0.85), 5.754 (0.58), 6.782 (3.55), 6.803 (3.93), 6.880 (1.99), 6.899 (3.97), 6.917 (2.28), 7.141 (1.96), 7.145 (1.96), 7.162 (3.10), 7.180 (1.49), 7.287 (3.39), 7.305 (3.06), 7.516 (2.25), 7.535 (3.39), 7.555 (2.58), 7.600 (3.94), 7.605 (3.48), 7.621 (14.17), 7.626 (9.44), 7.732 (4.27), 7.750 (3.54), 7.951 (2.25), 8.412 (3.35), 8.433 (3.11), 8.535 (9.75), 8.986 (3.00), 9.006 (2.85).
185	2	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.72 分; MS (ESIneg): m/z = 505 [M-H]-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.108 (4.30), 1.783 (2.07), 1.917 (2.11), 1.930 (1.65), 2.075 (1.64), 2.086 (5.94), 2.156 (1.41), 2.171 (1.60), 2.185 (1.08), 2.328 (0.70), 2.366 (0.42), 2.670 (0.85), 2.709 (0.44), 2.752 (4.01), 2.770 (0.64), 2.789 (0.58), 2.994 (3.16), 3.009 (6.19), 3.024 (3.45), 3.168 (0.68), 3.417 (1.38), 3.527 (1.42), 3.731 (1.06), 4.266 (4.94), 5.247 (2.07), 5.260 (1.94), 5.754 (8.83), 6.786 (3.64), 6.806 (4.14), 6.897 (1.83), 6.916 (3.84), 6.934 (2.23), 7.150 (1.96), 7.167 (3.21), 7.186 (1.56), 7.323 (3.41), 7.341 (3.12), 7.540 (2.24), 7.559 (3.64), 7.579 (2.41), 7.611 (7.22), 7.617 (16.00), 7.746 (4.79), 7.763 (4.88), 8.346 (1.16), 8.400 (0.60), 8.421 (3.41), 8.442 (3.22), 8.513 (7.91), 8.538 (1.10), 9.052 (1.55), 9.069 (1.55).
186		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.80 分; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H]+	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.48), 0.008 (3.60), 0.146 (0.48), 1.140 (6.02), 1.235 (0.55), 1.889 (1.18), 2.031 (2.12), 2.051 (2.52), 2.063 (2.18), 2.073 (1.69), 2.116 (2.61), 2.156 (1.44), 2.170 (1.66), 2.186 (0.98), 2.206 (0.83), 2.327 (1.00), 2.366 (0.43), 2.669 (1.05), 2.710 (0.52), 3.475 (2.09), 3.503 (2.40), 3.737

			(1.58), 3.759 (1.14), 3.813 (0.91), 3.835 (1.75), 3.865 (2.04), 3.877 (2.60), 3.892 (1.74), 3.903 (1.61), 4.254 (3.26), 4.266 (5.15), 4.280 (3.06), 4.366 (2.18), 4.538 (0.55), 5.032 (2.78), 5.207 (0.85), 5.221 (1.83), 5.241 (1.89), 5.255 (0.85), 6.781 (3.54), 6.801 (4.00), 6.891 (1.71), 6.910 (3.70), 6.929 (2.12), 7.145 (1.81), 7.162 (2.90), 7.183 (1.41), 7.305 (3.14), 7.324 (2.84), 7.464 (2.18), 7.482 (3.14), 7.503 (2.58), 7.606 (4.72), 7.610 (4.81), 7.621 (16.00), 7.625 (9.59), 7.706 (3.90), 7.724 (3.35), 8.133 (13.65), 8.279 (3.24), 8.299 (3.04), 8.434 (10.50), 9.044 (3.03), 9.065 (2.98), 12.729 (0.68).
187		LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.80 分；MS (ESIpos)：m/z = 534 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.149 (0.83), -0.008 (7.47), 0.008 (6.76), 0.146 (0.89), 1.235 (0.41), 1.260 (2.01), 1.335 (2.31), 1.901 (1.24), 2.005 (1.48), 2.017 (2.25), 2.028 (2.37), 2.040 (2.49), 2.049 (2.61), 2.085 (0.53), 2.149 (1.42), 2.167 (1.24), 2.185 (1.19), 2.200 (0.89), 2.327 (1.36), 2.366 (0.83), 2.523 (4.80), 2.670 (1.60), 2.710 (1.07), 3.501 (1.84), 3.527 (2.07), 3.732 (1.54), 3.780 (1.01), 3.800 (1.78), 3.821 (1.54), 3.852 (1.72), 3.862 (1.78), 3.879 (1.54), 3.889 (1.42), 4.258 (5.39), 4.270 (3.32), 4.374 (2.31), 5.029 (3.67), 5.037 (3.61), 5.197 (0.89), 5.212 (2.01), 5.231 (2.07), 5.246 (0.95), 5.753 (8.18), 6.782 (3.61), 6.803 (4.09), 6.895 (1.84), 6.913 (3.97), 6.932 (2.31), 7.147 (1.96), 7.165 (3.20), 7.182 (1.60), 7.310 (3.38), 7.328 (3.08), 7.463 (1.72), 7.483 (2.79), 7.503 (2.13), 7.609 (3.08), 7.621 (16.00), 7.625 (9.84), 7.709 (3.67), 7.725 (3.20), 8.132 (2.01), 8.276 (3.08), 8.297 (2.90), 8.428 (6.76), 9.044 (2.37), 9.065 (2.37), 12.724 (0.71).
188	4,5	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.18 分；MS (ESIneg)：m/z = 514 [M-H]-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (2.51), 0.008 (2.40), 1.778 (0.76), 1.789 (0.83), 1.806 (1.00), 1.999 (0.94), 2.012 (0.94), 2.020 (0.92), 2.034 (0.71), 2.327 (0.91), 2.670 (1.00), 4.034 (0.75), 4.055 (1.64), 4.076 (1.16), 4.161 (1.16), 4.171 (1.05), 4.179 (1.30), 4.198 (0.76), 5.017 (0.70), 5.031 (1.46), 5.050 (1.46), 5.065 (0.67), 5.754 (0.43), 6.746 (2.94), 6.766 (3.26), 6.848 (1.33), 6.868 (2.92), 6.885 (1.86), 7.049 (2.67), 7.066 (2.16), 7.127 (1.46), 7.148 (2.40), 7.165 (1.19), 7.419 (2.81), 7.438 (3.05), 7.721 (4.19), 7.724 (6.58), 7.730 (16.00), 7.734 (7.25), 7.816 (2.30), 7.835 (3.08), 7.856 (2.38), 8.049 (3.13), 8.052 (3.29), 8.067 (2.75), 8.136 (6.83), 8.138 (6.75), 8.649 (6.74), 8.652 (6.63), 9.105 (2.64), 9.125 (2.56), 9.233

			(10.60).
189	5	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.27 分；MS (ESIpos)：m/z = 534 [M+H]+	1H-NMR (400MHz, DMSO-d6)：δ [ppm]= 9.12 - 9.22 (m, 2H), 8.35 (s, 2H), 8.03 (dd, 1H), 7.88 - 7.96 (m, 1H), 7.79 - 7.88 (m, 1H), 7.67 - 7.76 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.11 - 7.20 (m, 1H), 6.88 - 6.97 (m, 1H), 6.76 (d, 1H), 5.01 - 5.13 (m, 1H), 4.07 - 4.28 (m, 2H), 2.02 - 2.15 (m, 1H), 1.94 (dtd, 1H).
190		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.11 分；MS (ESIpos)：m/z = 518 [M+H]+	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.149 (1.34), 0.008 (11.80), 0.146 (1.34), 1.234 (0.47), 2.050 (1.17), 2.058 (1.31), 2.072 (1.34), 2.085 (1.95), 2.210 (1.70), 2.222 (1.64), 2.231 (1.56), 2.245 (1.09), 2.327 (1.39), 2.366 (0.75), 2.523 (4.79), 2.669 (1.47), 2.710 (0.78), 3.060 (0.45), 3.162 (0.56), 3.174 (0.58), 3.249 (1.59), 3.269 (5.20), 3.280 (11.55), 3.291 (13.72), 3.864 (8.68), 3.875 (14.11), 3.886 (8.04), 4.223 (0.95), 4.244 (2.73), 4.252 (2.17), 4.265 (3.56), 4.293 (2.25), 4.312 (0.81), 5.245 (1.11), 5.259 (2.50), 5.277 (2.50), 5.292 (1.09), 5.754 (0.53), 6.788 (4.59), 6.809 (5.04), 6.917 (2.25), 6.933 (4.79), 6.952 (2.87), 7.157 (2.56), 7.175 (4.03), 7.192 (1.98), 7.377 (4.26), 7.395 (4.01), 7.484 (3.14), 7.506 (6.04), 7.528 (4.70), 7.586 (2.67), 7.591 (2.98), 7.598 (2.95), 7.603 (3.09), 7.612 (2.11), 7.619 (1.89), 7.625 (1.92), 7.673 (3.28), 7.691 (4.84), 7.712 (4.31), 7.796 (8.77), 7.815 (7.35), 8.253 (4.51), 8.256 (4.54), 8.274 (4.20), 8.419 (0.42), 8.679 (16.00), 9.157 (4.45), 9.177 (4.29).
191		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.14 分；MS (ESIpos)：m/z = 536 [M+H]+	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：3.284 (1.86), 3.296 (2.09), 3.310 (16.00), 3.864 (1.44), 3.875 (2.23), 3.886 (1.28), 4.236 (0.43), 4.260 (0.54), 5.248 (0.41), 6.782 (0.73), 6.802 (0.80), 6.924 (0.74), 6.941 (0.43), 7.168 (0.63), 7.364 (0.68), 7.383 (0.61), 7.593 (0.46), 7.617 (0.89), 7.641 (0.45), 7.675 (0.47), 7.688 (0.55), 7.695 (0.75), 7.706 (0.80), 7.714 (0.54), 7.726 (0.64), 7.774 (0.85), 7.790 (0.54), 8.295 (0.68), 8.313 (0.62), 8.626 (2.30), 9.156 (0.68), 9.176 (0.65).
192		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.25 分；MS (ESIpos)：m/z = 552 [M+H]+	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (0.73), 0.008 (0.67), 1.038 (0.70), 1.056 (1.42), 1.073 (0.73), 1.356 (16.00), 2.069 (0.41), 2.183 (2.23), 2.198 (0.40), 2.523 (0.65), 3.162 (5.24), 3.175 (5.43), 3.261 (1.01), 3.272 (2.30), 3.284 (2.43), 3.295 (1.34), 3.862 (1.80), 3.873 (3.10), 3.884 (1.73), 4.062 (0.46), 4.075 (1.30), 4.088 (1.26), 4.101 (0.43), 4.231 (0.62), 4.238 (0.48), 4.252 (0.64), 4.259 (0.79), 4.267

			(0.64), 4.274 (0.50), 4.283 (0.53), 4.335 (0.42), 5.238 (0.57), 5.257 (0.58), 6.631 (0.75), 6.784 (1.09), 6.802 (1.21), 6.870 (1.34), 6.902 (0.56), 6.905 (0.54), 6.921 (1.16), 6.939 (0.71), 6.942 (0.64), 7.148 (0.56), 7.152 (0.59), 7.169 (0.92), 7.187 (0.45), 7.190 (0.45), 7.362 (0.95), 7.381 (0.90), 7.502 (2.90), 7.506 (3.06), 7.636 (0.78), 7.659 (1.54), 7.682 (0.86), 7.688 (1.02), 7.693 (1.74), 7.698 (0.87), 8.319 (0.77), 8.334 (0.82), 8.342 (0.81), 8.358 (0.73), 8.680 (4.09), 9.152 (1.05), 9.172 (1.01).
193		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.46 分; MS (ESIpos): m/z = 552 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.61), −0.008 (8.00), 0.008 (5.20), 0.146 (0.61), 1.903 (1.83), 2.018 (3.13), 2.029 (3.53), 2.040 (3.33), 2.050 (3.82), 2.156 (2.07), 2.170 (2.36), 2.185 (1.71), 2.327 (2.03), 2.366 (1.50), 2.518 (10.92), 2.523 (9.71), 2.669 (2.07), 2.710 (1.58), 3.472 (1.54), 3.499 (2.56), 3.523 (1.34), 3.736 (2.19), 3.833 (1.71), 3.863 (2.48), 3.876 (2.52), 3.892 (1.83), 4.257 (5.69), 4.266 (6.05), 4.370 (3.09), 5.029 (4.51), 5.220 (2.48), 5.754 (1.38), 6.783 (4.95), 6.802 (5.28), 6.894 (2.88), 6.913 (5.20), 6.931 (3.01), 7.146 (2.80), 7.164 (4.35), 7.184 (1.99), 7.307 (4.39), 7.326 (3.78), 7.461 (2.19), 7.480 (3.49), 7.500 (2.36), 7.721 (4.75), 7.739 (4.06), 7.789 (16.00), 7.805 (15.51), 8.275 (3.57), 8.297 (3.25), 8.439 (5.32), 9.042 (3.25), 9.063 (3.09).
194		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.37 分; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.150 (0.76), 1.243 (1.14), 1.862 (2.65), 1.904 (3.87), 2.034 (6.99), 2.142 (4.04), 2.157 (4.55), 2.327 (2.86), 2.365 (1.05), 2.668 (3.16), 2.689 (9.05), 2.709 (1.60), 2.889 (0.97), 3.508 (3.16), 3.741 (3.75), 3.873 (5.09), 4.249 (14.53), 4.384 (6.23), 5.049 (4.97), 5.203 (5.26), 5.754 (16.00), 6.770 (9.35), 6.791 (10.32), 6.876 (5.64), 6.895 (11.49), 6.912 (6.48), 7.135 (5.73), 7.153 (8.80), 7.172 (4.63), 7.286 (10.78), 7.305 (12.25), 7.422 (4.88), 7.494 (4.88), 7.537 (6.19), 7.663 (5.05), 8.133 (2.95), 8.331 (10.27), 9.031 (3.83).
195		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.75 分; MS (ESIpos): m/z = 536 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (1.44), −0.008 (12.33), 0.008 (10.95), 0.146 (1.32), 1.258 (0.72), 1.902 (4.39), 2.034 (9.32), 2.148 (5.11), 2.164 (5.71), 2.180 (4.39), 2.197 (3.67), 2.327 (4.99), 2.366 (2.71), 2.523 (12.27), 2.670 (4.75), 2.689 (1.26), 2.709 (1.98), 2.812 (0.78), 3.509 (4.03), 3.745 (4.09), 3.874 (7.82), 4.257 (16.00), 4.376 (6.92), 5.037 (7.10), 5.221 (6.32), 5.754 (14.80), 6.777 (11.31), 6.797

			(12.27), 6.882 (7.64), 6.901 (15.28), 6.919 (8.84), 7.142 (6.86), 7.159 (10.83), 7.178 (5.23), 7.292 (12.75), 7.311 (11.49), 7.493 (5.29), 7.585 (5.23), 7.664 (9.26), 8.132 (2.05), 8.320 (6.26), 8.361 (10.23), 9.030 (4.45).
196		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.74 分; MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.87), 1.913 (2.01), 2.048 (3.88), 2.170 (2.51), 2.327 (1.94), 2.523 (5.82), 2.669 (1.97), 3.516 (1.51), 3.868 (2.41), 4.265 (7.06), 4.377 (3.51), 5.044 (3.01), 5.223 (2.74), 5.754 (16.00), 6.784 (6.46), 6.803 (6.93), 6.892 (3.08), 6.910 (6.43), 6.928 (3.88), 7.147 (3.25), 7.164 (5.12), 7.183 (2.68), 7.301 (4.92), 7.320 (4.62), 7.492 (5.12), 7.567 (3.68), 7.579 (3.75), 7.684 (3.48), 7.701 (3.18), 7.779 (5.82), 7.784 (5.72), 7.798 (5.82), 7.803 (5.62), 8.131 (2.91), 8.260 (2.74), 8.409 (3.45), 9.059 (1.97).
197		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.93 分; MS (ESIpos): m/z = 494 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (0.53), 2.055 (0.47), 2.182 (0.43), 2.194 (0.43), 2.523 (1.20), 3.072 (16.00), 4.234 (0.76), 4.241 (0.67), 4.253 (1.11), 4.261 (1.14), 4.276 (0.61), 5.233 (0.66), 5.253 (0.62), 5.754 (0.79), 6.781 (1.22), 6.799 (1.31), 6.895 (0.67), 6.914 (1.23), 6.933 (0.72), 7.147 (0.66), 7.164 (0.99), 7.182 (0.48), 7.342 (1.07), 7.361 (0.96), 7.586 (0.87), 7.609 (1.65), 7.634 (1.59), 7.652 (1.37), 7.668 (1.04), 7.673 (1.40), 7.687 (1.16), 7.707 (0.85), 7.733 (1.36), 7.747 (0.90), 8.252 (1.19), 8.256 (1.15), 8.273 (1.10), 8.558 (4.01), 9.072 (1.07), 9.092 (0.99).
198		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.17 分; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.98), 0.008 (2.20), 1.031 (16.00), 1.046 (15.86), 2.114 (0.42), 2.123 (0.49), 2.130 (0.48), 2.180 (0.43), 2.207 (0.73), 2.231 (0.54), 2.290 (0.86), 2.524 (0.71), 2.599 (7.81), 2.716 (2.57), 2.767 (1.36), 2.782 (4.28), 3.063 (13.77), 3.096 (5.64), 3.118 (5.22), 3.128 (2.34), 3.758 (0.72), 3.774 (0.93), 3.789 (0.67), 4.223 (0.45), 4.234 (0.63), 4.240 (0.73), 4.263 (1.22), 4.268 (1.11), 4.291 (0.83), 4.347 (0.83), 4.356 (1.15), 4.374 (0.55), 4.384 (0.64), 6.029 (0.51), 6.045 (0.60), 6.054 (0.62), 6.070 (0.47), 6.750 (0.57), 6.770 (0.61), 6.816 (1.14), 6.836 (1.59), 6.854 (0.46), 6.942 (0.62), 6.952 (0.92), 6.970 (1.59), 6.989 (0.90), 7.088 (0.43), 7.162 (1.02), 7.181 (1.47), 7.200 (0.67), 7.303 (1.07), 7.322 (0.94), 7.359 (0.50), 7.378 (0.44), 7.584 (1.50), 7.588 (2.38), 7.600 (0.65), 7.604 (0.60), 7.623 (0.60), 7.641 (2.51), 7.645 (2.60), 7.653 (1.17), 7.674 (6.23), 7.678

		(4.23), 7.684 (1.61), 7.760 (0.60), 7.763 (0.61), 7.778 (0.49), 7.781 (0.49), 7.810 (1.91), 7.828 (1.43), 8.233 (1.73), 8.252 (1.81), 8.270 (0.45), 8.621 (1.03), 8.626 (0.75), 8.649 (1.42), 8.685 (3.00).	
199	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.47 分; MS (ESIpos): m/z = 554 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.524 (0.76), 1.830 (0.77), 1.842 (0.85), 2.669 (0.44), 3.368 (16.00), 3.946 (0.56), 3.970 (1.28), 3.993 (1.00), 4.034 (1.18), 4.049 (1.17), 4.939 (1.39), 4.958 (1.38), 5.753 (0.43), 6.593 (3.28), 6.613 (3.44), 6.720 (2.29), 6.740 (2.71), 6.751 (1.49), 6.769 (2.88), 6.792 (2.81), 6.811 (1.48), 6.997 (1.58), 7.015 (1.39), 7.099 (1.40), 7.123 (3.83), 7.142 (4.69), 7.163 (2.24), 7.676 (2.67), 7.680 (2.28), 7.686 (2.02), 7.707 (3.17), 7.716 (8.16), 7.721 (7.33), 7.909 (2.73), 7.925 (2.29), 7.963 (2.59), 7.984 (2.17), 8.892 (2.25), 8.912 (2.12), 8.993 (6.13).
200	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.14 分; MS (ESIpos): m/z = 552 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.45), −0.008 (4.14), 0.008 (3.74), 0.146 (0.49), 1.157 (4.28), 1.175 (8.62), 1.192 (4.37), 1.237 (1.13), 1.398 (6.32), 1.988 (16.00), 2.019 (1.27), 2.040 (1.53), 2.054 (1.76), 2.073 (1.64), 2.191 (1.72), 2.204 (1.64), 2.213 (1.69), 2.227 (1.15), 2.327 (1.34), 2.366 (0.92), 2.522 (4.51), 2.669 (1.41), 2.710 (0.92), 3.247 (1.22), 3.265 (2.51), 3.295 (9.16), 3.874 (12.08), 4.002 (1.25), 4.020 (3.83), 4.038 (3.76), 4.056 (1.29), 4.200 (0.85), 4.224 (2.40), 4.249 (3.43), 4.258 (2.82), 4.275 (2.47), 5.230 (2.35), 5.245 (2.44), 5.754 (7.59), 6.774 (5.36), 6.795 (5.92), 6.887 (2.61), 6.905 (5.47), 6.924 (3.27), 7.142 (2.89), 7.159 (4.46), 7.177 (2.21), 7.181 (2.21), 7.344 (6.79), 7.360 (6.16), 7.363 (7.33), 7.370 (3.55), 7.374 (2.84), 7.389 (3.59), 7.393 (3.43), 7.452 (2.96), 7.466 (3.38), 7.472 (4.89), 7.485 (5.24), 7.491 (2.68), 7.505 (2.61), 7.646 (3.76), 7.669 (6.51), 7.691 (3.88), 7.734 (6.13), 7.737 (6.30), 7.754 (5.36), 7.757 (5.12), 8.341 (3.74), 8.356 (3.99), 8.364 (3.95), 8.380 (3.64), 8.604 (9.75), 8.612 (10.24), 9.143 (2.98), 9.149 (3.15), 9.163 (2.98), 9.170 (2.96).
201	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.08 分; MS (ESIpos): m/z = 554 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.72), 0.008 (2.48), 2.030 (0.56), 2.039 (0.58), 2.051 (0.60), 2.066 (0.88), 2.073 (0.77), 2.086 (3.11), 2.181 (0.62), 2.193 (0.79), 2.205 (0.79), 2.215 (0.72), 2.227 (0.47), 2.327 (0.60), 2.332 (0.43), 2.523 (1.88), 2.559 (1.25), 2.578 (1.51), 2.596 (1.97), 2.614 (1.49), 2.634 (0.95), 2.651

			(0.54), 2.665 (0.50), 2.669 (0.65), 2.674 (0.47), 3.710 (1.27), 3.720 (1.53), 3.728 (2.20), 3.737 (2.18), 3.744 (1.48), 3.755 (1.21), 3.845 (1.98), 3.877 (3.98), 3.909 (1.91), 4.223 (0.41), 4.244 (1.29), 4.252 (1.09), 4.264 (1.96), 4.272 (2.19), 4.287 (1.15), 4.306 (0.42), 5.237 (0.54), 5.251 (1.20), 5.271 (1.20), 5.285 (0.52), 5.754 (4.52), 6.792 (2.31), 6.810 (2.55), 6.812 (2.55), 6.904 (1.13), 6.907 (1.12), 6.923 (2.38), 6.942 (1.43), 6.944 (1.35), 7.156 (1.18), 7.160 (1.25), 7.177 (1.91), 7.195 (0.96), 7.199 (0.91), 7.355 (1.97), 7.373 (1.85), 7.638 (16.00), 7.657 (0.42), 7.664 (1.80), 7.682 (2.37), 7.685 (2.13), 7.703 (2.16), 7.834 (2.60), 7.837 (2.71), 7.852 (2.23), 7.855 (2.07), 8.237 (2.33), 8.240 (2.34), 8.258 (2.24), 8.261 (2.06), 8.688 (8.85), 9.217 (2.14), 9.237 (2.09).
202	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.04 分; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H]+		1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.84), −0.008 (8.37), 0.008 (8.34), 0.146 (0.90), 0.994 (0.52), 1.236 (1.34), 1.336 (0.57), 1.782 (1.25), 1.916 (1.25), 2.327 (1.74), 2.366 (1.09), 2.670 (1.88), 2.710 (1.09), 2.765 (2.18), 2.781 (4.28), 2.797 (2.15), 3.963 (0.87), 3.984 (2.07), 4.006 (1.34), 4.111 (1.55), 4.873 (1.80), 4.888 (3.60), 4.905 (2.43), 4.921 (1.58), 4.936 (1.88), 4.953 (1.31), 6.688 (3.46), 6.709 (3.87), 6.716 (1.80), 6.735 (3.46), 6.754 (2.51), 6.856 (3.41), 6.875 (2.53), 7.058 (1.66), 7.079 (2.70), 7.097 (1.53), 7.614 (11.50), 7.618 (16.00), 7.636 (4.99), 7.641 (5.42), 7.657 (1.20), 7.680 (1.61), 7.743 (1.77), 7.761 (4.12), 7.781 (3.76), 7.798 (4.58), 7.812 (2.21), 8.383 (2.67), 8.403 (2.70), 8.563 (2.67), 8.580 (2.43), 8.662 (0.57), 9.033 (11.99), 11.367 (0.60).
203	LC-MS (方法 L4): R_t= 3.85 分; MS (ESIpos): m/z = 582 [M+H]+		1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (2.46), 2.064 (0.79), 2.071 (0.81), 2.084 (0.92), 2.099 (1.21), 2.206 (0.83), 2.218 (1.14), 2.230 (1.08), 2.240 (1.07), 2.252 (0.73), 2.327 (0.63), 2.522 (1.85), 2.669 (0.67), 3.484 (3.25), 3.654 (5.30), 3.666 (4.89), 4.223 (0.66), 4.244 (1.80), 4.251 (1.36), 4.265 (1.77), 4.272 (2.23), 4.282 (1.77), 4.297 (1.50), 4.316 (0.61), 5.240 (0.78), 5.254 (1.76), 5.273 (1.72), 5.287 (0.74), 5.754 (1.31), 6.794 (3.28), 6.814 (3.60), 6.920 (1.57), 6.937 (3.30), 6.955 (1.94), 7.160 (1.66), 7.163 (1.71), 7.181 (2.72), 7.198 (1.33), 7.392 (2.85), 7.409 (2.68), 7.635 (8.69), 7.639 (16.00), 7.647 (5.36), 7.652 (4.23), 7.707 (2.28), 7.725 (3.22), 7.746 (2.80), 7.872 (3.73), 7.887 (2.92), 8.399 (3.12), 8.417 (2.89), 8.770

204	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.83 分；MS (ESIpos)：m/z = 508 [M+H]+	(11.57)，9.239（3.04），9.260（2.96）。 ^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：-0.150（1.38），-0.008（13.30），0.008（13.66），0.146（1.50），1.235（1.56），2.049（1.20），2.076（1.68），2.206（1.50），2.217（1.62），2.226（1.44），2.322（2.70），2.327（3.60），2.331（2.70），2.366（2.52），2.522（13.90），2.664（3.00），2.669（3.84），2.674（2.88），2.709（2.46），3.218（3.96），3.241（9.11），3.262（8.45），3.273（10.25），3.285（11.63），3.858（7.85），3.870（13.30），3.881（7.43），4.223（0.72），4.243（2.64），4.251（2.10），4.264（3.90），4.273（3.96），4.289（2.16），4.381（4.85），4.403（9.65），4.425（4.67），5.240（1.02），5.255（2.40），5.275（2.34），5.288（0.96），5.753（2.76），6.784（4.43），6.802（4.91），6.871（3.66），6.890（7.49），6.909（5.87），6.923（4.73），6.942（2.82），7.109（4.55），7.127（3.90），7.151（2.46），7.168（3.78），7.186（1.92），7.237（4.19），7.256（3.78），7.363（4.01），7.382（3.72），7.618（2.64），7.636（5.21），7.657（5.27），7.674（5.69），7.678（6.05），7.692（3.06），7.696（2.52），8.202（4.25），8.206（4.07），8.223（3.90），8.227（3.54），8.583（16.00），9.155（4.25），9.176（4.13）。
205	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.94 分；m/z = 568/570 (M+H)+	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 8.83（s，1H），8.20（d，J = 9.1 Hz，1H），7.67 - 7.63（m，1H），7.56（dd，J = 8.0，1.5 Hz，1H），7.34（td，J = 7.8，2.5 Hz，1H），7.25（d，J = 7.7 Hz，1H），7.23 - 7.12（m，2H），6.94 - 6.80（m，3H），5.39 - 5.31（m，1H），4.38 - 4
206	LC-MS（方法 L2）：R_t= 4.15 分；m/z = 568/570 (M+H)+	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 8.85（s，1H），8.17（d，J = 9.1 Hz，1H），7.64（d，J = 9.1 Hz，1H），7.43（t，J = 1.9 Hz，1H），7.30 - 7.17（m，4H），6.92（td，J = 7.5，1.2 Hz，1H），6.86（dd，J = 8.3，1.0 Hz，1H），6.80（d，J = 7.4 Hz，1H），5.40 - 5.33（m，1H）
207	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.41 分；m/z = 526/528 (M+H)+	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 8.84（d，J = 1.7 Hz，1H），8.14（dd，J = 9.1，1.4 Hz，1H），7.62（d，J = 9.2 Hz，1H），7.55（dd，J = 8.1，1.5 Hz，1H），7.34（td，J = 7.8，2.2 Hz，1H），7.26（d，1H），7.23 - 7.14（m，2H），6.94 - 6.83（m，3H），5.38 - 5.31（m，1H
208	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.61 分；m/z = 526/528 (M+H)+	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 8.83（s，1H），8.09（d，J = 9.1 Hz，1H），7.59（d，J = 9.1 Hz，1H），7.42（s，1H），7.32 - 7.15（m，4H），6.97 - 6.82（m，3H），5.33（q，J = 5.2 Hz，1H），4.38 - 4.28（m，1H），4.22 - 4.13（m，1H），3.12（s，6H），2.42 - 2.32

			(m, 1H
209		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.85 分; m/z = 552/554 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.78 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.57 – 7.50 (m, 2H), 7.32 – 7.17 (m, 5H), 6.94 – 6.77 (m, 3H), 5.40 – 5.33 (m, 1H), 4.38 – 4.30 (m, 1H), 4.22 – 4.14 (m, 1H), 3.91 – 3.80 (m, 4H), 3.44 – 3.31 (m, 4H), 2.44 – 2.33 (m, 1H), 2.25 –
210		LC-MS (方法 L2): R_t= 4.13 分; m/z = 552/554 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.81 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 8.1, 5.3 Hz, 1H), 7.47 – 7.36 (m, 3H), 7.32 – 7.18 (m, 3H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 5.41 – 5.33 (m, 1H), 4.40 – 4.32 (m, 1H), 4.
211		LC-MS (方法 L2): R_t= 4.39 分, m/z = 568/570 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.24 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (s, 3H), 7.39 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 7.1
212		LC-MS (方法 L2): R_t= 4.12 分, m/z = 568/570 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (dd, J = 8.0, 5.3 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.46 (td, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 7.41 – 7.33 (m, 2H), 7.16 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 6.91 (
213		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.75 分, m/z = 526/528 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.13 (dd, J = 8.1, 5.1 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.74 – 7.69 (m, 2H), 7.45 (td, J = 7.8, 4.4 Hz, 1H), 7.41 – 7.31 (m, 2H), 7.20 – 7.12 (m, 1H), 6.90 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.2, 1.0
214		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.27 分, m/z = 548 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (dd, J = 8.1, 5.5 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.49 – 7.34 (m, 3H), 7.33 – 7.26 (m, 1H), 7.16 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1
215		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.56 分, m/z = 548 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.68 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.63 – 7.55 (m, 3H), 7.49 – 7.37 (m, 2H), 7.21 – 7.14 (m, 1H), 6.97 – 6.90 (m, 1H), 6.83 – 6.77 (m, 1H), 5.31 – 5.23 (m, 1H), 4.33 – 4.20 (m, 2H), 3.87 – 3.78 (m

216	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.94 分；MS（ESIpos）：m/z = 565 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.326 (0.43), 3.568 (16.00), 3.897 (2.36), 3.910 (6.78), 3.954 (0.55), 4.259 (0.56), 5.263 (0.41), 6.778 (0.76), 6.798 (0.79), 6.909 (0.76), 6.928 (0.43), 7.141 (0.43), 7.162 (0.66), 7.359 (0.68), 7.379 (0.61), 7.754 (0.48), 7.771 (0.70), 7.792 (0.53), 7.952 (0.81), 7.970 (0.69), 8.151 (1.35), 8.356 (0.70), 8.378 (0.67), 8.396 (1.42), 8.590 (2.23), 8.803 (2.18), 9.184 (0.66), 9.205 (0.63).
217	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.04 分，m/z = 506 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.12 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.67 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.62 - 7.56 (m, 3H), 7.45 - 7.35 (m, 2H), 7.21 - 7.14 (m, 1H), 6.97 - 6.89 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 1.0 Hz, 1H), 5.30 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.20 (m, 2H), 2.
218	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.03 分，m/z = 506 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) : δ 9.11 (dd, J = 7.9, 5.8 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.45 - 7.38 (m, 2H), 7.35 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.33 - 7.26 (m, 1H), 7.16 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.
219	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.28 分；MS（ESIpos）：m/z = 476 [M+H]+	^{1}H-NMR (600 MHz, ジクロロメタン-d2) δ [ppm]: 2.505 (11.27), 3.076 (9.00), 3.332 (16.00), 4.248 (0.52), 4.262 (0.80), 5.254 (0.50), 6.784 (0.99), 6.797 (1.22), 6.915 (0.81), 6.927 (0.45), 7.055 (0.40), 7.071 (0.64), 7.148 (0.45), 7.161 (0.75), 7.343 (0.79), 7.356 (0.75), 7.625 (0.76), 7.643 (1.22), 8.223 (0.76), 8.237 (0.72), 8.548 (1.64), 9.091 (0.69), 9.104 (0.67), 10.063 (0.80).
220	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.86 分；MS（ESIpos）：m/z = 498 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.32), 0.008 (3.21), 1.236 (0.84), 1.817 (10.47), 1.834 (9.96), 2.029 (1.50), 2.037 (1.62), 2.048 (1.70), 2.064 (2.32), 2.071 (2.04), 2.198 (1.99), 2.210 (1.96), 2.219 (1.89), 2.231 (1.34), 2.327 (0.87), 2.366 (0.64), 2.669 (0.92), 2.710 (0.59), 3.607 (1.18), 3.634 (0.65), 3.880 (16.00), 4.208 (0.97), 4.230 (2.88), 4.257 (4.12), 4.266 (3.48), 4.273 (2.88), 4.282 (2.93), 4.294 (1.13), 4.300 (1.21), 5.224 (1.35), 5.239 (3.07), 5.258 (3.05), 5.273 (1.35), 6.779 (5.76), 6.799 (6.47), 6.894 (2.26), 6.913 (4.68), 6.932 (2.70), 6.998 (2.00), 7.017 (4.09), 7.036 (2.35), 7.146 (3.37), 7.165 (5.23), 7.182 (3.02), 7.199 (4.41), 7.222 (3.20), 7.274 (2.47), 7.352 (5.14), 7.371 (4.90), 7.465 (0.67), 7.486 (0.43), 7.610 (3.69), 7.627 (5.66), 7.676 (4.79), 7.696 (5.53), 7.714 (3.21), 8.095 (0.41), 8.114

221	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.11 分；MS（ESIpos）：m/z = 518 [M+H]+		(0.45)，8.262 (5.39)，8.283 (5.12)，8.578 (14.71)，9.146 (2.67)。 ^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：2.072 (1.74)，2.203 (1.62)，2.327 (1.90)，2.366 (1.16)，2.669 (2.05)，2.710 (1.47)，3.286 (11.07)，3.877 (14.20)，4.237 (2.72)，4.262 (3.40)，5.249 (2.54)，5.268 (2.69)，6.781 (4.77)，6.802 (5.41)，6.903 (2.42)，6.921 (5.14)，6.940 (2.97)，7.149 (2.63)，7.168 (3.98)，7.185 (2.05)，7.320 (3.24)，7.343 (6.52)，7.365 (7.89)，7.381 (3.79)，7.480 (3.06)，7.487 (4.62)，7.496 (3.43)，7.502 (4.47)，7.510 (2.88)，7.520 (3.15)，7.532 (2.66)，7.543 (2.57)，7.686 (2.75)，7.704 (4.93)，7.725 (4.83)，7.767 (5.66)，7.782 (3.55)，8.292 (4.37)，8.310 (4.10)，8.624 (16.00)，9.156 (4.28)，9.176 (4.41)。
222	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.07 分；MS（ESIpos）：m/z = 520 [M+H]+		^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：0.008 (1.64)，2.023 (0.54)，2.038 (1.00)，2.046 (1.02)，2.058 (1.08)，2.073 (1.49)，2.081 (1.28)，2.088 (0.94)，2.184 (0.70)，2.193 (1.09)，2.205 (1.44)，2.217 (1.35)，2.227 (1.31)，2.240 (0.90)，2.248 (0.69)，2.327 (0.51)，2.366 (0.43)，2.669 (0.49)，3.259 (1.78)，3.278 (5.13)，3.289 (11.26)，3.301 (15.43)，3.312 (16.00)，3.867 (7.04)，3.878 (11.75)，3.889 (6.69)，4.209 (0.69)，4.216 (0.81)，4.237 (2.18)，4.245 (1.75)，4.264 (2.74)，4.271 (2.61)，4.287 (2.00)，4.306 (0.79)，5.236 (0.95)，5.250 (2.07)，5.269 (2.07)，5.283 (0.94)，6.783 (3.72)，6.803 (4.15)，6.814 (0.48)，6.906 (1.85)，6.924 (3.92)，6.942 (2.32)，7.148 (1.95)，7.152 (2.07)，7.169 (3.35)，7.190 (2.50)，7.200 (1.81)，7.208 (1.77)，7.222 (1.73)，7.369 (3.48)，7.387 (3.23)，7.562 (0.70)，7.570 (0.83)，7.578 (0.92)，7.585 (1.40)，7.598 (1.38)，7.606 (1.34)，7.611 (1.38)，7.619 (0.86)，7.626 (0.75)，7.634 (0.68)，7.707 (2.41)，7.725 (3.96)，7.746 (3.74)，7.799 (4.59)，7.814 (2.97)，8.285 (0.81)，8.314 (3.61)，8.317 (3.68)，8.335 (3.42)，8.338 (3.29)，8.650 (12.72)，8.724 (0.73)，9.169 (3.62)，9.189 (3.54)。
223	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.70 分；MS（ESIpos）：m/z = 518 [M+H]+		^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：1.175 (0.49)，1.863 (1.82)，1.911 (2.02)，2.036 (3.68)，2.085 (1.72)，2.163 (2.23)，2.198 (1.58)，2.327 (1.01)，2.669 (1.08)，2.709 (0.62)，3.163 (3.07)，3.174 (3.15)，3.529 (1.52)，3.655 (0.88)，3.763 (1.37)，3.882 (2.44)，4.089 (0.62)，4.170 (3.56)，4.256 (6.88)，4.379 (3.32)，5.049 (3.25)，5.211 (2.58)，5.753 (9.32)，6.777 (6.14)，6.796 (6.47)，6.881 (3.02)，6.900 (6.29)，6.918 (4.00)，7.140 (3.30)，7.158 (5.04)，7.175 (2.77)，7.293 (5.66)，7.311 (5.73)，7.328

			(2.80), 7.349 (2.01), 7.502 (5.11), 7.651 (2.66), 8.133 (16.00), 8.321 (3.22), 8.355 (6.29), 8.737 (1.30), 9.047 (1.75), 12.596 (0.49).
224		LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.79 分；MS (ESIpos)：m/z = 523 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.149 (0.93), 0.146 (0.80), 2.056 (2.10), 2.203 (2.12), 2.327 (1.92), 2.366 (1.27), 2.670 (2.02), 2.709 (1.14), 3.893 (16.00), 4.229 (3.13), 4.249 (4.61), 4.256 (4.76), 4.495 (1.40), 5.241 (2.87), 5.258 (2.80), 6.770 (4.84), 6.790 (5.39), 6.878 (2.36), 6.896 (5.10), 6.914 (3.06), 7.134 (2.59), 7.152 (4.45), 7.171 (2.20), 7.333 (4.66), 7.352 (4.38), 7.507 (4.66), 7.525 (7.95), 7.550 (6.37), 7.569 (7.48), 7.588 (3.21), 7.691 (2.72), 7.709 (5.02), 7.730 (4.14), 7.788 (5.95), 7.804 (4.06), 8.195 (5.05), 8.214 (4.89), 8.287 (4.58), 8.308 (4.38), 8.483 (13.31), 9.143 (4.43), 9.164 (4.50), 9.188 (10.17).
225		LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.04 分；MS (ESIpos)：m/z = 498 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：2.049 (0.55), 2.058 (0.60), 2.069 (0.65), 2.084 (0.92), 2.092 (0.81), 2.200 (0.60), 2.210 (0.84), 2.222 (0.83), 2.231 (0.80), 2.244 (0.52), 2.387 (16.00), 2.670 (0.42), 3.246 (0.74), 3.266 (2.20), 3.278 (5.05), 3.290 (5.63), 3.652 (0.65), 3.863 (4.10), 3.874 (7.04), 3.885 (4.04), 4.225 (0.44), 4.246 (1.32), 4.253 (1.09), 4.267 (1.92), 4.276 (1.85), 4.293 (1.21), 4.312 (0.44), 5.246 (0.55), 5.260 (1.28), 5.279 (1.30), 5.293 (0.57), 5.754 (0.74), 6.788 (2.36), 6.809 (2.64), 6.915 (1.17), 6.933 (2.52), 6.952 (1.46), 7.048 (1.44), 7.072 (1.45), 7.156 (1.29), 7.175 (2.10), 7.191 (2.25), 7.222 (4.45), 7.376 (2.26), 7.395 (2.06), 7.659 (1.34), 7.678 (2.39), 7.698 (2.06), 7.758 (2.87), 7.776 (1.90), 8.243 (2.30), 8.264 (2.08), 8.668 (7.28), 9.157 (2.21), 9.178 (2.16).
226		LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.10 分；MS (ESIpos)：m/z = 518 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：3.279 (0.79), 3.291 (1.79), 3.312 (16.00), 3.868 (1.47), 3.879 (2.45), 3.889 (1.39), 4.237 (0.46), 4.258 (0.61), 4.286 (0.43), 5.249 (0.45), 5.268 (0.45), 5.754 (0.77), 6.781 (0.85), 6.801 (0.94), 6.904 (0.42), 6.922 (0.86), 6.941 (0.50), 7.149 (0.43), 7.167 (0.75), 7.304 (0.41), 7.324 (1.03), 7.344 (0.75), 7.366 (0.78), 7.385 (1.17), 7.400 (0.72), 7.644 (0.68), 7.695 (0.42), 7.713 (0.86), 7.734 (0.84), 7.754 (1.05), 7.769 (0.52), 8.300 (0.71), 8.318 (0.70), 8.629 (2.54), 9.157 (0.74), 9.177 (0.72).
227		LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.02 分；MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：2.030 (1.38), 2.038 (1.48), 2.053 (1.64), 2.064 (2.14), 2.072 (1.92), 2.187 (1.53), 2.199 (1.97), 2.210 (1.94), 2.220 (1.83), 2.233

	(ESIpos): m/z = 518 [M+H]+	(1.30), 2.669 (0.41), 3.254 (2.20), 3.287 (11.31), 3.876 (16.00), 4.213 (1.15), 4.234 (3.07), 4.241 (2.68), 4.255 (4.56), 4.264 (4.46), 4.281 (2.83), 4.300 (1.09), 5.229 (1.31), 5.244 (2.94), 5.262 (2.90), 5.277 (1.27), 5.753 (3.72), 6.777 (4.98), 6.798 (5.63), 6.896 (2.63), 6.914 (5.47), 6.933 (3.20), 7.144 (2.90), 7.163 (4.73), 7.182 (2.38), 7.244 (2.61), 7.265 (2.55), 7.289 (2.22), 7.297 (1.96), 7.311 (3.96), 7.318 (3.43), 7.332 (2.42), 7.340 (2.20), 7.355 (5.09), 7.374 (4.69), 7.573 (3.19), 7.586 (3.35), 7.595 (3.06), 7.608 (2.68), 7.666 (2.45), 7.683 (11.68), 7.703 (5.74), 7.721 (2.06), 8.279 (4.22), 8.283 (4.22), 8.299 (3.93), 8.303 (3.83), 8.598 (13.90), 9.158 (4.80), 9.178 (4.64).
228	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.11 分; MS (ESIpos): m/z = 530 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.050 (0.48), 2.057 (0.51), 2.071 (0.57), 2.085 (0.76), 2.092 (0.66), 2.199 (0.53), 2.210 (0.69), 2.221 (0.68), 2.231 (0.64), 2.244 (0.44), 3.245 (0.65), 3.265 (1.89), 3.276 (4.16), 3.288 (4.44), 3.822 (16.00), 3.844 (0.52), 3.864 (3.56), 3.874 (5.85), 3.884 (3.40), 4.246 (1.08), 4.253 (0.91), 4.267 (1.58), 4.276 (1.53), 4.293 (0.98), 5.244 (0.47), 5.258 (1.07), 5.277 (1.07), 5.291 (0.47), 5.754 (1.95), 6.788 (1.90), 6.809 (2.13), 6.916 (0.97), 6.935 (2.06), 6.954 (1.21), 7.062 (2.64), 7.094 (2.80), 7.156 (1.06), 7.175 (1.70), 7.197 (3.47), 7.378 (1.82), 7.397 (1.68), 7.662 (1.05), 7.682 (1.95), 7.701 (1.50), 7.782 (2.37), 7.799 (1.71), 8.251 (1.97), 8.272 (1.79), 8.677 (5.49), 9.160 (1.84), 9.180 (1.81).
229	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.76 分; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.69), −0.008 (5.65), 0.008 (5.56), 0.146 (0.66), 1.997 (0.61), 2.012 (1.19), 2.023 (1.58), 2.031 (1.41), 2.044 (2.52), 2.059 (2.38), 2.072 (0.97), 2.127 (0.89), 2.141 (2.46), 2.155 (2.88), 2.169 (1.49), 2.191 (1.36), 2.203 (0.61), 2.327 (1.22), 2.366 (1.05), 2.523 (3.99), 2.669 (1.30), 2.709 (1.13), 3.057 (15.92), 3.069 (16.00), 4.247 (5.37), 4.259 (8.78), 4.273 (5.09), 5.218 (1.36), 5.233 (3.02), 5.253 (3.02), 5.267 (1.38), 6.780 (5.48), 6.800 (6.06), 6.889 (2.85), 6.891 (2.82), 6.908 (6.03), 6.926 (3.63), 7.139 (2.88), 7.143 (3.02), 7.160 (4.73), 7.178 (2.35), 7.182 (2.30), 7.304 (5.04), 7.322 (4.71), 7.414 (1.99), 7.434 (5.79), 7.446 (4.98), 7.464 (7.53), 7.484 (3.74), 7.508 (4.98), 7.511 (9.38), 7.515 (6.42), 7.530 (7.11), 7.553 (3.24), 7.632 (8.14), 7.636 (4.76), 7.667 (5.87), 7.684 (4.76), 7.756 (1.49), 8.133 (6.12), 8.233 (1.00), 8.312 (4.40), 8.333 (4.21), 8.424

		(15.67), 8.963 (3.43), 8.983 (3.35), 12.706 (0.72).
230	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.93 分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.039 (0.49), 2.074 (0.74), 2.206 (0.68), 2.217 (0.65), 2.228 (0.62), 3.247 (0.58), 3.279 (4.26), 3.291 (4.54), 3.861 (3.48), 3.872 (5.83), 3.883 (3.38), 3.919 (16.00), 4.240 (1.05), 4.247 (0.85), 4.261 (1.44), 4.288 (0.95), 5.239 (0.43), 5.254 (1.04), 5.273 (1.05), 5.287 (0.48), 5.754 (5.28), 6.783 (2.11), 6.803 (2.33), 6.907 (0.98), 6.926 (2.11), 6.945 (1.22), 7.152 (1.05), 7.172 (2.27), 7.192 (1.76), 7.202 (1.25), 7.220 (1.17), 7.288 (1.26), 7.305 (1.27), 7.318 (1.25), 7.334 (1.22), 7.367 (1.77), 7.386 (1.63), 7.661 (0.93), 7.680 (2.04), 7.700 (1.95), 7.722 (2.44), 7.738 (1.14), 8.258 (1.70), 8.276 (1.55), 8.620 (6.28), 9.153 (1.82), 9.173 (1.77).
231	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.25 分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.072 (0.90), 2.204 (0.83), 2.327 (0.69), 2.366 (0.42), 2.408 (16.00), 2.670 (0.67), 3.282 (5.02), 3.294 (5.70), 3.862 (3.95), 3.873 (6.80), 3.885 (3.85), 4.237 (1.27), 4.259 (1.58), 4.285 (1.15), 5.249 (1.24), 5.268 (1.26), 6.783 (2.54), 6.803 (2.69), 6.906 (1.22), 6.924 (2.41), 6.941 (1.48), 7.147 (1.32), 7.169 (1.98), 7.186 (1.00), 7.326 (2.64), 7.352 (2.75), 7.365 (2.13), 7.381 (1.93), 7.448 (3.44), 7.465 (3.40), 7.674 (1.50), 7.692 (2.59), 7.713 (2.56), 7.743 (2.91), 7.757 (1.61), 8.273 (2.14), 8.277 (2.20), 8.294 (2.00), 8.612 (8.94), 9.154 (2.17), 9.175 (2.13).
232	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.90 分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.033 (0.68), 2.041 (0.74), 2.052 (0.79), 2.068 (1.07), 2.075 (0.94), 2.189 (0.70), 2.201 (0.97), 2.213 (0.96), 2.222 (0.91), 2.235 (0.63), 2.327 (0.60), 2.366 (0.45), 2.669 (0.68), 2.709 (0.48), 3.254 (0.88), 3.273 (2.55), 3.286 (5.77), 3.588 (15.32), 3.591 (16.00), 3.864 (4.82), 3.875 (8.30), 3.886 (4.64), 4.213 (0.57), 4.234 (1.64), 4.241 (1.30), 4.261 (2.03), 4.269 (1.72), 4.276 (1.38), 4.285 (1.39), 4.304 (0.57), 5.232 (0.65), 5.246 (1.48), 5.265 (1.51), 5.279 (0.66), 6.782 (2.77), 6.802 (3.06), 6.901 (1.38), 6.919 (2.88), 6.936 (1.69), 7.032 (0.93), 7.037 (0.97), 7.048 (1.14), 7.053 (2.04), 7.059 (1.39), 7.069 (1.33), 7.075 (1.25), 7.145 (1.39), 7.149 (1.51), 7.167 (2.40), 7.184 (2.10), 7.204 (1.50), 7.227 (1.53), 7.249 (0.88), 7.354 (2.50), 7.372 (2.32), 7.637 (0.62), 7.643 (1.31), 7.655 (4.76), 7.659 (6.97), 7.678 (3.56), 7.695 (1.24), 8.249 (2.35), 8.255 (2.38), 8.269

233	LC-MS（方法 L2）：R_t= 4.22 分，m/z = 602（Cl2 パターン）（M+H）+	(2.16), 8.274 (2.15), 8.597 (9.66), 9.143 (2.61), 9.163 (2.55). ^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.70 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.40 - 7.30 (m, 3H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.28 - 5.20 (m, 1H), 4.32
234	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.10min；MS（ESIpos）：m/z = 502 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.59), -0.008 (5.31), 0.008 (4.81), 0.146 (0.56), 2.049 (1.06), 2.057 (1.15), 2.069 (1.17), 2.084 (1.68), 2.091 (1.48), 2.198 (1.12), 2.211 (1.57), 2.223 (1.45), 2.233 (1.45), 2.246 (0.95), 2.327 (1.17), 2.366 (1.12), 2.523 (3.97), 2.669 (1.34), 2.710 (1.17), 3.249 (1.26), 3.268 (4.20), 3.280 (9.93), 3.291 (10.83), 3.651 (1.90), 3.865 (7.83), 3.876 (13.26), 3.887 (7.52), 4.225 (0.87), 4.245 (2.52), 4.253 (1.99), 4.267 (3.33), 4.293 (2.21), 4.312 (0.81), 5.245 (1.03), 5.259 (2.35), 5.279 (2.38), 5.293 (1.06), 6.789 (4.36), 6.809 (4.90), 6.917 (2.18), 6.933 (4.64), 6.951 (2.80), 7.154 (2.49), 7.157 (2.57), 7.175 (4.00), 7.193 (1.99), 7.247 (1.76), 7.253 (1.29), 7.265 (1.59), 7.271 (3.41), 7.277 (2.49), 7.294 (1.87), 7.300 (1.45), 7.319 (4.84), 7.324 (5.48), 7.340 (6.01), 7.356 (1.23), 7.377 (4.17), 7.396 (3.86), 7.681 (3.13), 7.700 (4.62), 7.720 (4.20), 7.827 (4.95), 7.831 (5.20), 7.845 (4.06), 7.848 (3.92), 8.273 (4.31), 8.276 (4.39), 8.295 (4.11), 8.693 (16.00), 9.165 (4.20), 9.185 (4.11).
235	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.29min；MS（ESIpos）：m/z = 568 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.091 (2.67), 2.220 (2.73), 2.327 (2.60), 2.367 (5.33), 2.668 (4.62), 2.710 (5.79), 3.882 (16.00), 4.244 (3.32), 4.266 (4.62), 5.255 (3.12), 6.789 (4.36), 6.809 (4.81), 6.915 (2.34), 6.934 (4.75), 6.952 (2.73), 7.155 (2.80), 7.174 (4.29), 7.195 (2.15), 7.381 (4.62), 7.399 (4.16), 7.706 (2.47), 7.724 (4.62), 7.743 (2.99), 7.886 (7.28), 7.903 (12.75), 7.985 (7.15), 8.302 (4.75), 8.323 (4.36), 8.693 (9.95), 9.174 (4.29), 9.194 (4.10).
236	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.38 分；MS（ESIpos）：m/z = 462 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.92), 0.008 (2.76), 1.236 (1.50), 1.259 (1.23), 1.299 (0.85), 1.983 (0.59), 1.996 (1.10), 2.008 (1.36), 2.016 (1.23), 2.030 (2.09), 2.044 (1.95), 2.057 (0.80), 2.118 (0.75), 2.132 (2.09), 2.146 (2.34), 2.161 (1.32), 2.181 (1.28), 2.195 (0.53), 2.300 (1.82), 2.327 (0.64), 2.366 (0.61), 2.523 (2.31), 2.669 (0.73), 2.709 (0.69), 3.057 (12.33), 3.070 (12.39), 3.341 (0.78), 3.370

			(0.41), 3.382 (0.48), 3.874 (0.57), 4.237 (4.47), 4.249 (7.39), 4.264 (4.32), 4.482 (1.02), 4.497 (1.07), 4.858 (10.93), 5.146 (0.64), 5.206 (1.12), 5.221 (2.49), 5.240 (2.47), 5.255 (1.12), 5.359 (0.43), 6.772 (4.55), 6.793 (4.96), 6.878 (2.39), 6.880 (2.39), 6.896 (4.95), 6.899 (4.90), 6.915 (2.97), 6.917 (2.87), 7.132 (2.42), 7.135 (2.57), 7.153 (4.02), 7.170 (2.01), 7.174 (1.96), 7.232 (0.48), 7.250 (0.41), 7.274 (1.85), 7.293 (8.65), 7.312 (7.85), 7.327 (1.21), 7.333 (1.21), 7.345 (3.29), 7.355 (13.29), 7.365 (4.96), 7.376 (1.77), 7.527 (1.53), 7.545 (2.97), 7.566 (2.27), 7.591 (1.64), 7.608 (2.84), 7.629 (4.71), 7.647 (2.65), 7.765 (1.79), 8.133 (0.54), 8.367 (16.00), 8.391 (3.06), 8.958 (2.52), 8.979 (2.52), 10.023 (0.51), 11.746 (5.38).
237	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.57 分; MS (ESIpos): m/z = 512 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.150 (0.77), 0.146 (0.83), 0.853 (0.66), 1.235 (5.81), 1.259 (3.13), 1.298 (2.19), 1.985 (1.63), 1.998 (1.98), 2.019 (2.99), 2.035 (2.68), 2.126 (2.85), 2.140 (3.27), 2.159 (2.19), 2.175 (1.95), 2.327 (1.98), 2.366 (1.29), 2.669 (2.37), 2.710 (1.57), 3.051 (15.79), 3.061 (16.00), 3.370 (1.57), 3.382 (1.70), 3.395 (1.15), 3.413 (0.73), 3.508 (0.97), 3.520 (1.18), 3.534 (0.94), 3.561 (1.11), 3.574 (1.22), 4.233 (6.02), 4.245 (10.37), 4.259 (6.33), 4.482 (2.37), 4.496 (2.33), 4.858 (9.39), 5.131 (0.66), 5.146 (1.29), 5.160 (0.63), 5.198 (1.74), 5.213 (3.69), 5.233 (3.76), 5.247 (1.77), 5.359 (1.22), 6.768 (7.10), 6.788 (7.93), 6.874 (3.27), 6.893 (7.03), 6.911 (4.24), 7.132 (3.58), 7.150 (5.95), 7.171 (2.85), 7.219 (0.56), 7.286 (6.26), 7.307 (11.55), 7.320 (3.51), 7.355 (11.93), 7.365 (3.90), 7.393 (4.45), 7.398 (4.56), 7.418 (4.73), 7.424 (4.42), 7.460 (0.94), 7.518 (4.42), 7.536 (7.55), 7.556 (7.23), 7.585 (8.59), 7.601 (5.11), 7.614 (3.20), 7.634 (2.19), 7.706 (1.01), 7.724 (1.50), 7.774 (2.57), 7.871 (11.10), 7.877 (10.96), 7.910 (2.57), 7.927 (2.23), 7.954 (0.59), 8.022 (0.70), 8.139 (1.18), 8.340 (15.06), 8.374 (5.91), 8.394 (5.57), 8.427 (0.73), 8.946 (4.28), 8.967 (4.28), 10.022 (3.72), 11.746 (4.21).
238	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.05 分; MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (0.56), 0.008 (0.52), 2.523 (0.53), 3.277 (0.80), 3.290 (1.68), 3.310 (16.00), 3.333 (0.41), 3.867 (1.46), 3.877 (2.48), 3.889 (1.37), 4.232 (0.50), 4.253 (0.68), 4.264 (0.64), 4.271 (0.44), 4.280 (0.43), 5.241 (0.43), 5.260 (0.43), 6.777 (0.84), 6.798 (0.93), 6.912 (0.84), 6.930 (0.49), 7.141 (0.44), 7.145 (0.46), 7.162 (0.73), 7.354 (0.77), 7.371 (0.72), 7.447 (0.89), 7.456

			(1.29), 7.468 (0.84), 7.475 (0.99), 7.668 (0.48), 7.680 (1.31), 7.685 (1.24), 7.690 (1.31), 7.709 (1.11), 7.727 (0.46), 8.286 (0.80), 8.291 (0.82), 8.306 (0.74), 8.311 (0.72), 8.589 (2.41), 9.154 (0.41).
239		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.18 分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.278 (3.88), 3.284 (1.78), 3.297 (2.06), 3.310 (16.00), 3.875 (2.72), 4.236 (0.51), 4.258 (0.65), 4.285 (0.46), 5.248 (0.49), 5.267 (0.50), 6.782 (0.98), 6.801 (1.08), 6.902 (0.49), 6.921 (0.99), 6.939 (0.59), 7.150 (0.51), 7.168 (0.80), 7.186 (0.41), 7.264 (0.62), 7.271 (0.72), 7.279 (0.66), 7.286 (0.65), 7.367 (0.86), 7.385 (0.82), 7.442 (0.63), 7.452 (0.65), 7.673 (0.52), 7.691 (1.06), 7.711 (1.07), 7.732 (1.23), 7.746 (0.57), 8.279 (0.87), 8.299 (0.80), 8.624 (3.45), 9.154 (0.86), 9.175 (0.85).
240		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.19 分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.50), 0.008 (0.44), 2.345 (4.63), 3.275 (0.72), 3.287 (1.65), 3.299 (1.87), 3.310 (16.00), 3.865 (1.37), 3.876 (2.36), 3.888 (1.31), 4.237 (0.45), 4.259 (0.60), 4.269 (0.56), 5.249 (0.43), 5.268 (0.43), 6.782 (0.83), 6.803 (0.90), 6.924 (0.83), 6.941 (0.49), 7.147 (0.41), 7.150 (0.43), 7.167 (0.71), 7.184 (0.80), 7.192 (0.61), 7.198 (0.56), 7.367 (0.70), 7.385 (0.66), 7.447 (0.53), 7.451 (0.52), 7.463 (0.55), 7.682 (0.43), 7.700 (0.93), 7.720 (1.01), 7.731 (1.02), 7.735 (1.15), 7.748 (0.49), 8.284 (0.71), 8.288 (0.72), 8.305 (0.69), 8.309 (0.65), 8.626 (3.04), 9.154 (0.75), 9.175 (0.74).
241		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.38 分; MS (ESIpos): m/z = 602 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.219 (16.00), 1.414 (0.57), 1.908 (0.65), 1.924 (0.64), 1.941 (0.52), 1.959 (0.45), 2.501 (12.69), 2.889 (0.42), 3.164 (0.96), 3.174 (0.90), 5.530 (0.45), 5.549 (0.44), 7.233 (0.64), 7.241 (0.67), 7.250 (1.06), 7.271 (0.78), 7.448 (0.44), 7.456 (0.48), 7.469 (0.40), 7.639 (5.38), 7.652 (0.69), 7.672 (0.56), 7.809 (0.75), 7.826 (0.60), 8.314 (0.64), 8.335 (0.58), 8.687 (2.17), 9.077 (0.63), 9.097 (0.60).
242		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.39 分; MS (ESIpos): m/z = 618 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.198 (16.00), 1.918 (0.63), 1.932 (0.85), 1.945 (0.51), 4.260 (0.44), 6.788 (0.61), 6.808 (0.69), 6.939 (0.64), 7.186 (0.52), 7.394 (0.55), 7.412 (0.51), 7.638 (5.73), 7.655 (0.62), 7.676 (0.53), 7.815 (0.70), 7.832 (0.56), 8.315 (0.60), 8.334 (0.55), 8.684 (2.06), 9.236 (0.58), 9.257 (0.57).
243		LC-MS (方法 L6):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.59), 0.008 (0.57), 1.194 (16.00), 1.209

	R_t= 2.63分; MS (ESIpos): m/z = 618 [M+H]+	(0.55), 2.041 (0.61), 2.056 (0.60), 2.067 (0.49), 2.086 (0.43), 4.279 (0.48), 4.293 (0.85), 4.305 (0.52), 6.785 (0.57), 6.804 (0.64), 6.881 (0.61), 7.163 (0.49), 7.292 (0.52), 7.310 (0.49), 7.643 (3.60), 7.659 (0.61), 7.680 (0.50), 7.819 (0.64), 7.834 (0.53), 8.352 (0.56), 8.371 (0.52), 8.689 (2.03), 9.172 (0.56), 9.192 (0.54).
244	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.27分; MS (ESIpos): m/z = 498 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.63), 0.008 (2.13), 1.862 (1.03), 1.885 (0.89), 1.898 (0.91), 2.002 (0.76), 2.023 (1.37), 2.034 (1.59), 2.054 (1.51), 2.156 (0.85), 2.170 (1.04), 2.185 (0.86), 2.201 (0.61), 2.311 (0.43), 2.327 (0.46), 2.376 (16.00), 2.392 (2.37), 2.669 (0.43), 3.033 (0.41), 3.192 (0.48), 3.205 (0.71), 3.213 (0.64), 3.228 (0.83), 3.305 (2.36), 3.461 (0.98), 3.489 (1.75), 3.516 (0.92), 3.691 (0.53), 3.707 (1.16), 3.728 (0.79), 3.788 (0.70), 3.805 (0.71), 3.821 (0.86), 3.831 (1.06), 3.844 (1.78), 3.857 (1.54), 3.871 (1.20), 3.883 (0.74), 4.163 (3.03), 4.258 (2.73), 4.266 (3.03), 4.279 (1.47), 4.374 (1.56), 5.215 (0.85), 5.227 (1.09), 5.247 (0.91), 5.260 (0.41), 6.780 (2.43), 6.799 (2.76), 6.891 (1.22), 6.910 (2.68), 6.928 (1.78), 7.014 (1.49), 7.038 (1.51), 7.144 (1.33), 7.162 (2.39), 7.179 (2.31), 7.205 (5.13), 7.253 (0.67), 7.305 (2.22), 7.324 (2.00), 7.450 (1.52), 7.469 (2.29), 7.489 (1.84), 7.638 (2.80), 7.653 (2.35), 8.144 (10.55), 8.227 (2.36), 8.248 (2.20), 8.418 (4.54), 8.423 (4.98), 8.786 (1.00), 9.041 (1.92), 9.061 (1.88).
245	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.24分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.77), −0.008 (6.72), 0.008 (6.90), 0.146 (0.79), 1.055 (0.79), 1.862 (1.68), 1.885 (1.70), 1.895 (1.97), 2.006 (1.70), 2.027 (2.95), 2.040 (3.20), 2.060 (1.95), 2.072 (1.32), 2.085 (1.63), 2.145 (1.45), 2.159 (1.57), 2.175 (1.52), 2.327 (1.52), 2.365 (1.04), 2.669 (1.41), 2.709 (0.77), 2.976 (0.89), 3.005 (1.41), 3.073 (1.32), 3.083 (1.34), 3.113 (0.93), 3.164 (2.00), 3.177 (2.34), 3.187 (2.36), 3.200 (2.22), 3.304 (2.68), 3.466 (1.97), 3.496 (2.86), 3.524 (1.75), 3.695 (1.16), 3.719 (1.95), 3.737 (1.34), 3.788 (0.68), 3.810 (1.16), 3.828 (1.48), 3.848 (2.50), 3.864 (2.18), 3.874 (3.20), 3.889 (1.95), 3.900 (1.23), 3.937 (0.43), 4.163 (11.73), 4.255 (5.47), 4.374 (2.88), 5.226 (1.84), 5.266 (0.59), 6.772 (4.31), 6.791 (5.17), 6.809 (1.38), 6.879 (2.04), 6.899 (4.70), 6.916 (3.56), 6.935 (0.70), 7.016 (1.41), 7.032 (2.79), 7.048 (1.86), 7.084 (0.86), 7.105 (0.68), 7.137 (2.31), 7.156 (4.45), 7.177 (3.63), 7.204 (2.20), 7.225 (1.41), 7.242 (0.68), 7.287

			(3.50), 7.306 (3.22), 7.342 (0.93), 7.359 (0.98), 7.448 (2.31), 7.466 (3.93), 7.487 (3.79), 7.526 (5.13), 7.541 (3.06), 7.688 (1.57), 7.696 (1.68), 7.705 (3.70), 8.204 (16.00), 8.276 (4.47), 8.297 (3.47), 8.360 (10.80), 8.716 (4.06), 9.014 (1.95), 9.027 (2.34), 9.035 (2.07), 9.047 (1.97), 9.155 (0.86), 9.176 (0.79).
246		LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.21 分；MS (ESIpos)：m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (1.15), 0.008 (1.23), 1.862 (0.77), 1.876 (0.55), 1.888 (0.61), 1.900 (0.68), 1.908 (0.60), 1.997 (0.55), 2.020 (0.91), 2.030 (1.23), 2.039 (0.98), 2.049 (0.99), 2.061 (0.58), 2.150 (0.56), 2.165 (0.68), 2.180 (0.59), 2.195 (0.42), 2.523 (0.68), 3.169 (1.12), 3.207 (0.44), 3.230 (0.51), 3.305 (0.99), 3.471 (0.58), 3.498 (1.19), 3.525 (0.73), 3.655 (0.44), 3.699 (0.41), 3.723 (0.82), 3.736 (0.56), 3.743 (0.59), 3.803 (0.57), 3.820 (0.55), 3.828 (0.57), 3.835 (0.56), 3.846 (1.52), 3.858 (1.38), 3.873 (0.89), 3.885 (1.01), 3.896 (0.64), 3.911 (16.00), 3.924 (2.42), 4.160 (2.23), 4.247 (1.69), 4.253 (2.01), 4.259 (1.98), 4.374 (1.08), 5.210 (0.63), 5.219 (0.73), 5.231 (0.77), 5.240 (0.56), 6.776 (1.78), 6.794 (1.90), 6.796 (1.93), 6.886 (0.87), 6.904 (1.89), 6.923 (1.25), 7.140 (1.08), 7.148 (1.24), 7.158 (1.75), 7.166 (1.29), 7.175 (1.95), 7.194 (1.17), 7.263 (1.08), 7.280 (1.12), 7.294 (2.16), 7.311 (1.67), 7.451 (1.14), 7.469 (1.65), 7.490 (1.47), 7.599 (1.95), 7.615 (1.51), 8.140 (6.92), 8.264 (1.70), 8.276 (0.41), 8.286 (1.58), 8.370 (4.09), 8.372 (3.69), 8.738 (0.72), 9.025 (1.07), 9.032 (0.96), 9.046 (1.07), 9.053
247		LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.82 分；MS (ESIpos)：m/z = 478 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (1.77), 0.008 (1.62), 1.754 (1.10), 3.086 (16.00), 4.249 (0.89), 4.257 (0.88), 5.230 (0.54), 6.777 (1.07), 6.797 (1.20), 6.890 (0.49), 6.908 (1.04), 6.926 (0.63), 7.143 (0.51), 7.160 (0.85), 7.178 (0.42), 7.339 (0.86), 7.357 (0.83), 7.586 (0.46), 7.600 (0.44), 7.669 (0.76), 7.686 (1.09), 7.708 (1.03), 7.788 (1.10), 7.803 (0.82), 8.233 (0.62), 8.303 (1.02), 8.321 (1.02), 8.550 (2.65), 9.066 (0.59), 9.088 (0.56).
248	3, 41		^{1}H-NMR(399,9532 MHz, DMSO)：δ= 8.8586 (3.81)；8.8384 (3.7)；8.7959 (0.89)；8.6133 (16)；8.3145 (0.54)；8.2003 (5.17)；8.1796 (6.09)；8.1605 (0.57)；8.1408 (0.42)；8.1194 (0.37)；7.7297 (2.81)；7.7117 (6.49)；7.6916 (5.56)；7.674 (8.15)；7.6572 (3.78)；7.5658 (3.63)；7.5485 (5.05)；7.5233 (0.53)；7.4659 (2.08)；7.4474 (5.9)；7.4352 (6.58)；7.4201 (10.6)；7.401 (7.64)；7.3696 (4.28)；7.1855 (0.44)；7.1677

			(2.86) ; 7.1479 (5.7) ; 7.1292 (3.51) ; 6.9273 (3.58) ; 6.9086 (6.16) ; 6.8902 (3.03) ; 6.7978 (0.51) ; 6.7802 (7.27) ; 6.76 (6.4) ; 5.3045 (0.38) ; 5.2303 (1.66) ; 5.215 (3.56) ; 5.1967 (3.61) ; 5.1821 (1.57) ; 4.2872 (1.16) ; 4.2678 (3.46) ; 4.2545 (6.45) ; 4.2294 (3.77) ; 4.209 (1.09) ; 4.0558 (0.79) ; 4.0381 (2.17) ; 4.0204 (2.21) ; 4.0027 (0.72) ; 3.7036 (0.64) ; 3.4987 (41.77) ; 3.4769 (2.9) ; 3.3203 (34.08) ; 3.2937 (39.4) ; 3.2522 (2.31) ; 2.6698 (1.63) ; 2.5008 (284.9) ; 2.3275 (1.72) ; 2.162 (2.06) ; 2.1511 (2.35) ; 2.1408 (2.37) ; 2.0491 (2.34) ; 2.0417 (2.67) ; 2.0242 (2.02) ; 2.0072 (1.6) ; 1.9885 (9.27) ; 1.2351 (0.38) ; 1.1928 (2.3) ; 1.175 (4.51) ; 1.1572 (2.22) ; -0.0001 (28.96) ; -0.0051 (8.21)
249	3, 99		^{1}H-NMR (399, 9532 MHz, DMSO) : δ= 8.8722 (2.6) ; 8.8534 (4.17) ; 8.8356 (2.45) ; 8.6283 (16) ; 8.3151 (0.4) ; 8.2158 (4.05) ; 8.1962 (4.44) ; 7.7428 (2.44) ; 7.7248 (7.39) ; 7.7193 (7) ; 7.7157 (6.57) ; 7.7049 (13.43) ; 7.6994 (14.58) ; 7.6871 (2.66) ; 7.4723 (2.01) ; 7.4623 (2.04) ; 7.453 (4.25) ; 7.4429 (3.96) ; 7.4331 (2.87) ; 7.4227 (5.23) ; 7.3996 (4.11) ; 7.3619 (3.39) ; 7.3461 (5.37) ; 7.3279 (2.31) ; 7.1671 (2.41) ; 7.1484 (5.12) ; 7.1288 (3.22) ; 6.9268 (2.74) ; 6.9082 (4.77) ; 6.8896 (2.27) ; 6.7797 (6.81) ; 6.7595 (6.15) ; 5.2265 (1.31) ; 5.2117 (3.11) ; 5.1938 (3.02) ; 5.1779 (1.3) ; 4.2866 (1.01) ; 4.2674 (3.19) ; 4.2527 (5.74) ; 4.245 (5.26) ; 4.2269 (3.27) ; 4.2067 (0.94) ; 4.0557 (0.4) ; 4.0377 (1.21) ; 4.0198 (1.19) ; 4.0022 (0.41) ; 3.4991 (33.03) ; 3.3194 (26.59) ; 3.2941 (42.87) ; 2.6699 (1.31) ; 2.6325 (1.42) ; 2.5047 (173.21) ; 2.5007 (220.51) ; 2.4968 (169.05) ; 2.3277 (1.28) ; 2.1552 (1.78) ; 2.1467 (1.98) ; 2.1354 (1.9) ; 2.0536 (1.58) ; 2.0461 (2.06) ; 2.0382 (2.41) ; 2.0293 (1.73) ; 2.0221 (1.72) ; 2.0124 (1.48) ; 2.0033 (1.41) ; 1.9882 (5.54) ; 1.3973 (0.39) ; 1.1925 (1.29) ; 1.1746 (2.48) ; 1.1569 (1.25) ; -0.0002 (29.01)
250	4, 87		^{1}H-NMR (399, 9532 MHz, DMSO) : δ= 8.8638 (2.16) ; 8.8431 (2.2) ; 8.7403 (8.57) ; 8.3148 (0.35) ; 8.2096 (2.24) ; 8.2067 (2.37) ; 8.1883 (2.63) ; 8.1855 (2.59) ; 7.8776 (2.13) ; 7.8749 (2.29) ; 7.8598 (2.88) ; 7.8571 (2.85) ; 7.7436 (2.21) ; 7.7227 (2.59) ; 7.7045 (1.68) ; 7.6508 (16) ; 7.4465 (2.08) ; 7.4284 (2.26) ; 7.181 (0.97) ; 7.1773 (1.02) ; 7.16 (2.16) ; 7.1425 (1.33) ; 7.1389 (1.31) ; 6.9459 (1.54) ; 6.9275 (2.62) ; 6.9086 (1.24) ; 6.7901 (2.91) ; 6.7708 (2.62) ; 5.246 (0.57) ; 5.2307 (1.34) ; 5.2111 (1.31) ; 5.1962

			(0.59); 4.2989 (0.4); 4.2923 (0.34); 4.2803 (1.25); 4.2648 (2.35); 4.2564 (2.18); 4.2462 (1.28); 4.238 (1.35); 4.2183 (0.41); 3.4928 (21.15); 3.3195 (28.27); 3.2832 (18.37); 2.6707 (0.76); 2.5055 (99.44); 2.5013 (134.25); 2.4971 (103.62); 2.3283 (0.8); 2.1902 (0.48); 2.1778 (0.73); 2.169 (0.84); 2.1575 (0.88); 2.1451 (0.68); 2.0765 (0.62); 2.0678 (0.83); 2.0606 (0.98); 2.0512 (0.71); 2.0439 (0.7); 2.034 (0.6); 2.0254 (0.58); 1.3977 (0.96); -0.0002 (18.38)
251		LC-MS (方法 L4): R_t= 2.76 分; MS (ESIpos): m/z = 523 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.832 (0.78), 0.872 (0.63), 1.225 (1.56), 1.239 (2.99), 1.254 (2.68), 1.285 (0.49), 2.012 (5.28), 2.125 (0.61), 2.136 (1.21), 2.143 (1.50), 2.153 (1.46), 2.162 (2.19), 2.172 (2.02), 2.181 (0.79), 2.253 (0.83), 2.265 (1.86), 2.277 (2.20), 2.290 (1.59), 2.306 (1.15), 2.317 (0.53), 3.149 (1.15), 3.179 (10.27), 3.371 (1.35), 3.379 (2.47), 3.394 (3.63), 3.403 (5.57), 3.412 (3.40), 3.423 (3.54), 3.431 (5.99), 3.440 (3.84), 3.456 (2.58), 3.465 (1.35), 3.947 (9.47), 3.955 (15.45), 3.964 (8.40), 4.057 (0.45), 4.071 (1.28), 4.086 (1.30), 4.100 (0.49), 4.278 (4.64), 4.288 (6.97), 4.294 (4.07), 4.299 (4.02), 5.328 (1.19), 5.339 (2.69), 5.354 (2.69), 5.365 (1.19), 5.443 (0.90), 5.448 (1.32), 6.779 (4.78), 6.796 (5.27), 6.863 (2.26), 6.878 (4.67), 6.893 (2.69), 7.124 (2.45), 7.139 (3.94), 7.154 (2.07), 7.309 (4.10), 7.324 (3.86), 7.506 (4.42), 7.520 (5.68), 7.613 (3.66), 7.628 (5.26), 7.644 (3.03), 7.658 (2.51), 7.672 (4.37), 7.689 (3.02), 7.811 (6.72), 7.814 (7.13), 7.818 (4.61), 7.821 (6.00), 7.825 (7.74), 7.828 (6.36), 7.831 (5.94), 8.107 (5.62), 8.123 (5.32), 8.315 (4.53), 8.332 (4.30), 8.604 (16.00), 9.065 (6.90), 9.103 (2.34), 9.118 (2.15).
252	2, 23		^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.0791 (1.76); 9.0587 (1.8); 8.5559 (7.36); 8.1993 (1.5); 8.1925 (1.41); 8.1814 (1.62); 8.1744 (1.67); 7.6235 (0.75); 7.6058 (2.84); 7.5938 (3.05); 7.5875 (6.22); 7.5767 (0.85); 7.5518 (1.11); 7.5301 (1.53); 7.4508 (0.54); 7.4455 (0.73); 7.4326 (1.69); 7.4272 (2.02); 7.4216 (1.16); 7.4156 (2.28); 7.4084 (1.97); 7.4032 (1.72); 7.3998 (1.7); 7.385 (0.7); 7.3589 (1.41); 7.3368 (1.88); 7.3173 (1.39); 7.1739 (0.83); 7.1704 (0.86); 7.1527 (1.79); 7.1353 (1.12); 7.1318 (1.06); 6.9096 (1.27); 6.8915 (2.21); 6.8728 (1.02); 6.7927 (2.53); 6.7726 (2.28); 5.7542 (1.11); 5.2613 (0.49); 5.2466 (1.08); 5.2274 (1.08); 5.213 (0.48); 4.2679

			(1.84) ; 4.2559 (3.15) ; 4.2415 (1.82) ; 3.3206 (48.83) ; 3.1342 (16) ; 3.0049 (0.62) ; 2.9974 (0.88) ; 2.9893 (1.13) ; 2.981 (0.87) ; 2.9732 (0.63) ; 2.9642 (0.34) ; 2.675 (0.38) ; 2.6705 (0.51) ; 2.6658 (0.38) ; 2.5232 (1.39) ; 2.5055 (63.06) ; 2.5011 (86.29) ; 2.4969 (64.79) ; 2.3323 (0.36) ; 2.3281 (0.5) ; 2.1894 (0.6) ; 2.1757 (0.69) ; 2.1696 (0.51) ; 2.156 (0.74) ; 2.1399 (0.74) ; 2.0304 (0.61) ; 2.0184 (0.69) ; 1.9969 (0.54) ; 1.9883 (0.86) ; 1.3979 (1.47) ; 0.6101 (1.75) ; 0.4165 (0.89) ; 0.0078 (0.39) ; -0.0001 (10.71) ; -0.0076 (0.41)
253	2, 8		^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO) : δ= 9.0796 (1.17) ; 9.0621 (1.2) ; 8.5624 (8.02) ; 8.2214 (0.93) ; 8.2105 (1.57) ; 8.1983 (1.03) ; 7.6978 (2.04) ; 7.694 (2.19) ; 7.6778 (2.53) ; 7.674 (2.5) ; 7.6177 (5.4) ; 7.6041 (4.04) ; 7.4523 (0.69) ; 7.4433 (0.72) ; 7.4327 (1.48) ; 7.4239 (1.42) ; 7.4131 (0.92) ; 7.4041 (0.85) ; 7.3455 (1.88) ; 7.329 (3.1) ; 7.3099 (1.5) ; 7.174 (0.81) ; 7.1702 (0.85) ; 7.1526 (1.69) ; 7.1353 (1.08) ; 7.1317 (1.05) ; 6.9092 (1.19) ; 6.8909 (2.03) ; 6.8721 (0.94) ; 6.793 (2.33) ; 6.791 (2.35) ; 6.7726 (2.13) ; 6.7706 (2.07) ; 5.2566 (0.41) ; 5.242 (0.94) ; 5.2229 (0.94) ; 5.2089 (0.4) ; 4.2665 (1.65) ; 4.2545 (2.8) ; 4.2402 (1.64) ; 3.3211 (41.34) ; 3.1368 (16) ; 3.0138 (0.45) ; 3.0047 (0.7) ; 2.9975 (0.96) ; 2.9893 (0.98) ; 2.9811 (0.72) ; 2.9735 (0.43) ; 2.6703 (0.39) ; 2.5235 (1.05) ; 2.51 (22.39) ; 2.5056 (47.11) ; 2.501 (65.73) ; 2.4966 (49.19) ; 2.4922 (23.62) ; 2.3279 (0.38) ; 2.1883 (0.57) ; 2.1742 (0.65) ; 2.1681 (0.49) ; 2.1546 (0.71) ; 2.1385 (0.72) ; 2.0349 (0.45) ; 2.0228 (0.65) ; 2.0115 (0.58) ; 2.0017 (0.49) ; 1.9882 (1.44) ; 1.9759 (0.32) ; 1.3975 (1.3) ; 1.175 (0.52) ; 0.6137 (1.77) ; 0.5976 (1.39) ; 0.4649 (0.32) ; 0.4414 (0.56) ; 0.4091 (1.27) ; 0.3695 (0.52) ; 0.0081 (0.44) ; -0.0002 (13.08) ; -0.0084 (0.42)
254	3, 81		^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO) : δ= 9.0974 (1.83) ; 9.0773 (1.86) ; 8.6752 (7.71) ; 8.3134 (0.64) ; 8.2118 (1.85) ; 8.2091 (1.97) ; 8.1907 (2.14) ; 8.1877 (2.13) ; 7.7947 (1.87) ; 7.7919 (1.98) ; 7.777 (2.41) ; 7.7741 (2.31) ; 7.6416 (5.47) ; 7.6376 (12.68) ; 7.632 (5.99) ; 7.6281 (3.45) ; 7.6155 (1.99) ; 7.6126 (2.16) ; 7.5945 (1.52) ; 7.3629 (1.74) ; 7.3442 (1.88) ; 7.1889 (0.84) ; 7.1854 (0.87) ; 7.1674 (1.81) ; 7.1502 (1.1) ; 7.147 (1.07) ; 6.9334 (1.31) ; 6.9152 (2.18) ; 6.8988 (1.01) ; 6.8964 (1.02) ; 6.8069 (2.45) ; 6.7867 (2.52) ; 5.2728 (0.51) ; 5.2582 (1.13) ; 5.2387 (1.12) ; 5.2248 (0.5) ; 4.281

			(1.89) ; 4.2694 (3.1) ; 4.2546 (1.8) ; 3.3184 (46.33) ; 3.1217 (16) ; 3.0207 (0.68) ; 3.0129 (0.98) ; 3.0047 (1.28) ; 2.9963 (0.95) ; 2.9888 (0.68) ; 2.9802 (0.33) ; 2.6749 (0.85) ; 2.6706 (1.14) ; 2.6661 (0.85) ; 2.5101 (68.82) ; 2.5059 (137.4) ; 2.5014 (187.25) ; 2.4971 (140.59) ; 2.3327 (0.8) ; 2.3283 (1.08) ; 2.3241 (0.79) ; 2.2024 (0.56) ; 2.1881 (0.67) ; 2.1696 (0.74) ; 2.1535 (0.7) ; 2.0686 (0.34) ; 2.0557 (0.71) ; 2.0447 (0.85) ; 2.0308 (0.51) ; 2.0226 (0.61) ; 2.0084 (0.53) ; 1.398 (3.21) ; 0.6121 (2.33) ; 0.5962 (2.26) ; 0.4148 (1.1) ; 0.4089 (1.1) ; 0.3834 (1.16) ; 0.0079 (1.22) ; −0.0002 (28.51) ; −0.0084 (1.03)
255	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.21 分；MS (ESIpos)：m/z = 576 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.149 (0.40), −0.008 (3.66), 0.008 (2.37), 1.938 (0.67), 2.015 (1.79), 2.073 (1.20), 2.179 (0.64), 2.328 (0.62), 2.366 (0.70), 2.385 (0.71), 2.669 (0.51), 3.356 (0.75), 3.498 (16.00), 3.893 (0.87), 3.915 (0.80), 4.216 (0.97), 4.238 (0.76), 4.267 (0.81), 4.625 (0.99), 4.640 (1.04), 4.659 (0.92), 5.267 (0.86), 6.791 (1.73), 6.810 (1.94), 6.925 (0.82), 6.941 (1.72), 6.959 (1.12), 7.168 (0.89), 7.185 (1.41), 7.202 (0.70), 7.394 (1.48), 7.411 (1.37), 7.645 (11.29), 7.673 (1.76), 7.694 (1.53), 7.820 (1.92), 7.838 (1.61), 8.342 (1.64), 8.361 (1.56), 8.671 (6.40), 9.188 (1.55), 9.208 (1.60).
256	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.91 分，m/z = 560 (M+H)+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.12 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.43 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.37 - 7.29 (m, 3H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.94 - 6.87 (m, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.0 Hz, 1H), 5.26 - 5.19 (m
257	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.71 分；MS (ESIpos)：m/z = 502 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.149 (0.43), 0.146 (0.47), 1.754 (0.43), 1.862 (3.00), 1.901 (2.89), 1.909 (2.71), 2.031 (4.75), 2.040 (4.61), 2.049 (5.14), 2.157 (2.74), 2.171 (3.27), 2.186 (2.55), 2.203 (1.78), 2.327 (0.93), 2.366 (0.74), 2.670 (0.93), 2.709 (0.69), 3.038 (0.45), 3.165 (1.51), 3.210 (0.53), 3.232 (0.51), 3.476 (2.42), 3.502 (4.70), 3.528 (2.55), 3.654 (0.43), 3.708 (1.60), 3.732 (3.42), 3.752 (2.34), 3.780 (1.22), 3.802 (2.18), 3.820 (2.17), 3.829 (2.57), 3.851 (3.64), 3.861 (4.91), 3.875 (4.51), 3.888 (3.51), 3.900 (2.05), 4.169 (4.22), 4.258 (8.38), 4.267 (9.23), 4.280 (4.38), 4.372 (4.77), 5.035 (5.52), 5.201 (1.06), 5.214 (2.86), 5.227 (3.55), 5.235 (3.58), 5.247 (2.92), 5.261 (1.17), 6.782 (7.98), 6.801 (8.91), 6.893

			(3.82), 6.912 (8.02), 6.930 (4.96), 7.145 (4.32), 7.163 (6.95), 7.182 (3.56), 7.211 (2.94), 7.216 (2.31), 7.234 (5.55), 7.240 (4.20), 7.258 (3.02), 7.263 (2.33), 7.307 (16.00), 7.324 (15.84), 7.361 (1.03), 7.377 (1.64), 7.399 (0.96), 7.467 (4.96), 7.486 (7.17), 7.507 (5.81), 7.704 (8.95), 7.722 (7.93), 7.742 (0.47), 7.887 (0.48), 7.901 (0.42), 8.134 (12.65), 8.269 (7.33), 8.291 (7.25), 8.313 (0.63), 8.394 (1.77), 8.432 (13.03), 8.436 (13.82), 8.810 (1.36), 9.046 (5.84), 9.067 (5.58), 12.645 (0.58).
258		LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.25 分；MS (ESIneg)：m/z = 516 [M-H]-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.149 (0.99), 0.146 (1.21), 1.055 (1.10), 1.243 (0.89), 1.862 (1.56), 1.907 (1.99), 2.038 (4.22), 2.085 (2.63), 2.159 (2.66), 2.327 (2.09), 2.366 (1.38), 2.669 (2.27), 2.710 (1.45), 3.509 (1.42), 3.743 (1.67), 3.873 (4.19), 4.251 (8.12), 4.394 (3.19), 5.059 (2.13), 5.200 (3.33), 5.754 (16.00), 6.776 (5.14), 6.796 (5.68), 6.875 (3.87), 6.893 (7.49), 6.912 (4.43), 7.138 (3.69), 7.157 (5.46), 7.177 (3.37), 7.289 (6.17), 7.307 (5.53), 7.448 (3.87), 8.132 (3.30), 8.325 (3.87), 9.046 (1.53), 12.220 (0.64).
259		LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.24 分；MS (ESIpos)：m/z = 518 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.149 (1.71), -0.008 (15.12), 0.008 (13.06), 0.146 (1.65), 1.038 (1.12), 1.055 (2.24), 1.073 (1.12), 1.236 (0.71), 1.862 (3.06), 1.908 (2.82), 2.039 (5.47), 2.085 (3.00), 2.146 (3.35), 2.160 (3.59), 2.180 (2.88), 2.195 (2.53), 2.327 (2.82), 2.332 (2.06), 2.366 (2.29), 2.523 (8.71), 2.669 (2.59), 2.690 (0.53), 2.709 (2.24), 3.509 (2.00), 3.744 (2.29), 3.874 (5.88), 4.238 (8.06), 4.253 (10.94), 4.388 (4.47), 5.054 (3.29), 5.205 (4.24), 5.218 (4.18), 5.754 (16.00), 6.774 (7.12), 6.795 (7.59), 6.878 (5.12), 6.896 (10.53), 6.915 (6.06), 7.139 (4.65), 7.157 (7.24), 7.177 (3.76), 7.235 (2.47), 7.290 (10.82), 7.309 (9.65), 7.501 (2.94), 7.561 (4.94), 8.132 (6.47), 8.337 (6.94), 9.043 (2.35), 12.703 (0.71).
260		LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.72 分；MS (ESIpos)：m/z = 500 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：1.898 (1.49), 1.907 (1.43), 2.003 (1.23), 2.023 (2.16), 2.034 (2.52), 2.054 (2.37), 2.156 (1.33), 2.170 (1.58), 2.186 (1.26), 2.202 (0.87), 3.169 (4.19), 3.191 (0.45), 3.203 (0.59), 3.213 (0.51), 3.226 (0.59), 3.305 (1.15), 3.472 (1.52), 3.498 (2.71), 3.524 (1.46), 3.696 (0.91), 3.720 (1.91), 3.741 (1.28), 3.776 (0.63), 3.798 (1.12), 3.817 (1.15), 3.826 (1.36), 3.841 (1.73), 3.853 (2.81), 3.867 (2.34), 3.881 (1.91), 3.893 (1.16), 4.168 (2.20), 4.258 (4.22), 4.266 (4.57), 4.376 (2.54), 5.217 (1.39), 5.228 (1.80), 5.248 (1.46), 5.753 (16.00), 6.780

			(4.05), 6.800 (4.44), 6.892 (1.82), 6.910 (3.93), 6.929 (2.45), 7.143 (2.06), 7.162 (3.40), 7.181 (1.72), 7.306 (3.35), 7.325 (3.06), 7.417 (1.77), 7.436 (4.71), 7.450 (3.62), 7.469 (5.99), 7.487 (4.73), 7.503 (3.14), 7.521 (4.74), 7.540 (2.68), 7.635 (6.07), 7.659 (4.38), 7.677 (3.91), 8.153 (14.28), 8.247 (3.60), 8.268 (3.45), 8.421 (6.72), 8.425 (7.54), 8.792 (0.74), 9.041 (2.88), 9.062 (2.77).
261		LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.75 分；MS (ESIpos)：m/z = 530 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (1.36), 0.008 (1.23), 1.897 (0.69), 2.031 (1.04), 2.050 (1.12), 2.156 (0.59), 2.170 (0.71), 2.185 (0.60), 3.169 (0.99), 3.191 (0.41), 3.203 (0.54), 3.212 (0.50), 3.226 (0.59), 3.305 (1.07), 3.464 (0.73), 3.490 (1.25), 3.518 (0.67), 3.712 (0.82), 3.734 (0.57), 3.790 (0.55), 3.814 (16.00), 3.829 (3.10), 3.847 (1.23), 3.861 (1.14), 3.874 (1.02), 3.887 (0.52), 4.163 (2.59), 4.258 (1.91), 4.266 (2.12), 4.374 (1.12), 5.234 (0.76), 5.245 (0.63), 5.754 (0.64), 6.781 (1.81), 6.799 (2.04), 6.893 (0.86), 6.912 (1.84), 6.930 (1.24), 7.025 (1.53), 7.030 (2.93), 7.035 (1.95), 7.075 (2.47), 7.079 (2.80), 7.127 (0.40), 7.145 (0.92), 7.162 (1.62), 7.183 (2.94), 7.186 (3.43), 7.231 (0.46), 7.307 (1.49), 7.326 (1.37), 7.451 (1.09), 7.469 (1.61), 7.490 (1.32), 7.659 (1.99), 7.675 (1.69), 8.151 (5.55), 8.239 (1.63), 8.260 (1.58), 8.422 (3.41), 8.427 (3.75), 8.793 (0.92), 9.041 (1.50), 9.062 (1.45).
262		LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.28 分；MS (ESIpos)：m/z = 518 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.149 (0.82), -0.008 (6.72), 0.008 (6.87), 0.146 (0.82), 0.889 (0.41), 1.236 (0.68), 1.862 (2.00), 1.904 (2.50), 2.036 (4.81), 2.057 (3.23), 2.073 (2.58), 2.148 (2.61), 2.162 (3.02), 2.178 (2.26), 2.196 (1.91), 2.327 (1.88), 2.366 (1.20), 2.523 (5.70), 2.669 (1.82), 2.709 (1.09), 3.524 (2.23), 3.755 (2.17), 3.818 (2.88), 3.885 (3.41), 4.175 (1.41), 4.243 (6.72), 4.256 (8.63), 4.379 (4.34), 5.041 (4.81), 5.211 (3.38), 5.224 (3.41), 5.754 (2.38), 6.775 (7.63), 6.794 (8.22), 6.883 (3.88), 6.899 (8.07), 6.918 (4.81), 7.139 (4.20), 7.156 (6.55), 7.174 (3.29), 7.295 (8.04), 7.312 (8.40), 7.326 (3.90), 7.367 (3.20), 7.383 (4.29), 7.400 (2.00), 7.487 (2.08), 7.506 (3.58), 7.525 (2.50), 7.634 (5.31), 8.133 (16.00), 8.325 (4.08), 8.360 (8.78), 9.040 (2.67), 9.057 (2.67), 12.699 (1.38).
263		LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.33 分；MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (1.65), 0.008 (1.52), 1.234 (0.49), 2.012 (0.66), 2.029 (0.92), 2.045 (0.89), 2.059 (1.10), 2.075 (1.44), 2.091 (1.89), 2.105

	(ESIpos): m/z = 576 [M+H]+	(1.51), 2.122 (0.75), 2.141 (0.59), 2.187 (0.65), 2.204 (0.65), 2.223 (0.59), 2.237 (0.50), 2.470 (0.58), 2.523 (1.48), 3.358 (0.47), 3.375 (0.74), 3.392 (0.84), 3.410 (0.50), 3.489 (16.00), 3.885 (0.41), 3.901 (0.97), 3.922 (0.95), 3.939 (0.41), 4.277 (1.55), 4.291 (2.65), 4.303 (1.60), 4.716 (1.07), 4.729 (1.23), 4.737 (1.20), 4.750 (1.01), 5.254 (0.41), 5.268 (0.92), 5.288 (0.94), 5.301 (0.42), 5.754 (8.22), 6.784 (1.67), 6.804 (1.85), 6.888 (0.85), 6.891 (0.84), 6.906 (1.80), 6.925 (1.08), 7.143 (0.86), 7.147 (0.92), 7.164 (1.44), 7.182 (0.72), 7.186 (0.72), 7.292 (1.53), 7.311 (1.42), 7.639 (1.85), 7.643 (3.39), 7.648 (8.87), 7.652 (4.00), 7.673 (1.82), 7.676 (1.64), 7.694 (1.64), 7.821 (2.01), 7.824 (2.06), 7.839 (1.67), 7.842 (1.59), 8.351 (1.69), 8.354 (1.71), 8.372 (1.62), 8.375 (1.52), 8.678 (6.32), 9.190 (1.68), 9.210 (1.63).
264	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.53 分; MS (ESIpos): m/z = 546 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.146 (0.40), 1.139 (16.00), 1.158 (15.94), 1.234 (0.94), 1.963 (2.29), 1.974 (2.70), 2.061 (3.26), 2.078 (3.19), 2.097 (1.79), 2.163 (1.02), 2.327 (0.81), 2.670 (0.80), 2.710 (0.44), 3.615 (2.37), 4.233 (1.49), 4.254 (2.33), 4.262 (2.43), 5.217 (1.48), 5.236 (1.45), 5.754 (5.93), 6.777 (2.79), 6.798 (3.23), 6.902 (1.43), 6.921 (2.91), 6.940 (1.74), 7.146 (1.44), 7.166 (2.27), 7.184 (1.15), 7.347 (2.34), 7.365 (2.28), 7.641 (4.23), 7.646 (4.54), 7.657 (14.09), 7.661 (8.47), 7.678 (2.81), 7.698 (2.23), 7.819 (3.12), 7.837 (2.42), 8.297 (2.64), 8.318 (2.50), 8.803 (9.16), 8.970 (2.59), 8.991 (2.51).
265	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.89 分; MS (ESIpos): m/z = 492 [M+H]+	1H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.00 (d, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.82 (t, 1H), 7.70 – 7.76 (m, 1H), 7.58 – 7.64 (m, 3H), 7.53 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.13 – 7.20 (m, 1H), 6.86 – 6.96 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.19 – 5.30 (m, 1H), 4.21 – 4.33 (m, 2H), 3.48 – 3.59 (m, 2H), 1.96 – 2.22 (m, 2H), 1.25 (t, 3H).
266	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.91 分; MS (ESIpos): m/z = 562 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.007 (3.09), 0.006 (1.99), 1.907 (2.42), 2.028 (0.58), 2.033 (0.60), 2.044 (0.71), 2.056 (0.83), 2.166 (0.52), 2.175 (0.71), 2.185 (0.75), 2.193 (0.77), 2.204 (0.50), 2.358 (0.89), 2.361 (1.22), 2.365 (0.93), 2.369 (0.58), 2.392 (0.70), 2.407 (0.71), 2.514 (3.50), 2.518 (3.01), 2.522 (2.34), 2.631 (0.87), 2.635 (1.14), 2.639 (0.81), 3.866 (0.46), 3.878 (1.06), 3.895 (0.91), 4.183 (0.43), 4.188 (0.44), 4.205 (1.12), 4.224 (0.89), 4.229 (0.73), 4.243 (0.75), 4.250

			(1.08), 4.262 (0.91), 4.277 (0.46), 4.638 (0.83), 4.649 (1.02), 4.654 (1.33), 4.665 (1.06), 5.254 (0.54), 5.264 (1.14), 5.280 (1.10), 5.291 (0.50), 6.786 (2.22), 6.788 (2.18), 6.802 (2.42), 6.804 (2.32), 6.919 (1.16), 6.921 (1.08), 6.933 (2.26), 6.935 (2.11), 6.948 (1.31), 6.950 (1.18), 7.169 (1.12), 7.172 (1.16), 7.186 (1.76), 7.200 (0.93), 7.203 (0.89), 7.388 (1.80), 7.403 (1.70), 7.629 (1.72), 7.634 (4.02), 7.637 (8.89), 7.639 (16.00), 7.642 (4.87), 7.652 (2.18), 7.654 (1.91), 7.669 (1.82), 7.806 (2.51), 7.809 (2.42), 7.821 (2.05), 7.823 (1.86), 8.303 (1.86), 8.320 (1.72), 8.680 (8.25), 12.586 (0.91).
267	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.85 分; MS (ESIpos): m/z = 530 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.068 (1.35), 2.198 (1.21), 2.210 (1.21), 2.220 (1.14), 3.278 (5.85), 3.289 (6.25), 3.311 (12.56), 3.604 (16.00), 4.215 (0.92), 4.237 (1.78), 4.265 (2.72), 5.246 (1.68), 5.263 (1.68), 5.753 (4.55), 6.780 (2.37), 6.800 (2.65), 6.899 (1.40), 6.917 (2.61), 6.935 (1.60), 7.114 (2.89), 7.136 (3.72), 7.164 (2.76), 7.181 (4.24), 7.186 (4.32), 7.355 (2.53), 7.374 (2.43), 7.410 (2.28), 7.415 (2.25), 7.432 (2.02), 7.437 (1.87), 7.527 (0.74), 7.547 (0.73), 7.582 (0.60), 7.629 (6.11), 7.647 (3.02), 7.665 (1.10), 8.224 (2.04), 8.238 (1.98), 8.571 (5.47), 9.139 (2.37), 9.159 (2.29).
268	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.68 分; MS (ESIpos): m/z = 514 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (1.66), 2.032 (1.12), 2.040 (1.20), 2.051 (1.31), 2.057 (1.32), 2.067 (1.86), 2.072 (1.94), 2.082 (1.19), 2.090 (0.84), 2.178 (0.94), 2.187 (1.30), 2.199 (1.63), 2.211 (1.54), 2.221 (1.49), 2.233 (0.98), 2.242 (0.78), 2.254 (0.49), 2.669 (0.48), 3.233 (0.95), 3.245 (1.65), 3.264 (4.14), 3.277 (8.27), 3.290 (9.38), 3.303 (8.05), 3.310 (8.12), 3.608 (4.08), 3.694 (1.02), 3.841 (0.90), 3.860 (7.34), 3.871 (12.70), 3.882 (7.04), 3.901 (0.86), 4.165 (0.48), 4.175 (0.48), 4.183 (0.53), 4.208 (0.81), 4.216 (1.03), 4.236 (2.56), 4.244 (2.08), 4.257 (3.61), 4.267 (3.55), 4.274 (2.38), 4.283 (2.35), 4.296 (0.92), 4.302 (0.93), 5.186 (0.41), 5.232 (1.10), 5.246 (2.38), 5.265 (2.35), 5.280 (1.03), 5.753 (0.98), 6.749 (0.48), 6.780 (4.50), 6.800 (5.03), 6.834 (0.58), 6.854 (0.72), 6.871 (0.52), 6.897 (2.22), 6.916 (4.62), 6.934 (2.69), 6.999 (3.38), 7.007 (3.89), 7.021 (3.65), 7.029 (3.73), 7.042 (0.46), 7.075 (2.55), 7.087 (2.73), 7.098 (4.07), 7.110 (4.00), 7.143 (2.39), 7.147 (2.50), 7.164 (4.00), 7.176 (2.61), 7.184 (4.22), 7.197 (3.38), 7.205

			(3.28), 7.219 (1.66), 7.228 (1.63), 7.245 (0.65), 7.265 (0.49), 7.355 (3.98), 7.373 (3.68), 7.519 (0.46), 7.540 (0.43), 7.584 (0.65), 7.599 (0.48), 7.609 (0.82), 7.615 (2.02), 7.629 (9.79), 7.648 (5.53), 7.666 (1.75), 8.217 (3.69), 8.223 (3.68), 8.236 (3.32), 8.242 (3.35), 8.280 (0.46), 8.532 (1.30), 8.572 (16.00), 9.118 (0.49), 9.140 (4.50), 9.160 (4.10).
269		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.75 分; MS (ESIpos): m/z = 530 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.88), −0.008 (8.18), 0.008 (7.45), 0.146 (0.90), 1.862 (1.33), 1.901 (1.64), 2.006 (1.70), 2.026 (2.93), 2.039 (3.18), 2.058 (1.87), 2.071 (1.25), 2.144 (1.40), 2.158 (1.62), 2.174 (1.40), 2.192 (1.09), 2.327 (1.27), 2.366 (0.88), 2.669 (1.35), 2.709 (0.82), 2.988 (0.49), 3.018 (0.82), 3.080 (0.76), 3.090 (0.82), 3.120 (0.64), 3.168 (3.38), 3.189 (1.64), 3.199 (1.70), 3.212 (1.83), 3.304 (6.01), 3.458 (2.03), 3.487 (2.61), 3.517 (1.76), 3.654 (0.60), 3.683 (1.07), 3.692 (1.19), 3.715 (2.54), 3.728 (1.58), 3.736 (1.37), 3.767 (0.66), 3.789 (1.35), 3.807 (1.58), 3.831 (1.83), 3.847 (3.20), 3.861 (2.56), 3.874 (3.40), 3.888 (1.23), 4.152 (7.55), 4.252 (5.35), 4.377 (2.97), 5.035 (0.45), 5.209 (1.89), 5.225 (1.93), 5.264 (0.43), 6.772 (4.37), 6.790 (5.03), 6.809 (0.90), 6.878 (2.19), 6.897 (4.78), 6.916 (3.30), 6.935 (0.49), 7.094 (6.19), 7.116 (7.26), 7.135 (2.60), 7.153 (4.41), 7.161 (6.99), 7.168 (8.02), 7.214 (1.25), 7.221 (1.29), 7.289 (3.71), 7.307 (3.41), 7.341 (0.72), 7.361 (0.64), 7.384 (4.27), 7.390 (4.02), 7.406 (3.71), 7.412 (3.61), 7.421 (3.04), 7.440 (4.06), 7.450 (1.05), 7.460 (3.61), 7.501 (5.07), 7.504 (5.29), 7.518 (3.34), 7.659 (1.00), 7.677 (1.58), 8.177 (16.00), 8.233 (4.10), 8.254 (3.80), 8.331 (8.27), 8.335 (8.60), 8.688 (2.58), 9.014 (2.13), 9.024 (2.44), 9.035 (2.24), 9.045 (2.24), 9.145 (0.62), 9.165 (0.59).
270		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.17 分; MS (ESIpos): m/z = 514 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.06), 0.008 (2.02), 1.862 (0.52), 1.902 (0.65), 1.991 (0.45), 2.008 (0.70), 2.029 (1.17), 2.041 (1.33), 2.052 (0.81), 2.062 (0.77), 2.074 (0.49), 2.085 (0.95), 2.145 (0.64), 2.159 (0.70), 2.175 (0.54), 2.194 (0.46), 3.468 (0.59), 3.498 (0.87), 3.528 (0.48), 3.592 (16.00), 3.702 (0.50), 3.722 (0.73), 3.738 (0.54), 3.795 (0.43), 3.813 (0.59), 3.833 (0.70), 3.855 (1.29), 3.868 (0.86), 3.881 (0.82), 3.893 (0.49), 4.151 (0.44), 4.241 (1.65), 4.254 (2.29), 4.378 (1.10), 5.041 (0.99), 5.210 (0.85), 5.224 (0.81), 5.753 (5.11), 6.773 (1.87), 6.793

			(2.06), 6.877 (0.94), 6.896 (1.98), 6.914 (1.21), 6.988 (0.94), 6.995 (1.10), 7.010 (0.97), 7.018 (1.04), 7.061 (0.93), 7.072 (1.01), 7.084 (1.51), 7.095 (1.44), 7.136 (1.03), 7.156 (2.10), 7.165 (0.92), 7.177 (1.39), 7.186 (1.11), 7.200 (0.54), 7.208 (0.52), 7.289 (1.68), 7.307 (1.53), 7.430 (0.89), 7.448 (1.57), 7.469 (1.45), 7.511 (1.95), 7.528 (1.16), 8.134 (5.18), 8.235 (1.56), 8.256 (1.45), 8.331 (2.76), 8.335 (3.59), 9.027 (0.68), 9.036 (0.99), 9.047 (0.75), 9.057 (0.91).
271		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.78 分; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.150 (0.71), −0.008 (7.12), 0.008 (7.07), 0.146 (0.81), 1.157 (4.10), 1.175 (8.25), 1.192 (4.07), 1.234 (4.37), 1.258 (1.96), 1.298 (1.33), 1.759 (1.96), 1.913 (1.69), 1.988 (16.00), 2.051 (3.21), 2.153 (1.72), 2.168 (1.96), 2.328 (1.18), 2.366 (0.83), 2.669 (1.15), 3.482 (1.52), 3.509 (3.31), 3.537 (1.72), 3.601 (1.72), 3.749 (2.23), 3.858 (2.43), 3.871 (2.40), 3.884 (2.97), 3.898 (2.04), 4.003 (1.13), 4.021 (3.58), 4.038 (3.51), 4.056 (1.20), 4.179 (2.43), 4.265 (5.40), 4.372 (2.70), 5.035 (4.93), 5.231 (2.18), 5.753 (0.91), 6.782 (5.20), 6.802 (5.72), 6.891 (2.33), 6.910 (5.06), 6.928 (3.21), 7.141 (2.50), 7.162 (4.22), 7.184 (2.11), 7.304 (4.32), 7.322 (4.02), 7.480 (3.31), 7.499 (4.47), 7.519 (3.68), 7.757 (5.37), 7.774 (4.66), 7.854 (7.12), 7.898 (7.95), 7.970 (7.83), 8.137 (1.03), 8.299 (3.12), 8.322 (3.07), 8.420 (9.50), 8.427 (9.79), 8.804 (0.96), 9.056 (3.41), 9.075 (3.53).
272		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.74 分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.150 (0.66), −0.008 (6.04), 0.008 (5.39), 0.146 (0.68), 1.902 (1.46), 1.911 (1.34), 2.001 (1.38), 2.011 (1.72), 2.032 (2.75), 2.042 (2.15), 2.148 (1.40), 2.161 (1.58), 2.177 (1.24), 2.195 (0.96), 2.270 (16.00), 2.327 (0.88), 2.332 (0.72), 2.366 (0.84), 2.522 (2.61), 2.669 (0.86), 2.709 (0.78), 3.209 (0.40), 3.232 (0.44), 3.479 (1.26), 3.507 (2.19), 3.537 (1.20), 3.738 (1.70), 3.758 (1.16), 3.790 (0.56), 3.813 (1.00), 3.830 (1.10), 3.848 (1.30), 3.857 (1.48), 3.870 (2.75), 3.883 (2.11), 3.896 (1.78), 3.909 (1.08), 4.169 (2.17), 4.244 (3.65), 4.256 (4.49), 4.374 (2.29), 5.034 (3.53), 5.212 (1.76), 5.225 (1.74), 5.233 (1.40), 5.753 (11.87), 6.774 (3.91), 6.793 (4.33), 6.881 (2.01), 6.900 (4.21), 6.918 (2.63), 7.135 (2.07), 7.138 (2.15), 7.156 (3.47), 7.174 (1.84), 7.177 (1.76), 7.240 (1.90), 7.247 (2.25), 7.254 (2.13), 7.261 (2.07), 7.295 (3.59), 7.314 (3.31), 7.405 (2.07), 7.411

			(2.15), 7.420 (2.31), 7.426 (2.01), 7.458 (2.45), 7.477 (3.53), 7.498 (3.05), 7.604 (4.17), 7.621 (3.31), 8.133 (5.33), 8.299 (3.03), 8.321 (2.85), 8.361 (7.30), 8.365 (8.02), 8.733 (0.70), 9.030 (2.93), 9.051 (2.79).
273		LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.74 分；MS (ESIpos)：m/z = 504 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (2.37), 0.008 (2.35), 0.551 (0.53), 0.566 (0.84), 0.576 (1.24), 0.588 (1.45), 0.599 (1.08), 0.611 (1.48), 0.622 (1.39), 0.632 (0.86), 0.646 (0.65), 0.774 (0.62), 0.784 (0.88), 0.791 (1.19), 0.801 (1.30), 0.811 (1.67), 0.817 (1.59), 0.828 (1.34), 0.846 (0.86), 0.855 (0.59), 1.157 (4.26), 1.175 (8.61), 1.193 (4.39), 1.988 (16.00), 2.033 (0.49), 2.041 (0.65), 2.051 (0.77), 2.059 (0.84), 2.067 (1.09), 2.075 (1.07), 2.086 (1.16), 2.108 (0.49), 2.129 (0.92), 2.141 (0.96), 2.150 (0.81), 2.163 (0.50), 2.176 (0.40), 2.523 (1.27), 3.074 (1.32), 3.081 (1.31), 4.003 (1.26), 4.021 (3.80), 4.038 (3.76), 4.056 (1.22), 4.229 (0.56), 4.237 (0.42), 4.248 (1.37), 4.257 (1.41), 4.268 (1.85), 4.276 (1.87), 4.288 (1.35), 4.296 (1.55), 4.316 (0.56), 5.210 (0.65), 5.225 (1.45), 5.244 (1.46), 5.259 (0.63), 6.783 (2.84), 6.804 (3.11), 6.881 (1.36), 6.884 (1.39), 6.900 (2.84), 6.902 (2.84), 6.918 (1.71), 6.921 (1.66), 7.139 (1.38), 7.143 (1.48), 7.160 (2.30), 7.178 (1.14), 7.182 (1.14), 7.290 (2.42), 7.309 (2.25), 7.495 (2.03), 7.513 (2.65), 7.515 (2.51), 7.534 (2.35), 7.593 (1.59), 7.598 (3.85), 7.602 (4.25), 7.614 (14.30), 7.618 (8.44), 7.726 (3.30), 7.742 (2.69), 7.744 (2.68), 8.497 (2.63), 8.581 (9.25), 8.625 (2.55), 8.644 (2.39), 8.925 (2.56), 8.945 (2.48).
274		LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.87 分；MS (ESIpos)：m/z = 562 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.149 (0.88), 0.146 (0.84), 2.052 (4.40), 2.066 (4.83), 2.214 (1.52), 2.327 (1.69), 2.367 (1.09), 2.669 (1.57), 2.709 (0.86), 3.395 (1.87), 3.910 (1.80), 3.929 (1.91), 4.172 (0.60), 4.289 (4.76), 4.731 (1.76), 4.745 (2.27), 4.764 (1.74), 5.301 (1.84), 5.318 (1.95), 6.770 (3.24), 6.790 (3.65), 6.854 (1.59), 6.872 (3.37), 6.890 (2.08), 7.129 (1.78), 7.146 (2.92), 7.165 (1.59), 7.303 (3.15), 7.322 (2.98), 7.643 (16.00), 7.674 (2.68), 7.808 (3.99), 7.825 (3.00), 8.323 (3.22), 8.343 (2.92), 8.686 (8.56), 9.294 (0.92), 12.581 (0.51).
275		LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.37 分；MS (ESIpos)：m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：1.899 (0.93), 2.033 (1.88), 2.162 (1.12), 2.178 (0.96), 2.337 (16.00), 2.669 (0.47), 3.305 (4.05), 3.485 (0.97), 3.512 (1.74), 3.538 (0.94), 3.742 (1.19), 3.817 (0.74), 3.849 (0.94), 3.873 (2.10), 3.885 (1.33), 3.899

	532 [M+H]+	(1.41), 3.911 (0.81), 4.257 (3.03), 4.375 (1.62), 5.036 (0.83), 5.212 (1.24), 6.773 (2.99), 6.793 (3.25), 6.884 (1.29), 6.902 (2.92), 6.920 (1.71), 7.138 (1.51), 7.157 (4.16), 7.174 (3.09), 7.296 (2.55), 7.314 (2.22), 7.418 (2.01), 7.431 (2.00), 7.467 (1.65), 7.484 (2.51), 7.506 (2.14), 7.606 (3.17), 7.623 (2.58), 8.136 (11.05), 8.306 (2.13), 8.327 (1.99), 8.361 (5.15), 8.365 (5.57), 9.029 (2.00), 9.051 (1.92).
276	LC-MS（方法 L6）：R_t= 0.80 分；MS (ESIpos)：m/z = 522 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6)：δ [ppm]= 8.98 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.22 (brd, 1H), 8.03 (brs, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.52 - 7.66 (m, 4H), 7.33 (d, 1H), 7.15 (t, 1H), 6.90 (t, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.18 - 5.33 (m, 1H), 4.19 - 4.33 (m, 2H), 3.80 (brs, 2H), 1.99 - 2.23 (m, 2H).
277	LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.86 分；m/z = 460 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.28 (m, 1H), 7.78 - 7.62 (m, 2H), 7.51 (m, 1H), 7.35 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.25 - 7.11 (m, 3H), 6.91 (m, 1H), 6.83 - 6.75 (m, 1H), 5.24 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.25 (dt, J = 7.8, 4.8 Hz, 2H)
278	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.64 分，m/z = 520 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.40 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.70 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 7.65 - 7.55 (m, 1H), 7.36 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.30 - 7.21 (m, 2H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.87 (m, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2,
279	LC-MS（方法 L3）：R_t= 3.83 分，m/z = 478 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.37 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.68 - 7.54 (m, 2H), 7.34 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.30 - 7.20 (m, 2H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 6.94 - 6.87 (m, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.27 - 5.19 (
280	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.89 分；MS (ESIpos)：m/z = 507 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6)：δ [ppm]= 9.19 (d, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.34 (dd, 1H), 7.81 - 7.90 (m, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.47 - 7.56 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.12 - 7.21 (m, 1H), 6.87 - 6.97 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.20 - 5.32 (m, 1H), 4.18 - 4.33 (m, 2H), 3.89 (t, 4H), 2.16 - 2.28 (m, 1H), 2.00 - 2.11 (m, 1H).
281	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.59 分；MS (ESIpos)：m/z = 576 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (1.22), 0.008 (1.27), 2.023 (0.43), 2.058 (0.74), 2.065 (0.63), 2.129 (0.65), 2.148 (0.95), 2.159 (1.39), 2.178 (1.50), 2.197 (0.65), 2.259 (0.60), 2.271 (0.78), 2.289 (0.71), 2.322 (0.52), 2.327 (0.59), 2.523 (1.62), 2.670 (0.57), 3.336 (1.52), 3.354 (0.97), 3.632 (0.46), 3.644 (0.81), 3.656 (0.92), 3.663 (0.86), 3.688 (16.00), 3.711 (1.43), 3.729 (0.81), 3.736 (1.08), 3.764 (1.60), 3.783 (1.39), 3.798 (1.66), 3.815 (1.41), 3.823 (0.84), 3.840 (0.60), 4.236

		(1.01), 4.248 (1.31), 4.259 (1.81), 4.273 (1.00), 5.212 (0.93), 5.232 (0.97), 5.245 (0.41), 5.754 (0.44), 6.784 (1.82), 6.804 (1.98), 6.899 (0.92), 6.915 (1.93), 6.934 (1.14), 7.149 (0.92), 7.153 (0.95), 7.170 (1.52), 7.187 (0.76), 7.334 (1.55), 7.352 (1.44), 7.548 (1.35), 7.566 (1.81), 7.569 (1.62), 7.587 (1.49), 7.625 (12.56), 7.756 (2.12), 7.771 (1.68), 7.774 (1.70), 8.265 (1.73), 8.287 (1.54), 8.530 (5.88), 9.104 (1.73), 9.124 (1.66).
282	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.57 分; MS (ESIpos): m/z = 576 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.90), 0.008 (1.01), 1.356 (0.76), 2.020 (0.41), 2.030 (0.40), 2.056 (0.64), 2.064 (0.53), 2.115 (0.57), 2.134 (0.66), 2.146 (0.97), 2.164 (1.20), 2.184 (0.89), 2.196 (0.51), 2.261 (0.56), 2.273 (0.71), 2.280 (0.50), 2.292 (0.68), 2.323 (0.44), 2.327 (0.41), 2.523 (1.03), 3.333 (1.42), 3.352 (0.88), 3.653 (0.41), 3.665 (0.84), 3.684 (16.00), 3.702 (0.75), 3.721 (1.33), 3.739 (0.72), 3.745 (0.78), 3.776 (2.18), 3.779 (2.21), 3.797 (2.25), 4.241 (0.94), 4.250 (1.38), 4.261 (1.78), 5.218 (0.84), 5.238 (0.83), 5.754 (1.01), 6.784 (1.63), 6.804 (1.77), 6.895 (0.78), 6.897 (0.81), 6.915 (1.64), 6.932 (0.96), 6.934 (0.96), 7.147 (0.79), 7.151 (0.87), 7.168 (1.32), 7.186 (0.66), 7.190 (0.67), 7.328 (1.35), 7.345 (1.25), 7.544 (1.16), 7.562 (1.51), 7.566 (1.48), 7.584 (1.38), 7.624 (12.39), 7.752 (1.74), 7.755 (1.89), 7.770 (1.51), 7.772 (1.51), 8.250 (1.50), 8.253 (1.57), 8.271 (1.41), 8.274 (1.38), 8.524 (5.96), 9.102 (1.54), 9.123 (1.50).
283	LC-MS (方法 L6): R_t= 0.81 分; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.05 (d, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.57 - 7.64 (m, 3H), 7.44 - 7.52 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.11 - 7.20 (m, 1H), 6.87 - 6.95 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.18 - 5.28 (m, 1H), 5.03 (d, 1H), 4.36 (brs, 1H), 4.27 (br t, 2H), 3.79 - 3.93 (m, 2H), 3.68 - 3.79 (m, 1H), 3.49 (brd, 1H), 2.12 - 2.24 (m, 1H), 1.97 - 2.10 (m, 2H), 1.89 (brd, 1H).
284	LC-MS (方法 L6): R_t= 0.82 分; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.05 (d, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.57 - 7.65 (m, 3H), 7.45 - 7.51 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.92 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.22 (brd, 1H), 5.03 (d, 1H), 4.37 (brs, 1H), 4.20 - 4.31 (m, 2H), 3.68 - 3.91 (m, 3H), 3.51 (brd, 1H), 2.18 (brd, 1H), 2.03 (brd, 2H), 1.91 (brs, 1H).
285	4.62	^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.2548 (2.04); 9.2345 (2.1); 8.7855 (7.26); 8.3664	

			(2.02); 8.3479 (2.11); 8.3453 (2.18); 7.8787 (1.74); 7.8758 (1.94); 7.861 (2.47); 7.8581 (2.48); 7.7622 (1.94); 7.7414 (2.32); 7.7231 (1.43); 7.6547 (16); 7.377 (1.84); 7.3585 (1.98); 7.2033 (0.85); 7.1998 (0.91); 7.1823 (1.91); 7.1646 (1.15); 7.1615 (1.18); 6.9343 (1.34); 6.9157 (2.31); 6.8969 (1.1); 6.8176 (2.6); 6.7972 (2.33); 5.7568 (1.47); 5.3034 (0.53); 5.2897 (1.2); 5.2703 (1.21); 5.2561 (0.53); 4.2926 (1.27); 4.2792 (2.34); 4.2671 (1.8); 4.2581 (1.3); 4.2376 (0.33); 4.0706 (0.7); 4.0524 (2.63); 4.0345 (4.44); 4.0171 (4.89); 3.9996 (4.19); 3.9816 (2.38); 3.9627 (0.67); 3.6304 (3.62); 3.6065 (3.63); 3.3187 (31.43); 3.1462 (13.89); 2.6701 (0.58); 2.6659 (0.46); 2.5055 (77.14); 2.5012 (101.26); 2.4969 (75.96); 2.3321 (0.47); 2.3281 (0.61); 2.3241 (0.48); 2.2488 (0.44); 2.2418 (0.43); 2.2281 (0.71); 2.2163 (0.79); 2.2064 (0.75); 2.1941 (0.66); 2.1845 (0.36); 2.0978 (0.77); 2.0895 (0.89); 2.078 (0.63); 2.0643 (0.6); 2.0543 (0.57); 1.9886 (5.88); 1.3664 (0.32); 1.2071 (5.79); 1.1896 (12.06); 1.1762 (7.45); 1.1746 (7.59); 1.1724 (7.64); 1.1593 (11.84); 1.1417 (5.55); 0.0079 (0.56); −0.0002 (11.57)
286	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.71 分; MS (ESIpos): m/z = 547 [M+H]+		^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.226 (1.29), 0.233 (4.30), 0.237 (4.63), 0.239 (4.52), 0.243 (4.88), 0.249 (1.40), 0.340 (1.52), 0.346 (4.07), 0.350 (4.50), 0.357 (4.85), 0.360 (3.44), 0.368 (1.04), 1.356 (1.85), 2.038 (0.54), 2.043 (0.74), 2.048 (0.90), 2.055 (1.09), 2.058 (1.29), 2.064 (1.93), 2.069 (2.31), 2.075 (2.90), 2.080 (1.94), 2.085 (1.35), 2.091 (0.59), 2.138 (0.52), 2.147 (0.75), 2.153 (0.91), 2.160 (1.03), 2.166 (0.97), 2.175 (0.71), 2.183 (0.72), 2.430 (0.61), 2.875 (2.56), 2.886 (5.07), 2.896 (2.59), 3.568 (1.55), 3.578 (3.52), 3.587 (3.45), 3.597 (1.35), 4.235 (0.44), 4.240 (0.64), 4.246 (0.51), 4.253 (1.67), 4.259 (1.50), 4.267 (2.05), 4.272 (2.07), 4.280 (1.42), 4.285 (1.84), 4.291 (0.49), 4.299 (0.60), 4.304 (0.43), 5.243 (0.77), 5.253 (1.54), 5.266 (1.49), 5.276 (0.69), 6.785 (2.94), 6.787 (3.06), 6.799 (3.15), 6.801 (3.19), 6.884 (1.60), 6.886 (1.58), 6.897 (3.02), 6.899 (2.96), 6.909 (1.78), 6.911 (1.69), 7.149 (1.45), 7.151 (1.48), 7.163 (2.43), 7.174 (1.26), 7.177 (1.19), 7.299 (2.47), 7.312 (2.33), 7.525 (2.41), 7.537 (2.93), 7.539 (2.68), 7.552 (2.48), 7.603 (2.71), 7.606 (5.93), 7.609 (4.64), 7.625 (16.00), 7.628 (11.38), 7.728 (0.51), 7.731 (0.49), 7.740 (3.43), 7.741 (3.45), 7.751 (2.98), 7.753 (2.90), 7.908

		(1.67), 8.353 (2.70), 8.354 (2.72), 8.367 (2.61), 8.369 (2.48), 8.549 (9.74), 8.991 (2.87), 9.004 (2.73).
287	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.98 分; MS (ESIpos): m/z = 548 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.52), 0.146 (0.53), 1.883 (0.77), 1.896 (0.94), 1.912 (1.02), 1.927 (1.11), 1.943 (1.13), 1.961 (0.80), 1.971 (1.04), 1.990 (1.32), 2.009 (0.93), 2.061 (1.59), 2.074 (1.40), 2.084 (1.11), 2.098 (1.33), 2.109 (1.05), 2.191 (2.00), 2.202 (1.93), 2.226 (1.16), 2.240 (0.86), 2.327 (0.57), 2.366 (0.54), 2.669 (0.58), 2.710 (0.53), 3.225 (0.66), 3.239 (1.63), 3.252 (3.85), 3.266 (3.91), 3.279 (2.86), 3.800 (0.70), 3.818 (1.59), 3.838 (1.38), 3.857 (0.53), 4.279 (3.25), 4.293 (5.39), 4.304 (3.56), 4.768 (1.59), 4.782 (3.24), 4.795 (1.56), 5.260 (0.71), 5.274 (1.51), 5.293 (1.51), 5.308 (0.71), 6.778 (2.68), 6.798 (3.02), 6.875 (1.45), 6.893 (3.03), 6.912 (1.75), 7.138 (1.46), 7.156 (2.35), 7.176 (1.18), 7.292 (2.47), 7.310 (2.24), 7.600 (1.83), 7.621 (2.91), 7.638 (16.00), 7.787 (3.16), 7.804 (2.53), 8.227 (2.56), 8.249 (2.35), 8.638 (8.70), 9.180 (2.48), 9.201 (2.46).
288	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.99 分; MS (ESIpos): m/z = 548 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.41), -0.008 (3.63), 0.008 (3.20), 0.146 (0.42), 0.853 (0.41), 1.235 (1.98), 1.571 (1.78), 1.770 (0.57), 1.783 (0.70), 1.800 (0.80), 1.813 (0.68), 1.832 (0.43), 1.896 (0.87), 1.916 (1.53), 1.934 (1.55), 1.951 (0.86), 1.997 (0.58), 2.004 (0.58), 2.018 (0.64), 2.032 (0.84), 2.105 (0.65), 2.117 (0.95), 2.135 (0.76), 2.149 (0.82), 2.172 (0.84), 2.185 (0.78), 2.193 (0.74), 2.206 (0.55), 2.327 (0.80), 2.366 (0.49), 2.523 (2.44), 2.665 (0.62), 2.669 (0.80), 2.709 (0.47), 3.168 (2.40), 3.202 (3.42), 3.235 (0.84), 3.730 (0.53), 3.748 (1.27), 3.769 (1.21), 3.787 (0.48), 4.172 (0.78), 4.196 (1.49), 4.202 (1.69), 4.217 (1.98), 4.233 (1.24), 4.246 (1.34), 4.252 (1.02), 4.262 (1.06), 4.273 (0.58), 4.281 (0.53), 4.775 (0.76), 5.232 (0.50), 5.246 (1.11), 5.266 (1.12), 5.280 (0.50), 6.792 (2.30), 6.813 (2.51), 6.929 (1.14), 6.946 (2.23), 6.964 (1.27), 7.169 (1.12), 7.173 (1.19), 7.190 (1.80), 7.208 (0.87), 7.409 (1.87), 7.427 (1.76), 7.603 (1.59), 7.622 (2.28), 7.625 (2.41), 7.637 (16.00), 7.651 (0.76), 7.789 (2.46), 7.804 (1.99), 8.208 (1.97), 8.227 (1.82), 8.554 (0.70), 8.654 (8.22), 9.267 (1.92), 9.288 (1.85).
289	LC-MS (方法 L4): R_t= 2.19 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.41), 0.853 (0.82), 0.936 (14.10), 0.967 (12.05), 0.979 (4.08), 1.010 (0.93), 1.091 (4.11), 1.112 (3.92), 1.128 (1.36), 1.141

	(ESIneg): m/z = 545 [M-H]-	(1.26), 1.209 (11.78), 1.226 (11.85), 1.257 (0.62), 1.863 (0.62), 2.038 (2.45), 2.070 (3.11), 2.086 (2.26), 2.124 (1.91), 2.137 (1.96), 2.328 (0.85), 2.366 (0.73), 2.524 (1.17), 2.670 (0.58), 2.711 (3.09), 3.066 (0.92), 3.075 (0.86), 4.217 (1.18), 4.236 (2.48), 4.254 (2.47), 4.264 (2.19), 4.277 (2.14), 4.296 (2.20), 4.323 (1.05), 5.256 (1.20), 5.271 (2.47), 5.288 (2.36), 5.754 (6.01), 6.779 (4.19), 6.800 (4.70), 6.850 (1.07), 6.869 (3.08), 6.886 (3.51), 6.904 (1.82), 6.921 (0.41), 7.137 (2.50), 7.155 (4.01), 7.173 (2.04), 7.246 (2.37), 7.268 (3.62), 7.289 (1.98), 7.527 (2.12), 7.546 (3.59), 7.566 (2.59), 7.595 (5.35), 7.599 (4.71), 7.629 (16.00), 7.633 (13.65), 7.755 (4.31), 7.772 (3.86), 8.153 (1.08), 8.195 (5.33), 8.334 (0.71), 8.562 (0.74), 8.585 (0.69), 8.632 (2.97), 8.640 (2.11), 8.653 (2.92), 8.664 (5.42), 8.676 (5.87), 8.916 (1.70), 8.935 (3.21), 8.955 (1.84), 8.981 (0.70), 9.001 (0.72), 9.015 (0.69), 9.035 (0.60), 9.091 (0.68), 9.148 (0.75).
290	LC-MS (方法 L6): R_t= 2.50 分; MS (ESIpos): m/z = 548 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.02), -0.008 (8.92), 0.008 (8.60), 0.146 (1.00), 1.135 (7.45), 1.150 (7.45), 2.092 (0.86), 2.210 (0.77), 2.222 (0.70), 2.232 (0.75), 2.327 (1.38), 2.366 (0.75), 2.522 (3.76), 2.669 (1.31), 2.709 (0.68), 3.011 (0.88), 3.040 (1.40), 3.065 (1.22), 3.171 (0.86), 3.203 (2.49), 3.237 (1.13), 3.271 (0.95), 3.882 (0.86), 3.904 (1.86), 3.928 (2.90), 4.252 (1.18), 4.260 (1.02), 4.272 (1.81), 4.281 (1.77), 4.297 (0.97), 5.264 (1.11), 5.285 (1.13), 5.754 (6.81), 6.791 (2.20), 6.811 (2.42), 6.898 (1.09), 6.916 (2.17), 6.932 (1.24), 7.158 (1.11), 7.175 (1.77), 7.193 (0.88), 7.373 (1.83), 7.390 (1.67), 7.639 (16.00), 7.682 (1.45), 7.700 (2.08), 7.720 (1.88), 7.832 (2.51), 7.847 (1.92), 8.269 (2.08), 8.287 (1.92), 8.703 (7.92), 9.162 (1.99), 9.182 (1.90).
291	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.74 分; MS (ESIneg): m/z = 549 [M-H]-	^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.005 (0.51), 1.849 (0.72), 1.904 (0.43), 1.909 (0.44), 2.009 (0.42), 2.029 (0.63), 2.039 (0.75), 2.044 (0.67), 2.050 (0.81), 2.054 (0.88), 2.060 (0.72), 2.086 (1.13), 2.161 (0.42), 2.169 (0.75), 2.177 (0.71), 2.184 (0.86), 2.191 (0.78), 2.205 (0.57), 2.517 (0.75), 2.520 (0.73), 2.523 (0.59), 3.517 (0.55), 3.523 (0.43), 3.529 (0.50), 3.553 (0.60), 3.563 (1.79), 3.570 (1.96), 3.578 (0.98), 3.712 (0.61), 3.733 (0.80), 3.751 (0.73), 3.758 (0.72), 3.773 (0.86), 3.777 (1.00), 3.791 (1.38), 3.794 (1.30), 3.803 (1.20), 3.806 (1.23), 4.147 (0.64), 4.191

			(0.42), 4.213 (0.68), 4.217 (0.52), 4.233 (0.62), 4.240 (1.21), 4.245 (0.85), 4.253 (2.20), 4.259 (2.32), 4.263 (2.48), 4.271 (1.51), 4.979 (0.68), 4.998 (0.65), 5.070 (0.63), 5.090 (0.60), 5.216 (0.57), 5.226 (1.21), 5.238 (1.18), 5.247 (0.54), 5.761 (0.76), 6.787 (2.54), 6.801 (2.68), 6.909 (1.25), 6.922 (2.41), 6.934 (1.36), 7.154 (1.22), 7.167 (1.95), 7.180 (1.02), 7.326 (1.05), 7.339 (1.97), 7.351 (1.01), 7.504 (1.06), 7.507 (1.14), 7.519 (2.23), 7.531 (1.20), 7.533 (1.22), 7.621 (16.00), 7.737 (2.63), 7.739 (2.75), 7.749 (2.42), 7.751 (2.42), 8.247 (1.17), 8.261 (2.15), 8.276 (1.14), 8.463 (4.46), 8.474 (4.71), 9.093 (1.35), 9.100 (1.40), 9.107 (1.41), 9.114 (1.26).
292	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.92 分; MS (ESIneg): m/z = 546 [M-H]-		^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.005 (0.57), 1.860 (0.51), 1.871 (0.77), 1.882 (0.62), 1.890 (0.44), 1.909 (0.41), 1.923 (0.56), 1.930 (0.52), 1.934 (0.54), 1.940 (0.70), 1.946 (0.52), 1.954 (0.72), 1.961 (0.49), 1.974 (0.44), 2.035 (0.45), 2.040 (0.47), 2.049 (0.93), 2.060 (0.97), 2.069 (0.59), 2.080 (0.42), 2.086 (1.00), 2.383 (0.46), 2.386 (0.48), 2.389 (0.45), 2.475 (0.54), 2.482 (0.97), 2.517 (1.22), 2.520 (1.25), 2.523 (0.98), 2.846 (0.43), 2.859 (0.55), 2.871 (0.67), 2.888 (0.55), 2.973 (0.59), 2.988 (0.60), 3.000 (0.43), 3.307 (0.67), 3.386 (0.42), 3.399 (0.44), 3.808 (0.49), 3.822 (0.49), 3.904 (0.48), 3.918 (0.47), 4.649 (0.59), 4.659 (0.66), 4.663 (0.57), 4.672 (0.44), 4.757 (0.59), 4.766 (0.67), 4.771 (0.55), 4.779 (0.49), 5.535 (0.60), 5.547 (0.59), 5.578 (0.65), 5.591 (0.64), 5.761 (4.08), 7.186 (0.77), 7.198 (0.64), 7.207 (0.58), 7.219 (1.00), 7.233 (0.76), 7.237 (0.74), 7.239 (0.73), 7.244 (1.42), 7.248 (0.86), 7.251 (0.95), 7.254 (1.18), 7.258 (1.17), 7.275 (0.96), 7.286 (0.49), 7.362 (0.89), 7.374 (0.74), 7.450 (0.61), 7.453 (0.66), 7.464 (0.59), 7.623 (0.42), 7.636 (0.92), 7.639 (2.00), 7.644 (16.00), 7.646 (12.97), 7.651 (1.35), 7.654 (1.10), 7.657 (1.10), 7.659 (0.98), 7.665 (0.95), 7.671 (0.88), 7.806 (1.15), 7.809 (1.53), 7.812 (1.33), 7.818 (1.12), 7.821 (1.26), 7.824 (0.95), 8.291 (0.84), 8.293 (0.83), 8.305 (0.81), 8.308 (0.78), 8.314 (0.95), 8.316 (0.95), 8.328 (0.80), 8.330 (0.76), 8.697 (6.20).
293	LC-MS (方法 L3): R_t= 4.24 分; m/z =		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.11 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 7.1, 1.4 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.5, 7.1 Hz, 1H), 7.46

	484/486 (M+1)+	(d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.21 – 7.14 (m, 1H), 6.97 – 6.88 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.30 – 5.20 (m, 1H), 4.34 – 4.18 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.79 (s, 6H), 2.27 – 2.14 (m, 1H), 2.13 – 1.97 (m, 1H).
294	LC-MS (方法 L3): R_t= 3.20 分; m/z = 501/503 (M+1)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.19 (dd, J = 8.5, 1.5 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 7.1, 1.5 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.4, 7.1 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.22 – 7.12 (m, 1H), 6.97 – 6.88 (m, 1H), 6.86 – 6.76 (m, 3H), 6.
295	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.74 分; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.900 (1.01), 1.909 (0.98), 2.019 (1.52), 2.030 (1.94), 2.148 (0.92), 2.162 (1.06), 2.178 (0.86), 2.194 (0.65), 2.399 (16.00), 3.169 (5.63), 3.232 (0.41), 3.305 (3.16), 3.314 (2.97), 3.479 (0.92), 3.506 (1.78), 3.533 (0.99), 3.711 (0.62), 3.734 (1.27), 3.755 (0.85), 3.789 (0.43), 3.811 (0.79), 3.829 (0.80), 3.845 (0.92), 3.856 (1.20), 3.866 (2.03), 3.879 (1.33), 3.894 (1.36), 3.905 (0.71), 4.165 (0.98), 4.256 (3.16), 4.374 (1.70), 5.034 (0.67), 5.214 (1.23), 5.226 (1.24), 6.773 (2.58), 6.793 (2.90), 6.882 (1.30), 6.901 (2.73), 6.919 (1.67), 7.135 (1.40), 7.156 (2.32), 7.174 (1.20), 7.296 (4.04), 7.311 (2.43), 7.323 (2.78), 7.424 (2.66), 7.441 (2.63), 7.460 (1.52), 7.478 (2.53), 7.499 (1.95), 7.614 (2.84), 7.632 (2.37), 8.137 (4.85), 8.291 (2.22), 8.313 (2.08), 8.357 (5.32), 9.028 (1.63), 9.032 (1.65), 9.048 (1.65).
296	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.34 分; MS (ESIpos): m/z = 424 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: –0.008 (1.98), 0.008 (2.08), 3.063 (16.00), 4.243 (0.55), 4.262 (0.79), 4.270 (0.88), 4.283 (0.48), 5.248 (0.49), 5.268 (0.51), 6.785 (1.01), 6.805 (1.09), 6.905 (0.49), 6.923 (0.99), 6.939 (0.58), 7.150 (0.51), 7.167 (0.80), 7.348 (0.87), 7.366 (0.87), 7.378 (1.07), 7.396 (0.89), 7.428 (1.31), 7.447 (2.17), 7.465 (0.96), 7.574 (2.11), 7.591 (1.75), 7.595 (1.21), 7.614 (0.67), 7.632 (1.09), 7.652 (1.07), 7.697 (1.20), 7.701 (1.29), 7.715 (0.80), 7.719 (0.73), 8.174 (1.00), 8.177 (1.02), 8.195 (0.93), 8.199 (0.88), 8.583 (3.79), 9.068 (0.83), 9.088 (0.78).
297	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.84 分; MS	^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.005 (0.54), 1.175 (0.51), 1.233 (0.88), 1.945 (0.48), 1.959 (1.35), 1.966 (0.68), 1.973 (1.44), 1.980 (1.50), 1.987 (0.67), 1.990

	(ESIpos): m/z = 492 [M+H]+	(0.61), 1.994 (1.45), 2.008 (0.53), 2.086 (2.18), 2.451 (0.53), 2.457 (0.63), 2.464 (1.16), 2.470 (1.43), 2.477 (1.47), 2.485 (1.96), 2.517 (0.87), 2.520 (0.88), 2.524 (0.72), 2.822 (0.63), 2.835 (1.18), 2.849 (1.35), 2.862 (1.68), 2.875 (0.78), 2.969 (1.03), 2.975 (1.07), 2.984 (1.12), 2.989 (1.08), 2.995 (0.85), 3.001 (0.81), 3.010 (0.76), 3.016 (0.67), 3.588 (0.86), 3.598 (2.43), 3.602 (2.62), 3.608 (3.14), 3.617 (1.76), 3.632 (0.42), 3.652 (3.34), 3.661 (4.14), 3.669 (1.71), 4.909 (0.68), 5.519 (0.77), 5.533 (2.21), 5.546 (2.18), 5.559 (0.73), 7.191 (0.82), 7.203 (2.41), 7.213 (3.76), 7.216 (3.96), 7.225 (2.72), 7.227 (2.72), 7.237 (1.21), 7.262 (3.11), 7.273 (1.90), 7.357 (2.79), 7.369 (2.30), 7.526 (2.39), 7.538 (2.98), 7.540 (2.73), 7.552 (2.48), 7.608 (2.68), 7.611 (5.84), 7.614 (4.57), 7.628 (15.29), 7.632 (11.06), 7.741 (3.49), 7.743 (3.42), 7.753 (3.14), 7.755 (2.91), 8.061 (1.26), 8.137 (16.00), 8.392 (2.82), 8.394 (2.80), 8.407 (2.71), 8.573 (9.90), 8.877 (2.88), 8.891 (2.74).
298	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.94 分; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H]+	^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.005 (0.41), 1.942 (0.52), 1.957 (1.44), 1.963 (0.74), 1.970 (1.55), 1.977 (1.60), 1.984 (0.73), 1.991 (1.56), 2.005 (0.56), 2.450 (0.57), 2.456 (0.67), 2.463 (1.22), 2.469 (1.51), 2.476 (1.48), 2.484 (1.77), 2.517 (0.76), 2.520 (0.73), 2.523 (0.57), 2.826 (0.69), 2.839 (1.33), 2.852 (1.51), 2.866 (1.87), 2.879 (0.87), 2.972 (1.15), 2.978 (1.19), 2.987 (1.24), 2.993 (1.19), 2.999 (0.94), 3.004 (0.89), 3.013 (0.85), 3.019 (0.75), 3.338 (3.68), 3.398 (0.51), 3.558 (0.53), 3.568 (2.60), 3.576 (6.35), 3.585 (4.12), 3.684 (1.95), 3.692 (4.19), 3.701 (3.62), 3.710 (1.33), 5.515 (0.84), 5.528 (2.43), 5.541 (2.41), 5.555 (0.80), 7.195 (0.86), 7.207 (2.64), 7.216 (3.91), 7.219 (4.26), 7.228 (2.98), 7.230 (2.98), 7.240 (1.27), 7.265 (3.39), 7.276 (2.07), 7.355 (2.95), 7.366 (2.41), 7.533 (1.96), 7.545 (2.81), 7.559 (2.13), 7.613 (4.94), 7.617 (4.00), 7.629 (16.00), 7.632 (10.79), 7.748 (3.54), 7.760 (3.14), 8.100 (1.02), 8.136 (6.62), 8.382 (2.78), 8.396 (2.64), 8.586 (8.69), 8.913 (2.35), 8.927 (2.27).
299	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.72 分; MS (ESIpos): m/z = 546 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 11.89 (d, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.58 – 7.66 (m, 3H), 7.50 – 7.58 (m, 1H), 7.10 – 7.30 (m, 4H), 5.51 – 5.65 (m, 1H), 4.70 (brd, 1H), 3.95 (brd, 1H), 3.17 (brs, 1H), 2.76 – 2.99 (m, 2H), 2.30 – 2.43 (m, 3H), 1.88 – 2.08 (m, 4H).

300	2, 6	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.14 分；MS（ESIpos）：m/z = 546 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.060 (0.42), 2.066 (0.45), 2.075 (0.47), 2.088 (0.65), 2.094 (0.56), 2.183 (0.44), 2.193 (0.60), 2.203 (0.58), 2.210 (0.55), 2.443 (1.65), 2.460 (1.72), 3.126 (0.42), 3.139 (0.95), 3.155 (0.91), 3.168 (0.40), 3.453 (1.32), 3.468 (1.45), 3.473 (1.52), 3.487 (1.39), 3.880 (1.72), 3.887 (1.73), 3.902 (1.54), 3.909 (1.48), 4.231 (0.98), 4.237 (0.78), 4.247 (1.45), 4.254 (1.38), 4.268 (0.84), 4.653 (1.89), 4.662 (1.90), 5.254 (0.43), 5.266 (0.90), 5.281 (0.89), 6.781 (1.78), 6.797 (1.91), 6.891 (0.89), 6.906 (1.77), 6.921 (0.96), 7.149 (0.84), 7.152 (0.86), 7.166 (1.42), 7.180 (0.70), 7.389 (1.48), 7.403 (1.38), 7.651 (16.00), 7.694 (1.17), 7.708 (1.63), 7.725 (1.38), 7.846 (1.88), 7.859 (1.51), 8.297 (1.59), 8.313 (1.46), 8.833 (5.84), 9.232 (1.60), 9.248 (1.53).
301	3, 3	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.21 分；MS（ESIpos）：m/z = 576 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.006 (0.68), 2.065 (0.46), 2.072 (0.53), 2.084 (0.50), 2.093 (0.68), 2.099 (0.58), 2.106 (0.41), 2.204 (0.47), 2.213 (0.62), 2.222 (0.62), 2.230 (0.60), 2.518 (0.74), 3.356 (1.31), 3.379 (1.39), 3.420 (1.28), 3.443 (1.40), 3.759 (0.97), 3.785 (1.89), 3.799 (2.05), 3.813 (2.09), 3.819 (1.80), 4.030 (0.93), 4.054 (2.69), 4.066 (2.67), 4.084 (2.39), 4.108 (0.98), 4.252 (1.06), 4.258 (0.86), 4.268 (1.59), 4.275 (1.59), 4.288 (0.92), 5.257 (0.45), 5.269 (0.98), 5.284 (0.95), 5.295 (0.42), 6.789 (1.89), 6.805 (2.04), 6.916 (0.91), 6.931 (1.88), 6.946 (1.06), 7.155 (0.89), 7.158 (0.91), 7.172 (1.53), 7.186 (0.73), 7.396 (1.60), 7.410 (1.49), 7.641 (16.00), 7.674 (1.24), 7.688 (1.77), 7.705 (1.45), 7.813 (1.96), 7.815 (1.98), 7.827 (1.59), 8.614 (1.68), 8.631 (1.59), 8.696 (5.91), 9.169 (1.74), 9.186 (1.68).
302		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.32 分；MS（ESIpos）：m/z = 560 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.006 (1.48), 1.977 (2.45), 1.985 (3.20), 2.061 (0.94), 2.067 (1.00), 2.073 (1.28), 2.089 (1.37), 2.094 (1.18), 2.101 (0.84), 2.107 (0.62), 2.196 (0.68), 2.205 (1.01), 2.212 (1.42), 2.222 (1.44), 2.230 (1.70), 2.240 (1.49), 2.252 (3.88), 2.271 (3.21), 2.292 (0.43), 2.361 (0.59), 2.518 (1.55), 2.522 (1.14), 2.635 (0.56), 2.976 (2.42), 2.998 (2.58), 3.014 (2.43), 3.037 (2.48), 3.530 (3.55), 3.548 (2.59), 3.554 (3.28), 4.225 (0.63), 4.230 (0.76), 4.247 (2.09), 4.253 (1.54), 4.264 (1.81), 4.271 (1.84), 4.281 (1.90), 4.287 (1.63), 4.294 (1.74), 4.303 (0.69), 4.309 (0.76), 4.316 (0.55), 4.414 (3.03), 5.247 (0.90), 5.259 (1.92), 5.274

			(1.85), 5.285 (0.82), 6.790 (3.65), 6.806 (3.88), 6.922 (1.77), 6.936 (3.59), 6.951 (2.00), 7.158 (1.76), 7.160 (1.81), 7.174 (2.97), 7.188 (1.47), 7.191 (1.38), 7.393 (3.10), 7.408 (2.87), 7.625 (10.72), 7.629 (16.00), 7.639 (5.39), 7.643 (5.55), 7.646 (2.39), 7.726 (0.54), 7.729 (0.50), 7.740 (2.23), 7.755 (3.44), 7.771 (2.93), 7.838 (3.90), 7.840 (4.07), 7.852 (2.90), 8.405 (3.15), 8.420 (2.90), 8.693 (11.68), 9.142 (3.37), 9.159 (3.24).
303	3,94		^{1}H-NMR(399,9532 MHz, DMSO): δ= 9.1897 (3.07); 9.1697 (3.08); 8.6999 (11.32); 8.267 (3.04); 8.2457 (3.34); 8.0999 (0.52); 8.0853 (0.45); 7.842 (3.13); 7.8244 (4.12); 7.72 (2.82); 7.6994 (3.57); 7.681 (2.24); 7.4668 (0.34); 7.4303 (0.34); 7.3979 (2.99); 7.3791 (3.33); 7.3415 (5.08); 7.3244 (4.63); 7.3196 (4.47); 7.3043 (1.56); 7.299 (1.58); 7.2806 (2.03); 7.2747 (2.74); 7.2519 (1.45); 7.1994 (1.49); 7.1795 (3.11); 7.1614 (1.93); 6.936 (2.19); 6.9174 (3.63); 6.8989 (1.79); 6.8126 (4.03); 6.7941 (3.62); 6.5851 (0.63); 6.5692 (0.59); 5.2851 (0.87); 5.2712 (1.94); 5.2526 (2.07); 5.238 (0.95); 4.3128 (0.7); 4.296 (1.79); 4.2741 (2.81); 4.253 (1.76); 4.2464 (2.03); 4.2239 (0.71); 3.9767 (2.68); 3.968 (2.61); 3.3189 (223.97); 3.2442 (2.16); 3.2141 (4.55); 3.1853 (2.46); 2.959 (1.92); 2.9418 (6.23); 2.9307 (3.17); 2.9237 (3.11); 2.9044 (1.79); 2.8953 (1.74); 2.6699 (3.71); 2.5052 (502.23); 2.5009 (661.81); 2.4966 (520.68); 2.3275 (3.85); 2.266 (0.88); 2.2232 (1.38); 2.2135 (1.48); 2.2008 (1.46); 2.1924 (1.27); 2.0867 (1.57); 2.0741 (1.82); 1.2862 (0.38); 1.2687 (0.48); 1.1687 (2.99); 1.1489 (14.24); 1.1439 (16); 1.1337 (15.75); 1.1285 (15.3); 0.9796 (0.37); 0.1461 (0.77); −0.0001 (185.99); −0.1498 (0.83)
304	4,03		^{1}H-NMR(399,9532 MHz, DMSO): δ= 9.1774 (0.67); 9.1576 (0.76); 8.5944 (2.4); 8.2724 (1.07); 8.2562 (1.18); 7.9525 (2.49); 7.7608 (0.4); 7.7376 (0.43); 7.7214 (0.76); 7.705 (2.49); 7.689 (1.82); 7.6851 (2.8); 7.6687 (1.86); 7.6537 (0.93); 7.5047 (0.32); 7.4854 (0.91); 7.4653 (1.16); 7.4546 (0.67); 7.4446 (1.44); 7.4361 (1.53); 7.4247 (0.93); 7.4155 (0.83); 7.3794 (1.2); 7.3566 (1.16); 7.3429 (0.88); 7.3272 (1.2); 7.3088 (0.58); 7.1857 (0.62); 7.1676 (1.13); 7.1481 (0.72); 6.9174 (0.63); 6.8992 (0.95); 6.8804 (0.48); 6.8023 (1.65); 6.7815 (1.43); 5.2499 (0.69); 5.2313 (0.63); 4.2592 (0.98); 4.2328 (0.72); 3.9863 (0.92); 3.3191 (221.03); 3.2639 (0.83); 3.2244

			(0.64) ; 3.1788 (0.44) ; 2.9416 (2.82) ; 2.9215 (1.53) ; 2.8905 (16) ; 2.7311 (14.48) ; 2.6702 (3.3) ; 2.5232 (7.65) ; 2.5054 (445.22) ; 2.5012 (567.66) ; 2.497 (406.38) ; 2.3321 (2.56) ; 2.3276 (3.26) ; 2.2056 (0.52) ; 2.1956 (0.59) ; 2.1834 (0.61) ; 2.0737 (0.9) ; 1.1689 (1.1) ; 1.1501 (5.7) ; 1.135 (5.9) ; 0.1463 (0.73) ; 0.0077 (6.72) ; -0.0003 (158.9) ; -0.1492 (0.77)
305	4, 13		^{1}H-NMR (399, 9532 MHz, DMSO) : δ= 9.0348 (1.54) ; 9.027 (1.53) ; 9.0145 (1.71) ; 8.5999 (5.17) ; 8.5952 (4.9) ; 8.3156 (0.56) ; 8.2763 (2.51) ; 8.2726 (2.47) ; 8.2556 (2.81) ; 8.2518 (2.69) ; 7.761 (0.83) ; 7.7408 (1.05) ; 7.7366 (1.17) ; 7.7204 (1.9) ; 7.7118 (3.55) ; 7.7079 (3.89) ; 7.7027 (4.15) ; 7.6918 (4.33) ; 7.6878 (4.41) ; 7.6822 (4.39) ; 7.6687 (4.22) ; 7.6652 (4.79) ; 7.651 (2.14) ; 7.505 (0.9) ; 7.4854 (1.99) ; 7.4656 (2.95) ; 7.4594 (1.58) ; 7.4449 (3.55) ; 7.4401 (3.42) ; 7.4255 (3.77) ; 7.4152 (3.13) ; 7.3825 (1.69) ; 7.3796 (1.25) ; 7.3635 (1.11) ; 7.3418 (1.95) ; 7.3288 (2.47) ; 7.3136 (1.38) ; 7.2798 (1.9) ; 7.2633 (3.48) ; 7.2506 (1.55) ; 7.2324 (3.2) ; 7.2181 (3.48) ; 7.2031 (2.13) ; 7.1855 (0.81) ; 7.1649 (0.41) ; 7.1441 (0.33) ; 6.5786 (0.32) ; 5.5633 (0.47) ; 5.5512 (0.67) ; 5.5336 (1.2) ; 5.5215 (1.33) ; 5.5153 (1.19) ; 3.9808 (2.15) ; 3.6332 (0.34) ; 3.3942 (0.37) ; 3.3649 (0.63) ; 3.3197 (538.15) ; 3.2493 (2.06) ; 3.221 (1.81) ; 3.1926 (1) ; 3.1655 (0.46) ; 3.0162 (0.77) ; 2.9635 (3.49) ; 2.9414 (4.71) ; 2.9076 (2.72) ; 2.8901 (1.88) ; 2.8843 (2.04) ; 2.8632 (1.51) ; 2.8439 (1.23) ; 2.8236 (0.74) ; 2.761 (0.33) ; 2.7302 (1.28) ; 2.7155 (0.39) ; 2.6747 (4.3) ; 2.67 (5.87) ; 2.6656 (4.46) ; 2.6168 (0.41) ; 2.5905 (0.52) ; 2.5232 (16.08) ; 2.5054 (777.81) ; 2.501 (1009.77) ; 2.4966 (729.53) ; 2.4266 (0.57) ; 2.3322 (4.4) ; 2.3277 (5.87) ; 2.3234 (4.4) ; 2.2742 (0.35) ; 2.2675 (0.52) ; 2.2222 (0.32) ; 2.1718 (0.36) ; 2.105 (1.65) ; 2.0945 (1.09) ; 2.0739 (3) ; 1.9705 (0.53) ; 1.9506 (1.22) ; 1.9296 (1.19) ; 1.919 (1.2) ; 1.8967 (1.12) ; 1.8764 (0.43) ; 1.2914 (0.37) ; 1.2694 (0.4) ; 1.1687 (2.59) ; 1.1444 (16) ; 1.1291 (15.53) ; 1.0966 (0.51) ; 0.9654 (0.39) ; 0.1461 (1.27) ; 0.0078 (11.48) ; -0.0002 (299.28) ; -0.0082 (14.69) ; -0.1498 (1.31)
306	4, 03		^{1}H-NMR (399, 9532 MHz, DMSO) : δ= 9.0457 (2.18) ; 9.0244 (2.21) ; 8.7059 (8.46) ; 8.3157 (0.33) ; 8.2677 (2.18) ; 8.2494 (2.31) ; 8.0868 (0.34) ; 7.8391 (2.16) ; 7.8242 (2.96) ; 7.7196 (2.12) ; 7.6988 (2.55) ; 7.6804 (1.63) ; 7.4555 (1.75) ; 7.4412 (2.02) ; 7.3429

			(3.69); 7.3267 (3.62); 7.3056 (1.37); 7.2952 (1.61); 7.2766 (4); 7.26 (2.09); 7.2539 (1.54); 7.2464 (3.22); 7.2405 (3.62); 7.2316 (3.27); 7.2236 (2.72); 7.2048 (0.59); 7.1689 (0.57); 7.1519 (0.6); 7.1375 (0.42); 6.5782 (0.53); 5.5813 (0.59); 5.5623 (1.71); 5.5425 (1.78); 5.5244 (0.59); 3.9738 (1.83); 3.3197 (331.29); 3.2386 (1.55); 3.2294 (1.7); 3.2119 (1.9); 3.2003 (1.93); 3.0346 (0.53); 3.0265 (0.64); 3.0133 (0.66); 2.9954 (1.02); 2.9859 (1.13); 2.9726 (3.04); 2.9417 (5.18); 2.917 (2.47); 2.897 (1.7); 2.8769 (1.23); 2.8572 (0.9); 2.8366 (0.65); 2.7309 (0.37); 2.6701 (3.8); 2.5751 (0.52); 2.5672 (0.55); 2.5566 (1); 2.5452 (1.54); 2.5053 (506.49); 2.501 (657.35); 2.4967 (480.65); 2.355 (0.43); 2.3278 (3.92); 2.2456 (0.33); 2.2001 (0.4); 2.1674 (0.46); 2.0952 (0.44); 2.074 (1.44); 1.9927 (0.53); 1.9724 (1.13); 1.9617 (0.71); 1.9517 (1.18); 1.9397 (1.1); 1.9195 (1.05); 1.8986 (0.43); 1.2999 (0.38); 1.2692 (0.54); 1.1689 (3.6); 1.145 (16); 1.1296 (15.96); 1.1004 (0.93); 0.9694 (0.35); 0.1465 (0.88); 0.0077 (7.81); -0.0003 (197.85); -0.1495 (0.91)
307		LC-MS（方法 L3）：R_t= 4.12 分；m/z = 501/503 (M+1)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.19 (dd, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 7.1, 1.4 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.5, 7.1 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.40 – 7.31 (m, 2H), 7.24 – 7.13 (m, 2H), 6.97 – 6.88 (m, 1H), 6.
308		LC-MS（方法 L3）：R_t= 4.61 分；m/z = 535/537 (M+1)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 7.1, 1.3 Hz, 1H), 7.63 (s, 3H), 7.37 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.22 – 7.13 (m, 1H), 6.97 – 6.90 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 5.30 – 5.
309		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.08 分，m/z = 564 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.31 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.67 – 7.60 (m, 2H), 7.44 – 7.31 (m, 2H), 7.25 – 7.11 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.31 – 4.18 (m, 2H),
310		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.26 分，m/z = 564/566（Cl2 パターン）(M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.70 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.40 – 7.30 (m, 3H), 7.20 – 7.13 (m, 1H), 6.95 – 6.88 (m, 1H), 6.82 – 6.76 (m, 1H), 5.28 – 5.20 (m, 1H), 4.32
311		LC-MS（方法 L3）：	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.17 (dd, J = 8.5,

		R_t= 4.51 分; m/z = 501/503 (M+1)+	1.4 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 7.1, 1.4 Hz, 1H), 7.67 - 7.58 (m, 2H), 7.51 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 1H
312		LC-MS (方法 L3): R_t= 4.72 分; m/z = 453 (M+1)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.15 (dd, J = 8.3, 1.6 Hz, 1H), 7.67 - 7.56 (m, 2H), 7.36 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.21 - 7.10 (m, 2H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.83 - 6.77 (m, 1H), 6.75 - 6.68 (m, 2H), 6.58 - 6.52 (m, 1H), 5.6
313		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.43 分; m/z = 502 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.32 (m, 1H), 7.81 - 7.68 (m, 2H), 7.58 - 7.47 (m, 1H), 7.37 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.25 - 7.12 (m, 3H), 6.92 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.26 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 4.26 (m, 2H), 3.88 (t,
314		LC-MS (方法 L2): R_t= 4.05 分, m/z = 602 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.23 (dd, J = 8.1, 4.6 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.56 - 7.41 (m, 1H), 7.40 - 7.23 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.99 - 6.86 (m, 1
315		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.80 分, m/z = 560 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.14 (dd, J = 8.1, 4.3 Hz, 1H), 8.60 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.48 - 7.40 (m, 1H), 7.37 - 7.27 (m, 2H), 7.15 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.93 - 6.87 (m, 1
316		LC-MS (方法 L3): R_t= 4.65 分, m/z = 526/528 (M+H)	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.15 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.20 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.67 (s, 3H), 7.36 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.21 - 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.28 - 5.2
317		LC-MS (方法 L6): R_t= 1.40 分; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.21), -0.008 (16.00), 0.008 (10.22), 0.146 (1.17), 1.679 (1.28), 1.768 (1.70), 2.062 (1.06), 2.328 (2.24), 2.367 (1.03), 2.524 (9.61), 2.671 (2.06), 2.711 (1.03), 3.648 (2.70), 3.664 (3.87), 3.681 (2.16), 3.818 (1.95), 3.833 (2.52), 3.851 (2.87), 4.252 (2.94), 4.451 (2.59), 5.176 (1.63), 5.755 (3.23), 6.818 (1.81), 6.837 (1.70), 6.894 (1.31), 7.193 (1.60), 7.294 (1.38), 7.620 (3.48), 7.628 (4.43), 7.672 (1.77), 7.692 (1.42), 7.833 (2.98), 7.865 (1.63), 7.970 (6.14), 8.217 (1.67), 8.234 (1.67), 8.477 (2.98), 8.881 (10.47), 9.374 (0.85).
318		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.81 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.83), -0.008 (6.59), 0.146 (0.79), 1.156 (0.87), 1.175 (1.80), 1.192 (0.87), 1.235 (0.41), 1.660 (1.14), 1.679 (1.24), 1.690

	(ESIpos): m/z = 548 [M+H]+	(1.49), 1.710 (1.37), 1.903 (1.53), 1.988 (3.52), 1.999 (1.41), 2.012 (2.20), 2.028 (2.14), 2.048 (1.84), 2.058 (1.57), 2.165 (1.18), 2.181 (1.02), 2.197 (0.75), 2.327 (1.16), 2.366 (0.85), 2.393 (1.28), 2.411 (1.60), 2.428 (1.39), 2.669 (1.26), 2.709 (0.81), 3.162 (2.53), 3.175 (2.69), 3.381 (0.77), 3.408 (1.45), 3.421 (1.62), 3.440 (1.20), 3.467 (1.26), 3.483 (3.03), 3.494 (2.47), 3.510 (2.92), 3.528 (1.91), 3.676 (1.47), 3.697 (2.53), 3.716 (2.92), 3.724 (2.72), 3.742 (3.19), 3.768 (1.62), 4.020 (0.71), 4.038 (0.79), 4.073 (0.66), 4.087 (0.68), 4.172 (0.56), 4.254 (4.73), 4.264 (2.90), 4.717 (2.13), 4.729 (4.29), 4.742 (2.05), 5.193 (0.81), 5.207 (1.74), 5.226 (1.76), 5.240 (0.87), 5.754 (0.50), 6.777 (3.46), 6.797 (3.81), 6.896 (1.66), 6.913 (3.44), 6.931 (1.97), 7.144 (1.84), 7.161 (2.90), 7.180 (1.41), 7.319 (2.94), 7.338 (2.71), 7.477 (2.16), 7.496 (2.96), 7.517 (2.65), 7.606 (4.71), 7.610 (5.82), 7.619 (16.00), 7.623 (9.06), 7.711 (3.79), 7.727 (3.19), 7.873 (0.50), 8.267 (3.11), 8.288 (2.92), 8.442 (11.23), 9.024 (3.13), 9.044 (3.03).
319	LC-MS (方法 L6): R_t= 1.94 分; MS (ESIpos): m/z = 500 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.062 (2.28), 2.197 (2.14), 2.209 (2.13), 2.218 (2.01), 2.327 (0.67), 2.670 (0.64), 3.876 (16.00), 4.213 (1.25), 4.234 (3.18), 4.254 (4.91), 4.262 (4.94), 5.244 (2.95), 5.261 (2.87), 6.776 (4.46), 6.796 (4.81), 6.893 (2.44), 6.911 (4.65), 6.930 (2.84), 7.142 (2.94), 7.161 (4.44), 7.179 (2.33), 7.351 (7.88), 7.369 (5.89), 7.391 (2.42), 7.416 (5.69), 7.423 (5.81), 7.435 (5.30), 7.454 (2.26), 7.537 (3.95), 7.553 (3.04), 7.629 (3.41), 7.645 (5.92), 7.671 (3.87), 7.691 (4.59), 7.709 (2.20), 8.265 (4.40), 8.285 (4.07), 8.575 (9.62), 9.149 (3.43), 9.168 (3.26).
320	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.27 分; MS (ESIpos): m/z = 590 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.006 (0.66), 0.006 (0.45), 0.992 (6.88), 1.006 (14.64), 1.020 (7.28), 1.175 (0.69), 1.914 (0.43), 1.921 (0.59), 1.928 (1.00), 1.935 (0.80), 1.941 (0.98), 1.949 (0.81), 1.963 (0.80), 1.975 (1.05), 1.988 (2.98), 1.999 (2.31), 2.015 (2.16), 2.027 (1.48), 2.044 (1.11), 2.050 (0.91), 2.056 (0.64), 2.169 (0.46), 2.176 (0.69), 2.186 (0.98), 2.196 (1.00), 2.204 (0.98), 2.214 (0.73), 2.221 (0.48), 2.363 (0.83), 2.379 (0.99), 2.392 (0.95), 2.407 (0.54), 2.519 (0.54), 3.335 (0.80), 3.347 (1.08), 3.351 (1.20), 3.361 (1.13), 3.375 (0.71), 3.865 (0.61), 3.878 (1.35), 3.895 (1.41), 3.903 (1.08), 3.911 (1.18), 3.917 (0.96), 3.925 (2.97), 3.936

			(3.39), 3.939 (3.31), 3.950 (2.96), 3.957 (0.88), 3.964 (0.87), 3.972 (0.69), 4.173 (0.74), 4.201 (0.52), 4.206 (0.61), 4.223 (1.57), 4.229 (1.11), 4.240 (1.23), 4.246 (1.02), 4.259 (1.03), 4.266 (1.36), 4.272 (1.21), 4.279 (1.31), 4.288 (0.64), 4.294 (0.66), 4.301 (0.49), 4.604 (1.49), 4.615 (1.69), 4.621 (1.65), 4.631 (1.40), 5.243 (0.66), 5.254 (1.44), 5.270 (1.42), 5.281 (0.66), 5.754 (0.82), 6.792 (2.76), 6.807 (2.92), 6.809 (2.90), 6.925 (1.36), 6.927 (1.41), 6.940 (2.72), 6.942 (2.70), 6.955 (1.55), 6.957 (1.49), 7.168 (1.42), 7.171 (1.43), 7.185 (2.32), 7.199 (1.13), 7.201 (1.08), 7.397 (2.28), 7.411 (2.13), 7.636 (4.40), 7.639 (7.81), 7.642 (16.00), 7.645 (6.46), 7.653 (2.33), 7.667 (2.83), 7.670 (2.89), 7.684 (2.31), 7.725 (0.57), 7.729 (0.54), 7.819 (2.92), 7.822 (3.03), 7.834 (2.48), 7.836 (2.40), 8.343 (2.59), 8.345 (2.59), 8.360 (2.42), 8.362 (2.31), 8.680 (9.87), 9.196 (2.58), 9.212 (2.50).
321	3, 37		^{1}H-NMR (399, 953 MHz, CDCl3) : δ= 9.1126 (4.72) ; 9.0958 (4.88) ; 9.0618 (1.78) ; 9.0408 (2.05) ; 8.1159 (0.51) ; 8.1073 (0.56) ; 8.0994 (0.58) ; 8.0917 (0.65) ; 8.0616 (0.48) ; 8.0511 (0.51) ; 8.0462 (0.52) ; 8.0366 (0.54) ; 7.9006 (1.45) ; 7.881 (1.8) ; 7.8347 (1.41) ; 7.8147 (2.11) ; 7.7661 (4.49) ; 7.761 (4.21) ; 7.7476 (6.54) ; 7.7434 (5.71) ; 7.7362 (3.9) ; 7.7155 (2.95) ; 7.6982 (1.01) ; 7.5821 (4.98) ; 7.5623 (5.73) ; 7.52 (0.37) ; 7.5044 (1.22) ; 7.4823 (1.25) ; 7.3467 (2.17) ; 7.3277 (5.49) ; 7.3079 (3.8) ; 7.2837 (3.47) ; 7.2612 (26.99) ; 7.2424 (6.4) ; 7.2359 (6.6) ; 7.2239 (5.17) ; 7.2163 (7.07) ; 7.1926 (3.1) ; 7.1696 (0.93) ; 6.9454 (1.11) ; 6.9262 (1.9) ; 6.9079 (0.91) ; 6.8815 (1.42) ; 6.8676 (6.02) ; 6.847 (7.37) ; 6.8332 (1.46) ; 6.8255 (2.03) ; 6.7513 (0.44) ; 6.7294 (0.44) ; 6.6499 (0.51) ; 6.6309 (0.48) ; 5.463 (0.52) ; 5.4511 (1.1) ; 5.4396 (1.55) ; 5.4277 (2.06) ; 5.4166 (1.59) ; 5.4055 (1.17) ; 5.3934 (0.57) ; 5.3772 (0.45) ; 5.3618 (0.93) ; 5.3447 (0.94) ; 5.3304 (0.42) ; 5.2987 (1.1) ; 4.345 (1.6) ; 4.327 (2.15) ; 4.3161 (2.64) ; 4.2918 (0.9) ; 4.284 (0.68) ; 4.2127 (0.88) ; 4.189 (2.02) ; 4.1633 (2.43) ; 4.1436 (2.4) ; 4.1261 (3.47) ; 4.1083 (3.64) ; 4.0904 (1.16) ; 3.2611 (13.51) ; 3.0936 (5.9) ; 3.0503 (16) ; 3.0032 (13.51) ; 2.9661 (13.47) ; 2.9245 (13.29) ; 2.3901 (0.54) ; 2.38 (0.86) ; 2.3661 (1.02) ; 2.3536 (1.63) ; 2.3427 (1.92) ; 2.3298 (1.66) ; 2.316 (1.68) ; 2.3065 (1.38) ; 2.2921 (0.68) ; 2.28 (0.49) ; 2.2702 (0.36) ; 2.1215 (1.79) ; 2.1092 (1.54) ; 2.1028 (1.49) ; 2.0868 (2) ; 2.0744 (1.46) ; 2.0598 (0.73) ; 2.041 (13.3) ; 1.5769

			(18.97); 1.3654 (0.45); 1.3479 (0.92); 1.3301 (0.51); 1.2747 (3.51); 1.2568 (7.17); 1.239 (3.48); −0.0003 (15.15)
322		LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.26 分；MS (ESIpos)：m/z = 550 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (1.57), −0.008 (16.00), 0.008 (12.28), 0.146 (1.64), 1.049 (0.50), 2.087 (0.63), 2.327 (3.21), 2.366 (2.46), 2.523 (10.58), 2.669 (3.09), 2.710 (2.46), 3.611 (1.20), 3.879 (3.72), 4.269 (1.01), 5.259 (0.69), 6.787 (1.26), 6.807 (1.51), 6.915 (0.76), 6.932 (1.39), 6.950 (0.76), 7.153 (0.76), 7.174 (1.13), 7.374 (1.20), 7.391 (1.89), 7.410 (1.26), 7.583 (1.70), 7.596 (2.08), 7.615 (1.70), 7.627 (1.95), 7.687 (0.94), 7.706 (1.26), 7.726 (1.32), 7.806 (1.45), 7.822 (1.32), 8.270 (1.39), 8.291 (1.20), 8.660 (4.66), 9.158 (1.20), 9.180 (1.13).
323		LC-MS（方法 L3）：R_t= 2.90 分；m/z = 543/545 (M+1)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.19 (dd, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 7.1, 1.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.4, 7.2 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.22 – 7.12 (m, 1H), 7.09 – 6.97 (m, 3H), 6.97 – 6.87 (m, 1H), 6.
324		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.91 分；m/z = 501/503 (M+1)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.17 (dd, J = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.67 – 7.50 (m, 2H), 7.34 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.23 – 7.06 (m, 2H), 6.97 – 6.86 (m, 1H), 6.86 – 6.67 (m, 3H), 5.33 – 5.18 (m, 1H), 4.37 – 4.15 (m, 2H), 3.0
325		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.19 分；m/z = 519/521 (M+1)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.20 (dd, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 7.1, 1.3 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.4, 7.2 Hz, 1H), 7.56 – 7.48 (m, 1H), 7.43 (dd, J = 13.3, 2.0 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.23 – 7.13 (m, 1H), 6.98 – 6.89 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 5.31 – 5.20 (m, 1H), 4.35 – 4.18 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.86 (d, J = 2.3 Hz, 6H), 2.28 – 2.13 (m, 1H), 2.13 – 1.99 (m, 1H).
326		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.86 分，m/z = 522（Cl2 パターン）(M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.01 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.66 – 7.55 (m, 2H), 7.43 – 7.30 (m, 2H), 7.23 – 7.12 (m, 2H), 6.89 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.21 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.30 – 4
327		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.96 分，m/z = 522（Cl2 パター	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.01 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.25 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.62 – 7.54 (m, 2H), 7.34 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.19 – 7.12 (m, 1H), 6.95 – 6.87 (m, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.27 – 5.18 (m,

		ン）(M+H)+	1H),
328	3,3		^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO)：δ= 9.1516 (1.99)；9.1309 (2.07)；8.6957 (7.38)；8.3158 (0.74)；8.1756 (2.08)；8.1554 (2.33)；7.8284 (2.07)；7.8125 (2.84)；7.6916 (1.99)；7.6725 (2.46)；7.6445 (16)；7.5625 (0.42)；7.5064 (0.53)；7.4855 (0.5)；7.4369 (0.53)；7.3832 (2.2)；7.3653 (2.36)；7.1937 (1.06)；7.1767 (2.08)；7.1581 (1.32)；6.948 (1.5)；6.9294 (2.46)；6.9118 (1.23)；6.8712 (0.85)；6.8097 (2.74)；6.79 (2.61)；6.6398 (0.41)；6.5791 (0.42)；5.2663 (0.57)；5.253 (1.33)；5.2338 (1.23)；5.2205 (0.6)；4.3072 (0.46)；4.2867 (1.27)；4.2736 (2.25)；4.2461 (1.37)；4.2259 (0.44)；3.5335 (1.43)；3.5183 (3.51)；3.503 (2.16)；3.374 (2.24)；3.3585 (3.93)；3.3413 (2.21)；3.32 (177.93)；3.1924 (2.23)；3.1748 (4.03)；3.1575 (2.36)；3.0637 (15.58)；2.6707 (3.2)；2.5016 (591.34)；2.3283 (3.36)；2.2181 (0.84)；2.2067 (0.96)；2.1977 (0.96)；2.1833 (1.83)；2.1627 (2.11)；2.1422 (4.09)；2.1222 (2.63)；2.0859 (5)；1.7864 (0.63)；1.7681 (1.98)；1.7497 (2.66)；1.7307 (1.77)；1.3554 (7.89)；1.2706 (0.49)；1.2335 (0.35)；1.1856 (0.35)；1.1692 (2.96)；0.1462 (1.19)；0 (271.12)；−0.1493 (1.3)
329		LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.80 分；MS (ESIpos)：m/z = 548 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.008 (0.68)，0.008 (0.56)，1.686 (0.43)，1.705 (0.40)，1.908 (16.00)，1.988 (0.70)，1.999 (0.46)，2.012 (0.70)，2.030 (0.70)，2.047 (0.66)，2.057 (0.44)，2.409 (0.49)，2.523 (0.51)，3.409 (0.50)，3.478 (0.83)，3.496 (0.94)，3.503 (0.93)，3.520 (0.72)，3.689 (0.90)，3.707 (1.31)，3.722 (1.18)，3.740 (0.74)，3.746 (0.64)，3.764 (0.47)，4.234 (0.64)，4.242 (0.95)，4.254 (1.33)，4.730 (0.48)，5.206 (0.55)，5.225 (0.56)，6.778 (1.01)，6.799 (1.13)，6.895 (0.51)，6.912 (1.07)，6.931 (0.64)，7.142 (0.52)，7.145 (0.56)，7.163 (0.88)，7.180 (0.43)，7.184 (0.43)，7.322 (0.91)，7.341 (0.85)，7.478 (0.75)，7.496 (0.99)，7.499 (0.92)，7.517 (0.89)，7.601 (0.47)，7.606 (1.15)，7.610 (1.62)，7.618 (4.75)，7.622 (2.49)，7.709 (1.15)，7.712 (1.18)，7.727 (1.01)，7.729 (0.98)，8.139 (0.93)，8.258 (0.90)，8.261 (0.90)，8.280 (0.91)，8.440 (3.42)，9.025 (1.00)，9.046 (0.98)。
330		LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.01 分；MS (ESIpos)：m/z = 510 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.008 (1.17)，0.008 (0.88)，2.021 (0.41)，2.030 (0.47)，2.036 (0.52)，2.073 (1.14)，2.169 (0.52)，2.181 (0.50)，2.191 (0.48)，2.523 (0.76)，3.082 (16.00)，4.220 (0.74)，4.226 (0.64)，4.240 (1.18)，4.249 (1.20)，4.265 (0.72)，5.213 (0.69)，5.229 (0.68)，5.754 (1.51)，6.772 (1.38)，6.792 (1.55)，6.878

			(0.73), 6.896 (1.52), 6.915 (0.91), 7.134 (0.75), 7.138 (0.79), 7.155 (1.26), 7.173 (0.63), 7.176 (0.61), 7.322 (1.30), 7.337 (1.39), 7.352 (0.91), 7.356 (0.87), 7.363 (0.63), 7.366 (0.62), 7.382 (0.84), 7.386 (0.81), 7.446 (0.76), 7.459 (0.83), 7.466 (1.28), 7.479 (1.28), 7.485 (0.72), 7.499 (0.63), 7.592 (1.03), 7.615 (1.76), 7.638 (1.08), 7.726 (1.39), 7.730 (1.40), 7.746 (1.23), 7.750 (1.17), 8.310 (0.92), 8.325 (1.02), 8.333 (0.99), 8.349 (0.90), 8.523 (2.23), 8.527 (2.23), 9.057 (0.86), 9.061 (0.87), 9.077 (0.86).
331	3,14		^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.1403 (1.94); 9.1288 (2); 9.1208 (2.32); 9.1103 (1.85); 8.6012 (10.54); 8.4715 (0.58); 8.3155 (1.57); 8.2143 (2.25); 8.1975 (2.56); 8.1729 (1.06); 7.7323 (2.07); 7.7127 (5.31); 7.6894 (10.46); 7.6737 (1.95); 7.4635 (1.67); 7.4521 (1.74); 7.4433 (2.94); 7.4332 (2.77); 7.4235 (2.08); 7.4143 (1.65); 7.3824 (1.86); 7.3618 (4.63); 7.3428 (4.44); 7.3225 (1.63); 7.1895 (1.81); 7.171 (3.64); 7.1535 (2.27); 6.9433 (2.6); 6.9255 (4.32); 6.9084 (2.02); 6.8059 (4.77); 6.7848 (4.45); 6.5782 (0.9); 5.2488 (1.97); 5.237 (2); 4.725 (1.91); 4.697 (7.04); 4.6722 (5.48); 4.6575 (5.6); 4.5955 (1.22); 4.5844 (1.61); 4.2921 (2.17); 4.2752 (3.94); 4.2675 (3.64); 4.2552 (2.23); 4.2471 (2.41); 4.2281 (0.89); 3.3183 (319.34); 3.2701 (0.87); 3.2496 (0.61); 3.1747 (0.71); 3.081 (16); 3.0759 (15.54); 2.9497 (1.08); 2.6703 (8.96); 2.5893 (0.63); 2.5051 (1239.6); 2.5012 (1583.24); 2.4971 (1204.24); 2.3276 (9.3); 2.2832 (0.88); 2.2475 (1.34); 2.2286 (1.72); 2.2205 (1.78); 2.1313 (0.96); 2.074 (5.92); 2.0168 (0.96); 1.2694 (0.87); 1.169 (4.47); 1.0034 (0.71); 0.9887 (0.75); 0.1463 (2.93); −0.0001 (642.47); −0.0792 (0.67); −0.1497 (3.13); −3.3083 (0.55)
332		LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.84 分；MS (ESIpos)：m/z = 562 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.57), 0.146 (0.52), 2.063 (1.66), 2.099 (1.25), 2.118 (1.43), 2.130 (1.93), 2.149 (2.41), 2.167 (1.95), 2.220 (1.77), 2.233 (1.79), 2.251 (1.61), 2.263 (1.00), 2.327 (1.50), 2.366 (0.82), 2.669 (1.50), 2.710 (0.73), 3.195 (1.82), 3.214 (2.75), 3.232 (2.11), 3.670 (1.75), 3.682 (1.88), 3.727 (1.27), 3.745 (3.54), 3.768 (4.92), 3.788 (5.88), 3.807 (3.11), 3.831 (1.00), 4.241 (3.47), 4.252 (4.68), 5.212 (2.04), 5.232 (2.04), 6.779 (3.36), 6.799 (3.81), 6.894 (1.72), 6.912 (3.65), 6.931 (2.13), 7.147 (1.88), 7.164 (3.13), 7.182 (1.54), 7.329

			(3.36), 7.347 (3.06), 7.522 (2.18), 7.542 (3.36), 7.562 (2.63), 7.623 (16.00), 7.742 (3.99), 7.759 (3.43), 8.257 (3.50), 8.277 (3.29), 8.501 (9.67), 9.095 (3.34), 9.115 (3.29), 12.559 (0.52).
333		LC-MS（方法 L6）：R_t= 2:56 分；MS (ESIpos)：m/z = 497 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: 2.092 (0.76), 3.286 (3.16), 4.171 (16.00), 4.267 (1.78), 5.273 (1.01), 6.793 (1.51), 6.817 (1.83), 6.912 (0.84), 6.931 (1.63), 6.949 (1.01), 7.160 (0.88), 7.182 (1.36), 7.359 (1.40), 7.378 (1.33), 7.703 (1.10), 7.723 (1.64), 7.741 (1.31), 7.843 (4.97), 7.859 (4.94), 7.903 (1.82), 7.917 (1.37), 8.294 (1.60), 8.297 (1.77), 8.315 (1.52), 8.816 (5.70), 9.194 (1.47), 9.213 (1.36).
334		LC-MS（方法 L7）：R_t= 2.60 分；MS (ESIpos)：m/z = 477 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.007 (4.15), 0.007 (3.67), 1.235 (1.26), 1.395 (7.56), 1.409 (16.00), 1.423 (7.72), 1.950 (1.18), 1.966 (1.28), 1.975 (1.34), 1.991 (1.30), 2.522 (1.98), 2.853 (1.24), 2.869 (1.51), 2.885 (1.92), 2.901 (0.85), 2.981 (1.03), 2.989 (1.09), 2.999 (1.11), 3.006 (1.07), 3.013 (0.81), 3.286 (5.84), 4.352 (1.51), 4.354 (1.53), 4.366 (4.56), 4.368 (4.83), 4.380 (4.46), 4.383 (4.79), 4.394 (1.38), 4.396 (1.51), 5.533 (0.78), 5.549 (2.29), 5.564 (2.27), 5.580 (0.78), 5.754 (0.91), 7.227 (2.02), 7.231 (3.49), 7.238 (4.46), 7.245 (4.52), 7.249 (3.34), 7.260 (1.11), 7.278 (2.99), 7.290 (1.65), 7.294 (1.20), 7.400 (2.19), 7.406 (2.33), 7.417 (2.00), 7.654 (2.35), 7.658 (5.35), 7.661 (4.98), 7.674 (15.77), 7.678 (10.55), 7.714 (2.52), 7.729 (3.39), 7.731 (3.32), 7.745 (2.97), 7.889 (3.47), 7.891 (3.80), 7.903 (3.01), 7.906 (3.03), 8.304 (3.32), 8.307 (3.57), 8.321 (3.16), 8.324 (3.16), 8.842 (11.93), 8.998 (2.83), 9.015 (2.77).
335		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.42 分；MS (ESIpos)：m/z = 507 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: −0.008 (1.09), 0.008 (1.03), 1.300 (13.37), 1.315 (15.22), 1.320 (15.14), 1.335 (13.44), 2.077 (1.40), 2.086 (1.14), 2.175 (0.96), 2.188 (1.01), 2.198 (1.11), 2.211 (0.97), 3.287 (1.40), 4.251 (1.94), 4.260 (2.90), 4.271 (3.78), 4.279 (2.28), 4.285 (1.96), 4.831 (0.79), 4.847 (2.11), 4.862 (2.86), 4.877 (2.07), 4.892 (0.76), 5.271 (1.74), 5.291 (1.73), 5.754 (1.60), 6.792 (2.95), 6.795 (3.21), 6.812 (3.38), 6.815 (3.52), 6.905 (1.65), 6.908 (1.68), 6.923 (3.35), 6.926 (3.31), 6.942 (2.06), 6.945 (1.96), 7.159 (1.66), 7.163 (1.75), 7.180 (2.64), 7.197 (1.36), 7.202 (1.34), 7.352 (2.66), 7.356 (2.66), 7.371 (2.57), 7.375 (2.32), 7.648 (1.92), 7.653 (4.51), 7.658 (3.68), 7.680 (16.00), 7.685 (11.73), 7.701 (2.83), 7.719

			(3.62), 7.722 (3.32), 7.740 (3.41), 7.880 (3.80), 7.884 (4.07), 7.898 (3.21), 7.902 (3.13), 8.304 (3.63), 8.308 (3.69), 8.325 (3.41), 8.329 (3.23), 8.844 (13.48), 9.131 (3.03), 9.152 (2.95).
336		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.47 分；MS (ESIpos)：m/z = 491 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]：-0.008 (3.40), 0.008 (3.27), 1.234 (1.59), 1.255 (13.29), 1.270 (13.33), 1.324 (13.22), 1.339 (13.35), 1.958 (1.08), 1.976 (1.27), 1.988 (1.33), 2.008 (1.28), 2.517 (2.28), 2.849 (1.21), 2.869 (1.58), 2.889 (2.03), 2.908 (0.90), 2.981 (1.12), 2.992 (1.19), 3.003 (1.21), 3.013 (1.12), 3.288 (2.34), 4.795 (0.80), 4.810 (2.09), 4.825 (2.87), 4.841 (2.06), 4.856 (0.77), 5.539 (2.27), 5.558 (2.27), 7.221 (2.05), 7.226 (3.83), 7.234 (4.60), 7.243 (5.51), 7.248 (3.90), 7.261 (1.41), 7.266 (1.19), 7.275 (3.08), 7.289 (1.56), 7.297 (1.00), 7.402 (2.18), 7.409 (2.34), 7.423 (1.93), 7.651 (2.03), 7.656 (4.64), 7.661 (3.85), 7.682 (16.00), 7.687 (11.77), 7.702 (2.80), 7.720 (3.59), 7.723 (3.36), 7.741 (3.39), 7.879 (3.80), 7.883 (4.13), 7.897 (3.21), 7.901 (3.15), 8.305 (3.55), 8.309 (3.70), 8.326 (3.40), 8.330 (3.18), 8.861 (12.80), 8.984 (2.98), 9.004 (2.89).
337		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.54 分；MS (ESIpos)：m/z = 517 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]：-0.008 (3.13), 0.008 (3.33), 1.233 (0.81), 1.599 (1.35), 1.607 (1.77), 1.618 (2.67), 1.624 (2.67), 1.655 (1.41), 1.671 (1.41), 1.685 (1.17), 1.707 (0.97), 1.760 (1.28), 1.773 (2.47), 1.785 (3.62), 1.791 (3.70), 1.799 (3.24), 1.804 (3.14), 1.813 (3.40), 1.818 (3.25), 1.824 (2.52), 1.829 (2.47), 1.852 (1.86), 1.861 (1.79), 1.873 (1.75), 1.952 (1.31), 1.963 (0.89), 1.970 (1.48), 1.982 (1.57), 1.990 (0.88), 2.002 (1.52), 2.021 (0.70), 2.517 (2.37), 2.845 (1.39), 2.865 (1.83), 2.885 (2.35), 2.905 (1.05), 2.979 (1.28), 2.989 (1.38), 3.001 (1.41), 3.011 (1.32), 3.018 (0.95), 3.029 (0.85), 3.040 (0.83), 3.288 (1.16), 5.212 (1.44), 5.218 (2.09), 5.224 (2.42), 5.229 (2.21), 5.236 (1.36), 5.518 (0.92), 5.537 (2.66), 5.556 (2.65), 5.575 (0.92), 5.754 (1.62), 7.218 (2.33), 7.223 (4.35), 7.231 (4.99), 7.240 (6.10), 7.245 (4.34), 7.258 (1.57), 7.263 (1.32), 7.272 (3.57), 7.287 (1.82), 7.294 (1.20), 7.412 (2.53), 7.419 (2.76), 7.433 (2.33), 7.647 (1.83), 7.652 (4.58), 7.657 (3.89), 7.676 (16.00), 7.680 (11.73), 7.694 (2.99), 7.712 (3.95), 7.715 (3.80), 7.733 (3.62), 7.868 (4.03), 7.871 (4.39), 7.885 (3.41), 7.889 (3.40), 8.250 (3.81), 8.254 (4.05), 8.271 (3.65), 8.274 (3.52), 8.818 (13.85), 9.049 (3.54), 9.069 (3.47).

338	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.62 分；MS (ESIpos)：m/z = 523 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]：-0.008 (1.69), 0.008 (1.48), 3.284 (16.00), 3.722 (1.56), 3.734 (2.60), 3.744 (1.75), 4.270 (1.58), 4.419 (0.92), 4.428 (1.44), 4.431 (1.39), 4.437 (1.43), 4.439 (1.46), 4.448 (0.90), 6.794 (1.04), 6.797 (1.09), 6.814 (1.20), 6.817 (1.20), 6.921 (1.21), 6.924 (1.15), 6.940 (0.75), 7.181 (0.92), 7.352 (0.93), 7.372 (0.91), 7.658 (1.44), 7.662 (1.50), 7.676 (5.94), 7.681 (3.69), 7.721 (0.99), 7.739 (1.31), 7.742 (1.17), 7.760 (1.24), 7.895 (1.40), 7.899 (1.44), 7.913 (1.18), 7.916 (1.10), 8.335 (1.30), 8.339 (1.31), 8.356 (1.25), 8.360 (1.14), 8.877 (4.74), 9.141 (1.07), 9.161 (1.04).
339	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.54 分；MS (ESIpos)：m/z = 549 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.149 (0.97), -0.008 (8.24), 0.008 (7.67), 0.146 (1.01), 1.147 (0.93), 1.750 (1.59), 1.915 (1.63), 2.075 (1.10), 2.204 (0.97), 2.366 (1.45), 2.669 (0.79), 2.710 (1.37), 3.287 (6.79), 3.337 (2.25), 3.366 (1.90), 3.390 (0.97), 3.865 (2.47), 3.895 (2.20), 4.253 (1.45), 4.282 (2.64), 4.748 (1.06), 4.758 (1.45), 5.272 (1.45), 5.292 (1.54), 6.795 (2.69), 6.798 (2.87), 6.815 (2.91), 6.818 (3.13), 6.910 (1.41), 6.913 (1.37), 6.929 (2.78), 6.932 (2.82), 6.948 (1.72), 6.951 (1.72), 7.165 (1.41), 7.169 (1.54), 7.189 (2.12), 7.208 (1.15), 7.387 (2.29), 7.407 (1.98), 7.652 (2.12), 7.657 (4.94), 7.661 (4.58), 7.678 (16.00), 7.683 (10.31), 7.725 (2.20), 7.742 (3.00), 7.746 (2.82), 7.764 (2.78), 7.894 (3.26), 7.898 (3.44), 7.912 (2.69), 7.916 (2.60), 8.366 (3.00), 8.370 (3.09), 8.387 (2.78), 8.391 (2.60), 8.852 (11.94), 9.170 (2.51), 9.191 (2.51).
340	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.35 分；MS (ESIpos)：m/z = 509 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：1.233 (1.46), 2.060 (1.17), 2.072 (1.22), 2.096 (1.85), 2.106 (1.52), 2.180 (1.45), 2.200 (1.60), 2.216 (1.38), 2.232 (1.09), 2.710 (0.59), 3.289 (2.29), 3.770 (2.50), 3.782 (6.45), 3.794 (6.45), 3.807 (2.58), 4.251 (3.09), 4.260 (3.55), 4.268 (6.08), 4.280 (3.73), 4.310 (0.75), 4.322 (1.11), 4.337 (3.05), 4.348 (6.79), 4.359 (6.81), 4.370 (2.86), 4.385 (0.96), 5.066 (2.32), 5.079 (4.75), 5.093 (2.23), 5.263 (1.21), 5.277 (2.42), 5.296 (2.39), 5.311 (1.08), 5.753 (12.22), 6.792 (4.39), 6.812 (4.98), 6.902 (2.47), 6.920 (4.70), 6.939 (2.63), 7.160 (2.23), 7.179 (3.73), 7.198 (2.03), 7.349 (3.82), 7.366 (3.59), 7.603 (0.66), 7.608 (0.74), 7.648 (2.33), 7.653 (5.18), 7.658 (5.13), 7.674 (16.00), 7.679 (12.12), 7.703 (2.84), 7.723 (4.62), 7.742 (3.57), 7.885 (3.87), 7.888 (4.97), 7.903 (3.20), 7.906

			(3.94), 8.442 (3.94), 8.445 (4.43), 8.463 (3.83), 8.466 (4.03), 8.845 (14.44), 9.174 (4.04), 9.194 (3.96).
341	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.64 分；MS (ESIpos)：m/z = 493 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：1.356 (12.14), 1.405 (7.22), 1.423 (15.61), 1.441 (7.48), 2.073 (1.45), 2.082 (1.17), 2.091 (0.93), 2.183 (2.15), 2.192 (0.97), 2.203 (0.95), 3.568 (4.88), 4.247 (1.66), 4.256 (2.16), 4.268 (2.79), 4.274 (2.58), 4.283 (1.57), 4.359 (1.14), 4.366 (1.13), 4.377 (3.75), 4.383 (3.69), 4.394 (3.64), 4.401 (3.71), 4.412 (1.11), 4.418 (1.11), 5.274 (1.50), 5.294 (1.49), 6.793 (2.69), 6.796 (2.93), 6.814 (3.05), 6.817 (3.20), 6.871 (0.97), 6.908 (1.45), 6.911 (1.48), 6.927 (2.96), 6.930 (2.93), 6.946 (1.82), 6.949 (1.73), 7.160 (1.45), 7.165 (1.54), 7.182 (2.32), 7.199 (1.17), 7.203 (1.14), 7.352 (2.34), 7.372 (2.26), 7.376 (2.03), 7.650 (1.93), 7.655 (4.49), 7.659 (4.77), 7.672 (16.00), 7.677 (9.62), 7.709 (2.46), 7.727 (3.23), 7.730 (3.00), 7.748 (3.04), 7.888 (3.41), 7.891 (3.59), 7.905 (2.88), 7.909 (2.77), 8.301 (3.25), 8.305 (3.35), 8.322 (3.10), 8.326 (2.87), 8.833 (12.05), 9.137 (2.57), 9.158 (2.52).
342	LC-MS（方法 L6）：R_t= 3.11 分；MS (ESIpos)：m/z = 533 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：0.951 (16.00), 1.175 (0.68), 1.783 (0.75), 1.802 (1.29), 1.820 (0.77), 1.988 (1.34), 4.409 (0.73), 4.414 (0.72), 7.655 (0.81), 7.659 (0.83), 7.670 (2.53), 7.675 (1.64), 7.720 (0.69), 7.878 (0.71), 8.816 (2.01).
343	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.84 分；MS (ESIpos)：m/z = 557 [M+H]+		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.008 (2.37), 0.008 (1.76), 1.147 (1.15), 1.926 (1.02), 1.944 (1.15), 1.957 (1.15), 1.976 (1.22), 2.366 (1.63), 2.710 (1.69), 2.838 (0.95), 2.858 (1.29), 2.878 (1.69), 2.956 (0.88), 2.966 (1.02), 2.979 (1.02), 2.987 (1.02), 3.289 (3.66), 5.382 (7.73), 5.386 (8.00), 5.415 (0.75), 5.565 (2.03), 5.584 (1.97), 7.132 (0.88), 7.150 (2.37), 7.169 (1.69), 7.204 (1.97), 7.223 (4.00), 7.232 (2.03), 7.242 (1.97), 7.252 (1.29), 7.264 (3.53), 7.282 (1.69), 7.318 (2.24), 7.336 (4.81), 7.365 (1.76), 7.381 (2.98), 7.400 (2.92), 7.447 (1.15), 7.463 (1.76), 7.468 (1.97), 7.483 (2.10), 7.488 (1.29), 7.503 (1.08), 7.661 (1.56), 7.666 (3.80), 7.670 (4.95), 7.681 (16.00), 7.686 (9.15), 7.718 (2.51), 7.736 (3.19), 7.739 (3.12), 7.757 (3.05), 7.903 (3.39), 7.906 (3.80), 7.920 (2.92), 7.924 (2.98), 8.278 (3.12), 8.281 (3.46), 8.299 (3.05), 8.303 (2.98), 8.913 (11.73), 9.095 (2.71), 9.115 (2.71).

344	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.84 分；MS（ESIpos）：m/z = 575 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.235 (1.30), 1.935 (1.60), 1.954 (1.98), 1.965 (2.10), 1.986 (1.91), 2.005 (0.73), 2.672 (0.79), 2.711 (0.59), 2.843 (1.62), 2.863 (2.27), 2.884 (2.82), 2.904 (1.36), 2.969 (1.94), 2.982 (1.99), 5.450 (1.65), 5.478 (7.32), 5.493 (7.42), 5.522 (1.77), 5.546 (1.27), 5.563 (3.23), 5.583 (3.15), 5.601 (1.18), 7.146 (1.70), 7.164 (4.06), 7.182 (3.27), 7.207 (2.49), 7.224 (4.59), 7.242 (2.89), 7.264 (6.36), 7.282 (5.13), 7.311 (1.84), 7.392 (5.56), 7.410 (6.38), 7.434 (2.03), 7.473 (1.31), 7.495 (2.55), 7.518 (2.46), 7.540 (1.11), 7.665 (7.07), 7.680 (16.00), 7.706 (2.83), 7.724 (4.62), 7.744 (2.99), 7.898 (4.83), 7.916 (4.01), 8.213 (4.51), 8.234 (4.18), 8.918 (9.86), 9.128 (3.96), 9.147 (3.86).
345	LC-MS（方法 L6）：R_t= 2.83 分；MS（ESIpos）：m/z = 569 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.964 (0.76), 2.524 (1.70), 2.861 (0.81), 2.881 (1.06), 3.288 (1.25), 3.759 (16.00), 5.351 (4.36), 5.356 (4.34), 5.573 (1.21), 5.593 (1.19), 6.939 (1.06), 6.946 (1.14), 6.963 (1.25), 7.038 (1.56), 7.056 (4.26), 7.160 (1.59), 7.179 (1.19), 7.208 (0.94), 7.226 (1.85), 7.243 (1.17), 7.266 (2.21), 7.285 (1.11), 7.316 (1.26), 7.337 (1.99), 7.355 (1.09), 7.392 (1.78), 7.410 (1.52), 7.657 (1.23), 7.662 (2.51), 7.666 (2.55), 7.679 (7.30), 7.683 (4.89), 7.708 (1.19), 7.726 (1.75), 7.747 (1.41), 7.892 (1.85), 7.895 (1.92), 7.910 (1.52), 7.913 (1.46), 8.273 (1.73), 8.277 (1.74), 8.294 (1.66), 8.298 (1.55), 8.899 (5.35), 9.092 (1.61), 9.113 (1.58).
346	LC-MS（方法 L6）：R_t= 1.65 分；MS（ESIpos）：m/z = 518 [M-HCl+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.897 (1.03), 3.371 (1.10), 3.386 (1.01), 5.457 (1.45), 5.543 (1.27), 5.562 (1.29), 7.232 (1.04), 7.237 (1.87), 7.245 (2.18), 7.254 (2.72), 7.258 (2.05), 7.284 (1.61), 7.298 (0.86), 7.431 (1.08), 7.438 (1.17), 7.452 (1.00), 7.670 (16.00), 7.720 (1.27), 7.738 (1.69), 7.741 (1.59), 7.759 (1.49), 7.918 (1.80), 7.921 (1.89), 7.936 (1.57), 7.939 (1.51), 8.494 (1.49), 8.515 (1.46), 8.867 (5.92), 9.235 (1.48), 9.255 (1.44).
347	LC-MS（方法 L5）：R_t= 1.39 分；MS（ESIpos）：m/z = 549 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.166 (16.00), 2.055 (1.38), 2.069 (2.83), 2.084 (1.40), 2.873 (0.61), 2.889 (0.78), 3.108 (11.26), 4.418 (0.63), 4.433 (1.14), 4.447 (0.94), 4.460 (1.14), 4.474 (0.60), 5.544 (0.93), 5.560 (0.92), 7.215 (1.08), 7.226 (1.40), 7.230 (1.64), 7.243 (1.31), 7.257 (0.63), 7.273 (1.47), 7.287 (0.74), 7.417 (1.21), 7.432 (1.02), 7.647 (0.90), 7.651 (2.01), 7.654 (1.86), 7.670 (4.81), 7.674

			(4.24), 7.701 (0.83), 7.717 (1.39), 7.732 (0.97), 7.875 (1.18), 7.877 (1.48), 7.889 (1.02), 7.891 (1.21), 8.314 (1.14), 8.316 (1.40), 8.331 (1.09), 8.333 (1.27), 8.809 (3.64), 9.077 (1.18), 9.093 (1.15).
348		LC-MS (方法 L6): R_t= 3.09 分; MS (ESIpos): m/z = 531 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.235 (2.39), 1.331 (1.53), 1.554 (1.87), 1.570 (3.23), 1.583 (3.23), 1.587 (3.23), 1.810 (1.44), 1.948 (0.98), 1.967 (1.15), 1.978 (1.21), 1.998 (1.12), 2.327 (0.78), 2.366 (1.18), 2.391 (1.44), 2.410 (1.90), 2.429 (1.44), 2.523 (3.83), 2.670 (0.81), 2.710 (1.10), 2.849 (1.01), 2.868 (1.33), 2.889 (1.90), 2.976 (0.95), 2.987 (1.07), 2.999 (1.01), 3.008 (0.98), 3.563 (4.90), 4.171 (1.21), 4.188 (1.44), 4.194 (3.17), 4.212 (3.11), 4.218 (3.26), 4.236 (3.11), 4.241 (1.53), 4.260 (1.15), 5.535 (2.02), 5.554 (1.96), 7.214 (2.13), 7.226 (2.80), 7.230 (3.14), 7.243 (2.57), 7.247 (2.80), 7.261 (1.53), 7.265 (1.27), 7.275 (3.06), 7.292 (1.38), 7.408 (2.42), 7.425 (1.96), 7.652 (1.99), 7.657 (4.73), 7.662 (5.19), 7.673 (16.00), 7.678 (9.23), 7.714 (2.36), 7.732 (3.11), 7.735 (2.85), 7.753 (2.88), 7.882 (3.20), 7.885 (3.57), 7.900 (2.74), 7.903 (2.68), 8.304 (3.11), 8.308 (3.23), 8.325 (2.91), 8.329 (2.77), 8.812 (11.70), 9.046 (2.62), 9.066 (2.51).
349		LC-MS (方法 L5): R_t= 1.37 分; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.997 (1.88), 1.009 (1.89), 1.256 (13.03), 1.268 (13.05), 1.324 (13.05), 1.337 (13.09), 1.963 (1.17), 1.978 (1.34), 1.987 (1.38), 2.004 (1.32), 2.514 (1.83), 2.523 (1.17), 2.852 (1.36), 2.868 (1.69), 2.884 (2.08), 2.900 (0.98), 2.986 (1.14), 2.995 (1.24), 3.004 (1.25), 3.012 (1.20), 3.018 (0.90), 3.027 (0.85), 4.801 (0.80), 4.813 (2.08), 4.825 (2.81), 4.837 (2.05), 4.850 (0.77), 5.526 (0.97), 5.541 (2.48), 5.557 (2.44), 5.571 (0.85), 7.222 (2.17), 7.227 (3.29), 7.233 (4.98), 7.241 (4.15), 7.245 (3.67), 7.256 (1.43), 7.260 (1.07), 7.274 (3.36), 7.287 (1.98), 7.291 (1.44), 7.404 (2.36), 7.408 (2.57), 7.420 (2.24), 7.649 (3.36), 7.652 (6.92), 7.656 (4.92), 7.681 (16.00), 7.685 (13.01), 7.704 (2.74), 7.718 (3.50), 7.720 (3.56), 7.735 (3.17), 7.878 (3.68), 7.881 (4.09), 7.892 (3.13), 7.895 (3.25), 8.306 (3.47), 8.309 (3.76), 8.323 (3.28), 8.326 (3.32), 8.861 (12.86), 8.984 (3.14), 9.001 (3.06).
350	5.06	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.35 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.303 (2.43), 1.322 (5.61), 1.341 (2.50), 3.252 (2.09), 3.271 (2.06), 4.250 (1.06), 4.259 (1.62), 4.268 (1.95), 4.275 (1.54), 4.284

		(ESIpos): m/z = 477 [M+H]+	(1.06), 5.305 (0.92), 5.325 (0.92), 6.783 (1.53), 6.785 (1.66), 6.803 (1.75), 6.806 (1.83), 6.911 (0.78), 6.914 (0.83), 6.930 (1.72), 6.932 (1.71), 6.948 (1.03), 6.951 (1.00), 7.149 (0.86), 7.153 (0.89), 7.170 (1.43), 7.350 (1.48), 7.370 (1.41), 7.652 (16.00), 7.752 (1.09), 7.770 (1.68), 7.791 (1.47), 7.871 (1.93), 7.874 (2.04), 7.889 (1.44), 7.892 (1.42), 8.319 (1.50), 8.322 (1.58), 8.340 (1.43), 8.343 (1.39), 8.839 (5.77), 9.102 (1.60), 9.123 (1.55).
351	5,1	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.36 分; MS (ESIpos): m/z = 471 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.10 (d, 1H), 8.81 (s, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.28 (brd, 1H), 7.71 - 7.84 (m, 2H), 7.46 (t, 1H), 7.30 - 7.40 (m, 3H), 7.12 - 7.22 (m, 1H), 6.93 (td, 1H), 6.79 (dd, 1H), 5.24 - 5.37 (m, 1H), 4.19 - 4.33 (m, 2H), 3.26 (q, 3H), 2.64 - 2.74 (m, 2H), 2.16 - 2.27 (m, 1H), 2.01 - 2.12 (m, 1H), 1.32 (t, 3H), 1.23 (t, 3H).
352		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.26 分; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.08 (d, 1H), 8.82 (s, 1H), 8.25 (dd, 1H), 7.73 - 7.83 (m, 2H), 7.44 (s, 1H), 7.30 - 7.38 (m, 3H), 7.17 (t, 1H), 6.93 (t, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.75 (s, 1H), 5.28 - 5.34 (m, 1H), 4.22 - 4.32 (m, 2H), 2.79 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.17 - 2.26 (m, 1H), 2.03 - 2.12 (m, 1H).
353		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.28 分; MS (ESIpos): m/z = 463 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (0.60), 2.086 (0.58), 2.094 (0.47), 2.203 (0.46), 2.214 (0.45), 2.225 (0.41), 2.794 (10.72), 4.248 (0.87), 4.271 (1.29), 4.276 (1.30), 4.286 (0.77), 5.299 (0.74), 5.318 (0.76), 5.754 (1.41), 6.787 (1.44), 6.808 (1.54), 6.911 (0.70), 6.928 (1.45), 6.946 (0.85), 7.150 (0.73), 7.154 (0.77), 7.171 (1.18), 7.189 (0.58), 7.353 (1.24), 7.372 (1.13), 7.656 (16.00), 7.754 (1.00), 7.772 (1.46), 7.793 (1.32), 7.884 (1.64), 7.886 (1.70), 7.901 (1.28), 7.904 (1.19), 8.285 (1.42), 8.288 (1.42), 8.306 (1.32), 8.309 (1.24), 8.844 (4.54), 9.082 (1.27), 9.103 (1.21).
354		LC-MS (方法 L6): R_t= 2.46 分; MS (ESIneg): m/z = 558 [M-H]-	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.46), 0.008 (0.44), 1.175 (0.60), 1.187 (0.74), 1.193 (1.32), 1.205 (1.44), 1.211 (0.70), 1.223 (0.71), 2.073 (0.67), 2.523 (0.41), 3.168 (16.00), 4.201 (0.40), 4.218 (0.81), 4.227 (0.56), 4.236 (0.80), 4.245 (0.62), 6.804 (0.95), 6.826 (0.84), 7.683 (3.23), 7.897 (0.42), 8.001 (0.60), 8.018 (0.44), 9.111 (0.89), 9.124 (0.80).
355		LC-MS (方法 L1):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.59), 0.008 (2.29), 2.135 (0.68), 2.224

		R_t= 1.25 分; MS (ESIpos): m/z = 488 [M+H]+	(0.56), 2.327 (1.51), 2.366 (1.57), 2.522 (5.91), 2.669 (1.22), 2.710 (0.80), 4.264 (1.54), 4.275 (1.87), 4.710 (5.79), 5.292 (0.89), 5.311 (0.86), 6.798 (1.54), 6.816 (1.69), 6.896 (0.83), 6.915 (1.63), 6.933 (0.95), 7.163 (0.83), 7.180 (1.34), 7.198 (0.65), 7.384 (1.40), 7.404 (1.25), 7.678 (16.00), 7.883 (1.10), 7.901 (1.66), 7.923 (1.51), 7.989 (2.02), 8.004 (1.40), 8.417 (1.57), 8.435 (1.45), 9.029 (5.19), 9.375 (1.45), 9.395 (1.34).
356		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.41 分; MS (ESIpos): m/z = 491 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.12 (d, 1H), 8.83 (s, 1H), 8.33 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.72 - 7.79 (m, 1H), 7.65 (s, 3H), 7.36 (d, 1H), 7.14 - 7.22 (m, 1H), 6.93 (t, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.25 - 5.37 (m, 1H), 4.20 - 4.34 (m, 2H), 3.17 - 3.26 (m, 2H), 2.20 (td, 1H), 1.99 - 2.11 (m, 1H), 1.64 - 1.78 (m, 2H), 1.02 (t, 3H).
357		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.39 分; MS (ESIpos): m/z = 489 [M+H]+	^{1}H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 8.89 - 9.00 (m, 2H), 8.04 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.72 - 7.80 (m, 1H), 7.67 (s, 3H), 7.28 - 7.39 (m, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.92 (t, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.54 (s, 1H), 5.19 - 5.29 (m, 1H), 5.03 (brs, 1H), 4.17 - 4.33 (m, 2H), 2.11 - 2.28 (m, 4H), 2.02 (brs, 1H).
358	4, 9	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.34 分; MS (ESIpos): m/z = 489 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.640 (1.22), 0.650 (1.42), 0.658 (1.28), 0.668 (0.69), 0.681 (0.74), 0.691 (1.29), 0.698 (1.52), 0.709 (1.18), 1.173 (1.12), 1.186 (2.68), 1.200 (2.43), 1.203 (2.55), 1.216 (0.95), 2.067 (0.40), 2.073 (0.54), 2.079 (0.80), 2.085 (0.85), 2.095 (0.95), 2.107 (1.22), 2.112 (1.05), 2.118 (0.74), 2.124 (0.52), 2.201 (0.53), 2.208 (0.81), 2.218 (1.13), 2.228 (1.10), 2.235 (1.08), 2.246 (0.78), 2.253 (0.54), 2.409 (0.51), 2.420 (1.04), 2.426 (1.14), 2.437 (1.81), 2.449 (1.05), 2.455 (1.00), 2.466 (0.59), 4.230 (0.57), 4.235 (0.67), 4.252 (1.84), 4.258 (1.37), 4.269 (1.59), 4.275 (1.46), 4.280 (1.41), 4.287 (1.66), 4.293 (1.43), 4.300 (1.50), 4.310 (0.60), 4.315 (0.65), 4.322 (0.46), 5.280 (0.80), 5.291 (1.74), 5.307 (1.69), 5.318 (0.75), 6.783 (3.28), 6.799 (3.54), 6.905 (1.59), 6.920 (3.31), 6.934 (1.85), 7.148 (1.91), 7.165 (2.68), 7.179 (1.30), 7.367 (2.83), 7.382 (2.86), 7.648 (16.00), 7.770 (1.92), 7.784 (3.02), 7.801 (2.71), 7.869 (3.37), 7.871 (3.35), 7.884 (2.52), 8.601 (2.89), 8.618 (2.72), 8.787 (0.65), 8.816 (9.10), 9.011 (2.78), 9.027 (2.65).
359		LC-MS (方法 L1):	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.007 (1.53), 0.006 (1.15), 1.527 (11.61), 1.542

	R_t= 1.38 分; MS (ESIpos): m/z = 491 [M+H]+	(11.90), 1.554 (11.58), 1.568 (11.39), 2.024 (0.41), 2.037 (0.85), 2.044 (0.90), 2.052 (0.94), 2.057 (0.92), 2.065 (1.24), 2.071 (1.06), 2.078 (0.75), 2.084 (0.55), 2.177 (0.52), 2.184 (0.80), 2.194 (1.16), 2.204 (1.11), 2.211 (1.11), 2.221 (0.74), 2.518 (0.93), 2.522 (0.72), 3.841 (0.48), 3.855 (1.08), 3.869 (1.42), 3.883 (1.05), 3.898 (0.42), 4.218 (0.51), 4.224 (0.67), 4.240 (2.00), 4.247 (1.53), 4.257 (2.08), 4.262 (2.36), 4.268 (1.99), 4.274 (1.55), 4.281 (1.68), 4.290 (0.52), 4.297 (0.62), 4.303 (0.43), 5.264 (0.80), 5.276 (1.75), 5.292 (1.70), 5.303 (0.77), 6.784 (3.41), 6.798 (3.68), 6.916 (1.72), 6.918 (1.66), 6.930 (3.46), 6.945 (2.02), 7.151 (1.65), 7.154 (1.69), 7.168 (2.77), 7.182 (1.36), 7.185 (1.32), 7.353 (2.85), 7.368 (2.66), 7.616 (12.83), 7.620 (16.00), 7.643 (4.67), 7.647 (6.31), 7.651 (2.84), 7.720 (2.36), 7.735 (3.26), 7.738 (2.76), 7.752 (2.91), 7.840 (3.95), 7.842 (3.96), 7.854 (3.15), 7.856 (2.93), 8.446 (3.04), 8.461 (2.92), 8.757 (12.10), 9.108 (3.03), 9.125 (2.93).
360	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.12 分; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H]+	^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.005 (1.55), 2.061 (0.52), 2.067 (0.77), 2.071 (0.86), 2.079 (0.95), 2.083 (0.89), 2.090 (1.10), 2.094 (0.95), 2.101 (0.63), 2.197 (0.52), 2.202 (0.70), 2.211 (1.08), 2.219 (1.07), 2.225 (1.08), 2.234 (0.81), 2.386 (0.48), 2.517 (1.21), 2.520 (1.17), 2.523 (0.96), 2.614 (0.48), 4.190 (1.43), 4.199 (0.87), 4.204 (1.08), 4.215 (5.45), 4.223 (1.99), 4.229 (4.83), 4.253 (1.43), 4.266 (1.08), 4.271 (1.32), 4.277 (1.21), 4.283 (1.51), 4.290 (0.72), 4.296 (0.76), 4.301 (0.61), 5.278 (0.77), 5.288 (1.58), 5.301 (1.57), 5.310 (0.71), 6.785 (3.04), 6.798 (3.20), 6.888 (1.54), 6.890 (1.54), 6.901 (3.04), 6.913 (1.75), 6.915 (1.67), 7.152 (1.45), 7.154 (1.49), 7.166 (2.44), 7.177 (1.22), 7.180 (1.20), 7.355 (2.91), 7.366 (4.77), 7.659 (8.30), 7.661 (16.00), 7.667 (5.88), 7.670 (4.36), 7.673 (1.81), 7.773 (2.24), 7.785 (2.96), 7.787 (2.70), 7.799 (2.65), 7.898 (3.37), 7.899 (3.46), 7.909 (2.76), 7.911 (2.71), 8.004 (2.52), 8.349 (2.84), 8.350 (2.88), 8.363 (2.68), 8.365 (2.58), 8.951 (10.28), 9.490 (2.95), 9.504 (2.84).
361	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.44 分; MS (ESIpos): m/z = 474 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (0.70), 0.008 (0.49), 1.398 (16.00), 1.988 (0.45), 2.519 (0.43), 6.790 (0.48), 6.849 (0.44), 6.851 (0.45), 6.870 (0.51), 6.872 (0.48), 6.966 (0.40), 7.673 (0.41), 7.696 (4.12), 7.933 (0.43), 7.951 (0.60), 7.953 (0.54), 7.972 (0.53), 8.054 (0.67), 8.057 (0.62), 8.071 (0.49), 8.075 (0.41), 9.279

362	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.25 分；MS（ESIpos）：m/z = 509 [M+H]+	(0.96), 9.311 (0.50). 1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (3.35), 0.008 (3.09), 1.942 (0.95), 1.962 (1.01), 1.973 (1.12), 1.994 (1.07), 2.877 (0.97), 2.897 (1.34), 3.072 (2.46), 3.089 (5.60), 3.105 (2.97), 3.287 (1.80), 3.448 (1.02), 3.452 (1.05), 3.463 (2.26), 3.469 (2.04), 3.479 (2.06), 3.483 (2.02), 3.500 (0.82), 4.961 (1.79), 4.975 (4.01), 4.989 (1.75), 5.573 (1.56), 5.593 (1.55), 5.754 (4.61), 7.226 (2.94), 7.234 (3.06), 7.240 (3.44), 7.248 (5.14), 7.258 (1.67), 7.266 (2.16), 7.276 (1.40), 7.279 (1.19), 7.511 (1.39), 7.523 (1.39), 7.533 (1.20), 7.657 (3.86), 7.659 (5.48), 7.663 (16.00), 7.667 (6.58), 7.670 (3.35), 7.673 (2.04), 7.676 (1.25), 7.683 (0.83), 7.839 (1.73), 7.857 (2.68), 7.860 (1.98), 7.879 (2.73), 7.927 (2.89), 7.931 (3.10), 7.945 (2.00), 7.949 (1.80), 8.630 (2.51), 8.634 (2.52), 8.651 (2.41), 8.655 (2.15), 8.879 (10.16), 9.027 (2.07), 9.048 (2.05).
363	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.37 分；MS（ESIpos）：m/z = 558 [M+H]+	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)δ[ppm]: -0.008 (2.58), 0.008 (2.57), 1.356 (1.00), 2.085 (16.00), 4.144 (1.13), 5.754 (1.90), 6.743 (1.76), 6.747 (2.04), 6.764 (1.98), 6.767 (2.24), 6.788 (1.04), 6.791 (1.01), 6.807 (2.03), 6.810 (1.93), 6.826 (1.26), 6.829 (1.15), 6.992 (1.32), 6.995 (2.52), 6.997 (1.59), 7.013 (1.50), 7.015 (2.62), 7.017 (1.66), 7.111 (0.95), 7.116 (1.01), 7.132 (1.62), 7.138 (1.65), 7.141 (1.44), 7.150 (2.04), 7.153 (2.12), 7.157 (1.66), 7.159 (1.41), 7.169 (1.40), 7.171 (1.37), 7.265 (1.54), 7.285 (1.54), 7.584 (1.21), 7.589 (1.25), 7.604 (1.61), 7.609 (1.64), 7.623 (1.04), 7.628 (1.04), 7.681 (0.99), 7.684 (1.64), 7.686 (2.60), 7.690 (5.09), 7.695 (12.74), 7.698 (4.45), 7.700 (3.56), 7.734 (1.72), 7.751 (2.14), 7.755 (2.02), 7.773 (2.10), 7.916 (2.37), 7.919 (2.53), 7.934 (2.01), 7.938 (1.93), 8.298 (1.27), 8.300 (1.54), 8.303 (1.59), 8.305 (1.45), 8.310 (1.37), 8.312 (1.59), 8.315 (1.49), 8.317 (1.32), 8.336 (2.29), 8.339 (2.36), 8.357 (2.07), 8.361 (1.99), 9.071 (8.31), 9.124 (1.92), 9.144 (1.88).
364	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.28 分；MS（ESIpos）：m/z = 525 [M+H]+	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.66), 0.008 (2.57), 2.119 (1.04), 2.128 (0.86), 2.366 (0.82), 2.710 (0.82), 3.060 (2.72), 3.077 (6.64), 3.093 (3.50), 3.287 (2.70), 3.438 (1.04), 3.454 (2.48), 3.468 (3.16), 3.481 (2.10), 3.497 (0.89), 4.254 (1.46), 4.263 (1.26), 4.273 (2.24), 4.282 (2.43), 4.297 (1.35), 4.946 (2.06), 4.960

			(4.56), 4.974 (1.99), 5.291 (1.28), 5.310 (1.31), 6.781 (2.41), 6.784 (2.61), 6.802 (2.74), 6.805 (2.88), 6.910 (1.33), 6.913 (1.46), 6.928 (2.63), 6.932 (2.57), 6.947 (1.59), 6.950 (1.53), 7.151 (1.31), 7.156 (1.35), 7.173 (2.21), 7.190 (1.24), 7.194 (1.13), 7.448 (2.17), 7.465 (2.06), 7.627 (1.00), 7.632 (1.04), 7.658 (5.73), 7.662 (16.00), 7.666 (6.68), 7.669 (3.41), 7.675 (1.22), 7.838 (1.93), 7.856 (2.97), 7.859 (2.35), 7.877 (2.92), 7.929 (3.21), 7.932 (3.50), 7.946 (2.21), 7.950 (2.06), 8.624 (2.97), 8.627 (2.97), 8.645 (2.70), 8.649 (2.50), 8.881 (10.45), 9.155 (2.48), 9.175 (2.37).
365		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.32 分; MS (ESIpos): m/z = 507 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.150 (1.77), −0.008 (16.00), 0.008 (14.17), 0.146 (1.65), 1.236 (0.71), 2.104 (1.48), 2.217 (1.18), 2.327 (3.48), 2.366 (2.13), 2.523 (12.52), 2.669 (3.84), 2.709 (2.18), 4.249 (2.01), 4.269 (2.72), 4.297 (1.83), 5.284 (1.83), 5.303 (1.89), 5.754 (4.66), 6.784 (3.66), 6.804 (4.13), 6.917 (1.89), 6.932 (3.60), 6.951 (2.36), 7.155 (1.89), 7.173 (2.89), 7.193 (1.54), 7.357 (3.25), 7.362 (7.38), 7.366 (5.20), 7.394 (13.99), 7.398 (11.04), 7.430 (3.01), 7.447 (2.95), 7.814 (2.48), 7.832 (4.07), 7.853 (4.07), 7.892 (4.43), 7.896 (4.84), 7.910 (2.89), 8.550 (3.96), 8.554 (3.84), 8.571 (3.72), 8.575 (3.48), 8.841 (14.23), 9.114 (3.31), 9.135 (3.25).
366	4,79		^{1}H-NMR(399,9532 MHz, DMSO): δ= 9.129 (0.47); 9.1148 (0.47); 9.1094 (0.47); 8.7855 (1.25); 8.7775 (1.27); 8.6377 (0.78); 8.6169 (0.83); 7.8685 (0.52); 7.8505 (0.85); 7.8295 (0.79); 7.7781 (1.03); 7.7634 (0.65); 7.7608 (0.66); 7.7301 (0.69); 7.7265 (0.81); 7.7101 (0.84); 7.7068 (0.92); 7.4773 (0.34); 7.4638 (0.65); 7.4576 (0.71); 7.4446 (0.66); 7.4301 (0.75); 7.4129 (0.41); 7.3928 (0.56); 7.3822 (0.55); 7.3662 (0.35); 7.1798 (0.35); 7.1614 (0.7); 7.1419 (0.43); 6.9335 (0.47); 6.915 (0.8); 6.8966 (0.39); 6.7926 (0.94); 6.7722 (0.84); 5.2907 (0.43); 5.2723 (0.45); 4.2863 (0.4); 4.2718 (0.77); 4.263 (0.76); 4.2526 (0.49); 4.2448 (0.48); 3.3189 (19.02); 3.0568 (0.38); 3.0385 (1.18); 3.0201 (1.27); 3.0017 (0.5); 2.5053 (32.31); 2.501 (45.79); 2.4969 (38.72); 1.3977 (16); 1.1703 (1.73); 1.1519 (3.55); 1.1335 (1.74); 0.0074 (1.2); −0.0002 (26.74)
367	5,48		^{1}H-NMR(399,9532 MHz, DMSO): δ= 9.1306 (2.01); 9.1101 (2.05); 8.8861 (7.98); 8.6364

		(2) ; 8.6333 (2.17) ; 8.6154 (2.23) ; 8.6122 (2.26) ; 7.9429 (1.75) ; 7.9397 (1.94) ; 7.925 (2.69) ; 7.9218 (2.64) ; 7.8638 (2.19) ; 7.8429 (2.42) ; 7.8248 (1.46) ; 7.6937 (0.7) ; 7.6622 (16) ; 7.458 (1.87) ; 7.4401 (1.96) ; 7.1926 (0.85) ; 7.1892 (0.9) ; 7.1715 (1.84) ; 7.1543 (1.13) ; 7.1505 (1.13) ; 6.948 (1.34) ; 6.9295 (2.26) ; 6.9106 (1.06) ; 6.8025 (2.51) ; 6.7834 (2.23) ; 6.5799 (0.36) ; 5.7548 (2.41) ; 5.3226 (0.52) ; 5.3079 (1.15) ; 5.2891 (1.14) ; 5.2746 (0.5) ; 4.3171 (0.37) ; 4.2984 (1.12) ; 4.2828 (2.04) ; 4.2742 (1.92) ; 4.2638 (1.11) ; 4.2555 (1.22) ; 4.2357 (0.36) ; 3.3221 (28.56) ; 3.0452 (1.38) ; 3.0269 (4.39) ; 3.0085 (4.61) ; 2.9901 (1.55) ; 2.9503 (2.63) ; 2.5062 (35.71) ; 2.5018 (49.01) ; 2.4975 (37.88) ; 2.2455 (0.37) ; 2.2396 (0.4) ; 2.2253 (0.63) ; 2.2154 (0.69) ; 2.2039 (0.74) ; 2.1923 (0.58) ; 2.183 (0.34) ; 2.1277 (0.35) ; 2.1193 (0.52) ; 2.1122 (0.71) ; 2.1045 (0.86) ; 2.0944 (0.61) ; 2.0876 (0.59) ; 2.078 (0.53) ; 2.0688 (0.48) ; 1.397 (6.52) ; 1.2337 (0.54) ; 1.1701 (1.44) ; 1.1529 (5.39) ; 1.1345 (11.03) ; 1.1161 (5.17) ; 0.0078 (2.03) ; -0.0002 (46.62)
368	3,76	^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO) : δ= 9.4079 (0.91) ; 9.3936 (0.81) ; 9.3876 (0.93) ; 9.348 (0.54) ; 9.3284 (1.17) ; 9.3084 (0.7) ; 9.2139 (0.51) ; 9.2004 (1.18) ; 9.1877 (1.26) ; 9.1743 (0.63) ; 9.1376 (0.37) ; 9.124 (0.46) ; 9.1127 (0.45) ; 9.0815 (0.48) ; 9.069 (0.72) ; 9.0563 (0.54) ; 8.9299 (4.95) ; 8.9181 (2.18) ; 8.3146 (0.48) ; 7.8564 (6.67) ; 7.8446 (5.81) ; 7.8246 (0.32) ; 7.7421 (2.74) ; 7.7383 (2.93) ; 7.7222 (3.38) ; 7.7184 (3.39) ; 7.4976 (0.59) ; 7.4918 (1.24) ; 7.4783 (1.38) ; 7.4723 (2.72) ; 7.4633 (1.1) ; 7.4588 (1.07) ; 7.4523 (1.75) ; 7.4438 (0.68) ; 7.429 (1.04) ; 7.4219 (1.82) ; 7.4179 (1.54) ; 7.4031 (1.84) ; 7.399 (1.97) ; 7.3891 (1.42) ; 7.3854 (1.42) ; 7.38 (0.92) ; 7.3699 (1.26) ; 7.3497 (0.86) ; 7.3415 (0.86) ; 7.1887 (1.08) ; 7.1706 (2.27) ; 7.1526 (1.33) ; 6.9372 (1.41) ; 6.9184 (2.37) ; 6.8998 (1.11) ; 6.8025 (2.56) ; 6.782 (2.28) ; 5.7548 (16) ; 5.244 (0.78) ; 5.2248 (1.32) ; 4.3011 (0.47) ; 4.2715 (1.25) ; 4.2597 (1.64) ; 4.2386 (1.15) ; 4.2313 (1.34) ; 4.2105 (1.16) ; 4.19 (0.42) ; 4.0556 (0.74) ; 4.0378 (2.3) ; 4.02 (2.33) ; 4.0022 (0.78) ; 3.6324 (0.57) ; 3.6282 (0.47) ; 3.6193 (0.65) ; 3.6135 (1.07) ; 3.6005 (1.04) ; 3.595 (0.97) ; 3.5876 (0.71) ; 3.5816 (1.03) ; 3.569 (0.62) ; 3.5629 (0.59) ; 3.4779 (0.67) ; 3.3947 (0.75) ; 3.3771 (0.89) ; 3.3607 (0.77) ; 3.3457 (1.02) ; 3.3189 (76.03) ; 3.3011 (0.56) ; 3.2956 (0.52) ; 3.2762 (0.74) ; 2.6748 (0.91) ; 2.6703

			(1.21) ; 2.6656 (0.94) ; 2.5235 (3.02) ; 2.5099 (69.23) ; 2.5056 (147.9) ; 2.501 (208.96) ; 2.4966 (158.74) ; 2.4924 (78.18) ; 2.3323 (0.85) ; 2.328 (1.2) ; 2.3235 (0.9) ; 2.2195 (0.41) ; 2.2066 (0.59) ; 2.1969 (0.68) ; 2.1869 (0.78) ; 2.1765 (0.84) ; 2.1662 (0.77) ; 2.1545 (0.61) ; 2.0945 (0.63) ; 2.085 (0.73) ; 2.0685 (0.72) ; 2.0511 (0.6) ; 1.9884 (9.96) ; 1.3946 (1.94) ; 1.3881 (1.89) ; 1.376 (4.14) ; 1.3695 (3.96) ; 1.3626 (3.1) ; 1.3577 (2.54) ; 1.3506 (2.19) ; 1.344 (5.38) ; 1.3253 (2.43) ; 1.1927 (2.64) ; 1.1749 (5.28) ; 1.1571 (2.56) ; 0.008 (1.98) ; −0.0001 (61.25) ; −0.0084 (2.3)
369	3,94		^{1}H-NMR (399,9532 MHz, DMSO) : δ= 9.2003 (2.67) ; 9.1806 (3.23) ; 9.167 (2.01) ; 9.0322 (8.51) ; 9.019 (6.5) ; 8.9438 (4.48) ; 8.9221 (4.91) ; 8.3143 (2.06) ; 7.9838 (3.69) ; 7.9659 (6.23) ; 7.9442 (6.22) ; 7.9065 (7.21) ; 7.889 (4.28) ; 7.7531 (5.21) ; 7.7495 (5.57) ; 7.7332 (6.28) ; 7.7295 (6.44) ; 7.508 (2.22) ; 7.4958 (2.14) ; 7.4886 (4.93) ; 7.4766 (4.41) ; 7.4689 (3.41) ; 7.4566 (5.08) ; 7.432 (6.44) ; 7.4078 (3.86) ; 7.3882 (1.78) ; 7.1782 (1.86) ; 7.1588 (3.64) ; 7.1396 (2.31) ; 6.9267 (1.91) ; 6.9158 (2) ; 6.908 (3.3) ; 6.8978 (2.95) ; 6.8915 (1.75) ; 6.8809 (1.36) ; 6.789 (5.67) ; 6.7684 (5.12) ; 5.7544 (10.27) ; 5.214 (1.39) ; 5.2001 (2.98) ; 5.1805 (2.91) ; 5.1675 (1.28) ; 4.305 (1.02) ; 4.2955 (1.49) ; 4.2776 (2.26) ; 4.2627 (2.39) ; 4.2546 (1.65) ; 4.2028 (1.82) ; 4.1938 (1.6) ; 4.1816 (2.42) ; 4.1738 (2.22) ; 4.1539 (1.1) ; 4.0375 (0.53) ; 4.0197 (0.62) ; 3.9026 (0.65) ; 3.7185 (0.69) ; 3.7005 (2.39) ; 3.6828 (6.64) ; 3.6642 (7.29) ; 3.6477 (3.14) ; 3.631 (1.2) ; 3.6135 (0.55) ; 3.5953 (0.33) ; 3.3784 (0.72) ; 3.3184 (262.18) ; 2.675 (3.55) ; 2.6703 (4.96) ; 2.666 (3.64) ; 2.5236 (12.22) ; 2.5055 (584.02) ; 2.5011 (819.49) ; 2.4967 (626.86) ; 2.3325 (3.45) ; 2.3279 (4.64) ; 2.3235 (3.47) ; 2.1791 (1.23) ; 2.1677 (1.59) ; 2.1578 (1.93) ; 2.1464 (2.45) ; 2.133 (2.65) ; 2.1234 (2.57) ; 2.0956 (1.25) ; 2.0828 (0.81) ; 1.9882 (2.46) ; 1.3887 (0.5) ; 1.3197 (7.73) ; 1.3046 (14.27) ; 1.301 (16) ; 1.2858 (7.08) ; 1.2826 (7.64) ; 1.2589 (1.64) ; 1.2352 (4.77) ; 1.193 (1.14) ; 1.1751 (1.98) ; 1.1573 (1.17) ; 1.1406 (0.7) ; 1.1176 (0.38) ; 1.0977 (0.35) ; 0.8541 (0.85) ; 0.8372 (0.72) ; 0.768 (0.51) ; 0.7585 (0.6) ; 0.7287 (0.37) ; 0.1458 (0.91) ; 0.0079 (6.73) ; −0.0002 (210.64) ; −0.0083 (8.7) ; −0.1499 (0.88)
370	4,44		^{1}H-NMR (399,9532 MHz, DMSO) : δ= 9.3994 (1.2) ; 9.3782 (2.63) ; 9.3572 (1.64) ; 9.1706 (1.25) ; 9.1482 (2.41) ; 9.1234 (1.62) ; 9.0407 (6.79) ; 9.0256 (5.14) ; 8.0137 (2.95) ;

			7.9958 (3.69) ; 7.8636 (2.22) ; 7.8447 (3.05) ; 7.824 (1.78) ; 7.6865 (2.25) ; 7.6816 (5.53) ; 7.6774 (5.78) ; 7.6659 (16) ; 7.6613 (10.26) ; 7.4424 (1.15) ; 7.4242 (1.23) ; 7.3796 (1.54) ; 7.3615 (1.65) ; 7.1997 (1.27) ; 7.1795 (2.54) ; 7.1609 (1.67) ; 6.9491 (1.99) ; 6.9307 (3.38) ; 6.9119 (1.61) ; 6.8111 (3.75) ; 6.7907 (3.34) ; 5.7549 (6.05) ; 5.2713 (0.45) ; 5.2578 (1.23) ; 5.239 (1.43) ; 5.2251 (1.09) ; 5.2116 (0.34) ; 4.3107 (0.44) ; 4.3029 (0.54) ; 4.2848 (1.37) ; 4.2718 (2.3) ; 4.2635 (1.9) ; 4.2523 (1.39) ; 4.2444 (1.58) ; 4.2328 (0.73) ; 4.2244 (1.04) ; 4.217 (0.53) ; 4.2041 (0.33) ; 3.6141 (0.78) ; 3.6102 (0.99) ; 3.5958 (1.19) ; 3.5918 (1.15) ; 3.5813 (1.08) ; 3.5775 (1.52) ; 3.5627 (1.01) ; 3.5591 (1.28) ; 3.5409 (0.4) ; 3.3918 (1.1) ; 3.3729 (1.38) ; 3.3592 (1.03) ; 3.353 (1.23) ; 3.3401 (1.19) ; 3.3338 (1.2) ; 3.3202 (28.4) ; 3.3014 (0.76) ; 2.675 (0.44) ; 2.6707 (0.61) ; 2.6662 (0.47) ; 2.5235 (1.63) ; 2.5058 (73.82) ; 2.5014 (103.74) ; 2.497 (80.59) ; 2.493 (41.24) ; 2.3326 (0.43) ; 2.3281 (0.59) ; 2.3239 (0.48) ; 2.2328 (0.49) ; 2.2203 (0.71) ; 2.2113 (0.74) ; 2.1984 (1.03) ; 2.1872 (0.95) ; 2.1772 (0.91) ; 2.165 (0.61) ; 2.155 (0.35) ; 2.1416 (0.36) ; 2.1271 (0.7) ; 2.1187 (0.84) ; 2.1035 (0.67) ; 2.0935 (0.67) ; 2.0842 (0.76) ; 2.0783 (0.75) ; 2.0684 (0.55) ; 2.0605 (0.45) ; 2.0507 (0.37) ; 2.0437 (0.32) ; 1.3819 (3.75) ; 1.3633 (8.24) ; 1.3575 (3.82) ; 1.3445 (4.22) ; 1.3387 (6.43) ; 1.3199 (2.77) ; 1.2332 (0.72) ; 1.1754 (0.4) ; −0.0002 (0.66)
371	4, 54		^{1}H-NMR(399, 9532 MHz, DMSO) : δ= 9.1895 (3.04) ; 9.1694 (3.1) ; 9.1296 (0.37) ; 9.1153 (10.56) ; 8.9396 (3.14) ; 8.9368 (3.35) ; 8.9178 (3.51) ; 8.915 (3.51) ; 8.3143 (0.49) ; 8.0499 (2.68) ; 8.0473 (2.89) ; 8.0321 (4.35) ; 8.0293 (4.1) ; 7.9727 (3.41) ; 7.9543 (2.73) ; 7.951 (3.52) ; 7.9328 (2.34) ; 7.7006 (3.22) ; 7.6959 (6.75) ; 7.6912 (4.54) ; 7.655 (16) ; 7.6503 (13.06) ; 7.4831 (2.66) ; 7.4649 (2.85) ; 7.1902 (1.31) ; 7.1863 (1.38) ; 7.1687 (2.79) ; 7.1515 (1.77) ; 7.1478 (1.69) ; 6.9385 (2.04) ; 6.9201 (3.47) ; 6.9036 (1.63) ; 6.9012 (1.66) ; 6.7982 (3.87) ; 6.779 (3.55) ; 5.7544 (1.92) ; 5.2344 (0.76) ; 5.2216 (1.73) ; 5.2018 (1.72) ; 5.1876 (0.75) ; 4.3164 (0.62) ; 4.3031 (0.84) ; 4.2899 (1.38) ; 4.2793 (1.29) ; 4.2738 (1.51) ; 4.2653 (1.02) ; 4.2225 (0.99) ; 4.2147 (1.33) ; 4.2016 (1.16) ; 4.1939 (1.75) ; 4.1864 (0.87) ; 4.1743 (0.72) ; 4.1658 (0.65) ; 3.7057 (0.34) ; 3.6883 (1.22) ; 3.6828 (1.08) ; 3.6702 (3.31) ; 3.6645 (3.08) ; 3.6516 (3.37) ; 3.6461 (3.16) ; 3.6329 (1.16) ; 3.6285 (1.24) ; 3.3193 (68.59) ; 2.675 (0.88) ;

			2.6705 (1.18); 2.6659 (0.87); 2.5236 (3.14); 2.5101 (69.48); 2.5058 (144.19); 2.5013 (199.43); 2.4969 (149.23); 2.4928 (72.67); 2.3326 (0.83); 2.3282 (1.16); 2.3238 (0.81); 2.2169 (0.37); 2.204 (0.5); 2.1912 (0.95); 2.1785 (1.25); 2.1702 (1.47); 2.1564 (1.69); 2.1486 (1.83); 2.14 (1.59); 2.126 (0.94); 2.1147 (0.54); 2.1053 (0.46); 1.3515 (0.39); 1.3055 (7.28); 1.2869 (15.83); 1.2685 (7.21); 1.2352 (4.31); 1.17 (0.64); 1.1521 (0.57); 0.8536 (0.58); 0.835 (0.32); -0.0002 (1.18)
372	4.08		^{1}H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 12.3602 (1.81); 9.1502 (2.55); 9.1301 (2.52); 8.892 (9.63); 8.8835 (0.49); 8.6271 (2.4); 8.624 (2.53); 8.6058 (2.71); 8.6028 (2.68); 7.9529 (2.14); 7.9502 (2.26); 7.9352 (3.25); 7.9323 (3.12); 7.9076 (0.43); 7.8737 (2.65); 7.8528 (2.81); 7.8346 (1.74); 7.6694 (8.23); 7.6663 (16); 7.4556 (2.26); 7.4372 (2.36); 7.1902 (1.1); 7.1719 (2.32); 7.1546 (1.4); 7.151 (1.4); 6.9475 (1.65); 6.9287 (2.79); 6.91 (1.31); 6.8025 (3.17); 6.7815 (2.81); 5.3004 (0.68); 5.2866 (1.49); 5.2669 (1.46); 5.2527 (0.64); 4.3167 (0.34); 4.3082 (0.53); 4.2896 (1.41); 4.2737 (2.43); 4.2645 (2.36); 4.2534 (1.28); 4.245 (1.54); 4.2252 (0.51); 4.2177 (0.4); 4.0377 (0.33); 4.0198 (0.37); 3.3181 (128.86); 3.1629 (2.73); 3.145 (6.07); 3.1272 (3.01); 2.89 (0.57); 2.7306 (0.51); 2.6743 (2.28); 2.6697 (3.09); 2.6658 (2.38); 2.615 (0.4); 2.597 (0.4); 2.5228 (8.93); 2.5052 (404.28); 2.5009 (529.51); 2.4965 (389.18); 2.477 (6.31); 2.332 (2.29); 2.3276 (3.04); 2.323 (2.27); 2.2559 (0.33); 2.2437 (0.53); 2.2366 (0.54); 2.2221 (0.88); 2.2127 (1.01); 2.2005 (0.98); 2.1892 (0.78); 2.1288 (0.69); 2.1204 (0.93); 2.1136 (1.11); 2.1049 (0.78); 2.0969 (0.76); 2.0877 (0.7); 2.0787 (0.66); 1.9883 (1.45); 1.2344 (0.51); 1.1925 (0.48); 1.1741 (0.82); 1.1569 (0.42); 1.1054 (0.4); 0.0077 (1.78); -0.0003 (53.99); -0.008 (2.53)
373		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.39 分; MS (ESIpos): m/z = 479 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 4.172 (16.00), 4.245 (0.90), 4.254 (1.07), 4.269 (1.49), 4.273 (1.51), 4.283 (0.86), 5.274 (0.83), 5.293 (0.83), 5.754 (12.35), 6.793 (1.40), 6.796 (1.53), 6.814 (1.59), 6.816 (1.66), 6.909 (0.74), 6.912 (0.74), 6.928 (1.55), 6.930 (1.54), 6.946 (0.93), 6.949 (0.91), 7.159 (0.76), 7.163 (0.82), 7.180 (1.29), 7.363 (1.33), 7.380 (1.25), 7.650 (0.88), 7.655 (2.07), 7.659 (2.33), 7.670 (7.40), 7.675 (4.39), 7.702 (1.20), 7.720 (1.66), 7.723 (1.57), 7.741 (1.47), 7.886

			(1.69), 7.890 (1.80), 7.904 (1.44), 7.908 (1.42), 8.296 (1.61), 8.299 (1.63), 8.317 (1.54), 8.320 (1.45), 8.811 (5.57), 9.192 (1.36), 9.212 (1.34).
384	1.66		384: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9731(0.6);8.9623(0.6);8.9531(0.6);8.9419(0.5);8.4859(0.4);8.3740(0.7);8.3670(0.7);8.3565(0.8);8.3495(0.8);8.3209(2.7);7.7618(0.4);7.7477(0.4);7.7333(0.5);7.7203(0.4);7.6684(1.2);7.6517(1.2);7.6483(1.4);7.5524(0.5);7.5423(3.3);7.5361(1.8);7.5245(1.4);7.5070(0.4);7.4333(0.4);7.4228(0.5);7.4138(0.9);7.4033(0.8);7.3941(0.6);7.3837(0.5);7.3046(1.3);7.2862(1.8);7.2711(0.5);7.1678(0.5);7.1476(1.1);7.1280(0.6);6.9086(0.8);6.8899(1.2);6.8713(0.6);6.7857(1.6);6.7654(1.3);5.2479(0.3);5.2338(0.7);5.2140(0.7);4.2573(1.1);4.2441(1.8);4.2314(1.1);3.3217(36.1);3.062(2.2);3.0560(2.8);3.0504(2.7);3.0439(2.5);3.0278(0.6);2.5049(33.4);2.5007(44.2);2.4965(34.0);2.1736(0.3);2.1521(0.4);2.1380(0.6);2.1241(0.5);2.0312(0.5);2.0163(0.6);2.0038(0.3);1.9947(0.4);1.9884(0.4);1.3971(16.0);-0.0002(19.8)
385	1.55		385: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9954(0.7);8.9747(0.7);8.4127(0.8);8.3889(3.2);7.8025(0.5);7.7890(0.5);7.6892(0.8);7.6729(1.1);7.5759(0.9);7.5701(0.4);7.5551(1.2);7.5367(0.7);7.3163(0.7);7.2977(0.8);7.1731(0.7);7.1561(1.1);7.1385(0.6);6.9188(0.5);6.9014(0.9);6.8835(0.4);6.7948(1.0);6.7745(1.0);5.2426(0.5);5.2229(0.5);4.2655(0.8);4.2517(1.4);4.2391(0.8);3.3230(12.3);3.0662(2.8);3.0538(2.8);2.5055(17.4);2.5013(22.6);2.4970(17.0);2.1478(0.4);2.1343(0.4);2.0450(0.3);2.0307(0.4);1.9884(0.9);1.3974(16.0);1.1746(0.4);0.0078(0.5);-0.0002(12.0)
395	1.93		395: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9826(3.1);8.9620(3.2);8.4484(2.1);8.4334(2.3);8.4245(2.4);8.4103(12.6);8.3268(0.6);7.9292(1.8);7.9165(1.8);7.6580(3.8);7.6532(7.4);7.6484(4.2);7.5327(2.4);7.5095(4.5);7.4864(2.4);7.4628(11.2);7.4594(10.8);7.3192(0.3);7.3065(2.9);7.2879(3.1);7.1773(1.4);7.1738(1.4);7.1563(2.9);7.1388(1.9);7.1353(1.8);6.9190(2.0);6.9164(2.2);6.9001(3.6);6.8979(3.8);6.8819(1.8);6.8792(1.8);6.7961(4.0);6.7940(4.1);6.7757(3.7);6.7735(3.6);5.7559(16.0);5.2477(0.8);5.2330(1.9);5.2134(1.9);5.1997

			(0.9) ;4.2618(3.1) ;4.2486(5.4) ;4.2356(3.4) ;4.0379(0.4) ;4.0202(0.4) ;3.3218(86.0) ;3.0661(11.7) ;3.0536(11.8) ;2.6749(0.6) ;2.6705(0.8) ;2.6660(0.6) ;2.5238(2.8) ;2.5103(50.5) ;2.5060(102.1) ;2.5015(134.9) ;2.4970(97.8) ;2.4927(47.7) ;2.3328(0.6) ;2.3282(0.8) ;2.3237(0.6) ;2.1916(0.4) ;2.1780(0.9) ;2.1627(1.0) ;2.1574(0.9) ;2.1424(1.6) ;2.1289(1.5) ;2.1149(0.6) ;2.0549(0.5) ;2.0425(1.3) ;2.0280(1.5) ;2.0205(0.8) ;2.0150(0.9) ;2.0069(1.1) ;1.9887(2.2) ;1.3973(10.5) ;1.3516(0.5) ;1.2587(0.4) ;1.2492(0.3) ;1.2333(0.9) ;1.1926(0.5) ;1.1748(1.0) ;1.1570(0.5) ;0.0080(1.2) ;-0.0001(34.0) ;-0.0084(1.3)
427	3.81		427: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=8.8749(4.5) ;8.8543(4.6) ;8.6918(16.0) ;8.2529(4.8) ;8.2338(5.1) ;8.2316(5.1) ;7.8425(4.2) ;7.8272(6.1) ;7.7693(4.8) ;7.7486(5.2) ;7.7304(3.1) ;7.6505(0.9) ;7.6422(1.0) ;7.6350(1.2) ;7.6273(1.9) ;7.6235(2.0) ;7.6142(1.9) ;7.6064(1.9) ;7.6016(1.9) ;7.5948(1.2) ;7.5866(1.0) ;7.5788(0.8) ;7.4334(4.3) ;7.4147(4.7) ;7.2421(2.4) ;7.2322(2.4) ;7.2202(2.3) ;7.1731(2.1) ;7.1554(4.4) ;7.1378(2.7) ;6.9373(3.2) ;6.9188(5.5) ;6.9002(2.6) ;6.7863(6.0) ;6.7657(5.5) ;5.2365(1.2) ;5.2204(2.8) ;5.2018(2.8) ;5.1875(1.3) ;4.2935(0.8) ;4.2753(2.7) ;4.2587(4.8) ;4.2499(4.6) ;4.2384(2.6) ;4.2310(2.9) ;4.2102(0.9) ;4.0554(0.4) ;4.0378(0.9) ;4.0205(0.9) ;3.4979(41.4) ;3.4611(0.3) ;3.3196(127.6) ;3.2906(37.1) ;3.2593(0.4) ;3.2518(0.4) ;2.6711(1.5) ;2.6075(0.4) ;2.5052(201.2) ;2.5014(249.4) ;2.3279(1.4) ;2.1701(1.6) ;2.1600(1.7) ;2.1500(1.9) ;2.1376(1.4) ;2.1280(0.8) ;2.0556(1.8) ;2.0483(2.1) ;2.0386(1.5) ;2.0298(1.5) ;2.0223(1.3) ;2.0126(1.2) ;1.9885(3.7) ;1.3978(3.7) ;1.2364(0.7) ;1.1922(0.9) ;1.1746(1.9) ;1.1566(1.0) ;-0.0002(4.5)
445	2.13		445: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=8.4154(0.6) ;8.4123(0.6) ;7.6823(0.4) ;7.6786(0.4) ;7.6571(0.4) ;7.6475(0.4) ;7.6400(0.9) ;6.7637(0.4) ;5.7524(16.0) ;4.0645(0.6) ;3.8724(0.6) ;3.3200(2.8) ;2.5052(4.9) ;2.5008(6.3) ;2.4963(4.5) ;2.3205(0.4) ;1.9880(0.7) ;1.1752(0.4) ;-0.0002(4.8)
452	3.94		452: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=8.7209(3.6) ;8.7000(4.0) ;8.6897(16.0) ;8.2701(3.6) ;8.2667(4.0) ;8.2490(4.3) ;8.2456(4.2) ;7.8441(3.0) ;7.8409(3.3) ;7.8265(5.0) ;7.8233(4.6) ;7.7697(4.4) ;7.7515(3.6) ;7.7486(4.4) ;7.7308(2.8) ;7.6522(0.7) ;7.6444(0.8) ;7.6369(0.9) ;7.6300(1.4) ;7.6246(1.4) ;7.6163(1.4) ;7.6081(1.3) ;7.6034(1.4) ;7.5958(0.9) ;7.5887(0.8) ;7.5810(0.6) ;7.4924)

			7(0.3);7.4814(2.2);7.4729(2.9);7.4605(2.8);7.2674(1.3);7.2549(3.5);7.2449(6.3);7.2328(9.0);7.2219(8.0);7.2162(3.8);7.2103(4.7);7.1981(0.5);5.7572(10.3);5.5284(1.0);5.5088(2.9);5.4887(2.9);5.4687(1.0);3.4923(37.5);3.3247(16.2);3.3105(0.7);3.2922(32.1);2.9922(0.7);2.9841(0.8);2.9705(0.9);2.9620(1.0);2.9529(1.6);2.9448(1.6);2.9309(1.6);2.9228(1.4);2.8834(1.1);2.8630(2.4);2.8426(1.8);2.8234(1.2);2.802 6(0.7);2.5231(1.6);2.5094(15.9);2.5051(32.4);2.5007(41.5);2.4962(30.3);2.4728(1.7);2.4643(1.4);2.4530(0.8);2.4449(0.6);1.9656(0.7);1.9440(1.9);1.9342(0.8);1.923 2(1.9);1.9127(1.8);1.9014(0.8);1.8918(1.7);1.8700(0.6)
481	3, 33		481: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.8434(0.4);9.1777(1.2);9.1644(1.4);9.1583(1.5);9.1461(1.1);8.9656(0.6);8.5679(0.4);8.5578(0.4);8.3141(0.4);8.2906(0.3);8.2685(0.4);8.2490(2.2);8.2440(2.2);8.2295(2.4);8.2244(2.4);8.0111(0.7);7.9895(0.6);7.9522(1.0);7.6897(2.8);7.6861(2.8);7.6697(3.4);7.6661(3.2);7.6383(1.3);7.6206(3.6);7.6005(6.3);7.5945(4.4);7.5819(1.4);7.5774(0.8);7.5191(0.4);7.5077(0.4);7.4986(0.4);7.4872(0.4);7.4510(1.0);7.4428(0.9);7.4319(1.9);7.4236(1.7);7.4122(1.2);7.4041(1.0);7.3352(2.6);7.3166(3.0);7.3077(2.3);7.2883(0.9);7.1880(1.2);7.1703(2.4);7.1527(1.5);6.9365(1.3);6.9169(2.1);6.8982(1.0);6.8079(3.2);6.7875(2.9);5.7540(7.8);5.2734(1.3);4.3307(0.6);4.3220(0.9);4.3038(1.1);4.2928(1.5);4.2828(0.9);4.2350(1.1);4.2103(1.5);4.1831(0.6);4.1709(0.8);4.0380(0.6);4.0202(0.6);3.8597(5.5);3.8494(7.9);3.8384(5.6);3.5677(1.0);3.3182(55.2);3.2947(0.7);3.2627(6.5);2.8904(6.9);2.7313(6.1);2.6743(0.9);2.6700(1.2);2.6657(0.9);2.6238(0.6);2.5054(151.3);2.5010(194.0);2.4966(144.4);2.4305(16.0);2.3321(0.9);2.3276(1.2);2.3234(0.8);2.2815(0.4);2.2703(0.6);2.2584(0.6);2.2457(1.0);2.2346(1.0);2.2223(0.8);2.2102(0.7);2.0907(1.1);2.0764(0.8);2.0611(0.8);1.9881(2.2);1.9643(2.5);1.9078(0.7);1.2982(0.8);1.2586(1.2);1.2354(1.8);1.1925(0.7);1.1749(1.3);1.1570(0.7);1.0448(0.8);1.0296(0.9);0.8533(0.5);0.8367(0.4);−0.0002(20.1)
482	4, 36		482: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.2312(1.6);9.2113(1.7);8.8635(0.8);8.8560(0.7);8.6870(4.9);8.6846(4.8);8.4211(0.4);8.4187(0.4);8.4001(0.5);8.3976(0.5);8.3288(2.1);8.3253(2.2);8.3085(2.4);8.

			3046(2.3);7.9518(2.0);7.9399(0.4);7.9219(0.6);7.9013(0.5);7.8692(0.6);7.8658(0.7);7.8512(0.4);7.8481(0.4);7.7575(1.4);7.7398(3.3);7.7265(0.8);7.7194(3.5);7.7134(3.1);7.7092(5.0);7.7044(3.8);7.6931(3.6);7.6900(4.4);7.4756(0.6);7.4676(0.9);7.4573(1.2);7.4481(1.9);7.4380(1.7);7.4285(1.2);7.4184(1.1);7.4106(0.4);7.4063(0.5);7.3859(0.6);7.3624(3.5);7.3434(4.0);7.3282(1.0);7.1883(1.2);7.1679(2.6);7.1496(1.6);6.9420(0.4);6.9215(1.7);6.9027(2.5);6.8841(1.1);6.8042(3.6);6.7838(3.2);6.4934(0.6);6.3542(1.2);6.2153(0.6);5.2813(0.6);5.2666(1.4);5.2495(1.3);5.2341(0.6);4.3072(0.4);4.2994(0.6);4.2811(1.5);4.2661(2.6);4.2573(2.4);4.2461(1.4);4.2383(1.6);4.2184(0.5);3.6443(1.0);3.6356(1.1);3.6076(2.1);3.5982(2.1);3.5702(1.1);3.5611(1.1);3.3361(8.5);3.1204(16.0);2.8898(12.3);2.7309(11.2);2.6697(0.4);2.5464(0.5);2.5320(0.4);2.5051(52.8);2.5008(69.0);2.4966(53.0);2.3273(0.4);2.2272(0.8);2.2132(1.0);2.2032(1.0);2.1911(1.0);2.1802(0.8);2.1700(0.5);2.0712(0.8);2.0635(1.0);2.0557(1.1);2.0404(0.8);2.0291(0.7);2.0202(0.7);2.0057(0.3);-0.0003(6.8)
483	4,51		483: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1530(3.3);9.1331(3.3);8.3144(0.4);8.2384(3.3);8.2175(3.5);7.8013(3.3);7.7859(4.0);7.7833(4.0);7.6663(12.9);7.6617(16.0);7.6435(3.0);7.6257(7.6);7.6217(9.8);7.6044(2.4);7.3530(3.1);7.3342(3.3);7.1978(1.5);7.1799(3.2);7.1626(1.9);7.1591(1.9);6.9502(2.2);6.9325(3.8);6.9143(1.8);6.8162(4.2);6.7962(3.8);5.7539(0.9);5.3110(0.9);5.2992(1.9);5.2910(1.6);5.2806(1.9);5.2681(0.9);4.3430(0.8);4.3318(1.2);4.3146(1.5);4.3034(1.9);4.2377(1.5);4.2126(2.1);4.1903(1.0);4.1861(0.8);3.8582(7.3);3.8486(9.8);3.8372(7.6);3.3198(91.4);3.2545(9.6);2.8907(1.6);2.7317(1.5);2.6703(1.1);2.5307(28.2);2.5057(131.0);2.5014(169.2);2.4972(132.2);2.4303(0.4);2.3280(1.0);2.3238(0.9);2.2931(0.5);2.2833(0.7);2.2694(0.8);2.2569(1.3);2.2474(1.3);2.2359(1.1);2.2245(1.0);2.1036(1.5);2.0895(1.1);2.0744(1.0);2.0689(1.0);1.3522(0.3);1.2983(0.4);1.2583(0.6);1.2331(1.0);1.0454(0.5);1.0302(0.5);-0.0002(21.6)
484	1,75		484: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0532(4.3);9.0323(4.2);8.5051(0.4);8.4393(4.2);8.4350(4.5);8.4201(4.4);8.4155(4.6);8.3939(8.8);8.3868(9.2);8.3142(1.4);7.6897(0.4);7.6761(6.0);7.6726(6.4);7.6560(7.9);7.6525(8.2);7.6359(2.7);7.6087(1.6);7.5964(2.8);7.5831(4.2);7.5660(16.

			0) ; 7. 5467 (7. 3) ; 7. 5290 (2. 7) ; 7. 4346 (2. 4) ; 7. 4274 (2. 4) ; 7. 4149 (4. 7) ; 7. 4079 (4. 6) ; 7. 395 3 (2. 9) ; 7. 3881 (2. 7) ; 7. 3083 (6. 5) ; 7. 3013 (7. 6) ; 7. 2893 (5. 4) ; 7. 1723 (2. 8) ; 7. 1545 (5. 6) ; 7 . 1369 (3. 3) ; 6. 9047 (4. 1) ; 6. 8873 (6. 8) ; 6. 8693 (3. 2) ; 6. 7945 (7. 5) ; 6. 7740 (6. 8) ; 5. 2588 (1. 6) ; 5. 2429 (3. 5) ; 5. 2246 (3. 4) ; 5. 2103 (1. 5) ; 4. 7025 (4. 2) ; 4. 6839 (6. 9) ; 4. 6682 (6. 4) ; 4. 646 5 (2. 6) ; 4. 6386 (2. 2) ; 4. 3431 (1. 0) ; 4. 3325 (1. 0) ; 4. 2970 (6. 9) ; 4. 2829 (10. 8) ; 4. 2688 (9. 9) ; 4. 2575 (8. 7) ; 4. 2461 (5. 4) ; 4. 2278 (0. 8) ; 4. 0556 (1. 0) ; 4. 0378 (3. 1) ; 4. 0200 (3. 2) ; 4. 0022 (1 . 1) ; 3. 7921 (5. 4) ; 3. 7775 (8. 0) ; 3. 7605 (5. 6) ; 3. 4061 (0. 4) ; 3. 3209 (633. 3) ; 3. 2515 (0. 4) ; 2. 6703 (5. 2) ; 2. 5056 (663. 0) ; 2. 5013 (852. 3) ; 2. 4971 (645. 4) ; 2. 3840 (0. 4) ; 2. 3324 (3. 9) ; 2. 32 80 (5. 2) ; 2. 3082 (0. 4) ; 2. 1919 (0. 8) ; 2. 1797 (1. 6) ; 2. 1597 (1. 9) ; 2. 1448 (2. 9) ; 2. 1293 (2. 4) ; 2. 1159 (1. 1) ; 2. 0312 (2. 3) ; 2. 0180 (2. 4) ; 1. 9883 (14. 6) ; 1. 2981 (0. 3) ; 1. 2593 (0. 4) ; 1. 2345 (1. 1) ; 1. 1926 (3. 6) ; 1. 1748 (7. 1) ; 1. 1570 (3. 5) ; 1. 0448 (6. 4) ; 1. 0295 (6. 3) ; 0. 8540 (0. 3) ; 0. 0 078 (1. 1) ; −0. 0002 (31. 7)
485	4, 61		485: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 0447 (1. 3) ; 9. 0241 (1. 4) ; 8. 6831 (5. 0) ; 8. 3580 (0. 9) ; 8. 3422 (1. 0) ; 8. 3344 (1. 0) ; 8. 3188 (1. 0) ; 7. 6986 (1. 6) ; 7. 6939 (3. 0) ; 7. 6892 (1. 8) ; 7. 6815 (1. 1) ; 7. 6582 (1. 9) ; 7. 6350 (1. 0) ; 7. 5067 (4. 9) ; 7. 5025 (4. 7) ; 7. 4296 (0. 9) ; 7. 4176 (1. 1) ; 7. 4087 (1. 0) ; 7. 2865 (0. 5) ; 7. 2766 (0. 9) ; 7. 2645 (1. 5) ; 7. 2529 (0. 7) ; 7. 2405 (2. 7) ; 7. 2354 (1. 7) ; 7. 2291 (1. 7) ; 7. 2245 (1. 3) ; 7. 2186 (1. 6) ; 5. 5624 (0. 4) ; 5. 5433 (1. 1) ; 5. 5237 (1. 1) ; 5. 5041 (0. 4) ; 3. 8775 (2. 7) ; 3. 8671 (4. 2) ; 3. 8565 (2. 8) ; 3. 5679 (2. 1) ; 3. 3194 (17. 3) ; 3. 2870 (3. 4) ; 3. 2784 (3. 4) ; 3. 0030 (0. 3) ; 2. 9938 (0. 4) ; 2. 9851 (0. 5) ; 2. 9765 (0. 6) ; 2. 9634 (0. 6) ; 2. 9552 (0. 5) ; 2. 9048 (0. 4) ; 2. 8845 (0. 9) ; 2. 864 6 (0. 7) ; 2. 8450 (0. 5) ; 2. 6708 (0. 5) ; 2. 6662 (0. 4) ; 2. 5661 (0. 3) ; 2. 5564 (0. 6) ; 2. 5453 (0. 8) ; 2 . 5356 (1. 0) ; 2. 5237 (2. 6) ; 2. 5059 (67. 0) ; 2. 5015 (85. 5) ; 2. 4972 (64. 1) ; 2. 3327 (0. 4) ; 2. 3285 (0. 5) ; 2. 3238 (0. 4) ; 1. 9882 (1. 2) ; 1. 9554 (0. 6) ; 1. 9449 (0. 3) ; 1. 9351 (0. 6) ; 1. 9237 (0. 6) ; 1. 9042 (0. 6) ; 1. 3978 (16. 0) ; 1. 1752 (0. 6) ; −0. 0002 (3. 5)
486	2. 63		486: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 3542 (5. 2) ; 9. 3302 (5. 6) ; 9. 1745 (3. 3) ; 9. 1546 (3. 4) ; 8. 5530 (16. 0) ; 8. 4199 (3. 0) ; 8. 404 3 (3. 3) ; 8. 3963 (3. 5) ; 8. 3808 (3. 2) ; 8. 1903 (5. 9) ; 8. 1702 (6. 4) ; 7. 7341 (3. 5) ; 7. 7112 (6. 5) ; 7 . 6943 (2. 1) ; 7. 6878 (5. 3) ; 7. 6762 (3. 0) ; 7. 6661 (2. 0) ; 7. 6563 (1. 7) ; 7. 5069 (2. 7) ; 7. 4864 (3. 7) ; 7. 4659 (2. 1) ; 7. 3456 (4. 0) ; 7. 3267 (4. 4) ; 7. 1685 (2. 0) ; 7. 1506 (4. 3) ; 7. 1329 (2. 6) ; 7. 130

			2(2.5);6.9072(3.0);6.8889(5.2);6.8703(2.4);6.7892(5.9);6.7690(5.4);5.2557(1.2);5.2415(2.6);5.2224(2.7);5.2081(1.2);4.2961(0.7);4.2873(1.0);4.2804(0.9);4.2686(2.4);4.2592(2.3);4.2526(2.8);4.2429(3.4);4.2350(2.7);4.2211(2.2);4.2140(2.8);4.1933(1.0);4.1864(0.8);4.0381(0.5);4.0204(0.5);3.8901(13.8);3.8786(8.0);3.8613(1.1);3.3619(1.0);3.3512(1.8);3.3217(51.2);3.3073(9.9);3.2947(4.6);3.2752(1.7);3.2647(1.0);2.6702(0.9);2.6662(0.7);2.5404(3.4);2.5054(114.7);2.5012(147.6);2.4969(111.5);2.3277(0.9);2.2413(0.6);2.2284(0.9);2.2203(1.2);2.2072(1.7);2.1979(1.7);2.1856(1.8);2.1736(1.3);2.1643(0.8);2.0621(1.2);2.0540(1.7);2.0471(1.9);2.0314(1.4);2.0198(1.3);2.0125(1.2);2.0049(0.8);1.9975(0.6);1.9883(2.2);1.2586(0.4);1.2350(0.4);1.1927(0.6);1.1749(1.1);1.1589(5.2);1.0697(4.9);1.0455(0.4);1.0301(0.4);0.1459(0.7);0.0073(6.8);−0.0002(147.2);−0.1497(0.8)
490	2.96		490: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1477(4.1);9.1276(4.1);8.5827(12.2);8.3171(2.9);8.3016(3.0);8.2939(3.1);8.2782(2.8);7.9206(2.2);7.6395(3.1);7.6171(5.3);7.5945(2.9);7.3628(2.2);7.3551(2.2);7.3452(2.4);7.3386(2.3);7.2276(2.8);7.2178(2.4);7.2081(3.6);7.1982(3.5);7.1819(2.0);7.1787(2.0);7.1607(4.1);7.1434(6.7);7.1244(2.7);7.0096(0.5);6.9931(0.7);6.9503(3.6);6.9211(5.0);6.9062(4.3);6.8877(2.0);6.7966(5.4);6.7764(4.8);5.2635(1.1);5.2495(2.4);5.2301(2.4);5.2154(1.1);4.2964(0.9);4.2773(2.1);4.2608(2.5);4.2515(2.8);4.2266(2.2);4.1995(0.8);4.0557(1.2);4.0379(3.4);4.0201(3.4);4.0023(1.1);3.8713(11.2);3.3206(387.1);3.2966(7.4);3.2905(7.5);3.2825(7.0);3.2732(5.1);3.2568(2.4);3.2395(1.2);2.6747(1.8);2.6703(2.4);2.6661(1.8);2.5057(315.1);2.5013(404.4);2.4970(301.6);2.4284(0.4);2.3278(5.0);2.2944(14.1);2.2808(14.3);2.2321(3.2);2.2139(1.4);2.2024(1.5);2.1933(1.5);2.1807(1.2);2.0542(1.7);2.0257(1.2);2.0200(1.1);2.0040(0.6);1.9883(14.3);1.8912(14.0);1.8683(13.8);1.3979(16.0);1.2586(0.3);1.2359(0.8);1.1927(3.8);1.1749(7.5);1.1571(3.7);1.0448(0.8);1.0296(0.8);−0.0002(5.2)
515	3.00		515: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1233(0.6);9.1025(0.6);8.5606(1.9);8.2915(0.5);8.2868(0.5);8.2717(0.5);8.2669(0.5);8.1363(10.5);7.7032(0.6);7.6996(0.6);7.6832(0.8);7.6797(0.7);7.6686(0.8);7.6482(1.2);7.6420(0.9);7.4385(0.4);7.4299(0.4);7.3534(0.6);7.3361(0.7);7.1628(0.

			5) ;7. 1460 (0. 3) ;7. 1422 (0. 3) ;6. 9168 (0. 4) ;6. 8993 (0. 6) ;6. 7981 (0. 7) ;6. 7787 (0. 6) ;4. 2597 (0. 6) ;4. 2485 (0. 5) ;4. 2391 (0. 3) ;3. 8361 (0. 4) ;3. 8217 (0. 4) ;3. 8088 (0. 5) ;3. 3351 (2. 2) ;3. 3298 (2. 2) ;3. 3070 (2. 3) ;3. 1311 (0. 5) ;3. 1135 (0. 7) ;3. 0824 (4. 2) ;2. 6708 (0. 4) ;2. 5061 (48. 0) ;2. 5017 (62. 2) ;2. 4973 (46. 5) ;2. 3283 (0. 4) ;2. 0857 (16. 0) ;2. 0411 (0. 4) ;2. 0329 (0. 4) ;1. 7082 (0. 4) ;−0. 0002 (7. 0)
516	3, 90		516: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=8. 8758 (2. 0) ;8. 8723 (2. 0) ;8. 8550 (2. 1) ;8. 7191 (6. 4) ;8. 7148 (6. 2) ;8. 3524 (1. 2) ;8. 3445 (1. 3) ;8. 3368 (1. 4) ;8. 3289 (2. 5) ;8. 3210 (1. 5) ;8. 3134 (1. 4) ;8. 3055 (1. 3) ;7. 7689 (2. 3) ;7. 7459 (4. 2) ;7. 7227 (2. 4) ;7. 7125 (0. 7) ;7. 7045 (0. 7) ;7. 6975 (1. 2) ;7. 6926 (1. 2) ;7. 6839 (1. 1) ;7. 6712 (1. 2) ;7. 6640 (0. 7) ;7. 6561 (0. 6) ;7. 6484 (0. 5) ;7. 4239 (1. 8) ;7. 4047 (1. 9) ;7. 3115 (0. 8) ;7. 2995 (1. 1) ;7. 2892 (1. 4) ;7. 2665 (0. 7) ;7. 1748 (1. 3) ;7. 1716 (1. 4) ;7. 1539 (2. 8) ;7. 1364 (1. 7) ;7. 1330 (1. 7) ;6. 9314 (2. 0) ;6. 9130 (3. 4) ;6. 8946 (1. 6) ;6. 7840 (3. 8) ;6. 7652 (3. 4) ;5. 2246 (0. 7) ;5. 2093 (1. 6) ;5. 1923 (1. 6) ;5. 1773 (0. 6) ;4. 2981 (0. 4) ;4. 2901 (0. 6) ;4. 2828 (0. 5) ;4. 2711 (1. 6) ;4. 2620 (1. 6) ;4. 2542 (2. 4) ;4. 2456 (2. 6) ;4. 2255 (1. 6) ;4. 2200 (1. 2) ;4. 2049 (0. 4) ;4. 1983 (0. 5) ;4. 0560 (0. 4) ;4. 0382 (1. 3) ;4. 0204 (1. 3) ;4. 0027 (0. 5) ;3. 5003 (16. 0) ;3. 4938 (15. 3) ;3. 4796 (0. 6) ;3. 3204 (13. 4) ;3. 2904 (24. 9) ;3. 2554 (0. 4) ;2. 6753 (0. 4) ;2. 6707 (0. 6) ;2. 6667 (0. 4) ;2. 5061 (71. 2) ;2. 5017 (92. 2) ;2. 4972 (69. 1) ;2. 3327 (0. 4) ;2. 3285 (0. 5) ;2. 3241 (0. 4) ;2. 1784 (0. 7) ;2. 1686 (0. 8) ;2. 1561 (1. 0) ;2. 1492 (1. 0) ;2. 1437 (1. 0) ;2. 1362 (0. 8) ;2. 0592 (0. 7) ;2. 0512 (0. 9) ;2. 0433 (1. 2) ;2. 0354 (1. 1) ;2. 0257 (0. 9) ;2. 0178 (0. 8) ;2. 0087 (0. 8) ;2. 0018 (0. 7) ;1. 9887 (6. 0) ;1. 3975 (4. 4) ;1. 1929 (1. 5) ;1. 1751 (3. 0) ;1. 1573 (1. 4) ;0. 0079 (0. 5) ;−0. 0002 (12. 2) ;−0. 0082 (0. 5)
518	2. 19		518: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 0894 (1. 9) ;9. 0689 (1. 9) ;8. 5253 (6. 9) ;8. 4176 (1. 8) ;8. 3983 (2. 0) ;7. 9524 (2. 4) ;7. 7616 (2. 1) ;7. 7592 (2. 1) ;7. 7438 (2. 6) ;7. 7414 (2. 4) ;7. 7153 (0. 8) ;7. 7027 (1. 6) ;7. 6900 (0. 8) ;7. 6238 (6. 7) ;7. 6194 (12. 3) ;7. 6103 (4. 6) ;7. 6061 (3. 5) ;7. 6009 (1. 5) ;7. 5766 (1. 8) ;7. 5583 (2. 0) ;7. 5555 (2. 0) ;7. 5374 (1. 5) ;7. 3313 (1. 8) ;7. 3134 (1. 9) ;7. 1897 (0. 9) ;7. 1870 (0. 8) ;7. 1692 (1. 8) ;7. 1516 (1. 2) ;7. 1480 (1. 1) ;6. 9265 (1. 3) ;6. 9239 (1. 3) ;6. 9076 (2. 2) ;6. 8894 (1. 1) ;6. 8867 (1. 0) ;6. 8100 (2. 5) ;6. 7896 (2. 3) ;5. 2760 (0. 5) ;5. 2619 (1. 1) ;5. 2426 (1. 1) ;5. 2280 (0. 5) ;4. 6943 (1. 5) ;4. 6787 (2. 2) ;4. 6755 (2. 2) ;4. 6691 (1. 7) ;4. 6600 (1. 9) ;4. 6536 (2. 3) ;4. 650

		5(2.1);4.6349(1.6);4.3095(0.3);4.2989(1.9);4.2902(3.4);4.2843(4.8);4.2753(5.3);4.2612(3.2);3.8016(1.6);3.7850(2.6);3.7698(1.8);3.3394(0.5);3.3204(30.7);3.3072(1.3);3.2882(0.7);3.2737(0.4);2.8904(16.0);2.7318(13.8);2.6747(0.4);2.6701(0.5);2.6659(0.4);2.5058(64.7);2.5014(82.8);2.4969(60.3);2.4927(29.6);2.3281(0.5);2.1972(0.4);2.1851(0.4);2.1757(0.6);2.1616(0.9);2.1460(0.7);2.1320(0.3);2.0740(2.6);2.0620(0.8);2.0505(0.8);2.0356(0.6);2.0263(0.6);2.0164(0.5);0.0079(1.5);-0.0002(38.6);-0.0085(1.5)
522	2.88	522: ^{1}H-NMR(601.6 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0428(0.8);9.0296(0.8);8.1535(0.8);8.1513(0.8);8.1394(0.9);8.1372(0.9);7.7631(0.8);7.7608(0.8);7.7512(1.0);7.7490(0.9);7.6672(3.5);7.6640(3.9);7.6101(0.9);7.6069(1.5);7.6038(0.7);7.5892(0.8);7.5772(0.8);7.5752(0.8);7.5632(0.7);7.3301(0.6);7.3172(0.7);7.1857(0.4);7.1831(0.4);7.1716(0.7);7.1600(0.4);7.1574(0.4);6.9397(0.5);6.9380(0.5);6.9257(0.8);6.9149(0.4);6.9132(0.4);6.8047(0.9);6.7924(0.9);5.7502(1.4);5.2771(0.4);5.2642(0.4);4.2903(0.4);4.2268(0.3);4.2106(0.5);3.3053(4.6);3.0336(16.0);2.5150(7.7);2.5060(4.4);2.5030(9.2);2.5000(12.7);2.4970(9.2);2.4940(4.3);1.3973(0.8);-0.0002(9.1)
523	2.11	523: ^{1}H-NMR(601.6 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0676(0.4);9.0547(0.6);9.0421(0.3);8.1664(0.9);8.1630(0.9);8.1534(1.1);8.1499(1.0);7.6767(1.1);7.6741(1.1);7.6632(1.3);7.6607(1.2);7.5844(0.6);7.5726(1.4);7.5593(2.3);7.5550(1.3);7.5467(0.4);7.4260(0.6);7.4174(0.4);7.3207(0.5);7.3128(0.9);7.3014(1.2);7.1740(0.4);7.1635(0.8);7.1501(0.4);6.9255(0.4);6.9132(0.5);6.7968(1.0);6.7823(0.9);5.3055(0.4);5.2630(0.4);5.2568(0.4);4.2883(0.4);4.2826(0.4);4.2086(0.4);4.1667(0.4);3.3028(42.7);3.0387(16.0);3.0127(0.7);2.6147(0.4);2.6116(0.5);2.6084(0.4);2.6054(0.5);2.5208(0.9);2.5178(1.1);2.5147(1.2);2.5059(28.6);2.5029(63.1);2.4999(88.1);2.4968(63.1);2.4938(29.0);2.4136(4.2);2.3869(0.4);2.3840(0.5);2.3811(0.4);2.2183(0.4);2.2113(0.4);1.3983(11.6);0.0052(1.4);-0.0002(61.6);-0.0058(2.3)
524	2.34	524: ^{1}H-NMR(601.6 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0713(0.8);9.0578(0.8);8.1990(0.9);8.1846(0.9);7.7017(0.8);7.6914(1.0);7.6896

			(1.0) ;7.6095 (0.9) ;7.5972 (1.0) ;7.5837 (0.8) ;7.5631 (0.4) ;7.3217 (0.8) ;7.3096 (0.8) ;7.1789 (0.8) ;7.1680 (1.0) ;7.1566 (0.6) ;6.9311 (0.6) ;6.9192 (1.0) ;6.9080 (0.6) ;6.8015 (1.0) ;6.7876 (0.9) ;5.2704 (0.6) ;5.2579 (0.5) ;4.3124 (0.4) ;4.3049 (0.4) ;4.2890 (0.4) ;4.2232 (0.5) ;4.2075 (0.5) ;4.1930 (0.3) ;4.1891 (0.4) ;3.3025 (59.1) ;3.2911 (0.4) ;3.0396 (16.0) ;3.0127 (0.9) ;2.6120 (0.9) ;2.6084 (0.7) ;2.6057 (0.8) ;2.5210 (1.5) ;2.5180 (1.8) ;2.5145 (1.8) ;2.5058 (51.6) ;2.5030 (107.0) ;2.5000 (145.0) ;2.4970 (104.8) ;2.4942 (49.6) ;2.4679 (7.8) ;2.3842 (1.0) ;2.2364 (0.4) ;2.2282 (0.3) ;2.2188 (0.4) ;2.0703 (0.4) ;1.3984 (0.7) ;1.2362 (0.8) ;0.0966 (0.4) ;0.0052 (2.0) ;−0.0002 (82.2) ;−0.0057 (3.6) ;−0.1001 (0.5)
525	2.62		525: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.1140 (1.1) ;9.1057 (1.1) ;9.0945 (1.2) ;9.0855 (1.0) ;8.5540 (6.4) ;8.3143 (0.7) ;8.2423 (1.9) ;8.2373 (1.8) ;8.2225 (2.0) ;8.2176 (2.0) ;7.7020 (2.3) ;7.6983 (2.3) ;7.6822 (3.5) ;7.6783 (2.8) ;7.6659 (3.1) ;7.6457 (5.0) ;7.6395 (3.2) ;7.6264 (1.0) ;7.4582 (0.8) ;7.4470 (0.9) ;7.4388 (1.7) ;7.4279 (1.6) ;7.4191 (1.1) ;7.4078 (0.9) ;7.3495 (2.8) ;7.3293 (3.4) ;7.3094 (0.8) ;7.1767 (1.0) ;7.1592 (2.0) ;7.1411 (1.3) ;6.9254 (1.4) ;6.9072 (2.4) ;6.8882 (1.1) ;6.7955 (2.8) ;6.7753 (2.5) ;5.2371 (1.1) ;5.2227 (1.1) ;4.2896 (0.5) ;4.2708 (1.3) ;4.2555 (2.3) ;4.2473 (2.1) ;4.2358 (1.2) ;4.2282 (1.4) ;4.2078 (0.4) ;4.2005 (0.3) ;3.5676 (0.3) ;3.3679 (1.4) ;3.3498 (4.3) ;3.3208 (300.6) ;3.0155 (14.3) ;2.6749 (1.8) ;2.6704 (2.3) ;2.6663 (1.7) ;2.5234 (7.5) ;2.5058 (309.0) ;2.5014 (394.8) ;2.4970 (286.9) ;2.3325 (1.8) ;2.3280 (2.3) ;2.3240 (1.7) ;2.2142 (0.5) ;2.2047 (0.5) ;2.1922 (0.8) ;2.1823 (0.8) ;2.1699 (0.8) ;2.1586 (0.6) ;2.1484 (0.4) ;2.0360 (0.8) ;2.0218 (0.7) ;2.0092 (0.6) ;2.0012 (0.6) ;1.9885 (0.8) ;1.3979 (16.0) ;1.2461 (3.0) ;1.2288 (6.1) ;1.2111 (3.0) ;1.1924 (0.3) ;1.1750 (0.4) ;−0.0002 (1.8)
526	3.29		526: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.1145 (1.7) ;9.0942 (1.7) ;8.5403 (7.4) ;8.1746 (1.7) ;8.1548 (1.8) ;7.6988 (2.3) ;7.6951 (2.4) ;7.6788 (2.9) ;7.6748 (3.6) ;7.6559 (2.9) ;7.6357 (3.6) ;7.6280 (3.1) ;7.6136 (1.0) ;7.4537 (0.9) ;7.4429 (0.9) ;7.4343 (1.8) ;7.4235 (1.7) ;7.4147 (1.2) ;7.4039 (1.0) ;7.3536 (3.2) ;7.3346 (3.1) ;7.3083 (0.9) ;7.3051 (0.8) ;7.1757 (1.0) ;7.1569 (2.0) ;7.1382 (1.2) ;6.9241 (1.2) ;6.9056 (2.1) ;6.8868 (1.0) ;6.7922 (2.8) ;6.7720 (2.5) ;5.7549 (1.2) ;5.2457 (0.5) ;5.2315 (1.2) ;5.2132 (1.2) ;5.1980 (0.5) ;4.2829 (0.5) ;4.2761 (0.4) ;4.2640 (1.2) ;4.2546 (1.2) ;4.2470 (1.8) ;4.2373 (1.9) ;4.2238 (1.1) ;4.2164 (1.3) ;4.1962 (0.4) ;4.1885 (0.4) ;3.9291

			(0.3) ;3.9131 (0.8) ;3.8976 (1.1) ;3.8822 (0.8) ;3.8664 (0.4) ;3.5675 (0.5) ;3.3231 (30.0) ;2.9033 (16.0) ;2.5054 (39.1) ;2.5010 (51.0) ;2.4966 (38.0) ;2.2017 (0.4) ;2.1928 (0.5) ;2.1801 (0.8) ;2.1703 (0.8) ;2.1590 (0.8) ;2.1480 (0.6) ;2.1392 (0.4) ;2.0400 (0.6) ;2.0328 (0.8) ;2.0253 (0.9) ;2.0145 (0.7) ;2.0089 (0.7) ;1.9987 (0.6) ;1.9884 (0.8) ;1.3068 (3.5) ;1.2921 (5.6) ;1.2777 (3.4) ;1.2512 (3.4) ;1.2373 (5.5) ;1.2230 (3.7)
527	3.63		527: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.1286 (1.0) ;9.1083 (1.1) ;8.6686 (4.7) ;8.4516 (3.2) ;8.2373 (1.1) ;8.2341 (1.1) ;8.2161 (1.3) ;8.2128 (1.2) ;7.8200 (1.1) ;7.8167 (1.2) ;7.8022 (1.5) ;7.7989 (1.4) ;7.7348 (2.1) ;7.7297 (2.4) ;7.6837 (1.2) ;7.6655 (1.2) ;7.6626 (1.3) ;7.6443 (2.1) ;7.6384 (11.9) ;7.6320 (2.0) ;7.3779 (1.0) ;7.3605 (1.1) ;7.1943 (0.5) ;7.1905 (0.5) ;7.1728 (1.0) ;7.1559 (0.7) ;7.1521 (0.6) ;6.9502 (0.7) ;6.9476 (0.8) ;6.9293 (1.3) ;6.9130 (0.6) ;6.9103 (0.6) ;6.8094 (1.4) ;6.8075 (1.4) ;6.7889 (1.4) ;5.2566 (0.7) ;5.2372 (0.7) ;4.2852 (0.6) ;4.2699 (1.2) ;4.2609 (1.1) ;4.2491 (0.6) ;4.2412 (0.7) ;3.3594 (0.7) ;3.3415 (2.2) ;3.3200 (56.0) ;3.0101 (9.2) ;2.6752 (0.5) ;2.6706 (0.7) ;2.6662 (0.5) ;2.5237 (2.3) ;2.5103 (47.2) ;2.5060 (93.7) ;2.5015 (122.2) ;2.4970 (89.4) ;2.4929 (45.2) ;2.3326 (0.6) ;2.3283 (0.7) ;2.3238 (0.6) ;2.2063 (0.4) ;2.1961 (0.4) ;2.1845 (0.5) ;2.1724 (0.3) ;2.0710 (0.4) ;2.0632 (0.5) ;2.0484 (0.4) ;2.0365 (0.3) ;1.3978 (16.0) ;1.2311 (2.6) ;1.2134 (5.1) ;1.1956 (2.2) ;-0.0002 (0.5)
534	4,51		534: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=10.4184 (1.5) ;9.1346 (1.4) ;9.1144 (1.4) ;8.6595 (5.5) ;8.1798 (1.4) ;8.1587 (1.5) ;7.8117 (1.4) ;7.7965 (1.8) ;7.7941 (1.7) ;7.7032 (0.5) ;7.6815 (1.4) ;7.6605 (1.7) ;7.6458 (10.6) ;7.3875 (1.3) ;7.3689 (1.4) ;7.1966 (0.6) ;7.1784 (1.4) ;7.1608 (0.9) ;6.9817 (0.5) ;6.9771 (0.9) ;6.9724 (0.5) ;6.9544 (1.0) ;6.9360 (1.6) ;6.9173 (0.8) ;6.8121 (1.9) ;6.8008 (2.0) ;6.7960 (2.5) ;5.2728 (0.4) ;5.2584 (0.8) ;5.2391 (0.9) ;5.2247 (0.4) ;4.2869 (0.8) ;4.2708 (1.1) ;4.2589 (1.1) ;4.2454 (0.7) ;4.2376 (0.9) ;3.8866 (0.7) ;3.8705 (1.0) ;3.8538 (0.7) ;3.3288 (4.9) ;2.9128 (10.7) ;2.6782 (0.6) ;2.5136 (82.9) ;2.5093 (107.6) ;2.5050 (80.2) ;2.3403 (0.5) ;2.3361 (0.6) ;2.3319 (0.5) ;2.2178 (0.4) ;2.2040 (0.5) ;2.1942 (0.6) ;2.1821 (0.6) ;2.1704 (0.5) ;2.0675 (0.5) ;2.0600 (0.6) ;2.0439 (0.5) ;2.0335 (0.4) ;2.0261 (0.4) ;1.4053 (16.0) ;1.2887 (5.0) ;1.2725 (5.0) ;1.2420 (5.3) ;1.2258 (5.0)
535	4.46		535: ^{1}H-NMR (400.0 MHz, d_6-DMSO) :

			δ=8.8722(0.8);8.8516(0.8);8.7041(2.9);8.2580(1.2);8.2352(1.4);7.8664(1.4);7.8435(1.3);7.6619(3.4);7.4145(0.7);7.3959(0.8);7.1707(0.4);7.1537(0.7);7.1329(0.4);6.9285(0.5);6.9101(0.9);6.8908(0.4);6.7836(1.0);6.7635(0.9);5.2026(0.5);5.1839(0.5);4.2665(0.4);4.2583(0.4);4.2499(0.6);4.2428(0.6);4.2229(0.4);4.2156(0.5);3.4842(7.0);3.3198(29.6);3.2787(6.2);2.6708(0.3);2.5055(44.2);2.5014(56.4);2.4974(43.0);2.3286(0.3);2.0317(0.4);1.9886(0.5);1.3980(16.0);-0.0003(15.4)
540	3.72		540: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1842(4.4);9.1640(4.4);8.6741(16.0);8.4617(0.4);8.3556(3.0);8.3401(3.2);8.3321(3.3);8.3164(3.3);7.6826(3.4);7.6594(6.4);7.6362(3.2);7.4662(4.8);7.4486(5.5);7.4447(5.5);7.4269(4.5);7.3795(4.1);7.3605(4.4);7.1914(2.0);7.1887(2.0);7.1711(4.2);7.1530(2.6);7.1500(2.5);6.9408(3.0);6.9222(5.1);6.9035(2.4);6.8037(5.7);6.7840(5.1);5.2738(1.2);5.2596(2.6);5.2405(2.6);5.2262(1.1);4.3027(1.0);4.2958(0.9);4.2846(2.4);4.2751(2.3);4.2681(2.8);4.2591(3.5);4.2517(2.7);4.2384(2.1);4.2312(2.7);4.2103(1.0);4.2029(0.8);4.0555(0.7);4.0377(1.9);4.0199(1.9);4.0021(0.7);3.9008(1.0);3.8822(8.3);3.8717(14.3);3.8610(8.7);3.3197(180.6);3.2906(5.5);3.2801(11.1);3.2687(10.7);3.2580(4.7);3.2387(1.4);2.6745(1.6);2.6702(2.1);2.5055(277.9);2.5013(357.7);2.4970(267.8);2.3321(1.6);2.3279(2.2);2.2553(0.6);2.2451(0.9);2.2347(1.2);2.2216(1.7);2.2121(1.8);2.1999(1.8);2.1877(1.3);2.1789(0.8);2.0746(1.6);2.0676(1.9);2.0556(1.4);2.0399(1.3);2.0329(1.2);1.9883(8.1);1.3978(1.0);1.2592(0.3);1.2341(0.8);1.1926(2.1);1.1748(4.1);1.1569(2.1);-0.0002(42.6)
541	1.78		541: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9748(0.6);8.9542(0.6);8.4871(0.4);8.4708(2.2);8.4638(0.5);8.4484(0.4);8.3359(2.1);7.9088(0.3);7.8960(0.4);7.7294(0.7);7.7258(0.8);7.7093(0.9);7.7057(0.9);7.5431(0.5);7.5208(0.8);7.4979(0.5);7.4693(0.5);7.4610(0.4);7.4497(1.0);7.4300(0.6);7.3462(0.3);7.3415(0.5);7.3365(0.4);7.3272(1.1);7.3228(0.7);7.3076(0.8);7.3033(1.1);7.2820(0.7);7.1749(0.3);7.1716(0.3);7.1539(0.7);7.1363(0.4);7.1330(0.4);6.9111(0.5);6.8923(0.8);6.8739(0.4);6.7934(0.9);6.7732(0.8);5.2315(0.4);5.2128(0.4);4.2613(0.7);4.2476(1.2);4.2347(0.7);3.3288(21.4);3.0736(2.0);3.0669(1.4);3.061(2.2);2.5180(17.5);2.5140(34.2);2.5095(44.3);2.5051(32.0);2.1427(0.3);2.0180(0.

			3);1.9968(0.9);1.4060(16.0);1.2437(0.4);1.1831(0.4)
542	1.66		542: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9915(1.7);8.9705(1.8);8.5165(1.4);8.5013(1.5);8.4929(1.5);8.4778(1.3);8.3922(7.2);7.9585(0.8);7.9451(1.0);7.9379(1.0);7.9251(0.8);7.6623(0.4);7.6538(0.5);7.6394(0.9);7.6341(0.9);7.6261(0.9);7.6139(0.9);7.5986(0.5);7.5902(0.4);7.5685(1.5);7.5457(2.8);7.5228(1.5);7.3069(1.8);7.2877(2.0);7.2267(0.6);7.2113(0.8);7.2049(1.0);7.1995(1.0);7.1755(1.5);7.1717(1.5);7.1544(2.2);7.1367(1.4);7.1332(1.2);6.9136(1.5);6.8949(2.6);6.8763(1.2);6.7934(3.0);6.7729(2.8);5.7556(16.0);5.2463(0.6);5.2312(1.4);5.2118(1.4);5.1972(0.6);4.2576(2.0);4.2458(3.6);4.2342(2.0);4.0382(0.6);4.0204(0.6);3.3231(35.1);3.0726(4.9);3.0657(6.0);3.0603(5.8);3.0534(4.9);2.6753(0.3);2.6706(0.4);2.5103(28.6);2.5062(55.4);2.5017(70.8);2.4972(50.6);2.3286(0.4);2.1779(0.8);2.1644(0.8);2.1576(0.7);2.1428(1.0);2.1289(1.0);2.1160(0.4);2.0254(0.8);2.0189(0.8);2.0043(0.7);1.9887(3.0);1.3974(0.6);1.3525(0.5);1.2988(0.3);1.2590(0.5);1.2344(1.2);1.1928(0.7);1.1750(1.4);1.1572(0.7);0.0079(1.9);-0.0002(47.9);-0.0085(1.8)
543	4.25		543: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1849(4.4);9.1647(4.3);8.7031(1.0);8.6905(16.0);8.6712(0.7);8.3740(3.5);8.3584(3.8);8.3503(3.9);8.3348(3.6);8.3149(0.5);7.6836(3.9);7.6607(7.1);7.6380(3.7);7.6243(0.4);7.3846(4.1);7.3651(4.7);7.2348(0.5);7.2223(4.0);7.1898(5.8);7.1718(5.0);7.1540(3.1);7.1505(2.8);6.9435(3.5);6.9267(5.9);6.9083(2.7);6.8046(6.4);6.7845(5.9);6.7131(0.4);5.7551(0.4);5.2587(2.7);5.2416(2.7);5.2278(1.2);4.3052(1.2);4.2978(1.1);4.2860(2.8);4.2761(2.8);4.2697(3.2);4.2611(3.9);4.2528(2.9);4.2390(2.5);4.2324(3.0);4.2105(1.1);4.2039(0.9);4.0559(0.6);4.0377(1.8);4.0200(1.8);4.0019(0.6);3.8664(15.1);3.3202(106.3);3.2860(10.0);3.2751(9.5);2.6740(1.4);2.6705(1.8);2.6660(1.4);2.5055(243.9);2.5012(311.2);2.4968(223.6);2.3279(1.8);2.3233(1.3);2.2376(1.3);2.2238(1.9);2.2145(2.0);2.2028(2.0);2.1943(1.4);2.1895(1.5);2.0685(1.8);2.0522(1.6);1.9883(7.3);1.3976(5.4);1.3510(0.4);1.2985(0.4);1.2588(0.4);1.2354(1.3);1.1925(1.9);1.1747(3.9);1.1568(1.8);0.1464(0.7);0.0222(0.4);0.0079(6.3);-0.0002(153.6);-0.0085(5.8);-0.1493(0.7)

544	2.80	544: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1606(3.0);9.1401(3.1);8.6477(12.1);8.2912(2.2);8.2755(2.4);8.2676(2.5);8.2521(2.3);7.6215(2.5);7.5986(4.5);7.5757(2.5);7.3791(2.8);7.3620(3.0);7.1920(1.4);7.1885(1.4);7.1709(2.9);7.1534(1.8);7.1497(1.7);6.9443(2.1);6.9421(2.1);6.9256(3.6);6.9236(3.5);6.9073(1.7);6.9047(1.7);6.8055(4.1);6.7851(3.8);6.6355(2.1);5.7553(12.7);5.2771(0.8);5.2633(1.8);5.2443(1.8);5.2300(0.8);4.3146(0.5);4.3063(0.7);4.2990(0.6);4.2870(1.6);4.2781(1.6);4.2711(2.0);4.2624(2.4);4.2554(1.9);4.2420(1.5);4.2344(1.9);4.2136(0.7);4.2060(0.5);3.8626(9.5);3.8532(5.6);3.8342(0.7);3.8221(0.4);3.3200(38.5);3.2903(3.2);3.2796(6.3);3.2671(6.0);3.2350(1.0);2.6787(0.3);2.6702(0.8);2.5231(2.6);2.5097(54.0);2.5055(106.3);2.5010(136.5);2.4965(96.8);2.4922(46.2);2.4203(16.0);2.3242(1.1);2.2576(0.5);2.2436(0.7);2.2357(0.9);2.2137(1.2);2.2007(1.2);2.1894(0.9);2.1807(0.6);2.0829(7.5);2.0400(1.0);2.0318(0.8);2.0158(0.4);1.9882(0.8);1.5432(0.7);1.3973(1.0);1.3513(0.4);1.2587(0.5);1.2336(0.9);1.1746(0.4);0.1459(0.4);0.0079(3.7);−0.0002(97.6);−0.0085(3.4);−0.1493(0.4)
545	1.90	545: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0012(2.2);8.9809(2.3);8.5133(1.7);8.4986(1.6);8.4897(1.6);8.4749(1.4);8.4325(7.9);8.2292(0.6);8.0071(1.3);7.9948(1.2);7.6863(14.1);7.5760(1.7);7.5526(3.2);7.5293(1.7);7.3076(2.2);7.2888(2.2);7.1799(1.0);7.1765(1.2);7.1589(2.2);7.1414(1.4);7.1380(1.3);6.9211(1.7);6.9184(1.6);6.9022(2.7);6.8999(2.7);6.8839(1.3);6.8811(1.3);6.8673(3.0);6.8082(0.3);6.7983(3.0);6.7961(3.0);6.7779(2.8);6.7756(2.6);5.7552(16.0);5.2468(0.7);5.2319(1.5);5.2124(1.4);5.1971(0.6);4.2623(2.5);4.2494(4.1);4.2359(2.4);4.0381(0.9);4.0202(1.0);3.3223(44.4);3.0701(8.6);3.0576(8.5);3.0357(0.8);2.6753(0.4);2.6709(0.6);2.6665(0.4);2.5106(38.2);2.5063(75.6);2.5018(97.9);2.4973(70.3);2.4929(33.9);2.3332(0.4);2.3285(0.6);2.3240(0.4);2.1939(0.3);2.1795(0.8);2.1646(0.8);2.1595(0.7);2.1436(1.1);2.1303(1.0);2.1160(0.4);2.0570(0.5);2.0446(1.0);2.0307(1.2);2.0172(0.7);2.0089(0.8);1.9887(4.5);1.2590(0.4);1.2335(0.7);1.1928(1.2);1.1750(2.3);1.1573(1.2);−0.0002(3.4)
546	3.68	546: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO):

			δ=9.1871(4.2);9.1669(4.3);8.6805(16.0);8.3627(2.8);8.3473(3.0);8.3393(3.2);8.3236(2.9);7.6904(3.2);7.6672(6.0);7.6441(3.1);7.5394(2.8);7.4347(8.4);7.4122(8.4);7.3793(3.9);7.3591(9.8);7.1913(2.0);7.1880(2.1);7.1785(3.6);7.1709(4.1);7.1531(2.5);7.1496(2.3);6.9405(2.8);6.9219(4.7);6.9054(2.3);6.9030(2.3);6.8038(5.3);6.7850(4.9);5.7551(10.2);5.2756(1.1);5.2613(2.4);5.2412(2.4);5.2271(1.1);4.3122(0.6);4.3044(1.0);4.2852(2.2);4.2768(2.1);4.2686(2.6);4.2604(3.2);4.2535(2.5);4.2393(2.0);4.2322(2.6);4.2123(1.0);3.8842(7.5);3.8735(13.0);3.8634(7.8);3.3201(103.8);3.2938(4.9);3.2835(10.0);3.2721(9.7);3.2610(4.3);3.2399(1.3);2.6748(1.0);2.6701(1.4);2.6655(1.0);2.5055(190.0);2.5011(244.6);2.4967(177.2);2.4494(0.6);2.3276(1.4);2.3242(1.1);2.2561(0.6);2.2356(1.1);2.2230(1.5);2.2142(1.6);2.2015(1.6);2.1897(1.2);2.1810(0.7);2.0889(0.9);2.0734(1.5);2.0661(1.7);2.0509(1.3);2.0397(1.2);2.0325(1.2);1.9882(0.6);1.2982(0.4);1.2589(0.5);1.2354(1.3);0.1459(0.4);0.0078(3.5);−0.0002(86.5);−0.0082(3.6);−0.1499(0.4)
547	1.81		547: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9803(2.7);8.9596(2.7);8.4533(1.8);8.4383(2.0);8.4292(2.0);8.4129(11.0);7.9213(1.6);7.9079(1.6);7.5407(2.0);7.5240(2.5);7.5175(4.0);7.4943(2.0);7.3844(5.7);7.3618(5.8);7.3439(4.5);7.3054(2.7);7.2871(2.9);7.1782(1.3);7.1748(1.4);7.1612(3.1);7.1396(1.7);7.1361(1.6);6.9171(2.0);6.8987(3.4);6.8820(1.6);6.8798(1.6);6.7965(3.8);6.7760(3.5);5.7553(11.4);5.2518(0.8);5.2370(1.7);5.2169(1.7);5.2030(0.8);4.2627(2.9);4.2496(5.0);4.2364(2.9);4.0557(1.2);4.0379(3.6);4.0201(3.7);4.0023(1.2);3.3210(22.0);3.0647(10.6);3.0522(10.4);2.6745(0.4);2.6702(0.5);2.6655(0.4);2.5056(68.9);2.5012(88.8);2.4968(63.5);2.3277(0.6);2.1932(0.4);2.1801(0.9);2.1656(0.9);2.1595(0.8);2.1448(1.4);2.1311(1.3);2.1176(0.5);2.0530(0.5);2.0414(1.2);2.0266(1.4);2.0130(0.8);2.0054(1.0);1.9884(16.0);1.3975(2.5);1.1926(4.0);1.1748(8.0);1.1570(3.9);0.0078(1.4);−0.0002(35.4);−0.0085(1.2)
548	3.33		548: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1827(2.9);9.1746(2.9);9.1624(3.2);9.1541(2.8);8.6506(10.0);8.6441(9.3);8.3965(3.4);8.3810(3.7);8.3731(3.8);8.3574(3.6);8.3157(0.3);7.7100(3.6);7.6872(6.5);7.6643(3.3);7.5745(1.2);7.5534(2.7);7.5321(2.9);7.5111(1.3);7.3747(4.9);7.3560(6.

			6) ; 7. 3355 (3. 1) ; 7. 3257 (2. 3) ; 7. 3156 (1. 9) ; 7. 3046 (1. 1) ; 7. 2896 (1. 7) ; 7. 2743 (2. 2) ; 7. 249 2 (2. 1) ; 7. 2300 (1. 0) ; 7. 1862 (2. 3) ; 7. 1655 (4. 9) ; 7. 1478 (3. 0) ; 6. 9332 (3. 2) ; 6. 9148 (5. 4) ; 6 .8959 (2. 6) ; 6. 8004 (6. 6) ; 6. 7799 (6. 0) ; 5. 7555 (3. 2) ; 5. 2752 (0. 8) ; 5. 2508 (2. 6) ; 5. 2420 (2. 6) ; 4. 3002 (1. 2) ; 4. 2936 (1. 0) ; 4. 2819 (2. 8) ; 4. 2723 (2. 7) ; 4. 2654 (3. 1) ; 4. 2555 (3. 7) ; 4. 228 0 (2. 8) ; 4. 2046 (1. 0) ; 3. 8768 (16. 0) ; 3. 3206 (24. 3) ; 3. 2960 (10. 6) ; 3. 2914 (10. 6) ; 3. 2511 (1. 4) ; 2. 6702 (1. 3) ; 2. 5058 (182. 0) ; 2. 5015 (222. 3) ; 2. 4972 (161. 2) ; 2. 3286 (1. 3) ; 2. 2435 (1. 1) ; 2. 2317 (1. 3) ; 2. 2215 (1. 8) ; 2. 2084 (1. 8) ; 2. 1980 (1. 8) ; 2. 0647 (2. 1) ; 2. 0577 (1. 9) ; 2. 0466 (1. 7) ; 2. 0297 (1. 5) ; 1. 9886 (0. 8) ; 1. 3976 (0. 6) ; 1. 2331 (0. 4) ; 1. 1748 (0. 4) ; 0. 1462 (0. 3) ; −0. 0002 (64. 9)
549	3. 59		549: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 1861 (3. 0) ; 9. 1775 (3. 0) ; 9. 1663 (3. 2) ; 9. 1573 (2. 8) ; 8. 6558 (10. 4) ; 8. 6485 (9. 7) ; 8. 403 6 (3. 6) ; 8. 3879 (4. 0) ; 8. 3801 (4. 1) ; 8. 3645 (3. 7) ; 7. 7158 (3. 7) ; 7. 6930 (6. 8) ; 7. 6701 (3. 6) ; 7 .4984 (0. 6) ; 7. 4765 (1. 7) ; 7. 4585 (2. 0) ; 7. 4508 (1. 9) ; 7. 4253 (0. 8) ; 7. 3779 (5. 5) ; 7. 3587 (6. 9) ; 7. 3388 (2. 2) ; 7. 3334 (2. 2) ; 7. 3157 (1. 4) ; 7. 2930 (0. 5) ; 7. 1848 (2. 4) ; 7. 1676 (5. 0) ; 7. 149 7 (3. 0) ; 6. 9361 (3. 1) ; 6. 9174 (5. 4) ; 6. 8989 (2. 5) ; 6. 8016 (6. 9) ; 6. 7814 (6. 3) ; 5. 7559 (2. 5) ; 5 .2740 (0. 8) ; 5. 2602 (2. 1) ; 5. 2512 (2. 6) ; 5. 2405 (2. 6) ; 5. 2313 (2. 0) ; 4. 3086 (0. 8) ; 4. 3013 (1. 2) ; 4. 2948 (1. 0) ; 4. 2818 (2. 8) ; 4. 2730 (2. 7) ; 4. 2658 (3. 2) ; 4. 2565 (3. 6) ; 4. 2288 (2. 8) ; 4. 203 4 (1. 0) ; 3. 8760 (16. 0) ; 3. 3215 (55. 4) ; 3. 2905 (11. 0) ; 3. 2507 (1. 4) ; 2. 6706 (0. 9) ; 2. 5058 (119 .4) ; 2. 5015 (151. 2) ; 2. 4972 (110. 3) ; 2. 3287 (0. 9) ; 2. 3246 (0. 7) ; 2. 2345 (1. 2) ; 2. 2183 (1. 8) ; 2. 2090 (1. 8) ; 2. 2017 (1. 8) ; 2. 0818 (1. 2) ; 2. 0746 (1. 7) ; 2. 0663 (2. 0) ; 2. 0592 (1. 9) ; 2. 0404 (1 .5) ; 2. 0321 (1. 5) ; 2. 0254 (1. 2) ; 1. 2343 (0. 6) ; −0. 0002 (41. 6)
550	3. 94		550: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 2014 (2. 6) ; 9. 1811 (2. 6) ; 8. 7076 (8. 9) ; 8. 4095 (1. 7) ; 8. 3941 (1. 9) ; 8. 3860 (1. 9) ; 8. 3705 (1. 8) ; 7. 7354 (16. 0) ; 7. 7206 (2. 0) ; 7. 6972 (3. 6) ; 7. 6740 (1. 8) ; 7. 3844 (2. 5) ; 7. 3654 (2. 7) ; 7 .1898 (1. 2) ; 7. 1721 (2. 6) ; 7. 1543 (1. 6) ; 6. 9445 (1. 7) ; 6. 9254 (3. 0) ; 6. 9075 (1. 5) ; 6. 8061 (3. 4) ; 6. 7859 (3. 1) ; 5. 7556 (5. 5) ; 5. 2691 (0. 7) ; 5. 2558 (1. 6) ; 5. 2362 (1. 6) ; 5. 2219 (0. 7) ; 4. 303 1 (0. 6) ; 4. 2966 (0. 6) ; 4. 2847 (1. 4) ; 4. 2684 (1. 7) ; 4. 2592 (2. 1) ; 4. 2512 (1. 6) ; 4. 2303 (1. 6) ; 4 .2087 (0. 6) ; 4. 2024 (0. 5) ; 3. 8768 (8. 7) ; 3. 3202 (36. 4) ; 3. 2865 (6. 7) ; 3. 2752 (6. 4) ; 3. 2441 (0 .8) ; 2. 6703 (0. 7) ; 2. 5053 (96. 3) ; 2. 5013 (118. 5) ; 2. 4974 (89. 0) ; 2. 3275 (0. 6) ; 2. 2343 (0. 7) ;

			2.2204(1.0);2.2115(1.1);2.1996(1.1);2.1886(0.8);2.0703(1.2);2.0576(0.9);2.0431(0.8);2.0347(0.7);1.3974(0.4);1.2345(0.4);-0.0002(27.3)
553	4.18		553: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1942(4.5);9.1740(4.6);8.6557(16.0);8.3213(6.5);8.2983(7.3);8.2397(0.6);7.8522(0.4);7.8288(0.5);7.8164(7.8);7.7936(7.3);7.6328(14.6);7.5168(0.4);7.3705(4.3);7.3519(4.8);7.1870(2.2);7.1668(4.5);7.1485(2.8);6.9330(3.1);6.9143(5.5);6.8959(2.6);6.8001(6.2);6.7796(5.6);5.2596(1.3);5.2452(2.9);5.2264(2.8);5.2114(1.2);4.2957(1.1);4.2877(1.0);4.2761(2.5);4.2673(2.4);4.2605(2.8);4.2489(3.1);4.2407(2.7);4.2265(2.3);4.2194(2.9);4.1983(1.1);4.0552(0.9);4.0376(2.5);4.0198(2.5);4.0023(0.8);3.8740(14.9);3.3214(154.1);3.2935(5.8);3.2822(11.0);3.2705(10.5);3.2585(4.9);3.2385(1.7);3.2278(1.0);2.6701(1.4);2.5048(207.4);2.5012(254.2);2.3283(1.5);2.2354(1.0);2.2257(1.3);2.2134(1.8);2.2038(1.8);2.1918(1.9);2.1798(1.4);2.0681(1.3);2.0602(1.8);2.0537(2.0);2.0381(1.6);2.0268(1.4);2.0194(1.3);1.9883(10.2);1.3975(3.1);1.1926(2.6);1.1748(5.2);1.1569(2.6);-0.0002(37.7)
556	3.76		556: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1775(4.0);9.1574(4.0);8.6286(16.0);8.2793(6.4);8.2565(7.2);7.7842(7.7);7.7614(7.2);7.3674(3.9);7.3493(4.2);7.3373(1.2);7.3314(1.8);7.3260(1.1);7.3134(2.1);7.3077(3.5);7.3022(2.0);7.2894(1.2);7.2839(1.8);7.2783(1.0);7.1848(1.9);7.1813(1.9);7.1639(4.0);7.1462(2.5);7.1426(2.4);7.0495(3.6);7.0319(3.7);6.9289(2.8);6.9112(4.9);6.8933(2.3);6.7977(5.5);6.7777(5.0);5.2649(1.1);5.2506(2.5);5.2315(2.4);5.2174(1.1);4.3044(0.7);4.2959(0.9);4.2888(0.8);4.2769(2.2);4.2680(2.1);4.2605(2.5);4.2509(3.0);4.2426(2.4);4.2290(2.0);4.2219(2.6);4.2011(0.9);4.1935(0.7);4.0555(0.5);4.0377(1.3);4.0200(1.3);4.0024(0.4);3.9436(0.5);3.9000(1.0);3.8818(7.6);3.8708(13.2);3.8600(7.7);3.8413(0.9);3.3245(50.8);3.2916(4.7);3.2805(9.6);3.2687(9.2);3.2568(4.1);3.2378(1.4);3.2256(0.8);2.6700(0.7);2.5055(102.0);2.5013(130.9);2.4971(94.4);2.3278(0.7);2.3235(0.6);2.2484(0.5);2.2360(0.8);2.2276(1.1);2.2147(1.6);2.2056(1.6);2.1931(1.6);2.1805(1.1);2.1718(0.7);2.0755(0.8);2.0686(1.1);2.0602(1.5);2.0533(1.7);2.0417(1.3);2.0374(1.3);2.0257(1.2);2.0184(1.1);2.0112(0.7);2.0030(0.5);1.9883(5.2);1.3974(2.9);1.1927(1.3);1.1749(2.7);1.1570(1.3);0.0076)

			(2.5) ;-0.0002(60.6) ;-0.0083(2.4)
557	4.23		557: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.1770(4.0) ;9.1568(4.0) ;8.6318(16.0) ;8.2815(6.3) ;8.2586(7.2) ;7.7872(7.7) ;7.7643(7.2) ;7.5227(2.3) ;7.5178(3.8) ;7.5126(2.4) ;7.5006(2.4) ;7.4956(3.8) ;7.4903(2.2) ;7.3684(3.9) ;7.3501(4.2) ;7.2192(3.2) ;7.1851(3.5) ;7.1820(3.5) ;7.1648(4.7) ;7.1470(2.6) ;6.9298(2.8) ;6.9121(4.8) ;6.8925(2.2) ;6.7984(5.5) ;6.7782(5.0) ;5.2636(1.1) ;5.2493(2.5) ;5.2297(2.4) ;5.2151(1.1) ;4.3038(0.7) ;4.2952(0.9) ;4.2888(0.8) ;4.2770(2.2) ;4.2672(2.1) ;4.2608(2.5) ;4.2508(3.0) ;4.2422(2.3) ;4.2287(1.9) ;4.2214(2.5) ;4.2007(0.9) ;4.1935(0.7) ;4.0556(0.6) ;4.0380(1.7) ;4.0202(1.7) ;4.0025(0.6) ;3.8712(12.8) ;3.8615(7.6) ;3.8422(1.0) ;3.3270(205.6) ;3.2914(4.9) ;3.2806(9.1) ;3.2689(8.6) ;3.2572(4.0) ;3.2371(1.4) ;3.2266(0.9) ;2.6709(1.1) ;2.5062(163.1) ;2.5020(209.0) ;2.4978(151.9) ;2.3325(0.9) ;2.3283(1.2) ;2.2365(0.8) ;2.2271(1.2) ;2.2144(1.6) ;2.2047(1.6) ;2.1929(1.6) ;2.1816(1.1) ;2.0760(0.8) ;2.0596(1.5) ;2.0530(1.7) ;2.0413(1.3) ;2.0256(1.2) ;2.0181(1.1) ;1.9885(7.1) ;1.3976(3.1) ;1.1928(1.8) ;1.1750(3.6) ;1.1571(1.8) ;-0.0001(4.8)
558	4.13		558: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.1706(2.1) ;9.1527(2.1) ;8.6027(16.0) ;8.3154(0.4) ;8.2902(6.2) ;8.2673(7.0) ;7.8025(8.8) ;7.7881(4.9) ;7.7796(7.8) ;7.7481(1.9) ;7.7286(3.3) ;7.7088(1.6) ;7.6194(3.7) ;7.3615(3.8) ;7.3434(4.1) ;7.1811(1.8) ;7.1774(1.8) ;7.1595(3.9) ;7.1424(2.4) ;6.9232(2.7) ;6.9052(4.6) ;6.8870(2.1) ;6.7953(5.5) ;6.7750(4.9) ;5.7551(2.1) ;5.2581(1.1) ;5.2446(2.4) ;5.2255(2.4) ;5.2107(1.0) ;4.2995(0.7) ;4.2915(0.9) ;4.2856(0.9) ;4.2727(2.2) ;4.2642(2.1) ;4.2566(2.4) ;4.2466(2.5) ;4.2376(2.0) ;4.2163(2.1) ;4.1951(0.8) ;4.0377(0.4) ;4.0201(0.4) ;3.8775(11.0) ;3.3239(263.3) ;3.2894(6.2) ;2.6705(1.7) ;2.5236(4.5) ;2.5060(239.6) ;2.5017(306.1) ;2.4975(218.6) ;2.3284(1.8) ;2.2452(0.5) ;2.2233(1.1) ;2.2104(1.6) ;2.2010(1.6) ;2.1894(1.6) ;2.1774(1.2) ;2.0573(1.4) ;2.0498(1.6) ;2.0372(1.3) ;2.0225(1.1) ;1.9886(1.7) ;1.3974(1.0) ;1.1924(0.4) ;1.1748(0.9) ;1.1577(0.4) ;0.1461(0.6) ;0.0077(5.0) ;-0.0002(134.8) ;-0.0084(5.2) ;-0.1496(0.6)
564			564: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.1810(3.4) ;9.1696(3.5) ;9.1614(3.8) ;9.1496(3.2) ;8.6214(12.6) ;8.6138(11.8) ;8.3155(9.4) ;8.2926(10.6) ;7.8206(10.0) ;7.7978(9.3) ;7.7086(2.5) ;7.6910(5.4) ;7.6854(4.8

			) ; 7. 6715 (3. 4) ; 7. 6673 (2. 9) ; 7. 3843 (1. 6) ; 7. 3653 (9. 7) ; 7. 3517 (10. 5) ; 7. 3473 (13. 2) ; 7. 33 34 (5. 8) ; 7. 3249 (2. 6) ; 7. 3201 (3. 2) ; 7. 3053 (2. 8) ; 7. 2898 (1. 2) ; 7. 1810 (2. 8) ; 7. 1612 (6. 0) ; 7. 1427 (3. 7) ; 6. 9258 (3. 4) ; 6. 9073 (5. 7) ; 6. 8889 (2. 7) ; 6. 7951 (8. 5) ; 6. 7751 (7. 6) ; 5. 2617 (1 . 1) ; 5. 2413 (3. 1) ; 5. 2284 (3. 2) ; 4. 3001 (1. 0) ; 4. 2943 (1. 4) ; 4. 2870 (1. 2) ; 4. 2748 (3. 3) ; 4. 26 56 (3. 1) ; 4. 2585 (3. 6) ; 4. 2497 (3. 8) ; 4. 2408 (3. 2) ; 4. 2317 (2. 4) ; 4. 2203 (3. 4) ; 4. 2129 (2. 7) ; 4. 1923 (1. 3) ; 3. 8727 (16. 0) ; 3. 3218 (136. 5) ; 3. 3010 (10. 8) ; 3. 2915 (10. 8) ; 3. 2796 (9. 0) ; 3. 2 589 (3. 1) ; 3. 2398 (1. 7) ; 2. 6700 (2. 2) ; 2. 5051 (310. 4) ; 2. 5010 (398. 1) ; 2. 4968 (287. 4) ; 2. 424 2 (0. 4) ; 2. 3275 (2. 3) ; 2. 2091 (2. 0) ; 2. 2014 (2. 2) ; 2. 1944 (2. 1) ; 2. 1809 (1. 7) ; 2. 0525 (2. 2) ; 2 . 0436 (2. 2) ; 2. 0258 (1. 9) ; 2. 0176 (1. 6) ; 1. 2348 (0. 8) ; −0. 0003 (13. 2)
565	4. 03		565: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 1794 (1. 1) ; 9. 1588 (1. 1) ; 8. 7822 (0. 5) ; 8. 6253 (3. 8) ; 8. 6202 (3. 9) ; 8. 3083 (2. 6) ; 8. 2853 (2. 9) ; 7. 8100 (3. 2) ; 7. 7871 (3. 1) ; 7. 5936 (0. 8) ; 7. 5864 (0. 9) ; 7. 5823 (0. 9) ; 7. 5752 (0. 9) ; 7. 5711 (1. 0) ; 7. 5643 (1. 2) ; 7. 5604 (1. 0) ; 7. 5534 (0. 9) ; 7. 4579 (0. 8) ; 7. 4511 (0. 8) ; 7. 4423 (0. 8) ; 7. 4357 (0. 8) ; 7. 4271 (1. 0) ; 7. 4220 (1. 0) ; 7. 4150 (1. 0) ; 7. 4053 (2. 2) ; 7. 4002 (1. 1) ; 7. 3875 (1. 7) ; 7. 3829 (0. 9) ; 7. 3655 (2. 0) ; 7. 3489 (1. 5) ; 7. 1836 (0. 8) ; 7. 1634 (1. 6) ; 7. 1453 (1. 0) ; 6. 9293 (1. 1) ; 6. 9265 (1. 2) ; 6. 9101 (1. 8) ; 6. 8921 (0. 9) ; 6. 8893 (0. 9) ; 6. 7963 (2. 2) ; 6. 7760 (1. 8) ; 5. 2433 (0. 8) ; 5. 2305 (0. 7) ; 4. 2945 (0. 4) ; 4. 2750 (0. 9) ; 4. 2602 (0. 9) ; 4. 2468 (0. 9) ; 4. 2383 (0. 9) ; 4. 2248 (0. 8) ; 4. 2184 (1. 0) ; 4. 1975 (0. 4) ; 3. 8814 (3. 0) ; 3. 8723 (5. 0) ; 3. 8602 (3. 1) ; 3. 8410 (0. 5) ; 3. 3215 (139. 8) ; 3. 2898 (3. 6) ; 3. 2785 (3. 4) ; 2. 6746 (1. 3) ; 2. 6702 (1. 7) ; 2. 6655 (1 . 2) ; 2. 5235 (4. 2) ; 2. 5187 (6. 8) ; 2. 5100 (110. 3) ; 2. 5057 (227. 6) ; 2. 5012 (299. 7) ; 2. 4966 (210 . 2) ; 2. 4922 (97. 2) ; 2. 3368 (0. 6) ; 2. 3323 (1. 2) ; 2. 3278 (1. 7) ; 2. 3233 (1. 2) ; 2. 2084 (0. 6) ; 2. 1 892 (0. 6) ; 2. 0604 (0. 5) ; 2. 0532 (0. 7) ; 2. 0449 (0. 6) ; 2. 0371 (0. 5) ; 2. 0276 (0. 4) ; 2. 0192 (0. 5) ; 1. 5301 (3. 1) ; 1. 4948 (3. 2) ; 1. 4885 (1. 2) ; 1. 4529 (0. 9) ; 1. 3976 (16. 0) ; 1. 2344 (0. 4) ; −0. 000 2 (8. 6)
566	1. 71		566: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=8. 9879 (3. 8) ; 8. 9680 (3. 8) ; 8. 4481 (5. 6) ; 8. 4300 (12. 0) ; 8. 4220 (8. 5) ; 7. 9521 (0. 3) ; 7. 923 7 (2. 0) ; 7. 8814 (15. 0) ; 7. 8752 (16. 0) ; 7. 8612 (2. 1) ; 7. 6249 (5. 2) ; 7. 6083 (8. 1) ; 7. 5614 (6. 4)) ; 7. 5405 (6. 8) ; 7. 5226 (4. 2) ; 7. 4339 (4. 4) ; 7. 4279 (4. 8) ; 7. 4173 (4. 7) ; 7. 4114 (4. 0) ; 7. 3027 (4. 2) ; 7. 2830 (4. 5) ; 7. 1708 (2. 8) ; 7. 1673 (2. 8) ; 7. 1501 (5. 7) ; 7. 1322 (3. 5) ; 7. 1285 (3. 3) ; 6. 9

			055(4.0);6.9032(4.2);6.8847(7.0);6.8684(3.2);6.8659(3.2);6.7898(7.8);6.7694(7.1);5.7569(11.9);5.2623(1.4);5.2467(3.2);5.2284(3.1);5.2128(1.3);4.9059(4.0);4.8931(8.8);4.8804(4.0);4.2857(0.9);4.2659(3.8);4.2579(5.8);4.2484(6.9);4.2336(4.0);4.2151(1.0);4.0556(0.4);4.0378(1.2);4.0198(1.1);4.0021(0.4);3.6850(2.4);3.6707(7.8);3.6573(10.0);3.6444(4.9);3.5952(5.7);3.5840(6.8);3.5721(4.3);3.3213(90.6);2.6744(1.3);2.6702(1.8);2.6657(1.3);2.5234(4.8);2.5098(122.4);2.5055(249.9);2.5011(329.4);2.4966(234.1);2.4923(111.1);2.3323(1.3);2.3278(1.9);2.3234(1.4);2.1873(0.7);2.1740(1.2);2.1642(1.4);2.1534(1.8);2.1403(2.5);2.1243(2.1);2.1117(1.0);2.0664(1.0);2.0521(2.3);2.0411(2.4);2.0253(1.7);2.0167(1.6);2.0074(1.3);1.9886(5.2);1.2582(0.4);1.2344(1.0);1.1922(1.2);1.1743(2.6);1.1567(1.2);0.1459(0.7);0.0079(5.6);-0.0002(166.0);-0.0084(5.9);-0.1494(0.7)
567	1.42		567: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0073(3.6);8.9868(3.7);8.4799(13.7);8.4638(3.9);8.4434(4.0);7.9315(1.6);7.9195(3.1);7.9073(1.7);7.7132(4.1);7.6963(5.2);7.5965(0.8);7.5887(1.0);7.5790(4.5);7.5685(2.0);7.5606(5.4);7.5581(5.4);7.5477(1.9);7.5399(3.8);7.5256(0.8);7.3116(3.6);7.2930(4.0);7.1762(3.3);7.1726(3.6);7.1555(5.2);7.1378(2.3);7.1341(2.2);6.9102(2.7);6.8919(4.6);6.8733(2.2);6.7949(5.1);6.7747(4.7);5.7571(3.2);5.2731(1.0);5.2573(2.3);5.2384(2.3);5.2240(1.0);4.9044(2.7);4.8916(6.1);4.8787(2.9);4.3020(0.4);4.2928(0.6);4.2733(2.5);4.2651(3.9);4.2551(4.4);4.2492(4.0);4.2396(2.5);4.2218(0.6);3.6817(1.5);3.6675(5.2);3.6542(6.9);3.6416(3.4);3.6086(3.1);3.5963(6.2);3.5830(4.7);3.5689(1.4);3.3218(25.0);2.6745(0.7);2.6703(1.0);2.6662(0.8);2.5233(2.6);2.5055(133.6);2.5012(174.2);2.4970(126.3);2.3276(1.0);2.1948(0.4);2.1840(0.8);2.1720(0.9);2.1606(1.2);2.1486(1.7);2.1341(1.4);2.1194(0.7);2.0856(16.0);2.0641(1.7);2.0532(1.6);2.0376(1.2);2.0288(1.1);2.0193(0.9);2.0128(0.7);2.0046(0.4);1.9887(0.9);1.2351(0.7);1.1745(0.4);-0.0001(3.6)
568	1.53		568: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0342(1.9);9.0140(2.0);8.5727(6.2);8.4892(2.2);8.4672(2.2);8.4420(0.6);8.2975(0.4);8.2615(1.1);8.0721(0.9);8.0606(1.6);8.0483(1.0);7.9562(0.5);7.8662(2.1);7.8497(2.5);7.8153(16.0);7.7977(0.8);7.5936(1.8);7.5727(2.1);7.5543(1.6);7.3204(1.

			8) ;7.3024(2.2) ;7.1821(0.9) ;7.1645(2.0) ;7.1470(1.4) ;7.1436(1.4) ;6.9222(1.3) ;6.904 0(2.4) ;6.8850(1.3) ;6.8045(2.6) ;6.7848(2.5) ;5.7572(7.2) ;5.7396(0.3) ;5.2804(0.6) ;5 .2654(1.3) ;5.2464(1.4) ;5.2318(0.7) ;4.9134(1.6) ;4.9007(3.2) ;4.8881(1.6) ;4.3032(0. 4) ;4.2833(1.4) ;4.2743(2.1) ;4.2633(2.5) ;4.2580(2.6) ;4.2482(1.7) ;4.2305(0.6) ;4.037 9(0.8) ;4.0201(0.9) ;4.0023(0.3) ;3.6661(2.9) ;3.6533(3.7) ;3.6407(2.2) ;3.6145(2.2) ;3 .6024(3.4) ;3.5894(2.6) ;3.3241(7.3) ;3.3074(0.5) ;2.5060(41.9) ;2.5018(53.4) ;2.4975(40.1) ;2.1877(0.4) ;2.1793(0.5) ;2.1681(0.8) ;2.1557(1.0) ;2.1410(0.9) ;2.1258(0.6) ;2. 0946(0.5) ;2.0799(0.9) ;2.0699(1.0) ;2.0542(0.8) ;2.0447(0.7) ;2.0357(0.6) ;2.0293(0.5) ;1.9890(3.5) ;1.2988(0.4) ;1.2585(0.5) ;1.2312(0.7) ;1.1925(1.0) ;1.1747(1.8) ;1.1569 (1.0) ;-0.0002(1.2)
576	3.90		576: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=20.0029(0.9) ;9.1889(6.0) ;9.1694(6.2) ;8.6464(14.7) ;8.6381(15.0) ;8.3318(10.9) ;8. 3089(11.9) ;7.8301(11.0) ;7.8072(10.0) ;7.6892(1.6) ;7.6682(2.6) ;7.6486(2.6) ;7.4026(1.1) ;7.3714(3.5) ;7.3527(4.2) ;7.1816(5.1) ;7.1646(7.5) ;7.1472(4.8) ;6.9296(4.4) ;6.9 103(7.1) ;6.8923(3.8) ;6.7973(8.0) ;6.7765(7.6) ;5.2293(3.2) ;4.2951(1.7) ;4.2767(3.3) ;4.2608(3.3) ;4.2507(3.5) ;4.2420(3.3) ;4.2203(3.7) ;4.1924(1.5) ;3.9161(1.0) ;3.9087(1.1) ;3.8728(16.0) ;3.7425(1.0) ;3.3196(381.7) ;3.2976(12.2) ;3.2873(11.7) ;3.2380(1.9) ;2.6744(7.0) ;2.6702(9.7) ;2.6655(7.0) ;2.6612(3.6) ;2.5233(22.0) ;2.5099(648.2) ;2.5 055(1360.8) ;2.5010(1822.1) ;2.4965(1299.0) ;2.4920(613.8) ;2.4282(2.0) ;2.3323(7.9) ; 2.3277(10.7) ;2.3234(7.8) ;2.2851(1.0) ;2.2044(2.7) ;2.0556(2.4) ;2.0356(2.2) ;1.2408(1.1) ;-0.0002(68.2)
577	1.66		577: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=8.9783(4.8) ;8.9578(4.8) ;8.5458(3.4) ;8.5302(3.7) ;8.5222(3.6) ;8.5068(3.4) ;8.4827 (1.4) ;8.4655(0.4) ;8.4574(0.4) ;8.4398(0.4) ;8.4133(2.7) ;8.4054(16.0) ;8.0443(0.8) ;8 .0308(0.5) ;8.0114(0.4) ;7.9945(1.9) ;7.9831(3.6) ;7.9722(1.9) ;7.7219(5.6) ;7.7183(5. 8) ;7.7019(6.8) ;7.6982(6.6) ;7.5396(0.4) ;7.5281(3.8) ;7.5054(6.4) ;7.4834(4.5) ;7.471 1(5.3) ;7.4516(9.8) ;7.4431(1.6) ;7.4319(5.6) ;7.4231(0.9) ;7.3921(0.3) ;7.3727(0.6) ;7 .3473(6.3) ;7.3436(6.5) ;7.3281(5.6) ;7.3245(4.7) ;7.3118(0.8) ;7.2873(4.7) ;7.2693(5. 2) ;7.1660(2.4) ;7.1634(2.4) ;7.1455(5.1) ;7.1282(3.2) ;7.1246(3.0) ;6.8960(3.8) ;6.876

			9(6.2);6.8606(2.8);6.7853(6.9);6.7650(6.3);6.6074(0.5);6.5916(0.4);5.7570(8.6);5.2502(1.6);5.2353(3.1);5.2157(3.0);5.2010(1.4);4.9112(3.8);4.8980(8.6);4.8853(3.9);4.2747(0.8);4.2402(7.3);4.2276(4.6);4.2100(0.7);4.1986(0.4);4.0553(0.7);4.037 6(2.0);4.0197(1.9);4.0019(0.8);3.6838(2.3);3.6695(7.4);3.6560(9.4);3.6437(4.5);3.5967(4.6);3.5846(8.3);3.5711(6.6);3.5569(2.0);3.5289(0.4);3.4240(0.3);3.3211(225.0);2.6744(2.4);2.6700(3.2);2.6655(2.3);2.6025(0.4);2.5795(0.3);2.5234(7.9);2.5096(213.1);2.5055(434.5);2.5010(573.6);2.4966(408.4);2.4923(193.6);2.4434(0.9);2.4385(0.9);2.3322(2.3);2.3277(3.3);2.3232(2.3);2.1689(1.4);2.1475(1.8);2.1338(2.6);2.1207(2.2);2.1056(1.0);2.0549(1.1);2.0409(2.3);2.0263(2.3);2.0117(1.7);2.004 3(1.6);1.9886(9.4);1.9081(0.3);1.3974(0.7);1.3508(0.3);1.2979(2.2);1.2583(3.0);1.2351(2.6);1.1922(2.3);1.1743(4.8);1.1565(2.2);0.8663(0.4);0.8537(0.6);0.8378(0.4);−0.0002(22.2)
578	1.84		578: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9985(2.2);8.9780(2.3);8.5049(8.6);8.4947(2.0);8.4861(1.8);8.4710(1.5);8.1238(1.0);8.1117(1.8);8.1003(1.0);7.6592(3.0);7.6544(5.7);7.6497(3.2);7.5218(1.8);7.4987(3.4);7.4750(10.7);7.4705(9.2);7.2997(2.3);7.2817(2.5);7.1770(1.1);7.1734(1.1);7.1561(2.4);7.1383(1.5);7.1350(1.4);6.9084(1.7);6.8916(3.0);6.8733(1.4);6.8711(1.4);6.7964(3.3);6.7761(3.0);5.7570(13.6);5.2638(0.6);5.2483(1.5);5.2298(1.5);5.2142(0.7);4.9160(1.7);4.9034(4.0);4.8907(1.9);4.2892(0.4);4.2697(1.7);4.2614(2.4);4.2520(3.0);4.2376(1.8);4.2191(0.4);4.0557(0.6);4.0379(1.9);4.0201(1.9);4.0023(0.6);3.6763(1.0);3.6615(3.2);3.6485(4.3);3.6362(2.3);3.6094(2.1);3.5974(3.8);3.5842(2.9);3.5725(0.9);3.3230(35.7);2.6747(0.4);2.6706(0.5);2.6663(0.4);2.5238(1.2);2.5059(68.9);2.5015(90.7);2.4971(65.0);2.3284(0.5);2.3240(0.4);2.1790(0.5);2.1660(0.6);2.1552(0.8);2.1422(1.1);2.1265(0.9);2.1138(0.4);2.0744(0.4);2.0596(1.1);2.0484(1.0);2.0333(0.7);2.0239(0.7);2.0148(0.6);2.0076(0.4);1.9971(0.3);1.9888(8.2);1.3971(16.0);1.2586(0.4);1.1925(2.1);1.1747(4.2);1.1568(2.0);−0.0002(3.7)
579	1.61		579: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0615(0.4);9.0402(0.5);9.0006(7.4);8.9800(7.6);8.6025(1.7);8.5834(5.4);8.5682

			(5.9) ;8.5596(5.8) ;8.5445(5.4) ;8.5056(1.2) ;8.4832(15.4) ;8.4772(16.0) ;8.4524(0.5) ;8.4436(0.4) ;8.4293(0.3) ;8.1268(3.0) ;8.1146(2.0) ;8.0994(2.0) ;8.0864(3.4) ;7.6673(1.6) ;7.6596(2.1) ;7.6507(2.3) ;7.6445(3.2) ;7.6391(3.2) ;7.6309(3.2) ;7.6236(3.1) ;7.6180(3.2) ;7.6113(2.0) ;7.6033(1.7) ;7.5953(1.4) ;7.5580(5.5) ;7.5351(10.2) ;7.5124(5.4) ;7.4985(1.0) ;7.4754(1.7) ;7.3275(0.5) ;7.3007(7.9) ;7.2816(8.6) ;7.2356(2.1) ;7.2214(3.4) ;7.2145(3.9) ;7.1940(2.2) ;7.1750(4.5) ;7.1713(4.3) ;7.1539(8.4) ;7.1364(5.3) ;7.1328(4.8) ;6.9344(0.4) ;6.9060(6.0) ;6.8874(10.0) ;6.8689(5.0) ;6.8113(0.6) ;6.7940(12.0) ;6.7918(11.6) ;6.7736(10.7) ;6.7713(9.7) ;5.7574(15.4) ;5.2606(2.2) ;5.2456(4.9) ;5.2266(4.8) ;5.2116(2.0) ;4.9170(4.8) ;4.9062(9.9) ;4.9041(10.1) ;4.8926(5.4) ;4.8800(0.5) ;4.2823(1.2) ;4.2589(7.8) ;4.2481(10.8) ;4.2360(6.9) ;4.2174(1.2) ;4.2072(0.5) ;4.0559(0.9) ;4.0380(2.7) ;4.0203(2.8) ;4.0024(0.9) ;3.6805(3.2) ;3.6666(11.4) ;3.6537(15.0) ;3.6414(8.3) ;3.6174(4.2) ;3.6062(8.8) ;3.5961(10.2) ;3.5835(7.1) ;3.5594(1.0) ;3.5452(0.4) ;3.3229(55.3) ;2.6798(0.6) ;2.6752(1.2) ;2.6707(1.6) ;2.6660(1.2) ;2.5240(4.0) ;2.5191(6.4) ;2.5106(102.4) ;2.5061(214.3) ;2.5016(285.4) ;2.4971(201.0) ;2.4926(93.2) ;2.3326(1.1) ;2.3283(1.6) ;2.3239(1.2) ;2.1891(1.0) ;2.1779(2.0) ;2.1654(2.1) ;2.1559(2.6) ;2.1423(4.1) ;2.1277(3.3) ;2.1137(1.4) ;2.0676(1.7) ;2.0536(3.7) ;2.0411(3.4) ;2.0261(2.4) ;2.0174(2.4) ;2.0082(1.9) ;1.9890(12.6) ;1.3971(1.9) ;1.2992(2.0) ;1.2588(2.8) ;1.2348(1.5) ;1.1924(3.3) ;1.1747(6.6) ;1.1569(3.2) ;0.8537(0.4) ;0.0081(0.4) ;-0.0002(12.9) ;-0.0081(0.4)
589	2.43		589: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.3204(1.1) ;9.3135(1.1) ;9.3003(1.2) ;9.2927(1.0) ;8.5653(7.4) ;8.3124(1.6) ;8.3036(1.4) ;8.2966(1.7) ;8.2873(1.7) ;8.2791(0.4) ;7.7025(2.2) ;7.6989(2.4) ;7.6825(2.7) ;7.6788(2.7) ;7.6719(0.8) ;7.6538(3.4) ;7.6470(3.3) ;7.6381(6.8) ;7.4567(0.8) ;7.4467(0.8) ;7.4374(1.7) ;7.4275(1.6) ;7.4178(1.1) ;7.4076(1.0) ;7.3523(2.7) ;7.3323(3.6) ;7.3134(0.9) ;7.1863(0.9) ;7.1659(2.0) ;7.1482(1.2) ;6.9252(1.3) ;6.9067(2.2) ;6.8881(1.0) ;6.8028(2.7) ;6.7823(2.4) ;5.7568(16.0) ;5.2942(0.5) ;5.2792(1.2) ;5.2607(1.2) ;5.2464(0.6) ;5.1484(0.9) ;5.1392(1.6) ;5.1338(1.5) ;5.1246(0.8) ;4.2956(0.4) ;4.2771(1.2) ;4.2614(2.0) ;4.2522(2.0) ;4.2406(1.0) ;4.2328(1.2) ;4.2129(0.4) ;4.2075(0.3) ;4.0374(0.7) ;4.0196(0.6) ;3.6661(0.4) ;3.6505(1.0) ;3.6383(1.8) ;3.6256(1.9) ;3.5831(0.4) ;3.5455(2.

			6) ;3. 3210 (21. 3) ;3. 3034 (0. 4) ;3. 0572 (15. 5) ;2. 6701 (0. 6) ;2. 6654 (0. 5) ;2. 5051 (83. 3) ;2. 5007 (109. 1) ;2. 4964 (79. 4) ;2. 3273 (0. 6) ;2. 3233 (0. 5) ;2. 2266 (0. 5) ;2. 2137 (0. 8) ;2. 2033 (0. 8) ;2. 1911 (0. 8) ;2. 1798 (0. 6) ;2. 0667 (0. 8) ;2. 0593 (0. 9) ;2. 0497 (0. 7) ;2. 0377 (0. 6) ;2. 0327 (0. 6) ;2. 0238 (0. 5) ;1. 9884 (2. 9) ;1. 2347 (0. 5) ;1. 1919 (0. 8) ;1. 1742 (1. 5) ;1. 1564 (0. 7) ;-0. 0002 (9. 7)
590	3. 44		590: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 3230 (1. 9) ;9. 3026 (1. 9) ;8. 7282 (0. 8) ;8. 6746 (0. 3) ;8. 5838 (8. 2) ;8. 3304 (1. 7) ;8. 3262 (1. 8) ;8. 3102 (1. 8) ;8. 3060 (2. 0) ;7. 9109 (4. 6) ;7. 9048 (4. 8) ;7. 6985 (1. 1) ;7. 6845 (3. 0) ;7. 6738 (3. 3) ;7. 6536 (2. 8) ;7. 6410 (0. 9) ;7. 6360 (1. 4) ;7. 4926 (1. 6) ;7. 4863 (1. 7) ;7. 4607 (1. 5) ;7. 4549 (1. 4) ;7. 3529 (1. 9) ;7. 3352 (2. 0) ;7. 1897 (1. 2) ;7. 1866 (1. 2) ;7. 1682 (2. 1) ;7. 1514 (1. 3) ;7. 1473 (1. 2) ;6. 9385 (0. 3) ;6. 9281 (1. 4) ;6. 9100 (2. 3) ;6. 8922 (1. 1) ;6. 8203 (0. 4) ;6. 8035 (2. 9) ;6. 7849 (2. 4) ;5. 7568 (4. 1) ;5. 2936 (0. 6) ;5. 2778 (1. 2) ;5. 2600 (1. 2) ;5. 2445 (0. 6) ;5. 1331 (1. 4) ;4. 3052 (0. 4) ;4. 2974 (0. 6) ;4. 2901 (0. 6) ;4. 2777 (1. 3) ;4. 2616 (2. 0) ;4. 2525 (2. 0) ;4. 2406 (1. 1) ;4. 2325 (1. 2) ;4. 2122 (0. 4) ;3. 6684 (0. 4) ;3. 6540 (0. 9) ;3. 6401 (1. 6) ;3. 6268 (1. 8) ;3. 5844 (0. 4) ;3. 5555 (2. 0) ;3. 5444 (2. 6) ;3. 5068 (0. 4) ;3. 4949 (0. 4) ;3. 3197 (31. 2) ;3. 0560 (16. 0) ;3. 0377 (1. 8) ;2. 6746 (0. 8) ;2. 6700 (1. 1) ;2. 6654 (0. 8) ;2. 5231 (2. 9) ;2. 5096 (69. 2) ;2. 5054 (141. 9) ;2. 5009 (188. 1) ;2. 4965 (135. 6) ;2. 4922 (65. 6) ;2. 3321 (0. 8) ;2. 3276 (1. 1) ;2. 3232 (0. 8) ;2. 2478 (0. 4) ;2. 2268 (0. 6) ;2. 2135 (0. 9) ;2. 2041 (0. 9) ;2. 1919 (0. 9) ;2. 1835 (0. 6) ;2. 0762 (0. 6) ;2. 0685 (0. 8) ;2. 0611 (1. 0) ;2. 0519 (0. 7) ;2. 0343 (0. 7) ;2. 0262 (0. 6) ;1. 9885 (0. 4) ;1. 2580 (0. 4) ;1. 2349 (1. 4) ;0. 0079 (0. 4) ;-0. 0002 (12. 9)
591	3. 25		591: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 3476 (1. 8) ;9. 3272 (1. 8) ;8. 7005 (7. 3) ;8. 5245 (0. 4) ;8. 3686 (2. 0) ;8. 3493 (2. 2) ;8. 2720 (1. 2) ;7. 9656 (0. 5) ;7. 9319 (2. 0) ;7. 9142 (2. 4) ;7. 8341 (16. 0) ;7. 7034 (1. 8) ;7. 6847 (2. 0) ;7. 6642 (1. 4) ;7. 3800 (1. 9) ;7. 3618 (2. 0) ;7. 2027 (0. 9) ;7. 1993 (0. 9) ;7. 1815 (2. 0) ;7. 1641 (1. 2) ;7. 1611 (1. 2) ;6. 9518 (1. 3) ;6. 9330 (2. 3) ;6. 9146 (1. 2) ;6. 8173 (2. 8) ;6. 7968 (2. 5) ;5. 7572 (12. 0) ;5. 3147 (0. 5) ;5. 3002 (1. 2) ;5. 2813 (1. 3) ;5. 2664 (0. 6) ;5. 1438 (1. 1) ;5. 1288 (2. 4) ;5. 1136 (1. 1) ;4. 3120 (0. 4) ;4. 3050 (0. 4) ;4. 2928 (1. 2) ;4. 2757 (1. 9) ;4. 2668 (1. 9) ;4. 2535 (1. 1) ;4. 2460 (1. 3) ;4. 2258 (0. 4) ;4. 2188 (0. 4) ;4. 0382 (0. 9) ;4. 0204 (0. 9) ;3. 6465 (1. 0) ;3. 6331 (2. 4) ;3. 6200 (2. 6) ;3. 6066 (1. 4) ;3. 5492 (2. 4) ;3. 5372 (2. 9) ;3. 3260 (25. 5) ;3. 3049 (0. 4)

				;3.0624(14.0);2.5058(36.3);2.5017(45.5);2.4977(33.2);2.2521(0.4);2.2430(0.5);2.2305(0.8);2.2209(0.8);2.2089(0.9);2.1975(0.7);2.1887(0.4);2.1046(0.6);2.0965(0.8);2.0895(0.9);2.0738(0.7);2.0620(0.6);2.0537(0.6);1.9891(3.8);1.2320(0.3);1.1926(1.0);1.1748(1.9);1.1572(1.0);-0.0001(4.5)
595	3.61			595: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1408(0.9);9.1232(1.7);9.1128(1.2);9.1059(1.3);8.5911(7.4);8.3494(1.9);8.3335(2.1);8.3258(2.1);8.3102(1.9);8.1409(0.4);7.7554(3.0);7.7518(3.1);7.7353(3.7);7.7317(3.6);7.6777(2.3);7.6551(3.9);7.6324(2.2);7.5002(1.4);7.4897(1.3);7.4808(2.9);7.4702(2.7);7.4610(1.8);7.4505(1.6);7.4116(1.0);7.4079(1.1);7.3993(1.1);7.3919(1.8);7.3883(1.6);7.3754(1.7);7.3681(1.2);7.3560(2.0);7.3479(1.6);7.3377(1.5);7.3327(1.4);7.1785(1.3);7.1608(2.8);7.1431(1.7);6.9110(1.4);6.8927(2.5);6.8746(1.2);6.7951(3.5);6.7747(3.2);5.7569(16.0);5.2309(1.4);5.2174(1.3);4.2882(0.5);4.269 1(1.6);4.2537(2.7);4.2444(2.3);4.2322(1.3);4.2033(0.4);4.0557(0.6);4.0378(1.6);4 .0201(1.6);4.0023(0.6);3.7509(0.6);3.7434(0.5);3.7279(1.0);3.7217(1.2);3.7117(0. 7);3.7041(1.5);3.6822(1.2);3.6640(0.7);3.6542(0.7);3.6478(1.1);3.6339(1.7);3.628 1(1.2);3.6209(1.1);3.6138(1.3);3.6008(1.6);3.5817(2.2);3.5630(1.8);3.5434(0.5);3 .3865(0.6);3.3682(1.5);3.3552(1.7);3.3473(2.1);3.3228(43.4);3.2960(0.8);3.2790(0 .6);3.2636(1.0);3.2544(1.1);3.2470(1.0);3.2390(1.1);3.2120(1.6);3.1913(1.2);3.17 82(1.4);3.1674(0.5);3.1565(0.9);3.1462(0.7);3.1236(0.4);3.0852(14.4);3.0806(13.3);2.6985(1.0);2.6799(1.2);2.6746(1.3);2.6704(1.5);2.5233(2.1);2.5057(103.8);2.50 13(135.2);2.4969(96.5);2.3325(0.6);2.3281(0.8);2.2037(0.7);2.1932(0.9);2.1822(1. 1);2.1701(1.0);2.1617(0.8);2.1490(0.5);2.0299(1.2);2.0158(1.4);1.9887(8.2);1.966 1(1.1);1.9539(0.6);1.4852(0.6);1.4798(0.6);1.4688(1.0);1.4532(1.1);1.4363(0.9);1 .4216(0.6);1.2352(0.5);1.1923(1.8);1.1745(3.6);1.1567(1.8);0.0075(0.3);-0.0002(9 .6)
596	2.30			596: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0701(3.4);9.0498(3.5);8.5625(0.6);8.5278(0.5);8.4640(2.2);8.4489(2.6);8.4390 (11.6);8.4253(2.3);8.1352(0.7);7.8085(0.8);7.7955(1.7);7.7758(1.8);7.7613(0.9);7 .7046(6.4);7.6992(7.6);7.6691(0.7);7.6622(1.0);7.6543(0.9);7.6470(1.4);7.6418(1.

			4) ;7. 6338 (1. 4) ;7. 6213 (1. 4) ;7. 6135 (0. 9) ;7. 5969 (2. 8) ;7. 5738 (4. 2) ;7. 5512 (2. 2) ;7. 538 0 (0. 3) ;7. 4597 (6. 8) ;7. 4558 (6. 8) ;7. 4405 (0. 4) ;7. 2706 (2. 3) ;7. 2503 (2. 8) ;7. 2145 (1. 7) ;7 . 1920 (0. 9) ;7. 1737 (1. 8) ;7. 1528 (3. 5) ;7. 1353 (2. 1) ;6. 8948 (1. 7) ;6. 8760 (2. 8) ;6. 8579 (1. 3) ;6. 7898 (4. 9) ;6. 7697 (4. 4) ;6. 2235 (4. 2) ;6. 2186 (7. 2) ;6. 2137 (4. 2) ;6. 1947 (0. 4) ;5. 757 2 (15. 7) ;5. 2260 (1. 1) ;5. 2118 (2. 2) ;5. 1921 (2. 1) ;5. 1777 (0. 9) ;4. 4811 (3. 3) ;4. 4655 (7. 5) ; 4. 4500 (3. 9) ;4. 4309 (0. 4) ;4. 2266 (4. 2) ;4. 2215 (4. 5) ;4. 0560 (1. 1) ;4. 0380 (3. 4) ;4. 0202 (3 . 4) ;4. 0023 (1. 2) ;3. 8362 (3. 8) ;3. 8227 (3. 4) ;3. 3218 (25. 8) ;2. 8900 (0. 6) ;2. 7311 (0. 6) ;2. 6 707 (1. 0) ;2. 5236 (2. 6) ;2. 5057 (130. 4) ;2. 5014 (170. 3) ;2. 4971 (122. 6) ;2. 3282 (1. 0) ;2. 141 8 (0. 9) ;2. 1256 (1. 2) ;2. 1084 (1. 4) ;2. 0941 (1. 3) ;2. 0746 (0. 7) ;2. 0126 (1. 0) ;1. 9999 (1. 6) ;1 . 9888 (16. 0) ;1. 9666 (1. 0) ;1. 9535 (0. 7) ;1. 2347 (0. 6) ;1. 1924 (3. 8) ;1. 1746 (7. 5) ;1. 1568 (3 . 7) ;0. 0080 (0. 4) ;−0. 0001 (12. 0)
597	1. 84		597: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 0160 (2. 4) ;8. 9955 (2. 4) ;8. 5800 (1. 6) ;8. 5647 (1. 7) ;8. 5564 (1. 7) ;8. 5410 (1. 7) ;8. 5257 (8. 0) ;8. 2056 (1. 8) ;7. 6979 (16. 0) ;7. 5619 (1. 8) ;7. 5385 (3. 4) ;7. 5151 (1. 7) ;7. 2990 (2. 3) ;7 . 2808 (2. 6) ;7. 1797 (1. 1) ;7. 1764 (1. 2) ;7. 1586 (2. 4) ;7. 1412 (1. 5) ;6. 9103 (1. 7) ;6. 8921 (2. 9) ;6. 8735 (1. 4) ;6. 7985 (3. 3) ;6. 7784 (3. 0) ;5. 2605 (0. 7) ;5. 2452 (1. 5) ;5. 2258 (1. 5) ;5. 210 3 (0. 6) ;4. 9247 (1. 7) ;4. 9122 (3. 9) ;4. 8996 (1. 8) ;4. 2873 (0. 3) ;4. 2603 (2. 4) ;4. 2512 (3. 2) ;4 . 2197 (0. 4) ;3. 6760 (0. 9) ;3. 6623 (3. 1) ;3. 6494 (4. 2) ;3. 6376 (2. 3) ;3. 6131 (2. 2) ;3. 6014 (3. 8) ;3. 5884 (2. 8) ;3. 3245 (128. 5) ;2. 6710 (0. 9) ;2. 5058 (125. 4) ;2. 5015 (161. 2) ;2. 4973 (117. 7) ;2. 3284 (0. 9) ;2. 1769 (0. 5) ;2. 1553 (0. 8) ;2. 1416 (1. 1) ;2. 1263 (1. 0) ;2. 1128 (0. 5) ;2. 059 8 (1. 1) ;2. 0478 (1. 1) ;2. 0324 (0. 8) ;2. 0239 (0. 7) ;2. 0143 (0. 6) ;−0. 0001 (5. 0)
599	1. 26		599: ^{1}H-NMR (400. 0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9. 0562 (3. 0) ;9. 0349 (3. 1) ;8. 5743 (0. 4) ;8. 4690 (1. 5) ;8. 4526 (1. 9) ;8. 4440 (1. 9) ;8. 4303 (1. 6) ;8. 3837 (8. 0) ;8. 1530 (1. 3) ;7. 9531 (0. 3) ;7. 8091 (1. 4) ;7. 7969 (1. 3) ;7. 7809 (1. 2) ;7. 7236 (3. 8) ;7. 7207 (3. 8) ;7. 7033 (4. 5) ;7. 6086 (1. 1) ;7. 5735 (2. 2) ;7. 5518 (3. 6) ;7. 5294 (2. 0) ;7. 4708 (1. 4) ;7. 4608 (1. 8) ;7. 4511 (2. 7) ;7. 4413 (3. 2) ;7. 4317 (1. 7) ;7. 4217 (1. 9) ;7. 3433 (2. 1) ;7. 3279 (3. 6) ;7. 3127 (2. 0) ;7. 2532 (3. 2) ;7. 2358 (3. 5) ;7. 2145 (0. 4) ;7. 1976 (0. 5) ;7. 1703 (2. 3) ;7. 1507 (4. 4) ;7. 1322 (2. 8) ;6. 9427 (0. 3) ;6. 8980 (2. 9) ;6. 8795 (4. 7) ;6. 8617 (2. 6) ;6. 8121 (0. 5) ;6. 7871 (4. 7) ;6. 7668 (4. 2) ;5. 7564 (16. 0) ;5. 2306 (1. 0) ;5. 2157 (2. 1) ;5. 197

			2(2.0);5.1830(0.9);4.3402(3.3);4.2258(4.6);3.7613(3.1);3.5706(0.3);3.5591(0.4);3.5486(0.4);3.4758(0.7);3.3304(5.7);3.1731(0.6);2.8900(1.4);2.7307(1.4);2.6707(1.6);2.5587(0.4);2.5016(305.4);2.4478(0.8);2.4148(0.4);2.4082(0.4);2.3283(1.8);2.1700(0.5);2.1196(1.4);1.9881(2.0);1.9618(1.2);1.1742(0.4);-0.0003(14.4)
606	2.63		606: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=20.0019(0.4);11.6374(0.5);9.3368(2.0);9.3164(1.9);8.6542(0.4);8.6320(8.0);8.3582(2.0);8.3369(2.2);8.1752(0.6);8.1559(0.5);7.7946(2.0);7.7787(2.7);7.7011(2.2);7.6792(2.2);7.6623(1.5);7.6399(0.6);7.6304(0.7);7.6154(0.9);7.6105(0.9);7.5953(0.9);7.5661(0.6);7.3732(2.0);7.3556(2.2);7.2327(1.2);7.2036(1.6);7.1824(2.2);7.1642(1.3);6.9450(1.6);6.9252(2.4);6.9067(1.2);6.8179(2.7);6.7965(2.4);5.3127(0.7);5.2980(1.3);5.2805(1.4);5.2646(0.6);5.1508(1.2);5.1352(2.6);5.1201(1.3);4.3135(0.6);4.3101(0.6);4.2925(1.2);4.2749(1.8);4.2657(1.9);4.2452(1.4);4.2228(0.6);3.6428(2.3);3.6278(2.6);3.6139(1.6);3.5956(0.5);3.5628(2.5);3.5489(3.0);3.3286(367.5);3.0681(16.0);2.6830(4.0);2.6784(5.4);2.6738(4.0);2.6571(0.4);2.5916(0.5);2.5585(1.2);2.5138(734.5);2.5095(960.4);2.5050(690.4);2.4327(0.8);2.3888(0.5);2.3406(4.0);2.3362(5.6);2.3320(4.1);2.2638(0.5);2.2521(0.8);2.2294(0.9);2.2202(0.8);2.2097(0.9);2.1954(0.9);2.1014(0.6);2.0870(1.1);2.0807(1.0);2.0641(0.9);2.0539(0.8);1.7536(0.4);0.0082(2.7);-2.4241(0.4);-2.6703(0.5)
625	1.24		625: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0900(1.0);9.0696(1.1);8.5142(4.0);8.3294(1.0);8.3092(1.0);7.7732(0.5);7.7612(2.0);7.7455(1.8);7.6202(3.0);7.6160(7.0);7.6102(2.8);7.6064(1.8);7.5945(2.0);7.5821(1.0);7.5610(1.1);7.5428(0.8);7.2876(1.0);7.2700(1.0);7.1885(0.5);7.1848(0.5);7.1681(1.0);7.1501(0.6);7.1463(0.6);7.1283(2.2);6.9241(0.7);6.9055(1.3);6.8866(0.7);6.8599(2.3);6.8053(1.4);6.7852(1.3);5.7568(16.0);5.2445(0.6);5.2257(0.6);4.3461(0.9);4.3314(2.0);4.3165(1.0);4.2612(1.0);4.2481(1.7);4.2348(1.1);3.7783(1.0);3.7693(0.9);3.7633(0.9);3.3256(11.9);3.1318(1.5);2.5236(0.7);2.5101(19.3);2.5058(40.5);2.5013(54.2);2.4968(38.5);2.4925(18.1);2.1600(0.3);2.1388(0.5);2.1255(0.5);2.0744(0.4);2.0394(0.4);2.0254(0.5);2.0027(0.3);0.0079(0.7);-0.0002(21.3);-0.0084(0.7)

629	2.09		629: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9739(1.9);8.9538(1.9);8.5544(0.4);8.3842(2.7);8.3611(3.0);8.3534(6.7);7.8907(1.2);7.8785(1.2);7.6553(3.6);7.6515(2.8);7.6466(4.6);7.6418(2.6);7.6325(3.3);7.3204(1.6);7.2981(2.8);7.2783(1.9);7.1724(0.9);7.1505(1.7);7.1331(1.2);7.1292(1.1);6.9069(1.3);6.8885(2.2);6.8727(1.1);6.7876(2.5);6.7691(2.1);5.2365(0.6);5.2227(1.1);5.2020(1.0);5.1865(0.5);4.2514(1.9);4.2395(3.2);4.2256(1.8);3.3205(162.9);3.0650(1.7);3.0510(6.7);3.0385(6.8);2.6746(1.3);2.6702(1.7);2.6658(1.3);2.5456(0.4);2.5233(4.5);2.5098(111.1);2.5055(228.2);2.5011(302.5);2.4966(215.4);2.4923(102.0);2.3324(1.2);2.3278(1.7);2.3236(1.2);2.1786(0.4);2.1705(0.6);2.1564(0.7);2.1345(0.8);2.1206(0.8);2.1072(0.3);2.0227(0.7);2.0119(0.9);1.9896(0.6);1.9757(0.6);1.3975(16.0);1.2981(0.4);1.2580(0.6);1.2351(3.6);0.8536(0.5);0.0078(1.2);-0.0002(36.1);-0.0084(1.4)
630	5.59		630: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0221(2.2);9.0014(2.2);8.6578(9.6);8.2917(3.5);8.2688(4.0);7.7935(4.4);7.7706(4.1);7.6936(2.7);7.6889(5.3);7.6841(2.9);7.3740(3.2);7.3575(3.9);7.2960(0.5);7.2779(1.4);7.2596(5.4);7.2490(2.8);7.2439(2.0);7.2315(1.8);7.2267(1.4);7.2158(0.7);7.2100(0.7);6.7934(0.4);6.7889(0.4);5.7565(13.4);5.6226(0.6);5.6026(1.6);5.5824(1.6);5.5623(0.6);3.9159(0.5);3.8839(6.4);3.8527(0.5);3.3624(0.7);3.3515(1.3);3.3314(2.0);3.3200(16.7);3.2889(1.5);3.2793(2.4);3.2661(1.7);3.2475(1.3);3.2366(0.7);2.6747(0.4);2.6701(0.6);2.6658(0.4);2.5236(1.4);2.5100(39.3);2.5057(82.0);2.5012(109.3);2.4967(78.5);2.4924(37.7);2.4266(1.5);2.4077(1.6);2.3956(1.7);2.3767(1.5);2.3323(0.5);2.3280(0.6);2.3233(0.5);1.9885(0.7);1.8670(1.4);1.8451(1.4);1.8359(1.4);1.8144(1.2);1.3617(16.0);1.2982(0.6);1.2583(0.8);1.2329(1.9);1.2207(14.1);1.1928(0.4);1.1747(0.5);0.8528(0.3);0.0081(0.4);-0.0002(13.8);-0.0083(0.5)
635	4.08		635: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=16.1140(0.5);10.4114(5.2);9.2742(4.1);9.2545(4.1);8.6672(16.0);8.4984(0.8);8.3161(0.7);8.2805(5.8);8.2574(6.8);7.9468(0.5);7.8498(0.5);7.8211(0.5);7.8071(1.9);7.7922(13.1);7.7695(10.8);7.7494(1.6);7.7007(4.7);7.6894(5.4);7.6846(12.3);7.6801(10.0);7.6549(0.5);7.6293(0.5);7.5660(2.6);7.5463(3.9);7.5265(1.9);7.4103(0.6)

			;7.3731(7.7);7.3420(0.5);7.2955(0.6);7.2790(0.5);7.2579(0.6);7.1748(0.6);7.1587(0.5);6.9763(2.6);6.9717(4.9);6.9672(2.8);6.7934(10.6);6.7888(10.5);5.7571(3.0);5.7200(1.4);5.7123(1.4);5.7007(2.3);5.6927(2.3);5.6827(1.4);5.6722(1.3);4.2620(0.6);3.9041(0.7);3.8714(10.6);3.8595(8.3);3.3202(437.6);3.2547(10.3);3.2474(9.8);3.2274(3.3);3.2003(3.5);3.1809(2.7);3.0551(0.6);3.0434(0.7);3.0415(0.8);3.0359(1.0);3.0236(1.1);2.6887(0.9);2.6736(7.4);2.6705(7.5);2.6653(7.5);2.6262(2.8);2.6181(3.1);2.5684(1.0);2.5234(15.1);2.5055(828.6);2.5011(1116.3);2.4966(810.8);2.4925(396.0);2.3321(4.3);2.3276(6.2);2.3235(4.8);1.6275(0.5);1.5493(0.6);1.3738(0.7);1.3611(0.6);1.3526(0.7);1.3364(0.7);1.3137(0.6);1.2976(3.0);1.2584(4.5);1.2492(1.9);1.2336(4.7);1.1866(0.7);1.1670(0.7);1.1470(0.5);0.8837(0.6);0.8665(1.0);0.8532(1.2);0.8343(0.9);0.7968(0.5);0.0080(3.9);−0.0001(140.0);−0.0082(6.0);−0.1495(0.7)
636	1.89		636: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9971(1.4);8.9919(1.4);8.9766(1.4);8.9719(1.4);8.5599(0.3);8.5003(0.6);8.4458(2.8);8.4226(3.0);8.3554(7.4);8.3047(0.3);8.0757(1.1);8.0706(0.5);8.0539(1.2);7.9316(0.8);7.9195(1.1);7.9128(1.1);7.9002(0.8);7.6950(3.1);7.6724(3.0);7.6539(0.6);7.6428(0.5);7.6285(0.9);7.6152(0.9);7.6017(0.9);7.5872(0.4);7.5792(0.4);7.4949(0.8);7.4737(0.7);7.3020(1.7);7.2826(1.7);7.1716(1.2);7.1510(2.4);7.1329(1.9);7.1156(0.9);7.0876(0.6);6.9221(0.3);6.9074(1.5);6.8887(2.4);6.8702(1.2);6.7886(3.0);6.7683(2.6);5.7565(1.4);5.2367(0.7);5.2226(1.4);5.2034(1.3);5.1877(0.6);4.2500(2.2);4.2386(3.3);4.2272(2.0);3.3214(36.9);3.0794(2.4);3.0597(4.7);3.0529(5.6);3.0474(5.6);3.0406(4.9);3.0261(0.9);2.6705(0.8);2.6665(0.6);2.5422(0.5);2.5379(0.5);2.5324(0.4);2.5238(1.9);2.5102(57.4);2.5061(114.6);2.5017(149.9);2.4973(108.3);2.3331(0.6);2.3287(0.8);2.3240(0.7);2.1869(0.4);2.1731(0.8);2.1589(0.9);2.1531(0.7);2.1394(0.9);2.1240(0.9);2.1119(0.4);2.0419(0.4);2.0252(0.8);2.0171(0.9);2.0075(0.9);1.9889(0.9);1.9713(0.5);1.3979(16.0);1.2984(0.6);1.2590(0.9);1.2353(1.0);1.1749(0.4);0.8534(0.4);0.1464(0.6);0.0362(0.5);0.0081(6.1);0.0000(147.3);−0.0077(6.7);−0.0332(0.4);−0.1494(0.7)
637	2.00		637 (Atop 異性体 1): ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO):

10

20

30

40

50

			δ=8.9812(3.0);8.9606(3.1);8.5585(2.1);8.5432(2.2);8.5347(2.2);8.5195(2.0);8.4472(1.0);8.3740(10.8);7.8585(1.3);7.8460(2.4);7.8330(1.3);7.7210(3.3);7.7173(3.5);7.7009(4.0);7.6972(4.0);7.5268(2.4);7.5043(4.0);7.4818(2.7);7.4707(3.7);7.4513(6.4);7.4315(3.6);7.3428(4.1);7.3391(4.3);7.3237(3.3);7.3200(3.0);7.2841(2.8);7.2656(3.1);7.1683(1.4);7.1645(1.4);7.1474(2.9);7.1298(1.8);7.1259(1.7);6.9122(0.3);6.9043(2.1);6.9019(2.2);6.8834(3.6);6.8671(1.7);6.8646(1.7);6.7869(4.0);6.7664(3.6);6.5264(1.2);5.7564(10.6);5.2486(1.0);5.2332(1.9);5.2138(1.8);5.1993(0.8);4.2563(3.3);4.2421(5.3);4.2296(3.1);4.0381(0.5);4.0202(0.5);3.5676(1.2);3.5530(1.0);3.5354(3.3);3.5218(3.7);3.5179(3.7);3.5043(3.3);3.4865(1.0);3.3244(162.6);2.6748(0.7);2.6705(1.0);2.6659(0.7);2.5238(2.2);2.5189(3.5);2.5103(62.0);2.5059(130.8);2.5015(175.3);2.4970(125.4);2.4927(59.8);2.3326(0.7);2.3281(1.0);2.3240(0.7);2.1843(0.4);2.1710(0.9);2.1540(0.9);2.1492(1.0);2.1351(1.7);2.1215(1.5);2.1070(0.5);2.0365(0.6);2.0236(1.4);2.0079(1.5);1.9886(3.0);1.9756(0.8);1.9606(0.4);1.3973(1.0);1.2982(0.6);1.2779(7.4);1.2600(16.0);1.2422(7.8);1.2362(2.8);1.1924(0.7);1.1745(1.4);1.1568(0.7);1.1179(0.4);0.1460(0.7);0.0079(5.2);-0.0002(164.7);-0.0085(6.1);-0.1496(0.8)	
637	2.00		637 (Atop 異性体 2): ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=8.9813(3.2);8.9607(3.1);8.5586(2.0);8.5432(2.5);8.5346(2.2);8.5195(2.0);8.4528(0.5);8.4472(1.0);8.3793(4.0);8.3740(10.1);7.8910(0.4);7.8462(2.8);7.8341(1.5);7.7210(3.6);7.7173(3.4);7.7009(4.4);7.6971(3.8);7.5269(2.3);7.5044(4.0);7.4817(2.8);7.4763(1.8);7.4707(3.8);7.4564(2.4);7.4512(6.1);7.4370(1.4);7.4315(3.4);7.3722(0.4);7.3429(4.6);7.3392(4.1);7.3238(3.5);7.3201(2.9);7.2866(3.1);7.2675(3.4);7.1684(1.7);7.1647(1.5);7.1491(3.3);7.1299(2.1);7.1260(1.7);6.9045(2.3);6.9017(2.3);6.8858(3.8);6.8672(1.8);6.8647(1.6);6.7871(4.2);6.7666(3.8);6.5259(1.0);5.7618(3.4);5.7564(9.6);5.2477(1.1);5.2335(2.3);5.2150(2.0);5.1991(0.8);4.2561(4.1);4.2423(5.9);4.2302(3.3);4.0378(0.5);4.0201(0.5);3.5734(0.5);3.5677(1.2);3.5530(1.3);3.5355(3.7);3.5222(4.6);3.5181(4.1);3.5044(3.6);3.4867(1.0);3.3292(56.4);3.3241(147.2);2.6749(1.0);2.6704(1.0);2.5100(97.7);2.5060(162.3);2.5014(184.8);2.4969(125.4);2.3326(0.9);2.3282(1.0);2.1711(1.0);2.1543(1.2);2.1482(1.2);2.1349(1.8)	

			;2.1213(1.6);2.1069(0.6);2.0234(1.7);2.0079(1.8);1.9942(1.9);1.9885(3.2);1.9758(1.0);1.3973(1.0);1.2984(0.7);1.2778(7.7);1.2650(7.0);1.2599(16.0);1.2421(8.2);1.1924(0.8);1.1803(0.7);1.1746(1.4);1.1624(0.5);1.1566(0.8);1.1175(0.4);0.8531(0.3);0.1461(0.7);0.0054(57.5);-0.0002(161.4);-0.0084(7.7);-0.1496(0.7)
638	2.23		638: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0008(3.2);8.9802(3.2);8.5200(2.1);8.5049(2.3);8.4962(2.3);8.4812(2.3);8.4700(11.1);7.9621(1.4);7.9491(2.6);7.9360(1.4);7.6569(3.9);7.6521(7.7);7.6473(4.4);7.5206(2.6);7.4975(4.7);7.4688(12.2);7.4645(11.6);7.2968(3.0);7.2782(3.2);7.1784(1.5);7.1750(1.5);7.1575(3.0);7.1400(1.9);7.1363(1.8);6.9153(2.2);6.8968(3.8);6.8803(1.8);6.8780(1.8);6.7978(4.2);6.7776(3.9);5.7568(14.4);5.2612(0.8);5.2462(1.9);5.2271(1.9);5.2124(0.8);4.2879(0.4);4.2684(2.9);4.2535(5.0);4.2416(3.2);4.2248(0.4);4.0559(0.5);4.0381(1.4);4.0204(1.4);4.0025(0.5);3.5657(1.0);3.5479(3.4);3.5341(3.8);3.5305(3.9);3.5167(3.4);3.4992(1.0);3.3244(45.5);2.6751(0.3);2.6708(0.4);2.6664(0.3);2.5240(1.0);2.5062(58.1);2.5018(77.3);2.4974(55.4);2.4933(26.6);2.3284(0.4);2.3242(0.3);2.1917(0.4);2.1800(0.8);2.1675(0.8);2.1582(1.0);2.1439(1.7);2.1299(1.4);2.1160(0.6);2.0571(0.6);2.0444(1.4);2.0300(1.4);2.0168(0.9);2.0079(1.0);1.9976(0.8);1.9889(6.3);1.3966(2.5);1.2716(7.6);1.2537(16.0);1.2359(7.6);1.1928(1.6);1.1750(3.2);1.1572(1.6);1.1006(0.4);0.1459(0.4);0.0078(2.9);-0.0002(85.1);-0.0085(3.2);-0.1498(0.4)
639	2.03		639: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0037(3.5);8.9833(3.6);8.5928(2.3);8.5776(2.5);8.5692(2.5);8.5540(2.3);8.4447(8.2);7.9683(0.9);7.9555(1.6);7.9411(1.6);7.9269(1.7);7.9141(0.9);7.6638(0.8);7.6556(0.8);7.6367(1.6);7.6280(1.5);7.6154(1.5);7.6000(0.8);7.5928(0.6);7.5575(2.4);7.5348(4.5);7.5123(2.4);7.2980(3.6);7.2784(4.0);7.2281(1.0);7.2073(1.8);7.1856(1.1);7.1760(2.3);7.1556(3.8);7.1373(2.3);6.9128(2.6);6.8941(4.4);6.8755(2.1);6.7945(5.2);6.7742(4.7);5.7562(7.5);5.2574(1.0);5.2421(2.3);5.2232(2.3);5.2089(1.0);4.2637(3.6);4.2504(6.3);4.2383(3.7);4.0560(0.4);4.0382(1.2);4.0202(1.2);4.0029(0.4);3.5615(0.9);3.5447(2.8);3.5317(4.0);3.5142(2.9);3.3254(108.5);2.6706(0.7);2.5017(124.2);2.3283(0.7);2.1918(0.5);2.1788(1.1);2.1587(1.2);2.1432(2.0);2.1298

			(1.7) ;2.1157(0.7) ;2.0354(1.5) ;2.0224(1.6) ;2.0015(1.1) ;1.9887(6.0) ;1.3972(0.8) ;1.2987(0.3) ;1.2755(7.7) ;1.2577(16.0) ;1.2399(8.0) ;1.1925(1.4) ;1.1748(2.8) ;1.1570(1.4) ;1.1112(0.4) ;0.1461(0.5) ;-0.0003(106.4) ;-0.1497(0.5)
640	2.48		640: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.0190(2.7) ;8.9986(2.8) ;8.5860(1.9) ;8.5708(1.8) ;8.5624(1.9) ;8.5471(1.6) ;8.4880(8.4) ;8.4794(1.3) ;8.4515(0.7) ;8.4433(0.4) ;8.2878(0.5) ;8.2279(2.1) ;8.0387(1.2) ;8.0254(2.1) ;8.0125(1.1) ;7.7914(0.8) ;7.6916(16.0) ;7.5748(0.5) ;7.5631(1.8) ;7.5519(0.4) ;7.5398(3.4) ;7.5166(1.7) ;7.2969(2.4) ;7.2786(2.7) ;7.1814(1.1) ;7.1778(1.2) ;7.1606(2.5) ;7.1428(1.6) ;6.9190(1.7) ;6.9002(3.0) ;6.8820(1.5) ;6.7996(3.4) ;6.7792(3.1) ;5.7563(6.7) ;5.2566(0.7) ;5.2422(1.7) ;5.2228(1.7) ;5.2079(0.8) ;4.2673(2.5) ;4.2530(4.4) ;4.2411(2.9) ;4.0382(0.5) ;4.0200(0.5) ;3.5675(1.1) ;3.5501(2.9) ;3.5331(3.2) ;3.5189(2.7) ;3.5015(0.8) ;3.3250(141.3) ;2.6708(0.8) ;2.5059(106.3) ;2.5018(136.0) ;2.4976(97.9) ;2.3285(0.7) ;2.1793(0.7) ;2.1585(0.9) ;2.1438(1.4) ;2.1299(1.2) ;2.1166(0.5) ;2.0576(0.5) ;2.0442(1.2) ;2.0302(1.3) ;2.0171(0.8) ;2.0082(0.9) ;1.9888(2.3) ;1.3974(1.0) ;1.2982(0.3) ;1.2718(5.9) ;1.2620(2.4) ;1.2539(12.0) ;1.2362(6.0) ;1.1928(0.6) ;1.1750(1.1) ;1.1571(0.6) ;0.1461(0.6) ;0.0073(4.4) ;-0.0001(110.9) ;-0.0082(4.5) ;-0.1496(0.6)
641	1.92		641: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.0727(0.5) ;9.0637(0.6) ;9.0525(0.6) ;8.4190(0.8) ;8.4096(1.8) ;8.4004(2.2) ;7.7346(0.4) ;7.6795(1.2) ;7.6757(1.2) ;7.6593(1.2) ;7.6558(1.2) ;7.5940(0.5) ;7.5815(2.6) ;7.5618(1.4) ;7.5440(0.4) ;7.4389(0.5) ;7.4315(0.5) ;7.4194(0.9) ;7.4111(0.8) ;7.4002(0.5) ;7.3915(0.5) ;7.3174(0.7) ;7.3021(1.5) ;7.2863(1.2) ;7.1704(0.5) ;7.1530(1.0) ;7.1323(0.6) ;6.9077(0.7) ;6.8882(1.2) ;6.8702(0.6) ;6.7922(1.4) ;6.7715(1.2) ;5.2376(0.6) ;5.2210(0.6) ;4.2559(2.4) ;4.2484(2.3) ;3.7210(1.1) ;3.7090(0.9) ;3.3195(59.6) ;2.6702(1.5) ;2.5231(3.5) ;2.5054(198.0) ;2.5011(259.6) ;2.4968(186.2) ;2.3320(1.1) ;2.3277(1.5) ;2.1827(0.3) ;2.1601(0.4) ;2.1464(0.6) ;2.1325(0.5) ;2.0385(0.4) ;2.0240(0.5) ;1.9970(11.1) ;1.9022(1.6) ;1.3977(16.0) ;0.1461(1.0) ;0.0077(7.6) ;-0.0002(219.7) ;-0.0081(8.5) ;-0.1498(1.1)
644	2.03		644: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) :

			δ=9.1762(2.1);9.1562(2.2);8.6798(7.4);7.9799(1.3);7.9643(1.5);7.9565(1.5);7.9407(1.4);7.6877(2.4);7.6832(4.5);7.6479(3.0);7.5660(1.5);7.5426(2.8);7.5196(1.4);7.4951(8.0);7.4914(7.9);7.3265(2.0);7.3076(2.2);7.1882(1.1);7.1662(4.4);7.1530(1.6);6.9288(1.5);6.9104(2.5);6.8919(1.2);6.8417(3.1);6.8047(2.9);6.7842(2.6);5.2372(0.6);5.2226(1.3);5.2037(1.3);5.1892(0.6);4.3111(2.0);4.2962(4.0);4.2811(2.3);4.2538(1.2);4.2359(1.7);4.2269(1.8);4.2119(1.1);4.2052(1.3);4.1841(0.4);4.0378(0.5);4.0200(0.6);3.5379(2.0);3.5229(3.8);3.5078(1.9);3.3232(6.1);3.0749(16.0);2.8662(2.9);2.6705(0.7);2.5480(0.8);2.5053(97.3);2.5014(124.4);2.3284(0.7);2.2069(0.4);2.1981(0.6);2.1838(0.8);2.1745(0.8);2.1629(0.8);2.1517(0.6);2.0745(3.5);2.0303(0.9);2.0162(0.7);2.0025(0.6);1.9887(2.6);1.2341(0.9);1.1924(0.6);1.1746(1.2);1.1568(0.6);-0.0001(61.3)
647	3.90		647: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.2469(1.6);9.2267(1.7);8.7138(6.9);8.4548(3.2);8.3695(1.3);8.3539(1.4);8.3458(1.4);8.3303(1.3);7.7363(2.2);7.7312(2.4);7.6970(2.2);7.6921(4.6);7.6877(3.4);7.6656(2.6);7.6424(1.4);7.6381(0.9);7.6330(1.2);7.6280(0.6);7.5214(6.3);7.5172(6.1);7.3823(1.5);7.3649(1.6);7.1937(0.8);7.1902(0.8);7.1726(1.6);7.1552(1.0);7.1517(1.0);6.9391(1.1);6.9366(1.2);6.9180(2.0);6.9019(1.0);6.8993(1.0);6.8088(2.2);6.8068(2.2);6.7884(2.0);6.7863(2.0);5.7561(12.1);5.2495(0.4);5.2362(1.0);5.2167(1.0);5.2022(0.5);4.2875(0.3);4.2695(0.9);4.2546(1.8);4.2458(1.6);4.2339(0.9);4.2262(1.0);4.2061(0.3);4.0558(0.6);4.0380(1.7);4.0202(1.7);4.0024(0.6);3.7243(0.9);3.7057(2.6);3.6886(2.0);3.6540(0.4);3.6195(1.1);3.6034(2.2);3.5864(1.6);3.5681(0.8);3.5517(0.4);3.3229(30.8);3.0469(13.3);3.0228(0.8);2.9728(16.0);2.9526(0.6);2.6705(0.4);2.5240(0.9);2.5104(24.8);2.5061(52.1);2.5016(69.8);2.4971(49.8);2.4928(23.6);2.3283(0.4);2.2263(0.3);2.2177(0.4);2.2054(0.6);2.1949(0.6);2.1835(0.7);2.1718(0.5);2.0912(0.5);2.0835(0.6);2.0764(0.8);2.0614(0.5);2.0499(0.5);2.0418(0.5);1.9888(7.6);1.1927(2.0);1.1749(4.0);1.1571(1.9);0.0079(0.6);-0.0002(19.9);-0.0085(0.7)
648	2.06		648: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0572(2.9);9.0367(2.9);8.4493(10.6);8.1700(2.0);8.1550(2.1);8.1463(2.1);8.131

			4(2.0);7.7358(0.7);7.7309(0.8);7.6651(3.6);7.6604(7.0);7.6556(4.0);7.6378(0.4);7.6329(0.5);7.4698(11.0);7.4663(10.8);7.4519(2.4);7.4287(4.1);7.4056(2.1);7.3170(2.8);7.2990(3.1);7.1870(1.4);7.1840(1.4);7.1665(2.9);7.1487(1.8);7.1452(1.7);6.9224(2.0);6.9044(3.5);6.8874(1.7);6.8060(4.0);6.7857(3.6);5.7560(16.0);5.5709(0.8);5.5640(1.0);5.5582(0.9);5.4176(1.0);5.2110(0.8);5.1968(1.8);5.1775(1.8);5.1628(0.8);4.7415(0.4);4.7258(0.5);4.7120(0.9);4.6976(0.9);4.6840(0.9);4.6565(3.0);4.6425(1.9);4.6234(1.6);4.6147(1.7);4.5979(2.4);4.5899(2.1);4.5582(1.4);4.5287(0.6);4.2661(3.1);4.2539(5.1);4.2399(3.1);4.0559(0.6);4.0380(1.8);4.0202(1.8);4.0026(0.6);3.3241(88.4);3.0496(0.4);2.6708(0.7);2.5060(93.6);2.5017(121.8);2.4974(88.1);2.3287(0.7);2.2024(0.4);2.1879(1.0);2.1736(1.1);2.1537(1.3);2.1387(1.3);2.1252(0.5);2.0539(0.6);2.0402(1.2);2.0284(1.4);2.0149(0.9);2.0067(1.0);1.9888(8.4);1.3973(2.6);1.1928(2.1);1.1750(4.1);1.1572(2.0);0.0080(1.0);−0.0001(30.3)
649	3.76		649: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.3085(1.9);9.2880(2.0);8.6476(8.2);8.3888(1.4);8.3732(1.6);8.3651(1.6);8.3496(1.5);8.1547(0.5);7.6899(2.7);7.6851(5.2);7.6803(2.9);7.6387(1.6);7.6155(3.1);7.5923(1.6);7.5128(7.7);7.5088(7.6);7.3587(2.0);7.3408(2.1);7.1945(0.9);7.1910(1.0);7.1736(2.0);7.1559(1.2);7.1525(1.2);6.9340(1.5);6.9157(2.4);6.8992(1.2);6.8968(1.2);6.8099(2.7);6.7897(2.5);5.2926(0.5);5.2790(1.2);5.2593(1.2);5.2449(0.6);5.1397(1.0);5.1247(2.2);5.1092(1.0);4.3009(0.4);4.2935(0.4);4.2812(1.1);4.2719(1.1);4.2537(1.6);4.2400(1.0);4.2326(1.2);4.2124(0.4);4.2051(0.3);4.0377(0.8);4.0200(0.8);3.6455(0.8);3.6328(2.3);3.6195(2.5);3.6063(1.2);3.5285(2.3);3.5160(3.1);3.5041(1.4);3.3211(12.7);3.0487(16.0);2.6747(0.4);2.6700(0.6);2.6660(0.4);2.5234(1.3);2.5097(37.4);2.5056(78.3);2.5011(104.9);2.4967(76.0);2.3324(0.4);2.3278(0.6);2.3234(0.5);2.2371(0.4);2.2287(0.5);2.2165(0.8);2.2074(0.8);2.1953(0.8);2.1839(0.6);2.1748(0.4);2.0742(9.8);2.0583(0.7);2.0518(0.7);2.0411(0.6);2.0328(0.6);1.9885(3.7);1.1924(1.0);1.1746(1.9);1.1568(0.9);0.0079(0.6);−0.0003(20.1);−0.0085(0.8)
650	4.51		650: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1837(1.2);9.1634(1.3);8.6809(4.8);8.2435(0.9);8.2277(1.0);8.2197(1.0);8.2043

			(1.0);7.6933(1.4);7.6887(2.8);7.6837(2.0);7.6575(1.9);7.6343(0.9);7.5177(4.8);7.5133(4.7);7.3620(1.2);7.3438(1.3);7.1910(0.6);7.1874(0.6);7.1697(1.2);7.1524(0.8);7.1492(0.7);6.9344(0.9);6.9161(1.5);6.8981(0.7);6.8052(1.7);6.7851(1.5);5.7556(7.6);5.2537(0.3);5.2391(0.8);5.2201(0.8);5.2061(0.3);4.2758(0.7);4.2596(1.2);4.2506(1.2);4.2386(0.7);4.2304(0.8);3.5520(1.3);3.5365(16.0);3.5178(1.3);3.3250(45.2);3.0097(10.2);2.7359(1.0);2.7216(1.8);2.7177(1.9);2.7048(0.9);2.7002(0.9);2.5236(0.6);2.5059(34.1);2.5017(45.7);2.4974(33.7);2.2010(0.5);2.1907(0.5);2.1792(0.5);2.1683(0.4);2.0735(0.3);2.0661(0.4);2.0583(0.5);2.0435(0.4);2.0318(0.4);2.0234(0.4);0.0074(0.6);−0.0002(16.6);−0.0080(0.7)
661	3.48		661: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.2660(1.8);9.2458(1.8);8.7364(6.3);8.4266(1.2);8.4110(1.3);8.4029(1.3);8.3875(1.3);7.7469(11.3);7.7294(1.3);7.7061(2.5);7.6829(1.3);7.3840(1.6);7.3651(1.8);7.1922(0.8);7.1746(1.7);7.1566(1.0);7.1535(1.0);6.9384(1.2);6.9200(2.1);6.9014(1.0);6.8085(2.4);6.7883(2.1);5.2480(0.5);5.2343(1.0);5.2148(1.1);5.2011(0.5);4.2879(0.3);4.2693(0.9);4.2543(1.8);4.2453(1.7);4.2331(0.9);4.2256(1.1);4.2045(0.3);3.7270(1.0);3.7089(2.8);3.6921(2.1);3.6562(0.3);3.6219(1.1);3.6061(2.4);3.5891(1.7);3.5707(0.8);3.3195(31.5);3.0513(13.4);2.9714(16.0);2.6701(0.4);2.5050(45.4);2.5008(60.1);2.4965(44.9);2.3276(0.4);2.2270(0.4);2.2193(0.4);2.2055(0.6);2.1953(0.7);2.1842(0.7);2.1722(0.5);2.0920(0.5);2.0848(0.7);2.0775(0.8);2.0634(0.6);2.0509(0.5);2.0426(0.5);0.0077(2.0);−0.0002(58.4);−0.0083(3.0)
666	4.19		666: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1888(0.4);9.1756(2.0);9.1551(2.1);8.8415(0.9);8.6572(7.6);8.3810(1.4);8.3654(1.5);8.3574(1.6);8.3419(1.4);8.1800(1.9);7.7145(0.7);7.7106(0.7);7.7059(0.4);7.6898(2.4);7.6854(4.3);7.6809(2.5);7.6365(1.6);7.6133(3.0);7.5902(1.5);7.5413(1.0);7.5373(0.9);7.5138(7.7);7.5099(7.4);7.4093(1.7);7.3948(1.9);7.3893(1.9);7.2887(1.0);7.2836(1.3);7.2686(2.6);7.2587(1.1);7.2540(1.1);7.2404(2.9);7.2351(3.5);7.2262(3.2);7.2177(2.7);7.1992(0.5);5.7554(11.4);5.5865(0.6);5.5671(1.7);5.5474(1.8);5.5277(0.6);5.1663(0.3);4.4586(0.6);4.4451(0.3);3.6266(3.1);3.6152(2.4);3.5424(2.7);3.5304(3.5);3.3506(1.4);3.2177(0.4);3.0483(16.0);3.0232(0.8);3.0095(0.7);

			2.9999(0.8);2.9917(1.0);2.9833(1.0);2.9700(1.0);2.9614(0.9);2.9068(0.8);2.8863(1.6);2.8662(1.3);2.8468(0.9);2.8263(0.5);2.6707(0.3);2.5694(0.4);2.5600(0.5);2.5497(0.8);2.5390(1.1);2.5290(1.2);2.5059(41.4);2.5017(53.0);2.4974(39.4);2.3925(2.1);2.3288(0.3);1.9889(1.1);1.9703(1.1);1.9596(0.6);1.9500(1.1);1.9391(1.1);1.9293(0.5);1.9188(0.9);1.8974(0.3);1.2324(0.6);1.1749(0.4);-0.0001(16.4)
667	2.20		667: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1838(0.9);9.1637(0.9);8.6672(3.8);8.2561(0.9);8.2533(1.0);8.2348(1.1);8.2318(1.0);7.8167(1.1);7.8136(1.0);7.7994(2.0);7.7952(1.8);7.7744(1.0);7.7549(0.4);7.7051(1.0);7.6860(1.3);7.6714(1.0);7.6531(1.0);7.6502(1.1);7.6352(10.7);7.5676(0.6);7.5485(1.0);7.5297(0.4);5.7451(0.3);5.7340(0.6);5.7256(0.6);5.7149(0.3);3.5677(1.1);3.3192(50.0);3.2454(0.6);3.2261(0.7);3.1987(0.8);3.1793(0.7);3.0654(16.0);2.6876(0.8);2.6787(1.0);2.6704(0.7);2.6658(0.5);2.6408(0.7);2.6321(0.7);2.5234(1.7);2.5056(81.8);2.5013(106.7);2.4968(76.8);2.3320(0.5);2.3280(0.6);2.3241(0.4);1.9883(1.2);1.3976(5.9);1.1925(0.3);1.1747(0.7);1.1568(0.3);0.1461(0.4);0.0078(3.7);-0.0002(99.3);-0.0084(4.0);-0.1496(0.5)
668	3.94		668: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.1048(0.6);9.0845(0.6);8.5684(2.2);8.2951(0.9);8.2722(1.1);7.7677(1.1);7.7447(1.0);7.6197(2.0);7.3464(0.6);7.3272(0.6);7.1808(0.3);7.1623(0.6);7.1415(0.4);6.9222(0.4);6.9036(0.8);6.8863(0.3);6.7970(0.8);6.7766(0.7);5.2280(0.4);5.2096(0.4);4.2664(0.4);4.2398(0.5);4.2239(0.3);4.2180(0.4);3.3213(197.3);3.0723(9.7);3.0549(1.1);2.6700(1.0);2.5051(126.7);2.5011(167.6);2.4969(130.1);2.3278(1.0);1.3975(16.0);0.1457(0.6);-0.0003(133.9);-0.1501(0.7)
669	2.67		669: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0888(1.0);9.0685(1.0);8.5482(3.5);8.2431(1.6);8.2203(1.8);7.7361(1.8);7.7132(1.7);7.3437(1.0);7.3234(1.3);7.2978(0.9);7.2924(0.6);7.2742(0.4);7.1768(0.5);7.1593(1.0);7.1385(0.6);7.0392(1.0);7.0204(1.0);6.9196(0.7);6.9008(1.2);6.8822(0.6);6.7944(1.4);6.7741(1.2);5.2331(0.7);5.2138(0.6);4.2661(0.6);4.2491(0.9);4.2400(1.0);4.2265(0.6);4.2192(0.7);3.3208(107.7);3.0636(16.0);2.6703(0.9);2.5052(108.3);2.5012(145.2);2.4972(117.6);2.3278(0.9);2.1920(0.4);2.1823(0.4);2.1690(0.4);2

			.0407(0.4);2.0341(0.5);2.0229(0.4);2.0072(0.3);1.3976(2.0);0.1458(0.5);-0.0002(112.9);-0.1499(0.5)
670	2.84		670: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0781(0.7);9.0580(0.8);8.5100(2.0);8.1805(1.6);8.1576(1.9);7.6967(2.0);7.6738(1.8);7.3393(0.8);7.3205(0.9);7.2257(1.6);7.1779(0.4);7.1741(0.4);7.1563(0.8);7.1392(0.5);7.1353(0.5);7.0548(0.5);7.0243(0.5);6.9152(0.7);6.8967(1.1);6.8779(0.6);6.8661(0.5);6.8407(0.5);6.7933(1.2);6.7749(1.1);5.7551(0.4);5.2322(0.5);5.2138(0.5);4.2667(0.5);4.2575(0.5);4.2498(0.6);4.2380(0.7);4.2252(0.4);4.2173(0.6);3.5677(5.0);3.3190(47.9);3.0537(16.0);2.6747(0.4);2.6701(0.6);2.6656(0.4);2.5235(1.3);2.5099(32.8);2.5056(69.2);2.5011(93.6);2.4966(68.7);2.4922(34.2);2.3633(0.6);2.3451(2.6);2.3280(0.8);2.3235(0.6);2.1902(0.4);2.1802(0.3);2.1680(0.3);2.0341(0.4);1.3975(0.9);1.3203(1.7);1.2826(8.0);0.8894(0.7);0.1460(0.4);0.0079(3.1);-0.0002(94.5);-0.0084(4.2);-0.1497(0.4)
671	3.00		671: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0854(0.5);9.0650(0.5);8.6944(0.6);8.5236(3.9);8.2521(1.7);8.2292(1.8);7.7986(0.6);7.7790(1.0);7.7534(1.9);7.7395(0.5);7.7304(2.0);7.7225(1.0);7.7009(0.6);7.6084(0.8);7.3380(0.8);7.3199(0.9);7.1766(0.5);7.1728(0.4);7.1553(0.9);7.1381(0.5);7.1340(0.5);6.9150(0.6);6.8944(1.0);6.8759(0.5);6.7934(1.3);6.7728(1.1);5.7556(0.5);5.2278(0.6);5.2078(0.6);4.2631(0.6);4.2545(0.6);4.2459(0.7);4.2376(0.8);4.2136(0.5);3.3202(122.1);3.0699(16.0);3.0549(2.9);2.6746(0.7);2.6700(0.9);2.6656(0.7);2.5233(2.3);2.5098(55.6);2.5055(115.1);2.5011(154.0);2.4966(112.5);2.4923(56.1);2.3322(0.6);2.3278(0.9);2.3234(0.7);2.1869(0.4);2.1780(0.4);2.1659(0.4);2.0309(0.4);0.8892(0.7);0.1457(0.7);0.0077(4.8);-0.0002(143.2);-0.0084(6.6);-0.1498(0.7)
672	2.20		672: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO): δ=9.0722(0.4);9.0608(0.9);9.0405(0.9);8.5074(3.8);8.1786(1.6);8.1557(1.9);7.6922(1.9);7.6693(1.8);7.3389(0.8);7.3198(0.9);7.1783(0.4);7.1747(0.4);7.1572(0.8);7.1400(0.5);7.1359(0.5);7.0250(1.5);6.9161(0.6);6.8975(1.1);6.8814(0.5);6.8787(0.5);6.8394(1.0);6.8085(1.0);6.7953(1.3);6.7748(1.1);6.3561(0.3);5.2342(0.5);5.2146

			(0.5) ;4.2667(0.5) ;4.2568(0.5) ;4.2498(0.7) ;4.2396(0.8) ;4.2261(0.5) ;4.2188(0.6) ;3.3229(33.8) ;3.0542(16.0) ;2.5234(0.5) ;2.5097(11.7) ;2.5056(24.2) ;2.5011(32.4) ;2.4966(23.8) ;2.4923(11.9) ;2.3130(4.7) ;2.3061(4.8) ;2.1910(0.3) ;2.1813(0.4) ;2.1686(0.4) ;2.1573(1.8) ;2.0410(0.3) ;2.0334(0.4) ;1.2344(0.4) ;0.0079(1.1) ;-0.0002(31.5) ;-0.0084(1.4)
673	2.73		673: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.0829(2.0) ;9.0626(2.0) ;8.4835(6.9) ;8.4575(1.2) ;8.4426(1.3) ;8.4336(1.3) ;8.4188(1.2) ;7.8687(0.8) ;7.8560(1.6) ;7.8426(0.8) ;7.6931(16.0) ;7.5995(1.6) ;7.5762(3.1) ;7.5529(2.2) ;7.5258(0.6) ;7.5058(0.5) ;7.4980(0.5) ;7.4886(0.4) ;7.4803(0.5) ;7.4548(3.8) ;7.4504(3.9) ;7.2728(1.8) ;7.2546(1.9) ;7.1790(0.9) ;7.1752(0.9) ;7.1581(1.8) ;7.1405(1.2) ;7.1365(1.1) ;6.9004(1.4) ;6.8818(2.3) ;6.8654(1.0) ;6.8631(1.1) ;6.7942(2.6) ;6.7756(2.3) ;6.2176(2.4) ;6.2126(4.3) ;6.2077(2.5) ;5.7555(10.1) ;5.2284(0.5) ;5.2139(1.2) ;5.1949(1.2) ;5.1806(0.5) ;4.4965(0.6) ;4.4922(0.6) ;4.4773(1.9) ;4.4617(4.2) ;4.4463(2.1) ;4.2421(1.9) ;4.2296(3.2) ;4.2156(2.5) ;3.8610(1.0) ;3.8460(2.6) ;3.8316(2.5) ;3.8166(0.9) ;3.3249(29.4) ;2.6705(0.3) ;2.5239(0.8) ;2.5189(1.2) ;2.5103(18.1) ;2.5061(37.6) ;2.5017(50.5) ;2.4972(37.0) ;2.4929(18.4) ;2.1465(0.6) ;2.1327(0.6) ;2.1260(0.6) ;2.1119(0.9) ;2.0972(0.9) ;2.0828(0.3) ;2.0328(0.4) ;2.0199(0.8) ;2.0077(0.9) ;1.9943(0.6) ;1.9858(0.6) ;1.9715(0.5) ;1.3520(0.8) ;1.2586(0.4) ;1.2276(0.9) ;0.0072(2.0) ;-0.0002(60.0) ;-0.0084(2.8)
674	4.13		674: ^{1}H-NMR(400.0 MHz, d_6-DMSO) : δ=9.2997(1.7) ;9.2792(1.7) ;8.6010(6.9) ;8.3134(2.8) ;8.2904(3.1) ;7.7458(3.3) ;7.7229(3.2) ;7.6789(2.2) ;7.6743(4.1) ;7.6696(2.4) ;7.6590(0.4) ;7.6355(0.7) ;7.5524(0.4) ;7.3767(1.8) ;7.3464(1.8) ;7.3278(1.8) ;7.1892(0.9) ;7.1856(0.9) ;7.1683(1.7) ;7.1509(1.1) ;7.1473(1.0) ;6.9239(1.2) ;6.9054(2.1) ;6.8889(1.0) ;6.8866(1.0) ;6.8042(2.4) ;6.7835(2.0) ;5.7555(1.3) ;5.2834(0.5) ;5.2687(1.0) ;5.2494(1.1) ;5.2346(0.6) ;5.1224(1.1) ;5.1071(2.5) ;5.0920(1.1) ;4.2941(0.5) ;4.2867(0.5) ;4.2744(1.1) ;4.2654(1.0) ;4.2580(1.2) ;4.2502(1.4) ;4.2432(1.2) ;4.2303(0.9) ;4.2227(1.1) ;4.2024(0.4) ;4.1950(0.3) ;3.7342(0.3) ;3.7229(0.4) ;3.7106(0.4) ;3.6435(0.8) ;3.6309(2.1) ;3.6172(2.4) ;3.6039(1.3) ;3.5678(16.0) ;3.5277(2.0) ;3.5149(2.7) ;3.5038(1.3) ;3.3194(58.5) ;3.0752(0.5) ;3.0653(1

			.3) ;3.0459(13.7) ;2.6748(0.7) ;2.6702(1.0) ;2.6658(0.7) ;2.5097(63.1) ;2.5057(123.7) ; 2.5013(161.6) ;2.4968(118.2) ;2.3325(0.7) ;2.3281(0.9) ;2.3237(0.7) ;2.2229(0.5) ;2.20 97(0.7) ;2.2002(0.7) ;2.1882(0.8) ;2.1771(0.6) ;2.1664(0.4) ;2.0605(0.7) ;2.0529(0.8) ; 2.0428(0.6) ;2.0365(0.6) ;2.0267(0.6) ;2.0185(0.6) ;1.2586(0.5) ;1.2492(0.6) ;1.2355(1 .6) ;0.1461(0.6) ;0.0077(5.9) ;0.0000(131.3) ;-0.0081(7.0) ;-0.1495(0.6)
377		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.83 分；m/z = 473 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 8.97（s，1H），8.22（m，1H），8.09（d，J = 1.1 Hz，1H），7.68（d，J = 6.3 Hz，1H），7.60（m，1H），7.29（d，J = 7.4 Hz，1H），7.26 - 7.16（m，2H），6.96 - 6.81（m，3H），5.41 - 5.33（m，1H），4.34（m，1H），4.19（m，1H），3.96（s，3H），3.13（s，6H），2.44 - 2.33（m，1H），2.25 - 2.15（m，1H）.
378		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.82 分；m/z = 450 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 8.91（s，1H），8.77（d，J = 5.0 Hz，1H），8.25（m，1H），8.03（s，1H），7.79（m，1H），7.72（m，1H），7.67 - 7.59（m，1H），7.31（d，J = 7.3 Hz，1H），7.24 - 7.17（m，1H），7.13（d，J = 7.5 Hz，1H），6.98 - 6.90（m，1H），6.87（d，J = 8.2 Hz，1H），5.37（q，J = 5.4 Hz，1H），4.35（m，1H），4.21（m，1H），3.15（s，6H），2.46 - 2.34（m，1H），2.22（m，1H）.
379		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.08 分；m/z = 440 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 9.01（s，1H），8.15（t，J = 6.3 Hz，2H），7.68（d，J = 6.3 Hz，1H），7.62 - 7.54（m，1H），7.41（d，J = 7.3 Hz，1H），7.30（d，J = 7.5 Hz，1H），7.21（t，J = 7.7 Hz，1H），6.90（m，3H），6.76（s，1H），5.38（q，J = 5.4 Hz，1H），4.48（s，2H），4.35（m，1H），4.25 - 4.16（m，1H），3.12（s，6H），2.39（m，1H），2.21（m，1H）.
380		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.24 分；m/z = 439 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 9.00（s，1H），8.58（d，J = 5.1 Hz，1H），8.18（m，1H），7.69（m，1H），7.59（m，1H），7.43 - 7.28（m，4H），7.24 - 7.17（m，1H），6.97 - 6.83（m，2H），5.38（q，J = 5.4 Hz，1H），4.35（m，1H），4.20（m，1H），3.13（s，6H），2.63（s，3H），2.45 - 2.34（m，1H），2.22（m，1H）.
381		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.26 分；m/z = 439 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 8.92（s，1H），8.52 - 8.43（m，2H），8.20（m，1H），7.63 - 7.56（m，1H），7.52（m，1H），7.31（m，2H），7.23 - 7.17（m，1H），7.14（d，J = 4.8 Hz，1H），6.96 - 6.82（m，2H），5.37（q，J = 5.4 Hz，1H），4.34（m，1H），4.19（m，1H），3.15（s，6H），2.38（m 1H），2.26 - 2.15（m，1H），2.01（s，3H）.
382		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.63 分；m/z =	^{1}H-NMR（400 MHz，クロロホルム-d）δ 8.91（s，1H），8.70（s，1H），8.55（d，J = 4.9 Hz，1H），8.28 - 8.20（m，1H），7.65 - 7.57（m，2H），7.35 - 7.27（m，2H），7.24 - 7.14（m，

	259 (M+H)+.	2H), 6.92 (m, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.41 – 5.33 (m, 1H), 4.39 – 4.29 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.44 – 2.33 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
383	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.59 分; m/z = 443 (M+H)+.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.94 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.49 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.23 (m, 1H), 7.70 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.45 – 7.38 (m, 1H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.23 – 7.16 (m, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.41 – 5.32 (m, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.14 (s, 6H), 2.44 – 2.33 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
387	LC-MS (方法 M14): R_t= 1.40 分; m/z = 469 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.05–2.10 (m, 1H), 2.19–2.24 (m, 1H), 2.44 (s, 3H), 3.09 (s, 6H), 4.23–4.30 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.66 (t, 1H), 7.99 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.73 (s, 1H), 9.17 (d, 1H).
388	LC-MS (方法 M24): R_t= 1.27 分; m/z = 458 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.04–2.08 (m, 1H), 2.16–2.23 (m, 4H), 2.41 (s, 3H), 3.05 (s, 6H), 4.22–4.30 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.17 (t, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.58–7.62 (m, 2H), 7.13–7.17 (m, 1H), 8.56 (s, 1H), 9.09 (d, 1H).
389	LC-MS (方法 M23): R_t= 1.65 分; m/z = 455 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.06–2.09 (m, 1H), 2.20–2.22 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 4.25–4.29 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.96 (t, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.67 (t, 1H), 7.97 (d, 1H), 8.11 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.75 (s, 1H), 9.18 (d, 1H).
390	LC-MS (方法 M23): R_t= 1.67 分; m/z = 464 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.08–2.09 (m, 1H), 2.20–2.23 (m, 1H), 3.07 (s, 6H), 4.25–4.30 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.16–7.21 (m, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.61 (t, 1H), 7.81 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.70 (s, 1H), 9.15 (d, 1H).
391	LC-MS (方法 M14): R_t= 1.01 分; m/z = 444 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.05–2.10 (m, 1H), 2.18–2.24 (m, 1H), 2.49 (s, 3H), 3.05 (s, 6H), 4.25–4.30 (m, 2H), 5.27 (q, 1H), 6.80–6.85 (m, 2H), 6.95 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.66 (d, 1H), 8.05 (d, 1H), 8.15 (d, 1H), 8.67 (s, 1H), 9.14 (d, 1H).
399	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.31 分; m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.02 (s, 1H), 8.29 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.63 – 7.54 (m, 1H), 7.33 (m, 2H), 7.21

	510 (M+H)$^+$.	(t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (m, 4H), 5.38 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.40 – 4.31 (m, 1H), 4.26 – 4.16 (m, 1H), 3.88 – 3.79 (m, 4H), 3.59 – 3.51 (m, 4H), 3.13 (s, 6H), 2.40 (m, 1H), 2.27 – 2.17 (m, 1H).
400	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.86 分; m/z = 489 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.95 (s, 1H), 8.27 – 8.18 (m, 2H), 7.58 (q, J = 4.5 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.78 (s, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.33 (m, 1H), 4.24 – 4.13 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.14 (s, 6H), 2.44 – 2.33 (m, 1H), 2.25 – 2.14 (m, 1H).
401	LC-MS (方法 L9): R_t= 3.59 分; m/z = 455 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.96 (s, 1H), 8.41 – 8.25 (m, 2H), 8.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.59 (m, 3H), 7.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.21 (m, 2H), 6.97 – 6.83 (m, 2H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.25 – 4.16 (m, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.13 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.26 – 2.15 (m, 1H).
402	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.25 分; m/z = 455 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.96 (s, 1H), 8.63 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.60 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.47 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.21 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.42 – 5.33 (m, 1H), 4.83 (s, 2H), 4.39 – 4.30 (m, 1H), 4.25 – 4.15 (m, 1H), 3.14 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.26 – 2.16 (m, 1H), 1.68 (s, 1H).
403	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.89 分; m/z = 461 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.91 (s, 1H), 8.46 (s, 2H), 8.28 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.68 – 7.60 (m, 1H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.24 – 7.12 (m, 2H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.24 – 4.14 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.38 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
413	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.02 分; m/z = 461 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.94 (s, 1H), 8.24 (m, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.65 – 7.57 (m, 1H), 7.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 – 7.17 (m, 1H), 7.12 (s, 3H), 6.94 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.38 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.21 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.46 – 2.34 (m, 1H), 2.22 (m, 1H).
414	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.97 分; m/z = 477 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.91 (s, 1H), 8.32 – 8.22 (m, 2H), 7.70 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.66 – 7.58 (m, 1H), 7.36 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.25 – 7.17 (m, 1H), 7.12 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d,

			J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.20 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
415		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.02 分; m/z = 493 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.88 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.25 (m, 1H), 7.65 – 7.56 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 7.29 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.24 – 7.17 (m, 1H), 7.09 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.16 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
416		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.14 分; m/z = 501 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.98 (s, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.09 – 8.03 (m, 1H), 7.67 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.63 – 7.55 (m, 1H), 7.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 – 7.16 (m, 2H), 6.96 – 6.83 (m, 2H), 6.76 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 5.27 (m, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.13 (s, 6H), 2.38 (m, 1H), 2.20 (m, 1H), 1.37 (d, J = 6.2 Hz, 6H).
429		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.017 分; m/z = 508/510/512 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.23 (s, 1H), 9.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.69 – 7.55 (m, 3H), 7.49 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.29 – 4.15 (m, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.29 – 2.12 (m, 1H), 2.10 – 1.96 (m, 1H).
433		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.189 分; m/z = 560 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 8.29 – 8.21 (m, 1H), 7.95 – 7.87 (m, 1H), 7.66 – 7.58 (m, 2H), 7.52 – 7.43 (m, 1H), 7.33 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.27 – 7.19 (m, 1H), 7.15 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.27 – 5.17 (m, 1H), 4.32 – 4.16 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.24 – 2.12 (m, 1H), 2.08 – 1.96 (m, 1H).
434		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.894 分; m/z = 510 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 8.29 – 8.21 (m, 1H), 7.95 – 7.87 (m, 1H), 7.66 – 7.58 (m, 2H), 7.52 – 7.43 (m, 1H), 7.33 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.27 – 7.19 (m, 1H), 7.15 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.27 – 5.17 (m, 1H), 4.32 – 4.16 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.24 – 2.12 (m, 1H), 2.08 – 1.96 (m, 1H).
435		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.808 分; m/z = 483/485 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.32 – 8.23 (m, 1H), 7.96 – 7.84 (m, 2H), 7.80 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.71 – 7.62 (m, 2H), 7.34 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.91 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.29 – 5.17 (m, 1H), 4.33

			− 4.17 (m, 2H), 3.08 (s, 6H), 2.25 − 2.13 (m, 1H), 2.10 − 1.95 (m, 1H).
436		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.711 分; m/z = 456 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.4, 1.4 Hz, 1H), 7.66 − 7.60 (m, 1H), 7.59 − 7.53 (m, 1H), 7.37 − 7.26 (m, 2H), 7.20 − 7.07 (m, 2H), 6.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.5, 1.0 Hz, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.28 − 5.19 (m, 1H), 4.32 − 4.18 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 − 2.13 (m, 1H), 2.11 − 1.97 (m, 1H), 1.90 (s, 3H).
437		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.763 分; m/z = 456 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.0, 2.0 Hz, 1H), 7.69 − 7.59 (m, 2H), 7.35 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.28 − 7.07 (m, 4H), 6.91 (t, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 5.29 − 5.20 (m, 1H), 4.33 − 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.34 (s, 3H), 2.26 − 2.13 (m, 1H), 2.11 − 1.99 (m, 1H).
441		LC-MS (方法 M22): R_t= 1.67 分; m/z = 540 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.03−2.09 (m, 1H), 2.20−2.25 (m, 1H), 3.27−3.29 (m, 4H), 3.86−3.88 (m, 4H), 4.21−4.29 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.70 (t, 1H), 7.79 (d, 1H), 8.28 (d, 1H), 8.67 (s, 1H), 9.19 (d, 1H).
442		LC-MS (方法 M22): R_t= 1.46 分; m/z = 506 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.07−2.08 (m, 1H), 2.21−2.23 (m, 1H), 3.29−3.31 (m, 4H), 3.87−3.88 (m, 4H), 4.22−4.31 (m, 2H), 5.27 (q, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.93 (t, 1H), 7.17−7.20 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.71 (t, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.67 (s, 1H), 9.21 (d, 1H).
443		LC-MS (方法 M22): R_t= 1.84 分; m/z = 506 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.07−2.12 (m, 1H), 2.21−2.26 (m, 1H), 3.28−3.30 (m, 4H), 3.87−3.90 (m, 4H), 4.23−4.31 (m, 2H), 5.28 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.96 (t, 1H), 7.17−7.21 (m, 2H), 7.42 (d, 1H), 7.67 (t, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.37 (d, 1H), 8.77 (s, 1H), 9.24 (d, 1H).
456		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.76 分, m/z = 445 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.14 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.28 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.65 − 7.57 (m, 1H), 7.39 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.22 − 7.15 (m, 1H), 6.95 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.30 − 5.22 (m, 1H), 4.34 − 4.21 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.68 (s, 3H), 2.27 − 2.16 (m, 1H), 2.12 − 2.01 (m, 1H).
457		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.33 分; m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.05 (s, 1H), 8.03 (m, 2H), 7.58 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.53 (m, 1H), 7.39 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.26 − 7.17

	464 $(M+H)^+$;Cl パターン	(m, 2H), 6.95 (m, 1H), 6.88 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.38 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.41 – 4.31 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.11 (s, 6H), 2.45 – 2.34 (m, 1H), 2.23 (m, 1H).
458	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.82 分; m/z = 498 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.02 (s, 1H), 8.14 – 8.04 (m, 2H), 7.66 – 7.59 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.48 – 7.41 (m, 1H), 7.32 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 – 7.17 (m, 2H), 6.95 (m, 1H), 6.91 – 6.84 (m, 1H), 5.42 – 5.33 (m, 1H), 4.41 – 4.32 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.46 – 2.34 (m, 1H), 2.28 – 2.16 (m, 1H); contains 2.6% (w/w) EtOAc 及び0.2% (w/w) DIP.
459	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.26 分; m/z = 448 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.04 (s, 1H), 8.00 (m, 2H), 7.56 – 7.49 (m, 1H), 7.46 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.36 – 7.29 (m, 2H), 7.25 – 7.17 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.88 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.52 (m, 1H), 5.38 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.41 – 4.31 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.45 – 2.34 (m, 1H), 2.28 – 2.17 (m, 1H).
460	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.96 分; m/z = 493 $(M+H)^+$; 2*Cl パターン	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.86 (s, 1H), 8.65 – 8.59 (m, 2H), 8.27 (m, 1H), 7.64 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24 – 7.17 (m, 1H), 7.06 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.86 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.38 – 4.30 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.17 (s, 6H), 2.44 – 2.33 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
461	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.774 分; m/z = 602 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (t, 1H), 8.57 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.35 – 8.28 (m, 1H), 8.15 – 8.08 (m, 1H), 8.06 – 8.00 (m, 1H), 7.74 – 7.65 (m, 3H), 7.35 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.27 – 5.19 (m, 1H), 4.31 – 4.17 (m, 2H), 3.94 – 3.85 (m, 4H), 3.37 – 3.22 (m, 4H; 水シグナルと一致), 2.26 – 2.15 (m, 1H), 2.09 – 1.97 (m, 1H).
462	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.556 分; m/z = 534/536/538 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.33 – 8.25 (m, 1H), 7.73 – 7.66 (m, 2H), 7.62 – 7.56 (m, 1H), 7.52 (dd, J = 8.6, 2.5 Hz, 1H), 7.44 (bs, 1H), 7.37 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.92 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 – 5.20 (m, 1H), 4.33 – 4.19 (m, 2H), 3.94 – 3.81 (m, 4H), 3.36 – 3.22 (m, 4H; 水シグナルと一致), 2.27 – 2.15 (m, 1H), 2.11 – 1.99 (m, 1H).
463	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.464 分; m/z = 552 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.57 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.29 (dd, J = 7.8, 2.1 Hz, 1H), 7.92 (dt, J = 9.2, 4.9 Hz, 1H), 7.71 – 7.62 (m, 2H), 7.49 (td, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 7.1, 2.8 Hz, 1H), 7.24 (ddd, J = 17.1, 9.3, 2.5 Hz, 1H), 7.18 – 7.11 (m, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H),

			5.28 - 5.20 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.94 - 3.82 (m, 4H), 3.37 - 3.21 (m, 4H; 水シグナルと一致), 2.28 - 2.15 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).
464		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.359 分; m/z = 525/527 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.35 - 8.28 (m, 1H), 7.93 (dd, J = 8.3, 2.0 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.80 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.91 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.94 - 3.85 (m, 4H), 3.37 - 3.22 (m, 4H; 水シグナルと一致), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 1.99 (m, 1H).
465		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.263 分; m/z = 514/516 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.26 (dd, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.72 - 7.64 (m, 1H), 7.64 - 7.59 (m, 1H), 7.41 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 7.21 - 7.11 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.30 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.93 - 3.80 (m, 4H), 3.36 - 3.21 (m, 4H; 水シグナルと一致), 2.33 (s, 3H), 2.27 - 2.15 (m, 1H), 2.10 - 1.99 (m, 1H).
466		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.112 分; m/z = 498 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.26 (dd, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.72 - 7.64 (m, 1H), 7.64 - 7.57 (m, 1H), 7.36 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.31 (dd, J = 8.3, 6.2 Hz, 1H), 7.20 - 7.09 (m, 2H), 6.97 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 6.91 (t, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.93 - 3.82 (m, 4H), 3.36 - 3.22 (m, 4H; 水ピークと一致), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 2.00 (m, 1H), 1.89 (s, 3H).
467		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.239 分; m/z = 498 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.27 (dd, J = 7.4, 2.6 Hz, 1H), 7.74 - 7.65 (m, 2H), 7.37 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.28 - 7.22 (m, 1H), 7.22 - 7.10 (m, 3H), 6.92 (t, J = 7.5, 1.0 Hz, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.30 - 5.22 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.93 - 3.84 (m, 4H), 3.36 - 3.22 (m, 6H; 水シグナルと一致), 2.34 (s, 3H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.11 - 2.01 (m, 1H).
468		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.043 分; m/z = 494 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.15 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.23 (dd, J = 8.5, 1.2 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.3, 7.1 Hz, 1H), 7.56 (dd, J = 7.0, 1.2 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 2H), 7.12 - 7.05 (m, 1H), 6.98 - 6.87 (m, 2H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.31 - 5.20 (m, 1H), 4.34 - 4.18 (m, 2H), 3.87 (s, 4H),

			3.36 - 3.22 (m, 4H; 水シグナルと一致), 2.29 (s, 3H), 2.26 - 2.15 (m, 1H), 2.11 - 1.99 (m, 1H), 1.87 (d, J = 6.7 Hz, 3H).
469		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.944 分; m/z = 492/494/496 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.30 - 8.20 (m, 1H), 7.65 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.43 (bs, 1H), 7.34 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.91 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.27 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.26 - 2.13 (m, 1H), 2.10 - 1.96 (m, 1H).
470		LC-MS (方法 L9): R_t= 2.815 分; m/z = 472/474 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.67 - 7.55 (m, 2H), 7.40 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.33 (s, 3H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.97 (m, 1H).
471		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.770 分; m/z = 452 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.19 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.61 (t, 1H), 7.52 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 2H), 7.09 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.98 - 6.86 (m, 2H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 - 5.18 (m, 1H), 4.32 - 4.17 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.29 (s, 3H), 2.25 - 2.13 (m, 1H), 2.09 - 1.97 (m, 1H), 1.88 (d, J = 7.0 Hz, 3H).
472		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.75 分; m/z = 485 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.03 (s, 1H), 8.15 (m, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 6.93 (m, 1H), 6.87 (m, 1H), 6.55 (s, 2H), 5.38 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.20 (m, 1H), 3.96 (s, 6H), 3.12 (s, 6H), 2.45 - 2.34 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
473		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.76 分; m/z = 473 $(M+H)^+$; Cl パターン	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.97 (s, 1H), 8.20 (m, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.31 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.16 (m, 2H), 6.94 (m, 1H), 6.90 - 6.84 (m, 1H), 5.38 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.40 - 4.31 (m, 1H), 4.21 (m, 1H), 3.14 (s, 6H), 2.61 (s, 3H), 2.46 - 2.34 (m, 1H), 2.22 (m, 1H).
474		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.54 分; m/z = 485 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.00 (s, 1H), 8.17 (m, 1H), 7.96 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.42 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.24 - 7.16 (m, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.89 - 6.83 (m, 2H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.13 (s, 6H), 2.45 - 2.33

			(m, 1H), 2.21 (m, 1H).
475		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.76 分; m/z = 489 $(M+H)^+$;Cl パターン	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.94 (s, 1H), 8.25 - 8.18 (m, 1H), 8.13 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.64 - 7.56 (m, 2H), 7.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 - 7.15 (m, 2H), 6.95 - 6.89 (m, 2H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 4.08 (s, 3H), 3.14 (s, 6H), 2.44 - 2.32 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
476		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.91 分; m/z = 493 $(M+H)^+$;2*Cl パターン	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.88 (s, 1H), 8.36 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.25 (m, 1H), 7.65 - 7.56 (m, 2H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.23 - 7.16 (m, 1H), 7.10 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.89 - 6.83 (m, 1H), 5.37 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.38 - 4.30 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.16 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
480		LC-MS (方法 M22): R_t= 1.26 分; m/z = 500 $(M+H)^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.05-2.06 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 2.19-2.21 (m, 1H), 2.42 (s, 3H), 3.26-3.30 (m, 4H), 3.85-3.88 (m, 4H), 4.24-4.28 (m, 2H), 5.25 (q, 1H), 6.72 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.62-7.65 (m, 2H), 8.20 (d, 1H), 8.63 (s, 1H), 9.16 (d, 1H).
491		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.75 分; m/z = 536 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.82 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.29 (m, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.44 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.28 (s, 2H), 7.24 (m, 2H), 6.50 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.72 (m, 1H), 3.94 (t, J = 3.9 Hz, 4H), 3.43 (m, 4H), 3.10 - 2.90 (m, 2H), 2.74 (m, 1H), 1.96 (m, 1H).
492		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.87 分; m/z = 550 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.83 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 8.29 (m, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.44 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 7.25 - 7.08 (m, 4H), 6.65 - 6.54 (m, 1H), 5.45 - 5.36 (m, 1H), 4.12 (q, J = 7.2 Hz, OH), 3.92 (m, 4H), 3.43 (m, 4H), 2.89 - 2.74 (m, 2H), 2.24 - 2.11 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H), 1.97 - 1.77 (m, 2H).
496		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.93 分, m/z = 564/566 $(M+H)^+$; Cl2 パターン.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.90 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 7.55 - 7.47 (m, 2H), 7.36 (dd, J = 21.1, 7.6 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 7.24 - 7.18 (m, 2H), 6.99 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.39 (q, J = 5.5 Hz, 1H), 4.39 - 4.30 (m, 1H), 4.24 - 4.16 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.76 (d, J = 4.1 Hz, 4H), 3.36 (d, J = 4.3 Hz, 4H), 2.49 - 2.32 (m, 1H), 2.28 - 2.16 (m, 1H).
497		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.92 分, m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.93 (s, 1H), 7.60 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.42 - 7.35 (m, 2H), 7.35 - 7.28 (m, 2H), 7.21 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 7.10 (t, J = 8.9 Hz, 1H),

	548 (M+H)$^+$; Cl パターン.	6.99 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.39 (q, J = 5.2 Hz, 1H), 4.39 – 4.31 (m, 1H), 4.25 – 4.15 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.76 (d, J = 11.3, 6.7, 5.6 Hz, 4H), 3.34 (t, J = 4.3 Hz, 4H), 2.47 – 2.34 (m, 1H), 2.27 – 2.15 (m, 1H).
498	LC-MS (方法 L2): R_t = 3.98 分; m/z = 564/566 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.56 (s, 1H), 7.65 (d, J = 2.3 Hz, 3H), 7.53 (dd, J = 13.3, 2.7 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.34 – 4.20 (m, 2H), 3.98 (s, 3H), 3.88 (t, J = 4.0 Hz, 4H), 3.31 – 3.20 (m, 4H), 2.28 – 2.16 (m, 1H), 2.12 – 2.01 (m, 1H).
499	LC-MS (方法 L2): R_t = 3.61 分; m/z = 564/566 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 – 9.11 (m, 1H), 8.45 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.73 – 7.67 (m, 1H), 7.53 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.47 – 7.40 (m, 1H), 7.35 (d, J = 7.1 Hz, 3H), 7.16 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 4.25 (dt, J = 7.8, 4.6 Hz, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.88 (s, 4H), 3.30 – 3.19 (m, 4H), 2.26 – 2.15 (m, 1H), 2.09 – 2.00 (m, 1H).
500	LC-MS (方法 L2): R_t = 3.65 分; m/z = 548/550 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.49 (s, 1H), 7.58 – 7.49 (m, 3H), 7.45 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.39 – 7.31 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.33 – 4.19 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.88 (t, J = 4.2 Hz, 4H), 3.31 – 3.21 (m, 4H), 2.29 – 2.15 (m, 1H), 2.11 – 2.00 (m, 1H).
501	LC-MS (方法 L2): R_t = 3.42 分; m/z = 522/524 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.11 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 7.64 (s, 3H), 7.52 – 7.46 (m, 2H), 7.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.34 – 4.20 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.03 (s, 6H), 2.26 – 2.15 (m, 1H), 2.09 – 2.01 (m, 1H).
502	LC-MS (方法 L2): R_t = 3.09 分; m/z = 522/524 (M+H)$^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.09 (dd, J = 8.0, 5.0 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.69 (dd, J = 8.0, 1.4 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.47 – 7.40 (m, 1H), 7.32 (dd, J = 11.9, 5.4 Hz, 3H), 7.16 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 4.31 – 4.19 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.04 (s, 6H), 2.25 – 2.13 (m, 1H), 2.06 (d, J = 15.1 Hz, 1H).
503	LC-MS (方法 2):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.56 – 7.48 (m,

	R_t= 3.15分; m/z = 506 $(M+H)^+$.	3H), 7.42 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.34 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 7.20 – 7.12 (m, 1H), 6.91 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.31 – 4.19 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.04 (s, 6H), 2.25 – 2.14 (m, 1H), 2.09 – 1.98 (m, 1H).
504	LC-MS (方法 L9): R_t= 4.28分, m/z = 522/524 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.15 (s, 1H), 8.20 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.37 – 7.29 (m, 2H), 7.21 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 26.6, 8.1 Hz, 3H), 5.40 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.40 – 4.31 (m, 1H), 4.26 – 4.16 (m, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.89 (s, 6H), 2.44 – 2.33 (m, 1H), 2.27 – 2.16 (m, 1H).
505	LC-MS (方法 L9): R_t= 4.00分, m/z = 522/524 (Cl2パターン; $(M+H)^+$)	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.14 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 8.33 (dd, J = 21.9, 7.3 Hz, 1H), 7.55 – 7.47 (m, 2H), 7.34 – 7.27 (m, 2H), 7.21 (dd, J = 16.7, 8.0 Hz, 2H), 7.01 – 6.77 (m, 3H), 5.44 – 5.32 (m, 1H), 4.38 – 4.30 (m, 1H), 4.25 – 4.16 (m, 1H), 4.05 (s, 3H), 2.89 (s, 6H), 2.37 (td, J = 9.7, 4.7 Hz, 1H), 2.27 – 2.15 (m, 1H).
506	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.74分, m/z = 506/508 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 9.17 (s, 1H), 8.33 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 6.2, 2.6 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 8.5, 4.4 Hz, 2H), 7.24 – 7.16 (m, 1H), 7.10 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 7.01 – 6.84 (m, 3H), 5.39 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.39 – 4.30 (m, 1H), 4.25 – 4.16 (m, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.88 (s, 6H), 2.43 – 2.32 (m, 1H), 2.26 – 2.16 (m, 1H).
507	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.29分, m/z = 526/528.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.67 (s, 1H), 7.57 – 7.49 (m, 2H), 7.45 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.38 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 15.4, 1.7 Hz, 1H), 6.98 – 6.90 (m, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.24 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 5.38 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.40 – 4.31 (m, 1H), 4.25 – 4.15 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 2.46 – 2.34 (m, 1H), 2.27 – 2.16 (m, 1H).
508	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.06分, m/z = 526/528.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.64 (s, 1H), 7.57 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 7.24 – 7.16 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.31 – 6.15 (m, 1H), 5.41 – 5.30 (m, 1H), 4.39 – 4.26 (m, 1H), 4.18 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.06 (s, 6H), 2.44 – 2.33 (m, 1H), 2.25 – 2.14 (m, 1H).
509	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.07分, m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.66 (s, 1H), 7.59 – 7.49 (m, 2H), 7.41 – 7.31 (m, 2H), 7.29 (dd, J = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.24 – 7.16 (m, 1H), 7.11 (t, J = 8.9 Hz, 1H),

	510/512 (Cl2 パターン, $M+H)^+$.	6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.85 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.23 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 4.39 - 4.30 (m, 1H), 4.23 - 4.14 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.25 - 2.15 (m, 1H).
510	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.828 分; m/z = 560/562/564 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.23 - 9.11 (m, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.50 - 7.43 (m, 1H), 7.43 - 7.31 (m, 2H), 7.16 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.17 (m, 2H), 3.11 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.97 (m, 1H).
511	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.897 分; m/z = 544/546 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.62 - 7.53 (m, 2H), 7.41 - 7.32 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.33 - 4.17 (m, 2H), 3.11 (s, 6H), 2.26 - 2.14 (m, 1H), 2.11 - 1.98 (m, 1H).
512	LC-MS (方法 L2): R_t= 4.340 分; m/z = 602/604/606 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.70 (s, 3H), 7.40 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.35 - 4.17 (m, 2H), 3.95 - 3.83 (m, 4H), 3.37 - 3.25 (m, 4H; 水シグナルと一致, 2.29 - 2.16 (m, 1H), 2.14 - 2.02 (m, 1H).
513	LC-MS (方法 L2): R_t= 4.099 分; m/z = 602/604/606 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 - 9.22 (m, 1H), 8.75 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.74 (dd, J = 8.0, 1.4 Hz, 1H), 7.52 - 7.44 (m, 1H), 7.44 - 7.33 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.30 - 5.19 (m, 1H), 4.34 - 4.17 (m, 2H), 3.96 - 3.82 (m, 4H), 3.40 - 3.23 (m, 4H; 水シグナルと一致), 2.29 - 2.15 (m, 1H), 2.12 - 1.97 (m, 1H).
514		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.78 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.65 - 7.54 (m, 2H), 7.44 - 7.33 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 4.34 - 4.16 (m, 2H), 3.95 - 3.82 (m, 4H), 3.39 - 3.23 (m, 4H; 水シグナルと一致), 2.29 - 2.16 (m, 1H), 2.13 - 2.00 (m, 1H).
517	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.180 分; m/z = 550/552/554 $(M+H)^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.23 (s, 1H), 9.17 - 9.07 (m, 1H), 8.37 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.47 - 7.38 (m, 1H), 7.38 - 7.26 (m, 2H), 7.22 - 7.11 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2

	$^+$.	Hz, 1H), 5.24 (q, 1H), 4.34 – 4.18 (m, 2H), 3.92 – 3.77 (m, 4H), 3.30 – 3.16 (m, 4H), 2.28 – 2.12 (m, 1H), 2.11 – 1.95 (m, 1H).
528	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.588 分; m/z = 491/493 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.91 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.50 – 7.41 (m, 1H), 7.35 – 7.29 (m, 2H), 7.29 – 7.19 (m, 1H), 7.19 – 7.08 (m, 2H), 6.89 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.47 (s, 2H), 5.25 – 5.15 (m, 1H), 4.30 – 4.17 (m, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.21 – 2.10 (m, 1H), 2.06 – 1.93 (m, 1H).
529	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.722 分; m/z = 507/509/511 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.91 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.56 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 1.6 Hz, 2H), 7.19 – 7.07 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 5.20 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.27 – 4.19 (m, 2H), 2.98 (s, 6H), 2.21 – 2.10 (m, 1H), 2.05 – 1.95 (m, 1H).
530	LC-MS (方法 L10) R_t= 1.91 分, m/z = 564 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.93 (s, 1H), 7.59 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.39 – 7.28 (m, 4H), 7.26 – 7.16 (m, 2H), 7.01 – 6.82 (m, 3H), 5.51 – 5.20 (m, 1H), 4.48 – 4.28 (m, 1H), 4.28 – 4.12 (m, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.76 (dt, J = 8.1, 4.7 Hz, 6H), 3.34 (t, J = 4.5 Hz, 6H), 2.55 – 2.33 (m, 1H), 2.33 – 2.14 (m, 1H).
531	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.76 分, m/z = 552/554 (Cl2 パターン, M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.63 (s, 1H), 7.62 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 2H), 7.30 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.23 – 7.17 (m, 1H), 7.15 – 7.07 (m, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 6.20 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.38 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.40 – 4.31 (m, 1H), 4.24 – 4.14 (m, 1H), 4.15 – 3.75 (m, 4H), 3.43 (s, 4H), 2.46 – 2.35 (m, 1H).
532	LC-MS (方法 L2): R_t= 3.74 分, m/z = 568/570 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.61 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.52 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.33 – 7.27 (m, 2H), 7.20 (td, J = 7.6, 1.7 Hz, 2H), 6.96 – 6.82 (m, 2H), 6.20 (t, J = 6.5 Hz, 1H), 5.42 – 5.33 (m, 1H), 4.39 – 4.31 (m, 1H), 4.23 – 4.13 (m, 1H), 3.99 (d, J = 50.2 Hz, 4H), 3.44 (s, 4H), 2.46 – 2.34 (m, 1H), 2.26 – 2.16 (m, 1H).
533	LC-MS (方法 L9): R_t= 4.38 分, m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.65 (s, 1H), 7.60 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.39 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.31 (dd, J =

	568/570 $(M+H)^+$.	7.6, 1.6 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 15.6, 1.7 Hz, 1H), 6.98 – 6.91 (m, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.20 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.39 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.41 – 4.33 (m, 1H), 4.25 – 4.16 (m, 1H), 3.95 (s, 4H), 3.43 (s, 4H), 2.47 – 2.36 (m, 1H), 2.29 – 2.19 (m, 1H).
536	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.60 分; m/z = 533/535 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.99 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.98 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.50 – 7.43 (m, 1H), 7.33 (dt, J = 7.8, 4.6 Hz, 2H), 7.28 – 7.22 (m, 1H), 7.15 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 6.90 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 5.27 – 5.17 (m, 1H), 4.24 (dt, J = 8.6, 4.0 Hz, 2H), 3.83 (s, 4H), 3.28 – 3.15 (m, 4H), 2.24 – 2.12 (m, 1H), 2.06 – 1.95 (m, 1H).
537	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.67 分; m/z = 549/551 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.00 (dd, J = 8.3, 2.3 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.41 (td, J = 7.8, 5.9 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.21 – 7.11 (m, 3H), 6.89 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 5.21 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.25 (t, J = 8.5 Hz, 2H), 3.82 (s, 4H), 3.28 – 3.16 (m, 4H), 2.23 – 2.12 (m, 1H), 2.06 – 1.95 (m, 1H).
538	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.72 分; m/z = 549/551 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.98 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.57 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.18 – 7.11 (m, 2H), 6.95 – 6.87 (m, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.54 (s, 2H), 5.22 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.31 – 4.18 (m, 2H), 3.82 (s, 4H), 3.28 – 3.14 (m, 4H), 2.19 (dq, J = 13.4, 4.8 Hz, 1H), 2.02 (dq, J = 10.4, 3.7, 3.3 Hz, 1H).
551	LC-MS (方法 L2): 2.66 分, ; m/z = 507/509 $(M+1)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.92 (dd, J = 8.4, 2.4 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.47 – 7.37 (m, 1H), 7.30 (dd, J = 7.6, 1.6 Hz, 1H), 7.23 – 7.07 (m, 3H), 6.88 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.31 (d, J = 2.5 Hz, 2H), 5.20 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 4.24 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.23 – 2.10 (m, 1H), 2.06 – 1.92 (m, 1H).
559	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.60 分; m/z = 492 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.37 (s, 1H), 8.98 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.09 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.48 – 7.40 (m, 1H), 7.35 – 7.24 (m, 4H), 7.18 – 7.12 (m, 1H), 6.90 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.21 (dd, J = 7.9, 5.1 Hz, 1H), 4.30 – 4.18 (m, 2H), 3.03 (s, 6H), 2.22 – 2.12 (m, 1H), 2.06 – 1.96 (m, 1H).
560	LC-MS (方法 L2):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.20 (s, 1H), 8.98 (dd, J = 8.3, 2.4 Hz, 1H), 8.37 (s,

	R_t= 2.66 分; m/z = 508/510 $(M+H)^+$.	1H), 8.08 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.41 – 7.27 (m, 3H), 7.23 – 7.11 (m, 2H), 6.89 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.21 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 4.25 (td, J = 9.4, 8.0, 5.5 Hz, 2H), 3.03 (s, 6H), 2.22 – 2.11 (m, 1H), 2.06 – 1.94 (m, 1H).
561	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.74 分; m/z = 508/510 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.33 (s, 1H), 8.98 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.07 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.54 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.37 – 7.28 (m, 4H), 7.19 – 7.13 (m, 1H), 6.91 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.26 – 5.18 (m, 1H), 4.30 – 4.19 (m, 2H), 3.02 (s, 6H), 2.23 – 2.12 (m, 1H), 2.07 – 1.97 (m, 1H).
580	LC-MS (方法 M11): R_t= 1.52 分; m/z = 570 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.04–2.09 (m, 1H), 2.17–2.30 (m, 1H), 3.07 (s, 6H), 4.22–4.32 (m 2H), 5.21–5.26 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.64–7.68 (m, 4H), 7.81 (dd, 1H), 8.25 (dd, 1H), 8.66 (s, 1H), 9.13 (d, 1H).
581	LC-MS (方法 M11): R_t= 1.29 分; m/z = 492 (M+H)+	^{1}H-NMR (300 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 3.06 (s, 6H), 3.87 (dd, 1H), 4.05 (dd, 1H), 4.75 (d, 2H), 5.18–5.21 (m, 1H), 7.09–7.13 (m, 1H), 7.25–7.30 (m, 2H), 7.47–7.50 (m, 1H), 7.62–7.67 (m, 4H), 7.80 (dd, 1H), 8.23 (dd, 1H), 8.62 (s, 1H), 9.11 (d, 1H).
584	LC-MS (方法 L2): R_t= 2.79 分, m/z = 534 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.90 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.21 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.47 – 7.40 (m, 1H), 7.40 – 7.34 (m, 1H), 7.34 – 7.27 (m, 2H), 7.25 – 7.17 (m, 3H), 6.92 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.46 (s, 1H), 5.36 (dd, J = 7.6, 4.4 Hz, 1H), 4.38 – 4.30 (m, 1H), 4.22 – 4.14 (m, 1H), 3.84 (q, J = 5.9 Hz, 4H), 3.40 (q, J = 4.4 Hz, 4H), 2.43 – 2.33 (m, 1H), 2.27 – 2.16 (m, 1H).
609	LC-MS (方法 L10): R_t= 3.98 分; m/z = 602 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (dd, J = 8.1, 2.7 Hz, 1H), 8.68 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.77 (dt, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 7.62 – 7.56 (m, 1H), 7.49 – 7.34 (m, 3H), 7.20 – 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 – 5.10 (m, 1H), 4.32 – 4.18 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.8 Hz, 4H), 3.32 – 3.25 (m, 4H), 2.27 – 2.17 (m, 1H), 2.09 – 2.00 (m, 1H).
610	LC-MS (方法 L10): R_t= 4.00 分; m/z = 618/620 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (dd, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 8.8, 8.0, 1.6 Hz, 2H), 7.48 (td, J = 7.9, 5.1 Hz, 1H), 7.38 – 7.29 (m, 2H), 7.26 – 7.06 (m, 1H), 6.91 (tt, J = 7.5, 1.5 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.31 – 4.19 (m, 2H), 3.98 – 3.77 (m, 4H), 3.32 – 3.23 (m, 4H), 2.26 – 2.16 (m, 1H), 2.08 – 1.99 (m, 1H).

611	LC-MS（方法 L10）：R_t= 4.20 分；m/z = 618/620 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.41 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.84 – 7.66 (m, 2H), 7.39 (dd, J = 19.0, 1.8 Hz, 3H), 7.22 – 7.13 (m, 1H), 6.96 – 6.88 (m, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.32 – 4.19 (m, 2H), 3.98 – 3.71 (m, 4H), 3.32 – 3.22 (m, 4H), 2.27 – 2.17 (m, 1H), 2.10 – 2.01 (m, 1H).
612	LC-MS（方法 L10）：R_t= 3.67 分；m/z = 560 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (dd, J = 8.2, 2.8 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.41 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.71 (dq, J = 9.3, 1.5 Hz, 1H), 7.61 – 7.55 (m, 1H), 7.47 – 7.33 (m, 3H), 7.16 (td, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 6.91 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.22 (dt, J = 8.4, 4.3 Hz, 1H), 4.31 – 4.18 (m, 2H), 3.09 (s, 6H), 2.25 – 2.14 (m, 1H), 2.09 – 1.91 (m, 1H).
613	LC-MS（方法 L10）：R_t= 3.60 分；m/z = 576/578 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.11 (dd, J = 8.2, 3.8 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.40 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.76 – 7.68 (m, 2H), 7.47 (td, J = 7.9, 5.1 Hz, 1H), 7.36 – 7.28 (m, 2H), 7.19 – 7.12 (m, 1H), 6.90 (tt, J = 7.3, 1.5 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.22 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 4.31 – 4.17 (m, 2H), 3.09 (s, 6H), 2.19 (td, J = 9.1, 8.7, 3.9 Hz, 1H), 2.08 – 1.96 (m, 1H).
614	LC-MS（方法 L10）：R_t= 3.82 分；m/z = 576/578 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.38 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.70 (td, J = 4.4, 2.2 Hz, 2H), 7.40 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.35 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.20 – 7.13 (m, 1H), 6.91 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 4.31 – 4.19 (m, 2H), 3.08 (s, 6H), 2.24 – 2.14 (m, 1H), 2.08 – 1.99 (m, 1H).
615	LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.79 分，m/z = 550/552 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.24 (s, 1H), 9.06 (dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.45 – 7.30 (m, 3H), 7.24 – 7.11 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.22 (q, J = 6.3 Hz, 1H), 4.30 – 4.19 (m, 2H), 3.85 (q, J = 4.8, 3.8 Hz, 4H), 3.30 – 3.18 (m, 4H), 2.24 – 2.13 (m, 1H), 2.09 – 1.96 (m, 1H).
616	LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.92 分，m/z = 550/552 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.36 (s, 1H), 9.06 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.13 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.41 – 7.30 (m, 4H), 6.92 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.32 – 4.19 (m, 2H), 4.04 (s, 1H), 3.90 – 3.79 (m, 4H), 3.24 (q, J = 5.3 Hz, 4H), 2.22 – 2.14 (m,

			1H), 2.09 – 1.98 (m, 1H).
617		LC-MS (方法 L9): R_t= 4.03 分; m/z = 517/519 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.77 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.58 (s, 2H), 7.35 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 4.31 – 4.19 (m, 2H), 3.08 (s, 6H), 2.25 – 2.14 (m, 1H), 2.09 – 1.98 (m, 1H).
618		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.818 分; m/z = 492/494/496 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.18 (s, 1H), 9.06 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.55 – 7.44 (m, 3H), 7.38 – 7.29 (m, 2H), 7.25 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.31 – 4.17 (m, 2H), 3.00 (s, 6H), 2.26 – 2.13 (m, 1H), 2.09 – 1.95 (m, 1H).
619		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.836 分; m/z = 508/510/512 (M+H)$^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.16 (s, 1H), 9.10 – 9.00 (m, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.48 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.47 – 7.36 (m, 1H), 7.36 – 7.27 (m, 2H), 7.20 – 7.10 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 – 5.16 (m, 1H), 4.31 – 4.15 (m, 2H), 3.00 (s, 6H), 2.17 (dd, J = 8.6, 4.2 Hz, 1H), 2.01 (d, J = 13.7 Hz, 1H).
620		LC-MS (方法 M24): R_t= 1.34 分; m/z = 510 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, CD_3OD-d4): δ [ppm] = 2.22-2.25 (m, 1H), 2.31-2.35 (m, 1H), 3.18 (s, 6H), 4.29-4.34 (m, 1H), 4.38-4.43 (m, 1H), 5.36 (t, 1H), 6.86-6.92 (m, 1H), 6.98-7.03 (m, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.63 (dd, 1H), 7.71 (dd, 1H), 8.28 (dd, 1H), 8.55 (s, 1H).
621		LC-MS (方法 M47): R_t= 2.86 分; m/z = 560 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, CD_3OD-d4): δ [ppm] = 2.20-2.26 (m, 1H), 2.29-2.35 (m, 1H), 3.19 (s, 6H), 4.33-4.39 (m, 1H), 4.43-4.48 (m, 1H), 5.35 (t, 1H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.47 (t, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.63 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 8.29 (dd, 1H), 8.56 (s, 1H).
622		LC-MS (方法 M24): R_t= 1.43 分; m/z = 526 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, CD_3OD-d4): δ [ppm] = 2.16-2.21 (m, 1H), 2.27-2.32 (m, 1H,), 3.19 (s, 6H), 4.23-4.34 (m, 2H), 5.32 (t, 1H), 6.80 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.63 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 8.29 (dd, 1H), 8.56 (1 H, s).
623		LC-MS (方法 M47): R_t= 2.86 分; m/z = 510 (M+H)+	^{1}H-NMR (300 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 1.99-2.05 (1 H, m), 2.18-2.21 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 4.19-4.27 (m, 2H), 5.19-5.24 (m, 1H), 6.84 (dd, 1H), 7.00-7.07 (m, 1H), 7.17-7.22 (dd, 1H), 7.64-7.68 (m, 4H), 7.81 (dd, 1H), 8.24 (dd, 1H), 8.68 (s, 1H), 9.13 (d, 1H).

626	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.240 分；m/z = 534/536/538 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.25 (s, 1H), 9.12 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.58 – 7.49 (m, 2H), 7.47 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 7.40 – 7.29 (m, 2H), 7.27 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.92 (t, J = 7.5, 1.0 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.26 (q, 1H), 4.33 – 4.18 (m, 2H), 3.93 – 3.77 (m, 4H), 3.30 – 3.15 (m, 4H), 2.28 – 2.14 (m, 1H), 2.12 – 1.97 (m, 1H).
627	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.529 分；m/z = 550/552/554 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.41 (s, 1H), 9.12 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.63 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.52 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.93 (t, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (q, 1H), 4.33 – 4.18 (m, 2H), 3.89 – 3.74 (m, 4H), 3.27 – 3.13 (m, 4H), 2.29 – 2.12 (m, 1H), 2.12 – 1.98 (m, 1H).
632	LC-MS（方法 M30）：R_t= 1.65 分；m/z = 526 (M+H)+	^{1}H-NMR (300 MHz, DMSO-d6) : δ [ppm] = 2.07–2.11 (m, 1H), 2.23–2.27 (m, 1 H), 3.06 (s, 6H), 4.31–4.45 (m, 2H), 5.28 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.35 (t, 2H), 7.63–7.67 (m, 4H), 7.81 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.64 (s, 1H), 9.12 (d, 1H).
633	LC-MS（方法 M14）：R_t= 1.43 分；m/z = 570 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) : δ [ppm] = 2.06–2.10 (m, 1H), 2.20–2.24 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 4.31–4.44 (m, 2H), 5.26–5.31 (m, 1H), 6.88 (t, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.63–7.67 (m, 4H), 7.80 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.64 (s, 1H), 9.13 (d, 1H).
634	LC-MS（方法 M14）：R_t= 1.43 分；m/z = 570 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) : δ [ppm] = 2.06–2.10 (m, 1H), 2.20–2.24 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 4.31–4.44 (m, 2H), 5.26–5.31 (m, 1H), 6.88 (t, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.63–7.67 (m, 4H), 7.80 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.64 (s, 1H), 9.13 (d, 1H).
642	LC-MS（方法 L9）：R_t= 3.75 分；m/z = 543/545 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.24 (dd, J = 8.1, 2.0 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.69 – 7.60 (m, 2H), 7.46 (td, J = 9.3, 7.0 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 7.6, 1.6 Hz, 1H), 7.20 – 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.24 (dq, J = 10.3, 5.4 Hz, 1H), 4.31 – 4.18 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.5 Hz, 4H), 3.29 (d, J = 4.8 Hz, 4H), 2.28 – 2.15 (m, 1H), 2.05 (s, 1H).
651	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.79 分，m/z = 534 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.80 (s, 1H), 8.11 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.45 – 7.37 (m, 2H), 7.31 (dd, J = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 7.24 – 7.18 (m, 1H), 7.15 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 6.97 – 6.91 (m, 1H), 6.87 (dd, J = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 6.21 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.45 – 5.38 (m, 1H), 4.49 (s, 2H), 4.41 – 4.33 (m,

			1H), 4.24 – 4.15 (m, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.17 (s, 2H), 2.51 – 2.37 (m, 1H), 2.30 – 2.22 (m, 1H).
652		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.88 分; m/z = 559/661 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.76 (s, 1H), 8.39 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.78 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.37 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.20 – 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 5.28 – 5.21 (m, 1H), 4.32 – 4.18 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.8 Hz, 4H), 3.31 – 3.24 (m, 4H), 2.26 – 2.18 (m, 1H), 2.09 – 2.01 (m, 1H).
656		LC-MS (方法 L2): R_t= 2.697 分; m/z = 448/450 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 13.31 (s, 1H), 9.19 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.51 (dd, J = 7.4, 1.4 Hz, 1H), 8.17 (dd, J = 8.5, 1.5 Hz, 1H), 7.65 (t, J = 8.4, 7.4 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.19 (ddd, J = 8.7, 7.4, 1.7 Hz, 1H), 6.95 (t, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.28 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.34 – 4.19 (m, 2H), 3.09 (s, 6H), 2.28 – 2.16 (m, 1H), 2.12 – 2.00 (m, 1H).
657		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.83 分, m/z = 559/561 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.77 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.36 – 7.27 (m, 2H), 7.24 – 7.17 (m, 2H), 6.93 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.1 Hz, 1H), 6.21 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 5.41 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 4.50 (s, 2H), 4.40 – 4.32 (m, 1H), 4.24 – 4.14 (m, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.69 (s, 2H), 3.31 – 3.03 (m, 2H), 2.42 (dd, J = 12.0, 6.7 Hz, 1H), 2.31 – 2.18 (m, 1H).
658		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.86 分, m/z = 501 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.83 (s, 1H), 8.10 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.47 – 7.39 (m, 2H), 7.31 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.26 – 7.21 (m, 1H), 7.20 – 7.13 (m, 1H), 6.99 – 6.92 (m, 1H), 6.89 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.23 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 5.41 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.38 (dq, J = 10.3, 3.3 Hz, 1H), 4.26 – 4.18 (m, 1H), 3.08 (s, 6H), 2.48 – 2.38 (m, 1H), 2.30 – 2.21 (m, 1H).
659		LC-MS (方法 L2): R_t= 3.89 分, m/z = 517/519 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ 8.78 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.36 – 7.29 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.24 – 7.17 (m, 2H), 6.96 – 6.89 (m, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.1 Hz, 1H), 6.21 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 5.38 (s, 1H), 4.39 – 4.31 (m, 1H), 4.23 – 4.14 (m, 1H), 3.07 (s, 6H), 2.47 – 2.35 (m, 1H), 2.26 – 2.16 (m, 1H).

660		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.65 分；m/z = 491 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.87 (s, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 7.84 – 7.73 (m, 2H), 7.70 – 7.57 (m, 1H), 7.35 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.30 – 7.23 (m, 1H), 7.19 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.31 – 5.11 (m, 4H), 4.84 – 4.70 (m, 2H), 4.34 – 4.21 (m, 2H), 2.25 – 2.15 (m, 1H), 2.08 – 2.01 (m, 1H).
662		LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.91 分；m/z = 561 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.29 (dd, J = 8.3, 1.7 Hz, 1H), 7.96 – 7.87 (m, 2H), 7.68 – 7.60 (m, 1H), 7.48 – 7.43 (m, 1H), 7.31 – 7.25 (m, 1H), 7.21 – 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.27 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.34 – 4.19 (m, 2H), 2.23 (dp, J = 13.4, 4.3 Hz, 1H), 2.16 – 2.06 (m, 1H).
663		LC-MS（方法 L2）：R_t= 4.04 分，m/z = 559/561 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.28 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.72 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.45 – 7.38 (m, 1H), 7.22 – 7.15 (m, 1H), 6.94 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.84 – 6.78 (m, 1H), 5.28 (q, J = 6.1 Hz, 1H), 4.34 – 4.17 (m, 4H), 3.78 (d, J = 10.9 Hz, 2H), 3.52 (s, 2H), 3.09 (s, 2H), 2.29 – 2.20 (m, 1H), 2.14 – 2.05 (m, 1H).
664		LC-MS（方法 L2）：R_t= 4.11 分，m/z = 517/519 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.26 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.72 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.22 – 7.15 (m, 1H), 6.93 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.31 – 4.22 (m, 2H), 2.91 (s, 6H), 2.27 – 2.15 (m, 1H), 2.14 – 2.01 (m, 1H).
665		LC-MS（方法 M29）：R_t= 2.82 分；m/z = 510 (M+H)+	^{1}H-NMR (300 MHz, DMSO-d6)：δ [ppm] = 3.05 (s, 6H), 3.88 (dd, 1H), 4.04 (dd, 1H), 4.79 (d, 2H), 5.19-5.22 (m, 1H), 7.11-7.17 (m, 1H), 7.36 (dd, 2H), 7.62-7.67 (m, 4H), 7.80 (dd, 1H), 8.23 (dd, 1H), 8.63 (s, 1H), 9.14 (d, 1H).
677		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.83 分；m/z = 504 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (dd, J = 8.3, 4.4 Hz, 1H), 8.80 – 8.67 (m, 2H), 7.83 (dd, J = 7.1, 1.2 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 7.61 (dtd, J = 11.0, 5.9, 3.0 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 7.7, 2.1 Hz, 1H), 7.22 (dp, J = 7.8, 2.4 Hz, 1H), 7.19 – 7.14 (m, 1H), 6.92 (dd, J = 8.0, 6.8 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.29 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 4.26 (td, J = 7.4, 7.0, 3.3 Hz, 2H), 3.99 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.31 – 3.22 (m, 4H), 3.02 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.26 – 2.10 (m, 3H), 2.09 – 2.00 (m,

			1H).
678		LC-MS（方法 L11）：R_t= 3.80 min 及び 3.84 分；m/z = 505 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 - 9.14 (m, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.53 - 8.19 (m, 1H), 7.97 - 7.71 (m, 2H), 7.61 (qd, J = 8.8, 3.3 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.20 (dt, J = 27.0, 6.7 Hz, 2H), 6.93 (tt, J = 7.5, 1.4 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.30 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 4.34 (p, J = 8.8, 8.2 Hz, 1H), 4.27 - 4.13 (m, 3H), 4.02 (dt, J = 29.8, 9.3 Hz, 1H), 3.87 - 3.56 (m, 1H), 3.25 - 3.15 (m, 1H), 2.44 - 2.36 (m, 1H), 2.32 - 2.18 (m, 2H), 2.10 - 2.01 (m, 1H).
679		LC-MS（方法 L2）：R_t= 2.83 分；m/z = 532 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.14 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.53 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.80 (dt, J = 15.6, 7.2 Hz, 2H), 7.61 (dq, J = 12.7, 8.0, 6.9 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 - 7.13 (m, 2H), 6.93 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.31 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 4.31 - 4.19 (m, 2H), 2.94 (t, J = 11.7 Hz, 2H), 2.44 (d, J = 13.3 Hz, 3H), 2.25 (s, 4H), 2.00 (dt, J = 23.1, 11.4 Hz, 3H), 1.77 (dd, J = 22.3, 12.8 Hz, 2H).
680		LC-MS（方法 L9）：R_t= 3.973 分；m/z = 550/552 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 13.95 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 9.35 (dd, J = 8.2, 2.8 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.44 - 7.34 (m, 2H), 7.30 (t, J = 7.4, 1.5 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.96 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.25 (q, 1H), 4.35 - 4.15 (m, 2H), 3.85 (bs, 4H), 3.32 (bs, 4H; 水シグナルと一致), 2.30 - 2.15 (m, 1H), 2.13 - 1.99 (m, 1H).
681		LC-MS（方法 L2）：R_t= 4.067 分；m/z = 550/552 $(M+H)^+$.	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 14.16 (s, 1H), 9.36 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.79 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.61 - 7.54 (m, 3H), 7.41 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.22 - 7.14 (m, 1H), 6.99 - 6.90 (m, 2H), 6.81 (dd, J = 8.2, 1.4 Hz, 1H), 5.28 (q, J = 6.3 Hz, 1H), 4.35 - 4.18 (m, 2H), 3.85 (bs, 4H), 3.32 (bs, 4H; 水ピークと一致), 2.29 - 2.17 (m, 1H), 2.14 - 2.02 (m, 1H).
682		LC-MS（方法 L9）：R_t= 4.036 分；m/z = 508/510 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 14.15 (s, 1H), 9.30 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.44 - 7.33 (m, 2H), 7.33 - 7.26 (m, 1H), 7.17 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 7.9, 2.9 Hz, 2H), 6.79 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.31 - 4.20 (m, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.23 - 2.15 (m, 1H), 2.09 - 1.99 (m, 1H).

683	LC-MS（方法 L2）：R_t= 3.335 分；m/z = 508/510 $(M+H)^+$.	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 14.36 (s, 1H), 9.32 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.79 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.61 – 7.57 (m, 2H), 7.57 – 7.54 (m, 1H), 7.39 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.18 (td, J = 7.8, 7.3, 1.7 Hz, 1H), 6.97 – 6.90 (m, 2H), 6.81 (d, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.33 – 4.18 (m, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.27 – 2.16 (m, 1H), 2.13 – 2.02 (m, 1H).
689	LC-MS（方法 M48）：R_t= 2.70 分；m/z = 556 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)：δ [ppm] = 2.10–2.11 (m, 1H), 2.20–2.25 (m, 1H), 3.20–3.25 (m, 4H), 3.73–3.74 (m, 4H), 4.24–4.32 (m, 2H), 5.24 (q, 1H), 6.81 (dd, 1H), 6.95 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.54–7.55 (m, 1H), 7.77–7.83 (m, 2H), 8.68 (s, 1H), 9.24 (d, 1H).
690	LC-MS（方法 M29）：R_t= 2.91 分；m/z = 514 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)：δ [ppm] = 2.05–2.10 (m, 1H), 2.19–2.22 (m, 1H), 2.97 (s, 6H), 4.23–4.29 (m, 2H), 5.22–5.24 (m, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.17–7.21 (m, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.72–7.75 (m, 2H), 8.59 (s, 1H), 9.14 (d, 1H).
691	LC-MS（方法 M48）：R_t= 2.41 分；m/z = 570 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)：δ [ppm] = 2.06–2.10 (m, 1H), 2.20–2.24 (m, 1H), 3.27–3.32 (m, 4H), 3.72–3.73 (m, 4H), 4.24–4.29 (m, 2H), 5.24 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.95–6.97 (m, 1H), 7.17–7.19 (m, 1H), 7.38–7.40 (m, 1H), 7.70–7.78 (m, 4H), 8.65 (s, 1H), 9.24 (d, 1H).
692	LC-MS（方法 M7）：R_t= 1.67 分；m/z = 528 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, CD_3OD-d4)：δ [ppm] = 2.18–2.23 (m, 1H), 2.26–2.33 (m, 1H), 3.09 (d, 6H), 4.24–4.32 (m, 2H), 5.30 (t, 1H), 6.80–6.83 (m, 1H), 6.91–6.96 (m, 1H), 7.15–7.20 (m, 1H), 7.33–7.36 (m, 1H), 7.50–7.58 (m, 4H), 8.50 (s, 1H).
693	LC-MS（方法 M7）：R_t= 1.71 分；m/z = 570 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)：δ [ppm]= 2.08–2.10 (m, 1H), 2.22–2.25 (m, 1 H), 3.20–3.32 (m, 4H), 3.70 (s, 4H), 4.23–4.30 (m, 2H), 5.24 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.63–7.65 (m, 1H), 7.78–7.85 (m, 2H), 8.68 (s, 1H), 9.22 (t, 1H).
694	LC-MS（方法 M7）：R_t= 1.61 分；m/z = 528 (M+H)+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)：δ [ppm]=2.05–2.07 (m, 1H), 2.18–2.21 (m, 1H), 2.97 (s, 6H), 4.23–4.29 (m, 2H), 5.21 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.53–7.57 (m, 1H), 7.63–7.64 (m, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.81–7.84 (m, 1H), 8.58 (s, 1H), 9.12–9.14 (m, 1H).
374	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.38 分；m/z =	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：–0.149 (1.57), –0.008 (14.94), 0.008 (13.32), 0.146 (1.57), 2.038 (0.71), 2.103 (0.71), 2.179 (0.86), 2.214 (1.11), 2.327 (1.52), 2.366

	602 $[M+H]^+$	(1.11), 2.523 (4.71), 2.670 (1.62), 2.694 (1.01), 2.709 (1.16), 3.363 (2.08), 3.379 (1.47), 3.405 (1.47), 3.436 (1.52), 3.462 (1.37), 3.490 (0.76), 4.120 (3.70), 4.204 (0.96), 4.258 (1.67), 4.278 (1.92), 4.287 (1.97), 4.645 (0.96), 5.243 (1.06), 5.285 (0.96), 6.798 (3.54), 6.818 (4.00), 6.861 (0.86), 6.879 (1.77), 6.899 (1.06), 6.924 (0.91), 6.945 (1.82), 6.961 (1.11), 7.160 (1.06), 7.178 (1.67), 7.188 (1.77), 7.285 (1.47), 7.304 (1.32), 7.418 (1.57), 7.435 (1.52), 7.646 (14.89), 7.648 (16.00), 7.681 (0.86), 7.717 (2.43), 7.735 (3.49), 7.756 (3.14), 7.868 (4.00), 7.886 (3.19), 8.329 (1.87), 8.346 (2.53), 8.363 (1.57), 8.773 (6.43), 8.786 (6.73), 8.962 (0.61), 9.262 (1.82), 9.282 (3.29), 9.303 (1.57).
375	LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.93 分；MS (ESIpos)：m/z = 536 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：2.028 (0.47), 2.050 (0.77), 2.065 (0.73), 2.132 (0.72), 2.145 (0.85), 2.160 (0.51), 3.644 (16.00), 4.253 (1.62), 4.264 (2.51), 4.279 (1.47), 4.388 (1.53), 4.404 (1.52), 4.412 (1.50), 4.429 (1.52), 5.206 (0.44), 5.221 (0.97), 5.240 (0.94), 5.255 (0.45), 5.754 (0.63), 6.782 (1.85), 6.802 (2.07), 6.891 (0.88), 6.910 (1.89), 6.928 (1.09), 7.147 (0.94), 7.165 (1.54), 7.183 (0.71), 7.302 (1.62), 7.321 (1.48), 7.575 (1.18), 7.594 (1.75), 7.616 (3.91), 7.626 (8.51), 7.631 (4.90), 7.769 (2.16), 7.787 (1.79), 8.075 (0.67), 8.091 (1.40), 8.106 (0.67), 8.160 (0.82), 8.351 (1.65), 8.372 (1.58), 8.522 (5.37), 9.077 (1.61), 9.098 (1.57).
376	LC-MS 法 L1）：R_t= 1.21 分；MS (ESIpos)：m/z = 449 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.008 (1.28), 2.074 (0.92), 2.081 (0.95), 2.090 (1.23), 2.099 (1.37), 2.107 (1.62), 2.115 (1.60), 2.167 (1.52), 2.189 (1.28), 2.328 (0.53), 2.671 (0.49), 4.258 (0.94), 4.276 (2.38), 4.286 (2.24), 4.307 (2.99), 4.317 (2.25), 4.325 (2.52), 4.345 (0.91), 5.311 (1.02), 5.327 (2.32), 5.344 (2.34), 5.361 (1.07), 6.814 (4.66), 6.835 (5.19), 6.877 (2.09), 6.894 (4.48), 6.912 (2.65), 7.163 (2.38), 7.181 (3.70), 7.202 (1.79), 7.253 (3.98), 7.272 (3.65), 7.400 (3.14), 7.405 (3.55), 7.420 (6.02), 7.424 (5.83), 7.457 (5.34), 7.477 (7.81), 7.496 (3.47), 7.718 (5.20), 7.723 (5.42), 7.738 (4.66), 7.742 (4.46), 7.755 (1.40), 7.772 (6.63), 7.781 (7.42), 7.789 (16.00), 7.798 (1.88), 8.164 (3.15), 8.173 (2.91), 8.180 (2.79), 8.188 (2.77), 8.943 (7.32), 8.948 (7.68), 9.208 (4.01), 9.217 (9.88), 9.222 (9.87), 9.228 (4.19).
386	LC-MS（方法 L1）：	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.149 (1.19), −0.008 (9.91), 0.146 (1.21), 1.523

	R_t= 1.36分; MS (ESIpos): m/z = 526 $[M+H]^+$	(9.91), 1.529 (10.20), 1.541 (11.31), 1.552 (14.84), 1.572 (12.60), 2.009 (1.32), 2.018 (1.45), 2.028 (1.53), 2.045 (2.19), 2.052 (1.79), 2.072 (1.11), 2.178 (1.87), 2.190 (1.79), 2.200 (1.69), 2.327 (1.11), 2.366 (1.08), 2.669 (1.16), 2.709 (1.08), 3.848 (1.69), 4.207 (1.05), 4.226 (3.16), 4.234 (2.79), 4.245 (4.93), 4.254 (5.27), 4.270 (2.85), 4.289 (0.90), 5.243 (1.19), 5.258 (2.66), 5.276 (2.74), 5.292 (1.13), 5.753 (6.70), 6.771 (5.67), 6.791 (6.19), 6.895 (2.45), 6.914 (5.22), 6.933 (3.03), 7.141 (2.95), 7.159 (4.56), 7.176 (2.19), 7.327 (2.64), 7.334 (2.87), 7.353 (2.53), 7.465 (3.58), 7.471 (3.85), 7.489 (3.95), 7.495 (3.98), 7.736 (16.00), 7.745 (7.93), 7.752 (7.78), 7.769 (1.27), 7.911 (8.30), 7.918 (8.20), 8.473 (3.87), 8.483 (3.43), 8.489 (3.37), 8.498 (3.51), 8.669 (7.54), 8.679 (8.20), 9.119 (5.19), 9.139 (5.06).
392	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.85分; MS (ESIpos): m/z = 522 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.44), −0.008 (3.87), 0.008 (3.75), 0.146 (0.44), 1.235 (0.52), 2.012 (0.57), 2.023 (0.75), 2.033 (0.65), 2.046 (1.16), 2.060 (1.08), 2.073 (1.84), 2.135 (0.41), 2.149 (1.12), 2.163 (1.23), 2.181 (0.72), 2.199 (0.67), 2.327 (0.42), 2.366 (0.41), 2.523 (1.29), 2.670 (0.43), 2.710 (0.44), 4.252 (2.47), 4.264 (4.03), 4.278 (2.39), 4.512 (0.46), 4.544 (1.08), 4.577 (2.07), 4.606 (1.41), 4.637 (1.95), 4.647 (2.10), 4.661 (0.77), 4.676 (0.74), 4.691 (0.69), 4.705 (0.72), 4.718 (0.44), 5.178 (0.62), 5.193 (1.42), 5.212 (1.43), 5.226 (0.63), 5.411 (0.80), 5.557 (0.79), 5.754 (4.87), 6.791 (2.68), 6.812 (2.97), 6.894 (1.29), 6.897 (1.35), 6.915 (2.76), 6.931 (1.62), 6.934 (1.63), 7.150 (1.32), 7.154 (1.43), 7.171 (2.22), 7.189 (1.09), 7.192 (1.09), 7.314 (2.35), 7.331 (2.17), 7.472 (1.95), 7.490 (2.54), 7.493 (2.57), 7.511 (2.33), 7.614 (16.00), 7.737 (3.27), 7.753 (2.63), 7.755 (2.75), 8.065 (2.69), 8.084 (2.39), 8.181 (0.62), 8.488 (9.91), 9.045 (2.49), 9.065 (2.43).
393	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.31分; MS (ESIpos): m/z = 550 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.46), 0.146 (0.50), 2.004 (1.48), 2.054 (1.02), 2.073 (1.42), 2.129 (0.86), 2.179 (1.60), 2.192 (1.83), 2.203 (1.71), 2.214 (1.57), 2.327 (0.49), 2.366 (0.54), 2.669 (0.51), 2.710 (0.49), 3.015 (0.72), 3.192 (1.52), 3.220 (1.63), 3.403 (0.84), 3.429 (1.56), 3.454 (1.45), 4.219 (0.48), 4.240 (1.51), 4.248 (1.25), 4.261 (2.24), 4.270 (2.16), 4.287 (1.32), 4.306 (0.49), 4.909 (0.62), 5.030 (0.63), 5.226 (0.65), 5.241 (1.44), 5.260 (1.43), 5.274 (0.66), 6.787

			(2.64), 6.807 (2.91), 6.912 (1.29), 6.931 (2.76), 6.950 (1.60), 7.156 (1.39), 7.174 (2.28), 7.195 (1.06), 7.368 (2.41), 7.386 (2.21), 7.636 (16.00), 7.682 (1.66), 7.701 (2.56), 7.721 (2.23), 7.826 (3.11), 7.844 (2.39), 8.205 (2.59), 8.225 (2.30), 8.680 (8.42), 9.126 (2.54), 9.147 (2.47).
394		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.00 分; MS (ESIpos): m/z = 540 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.00), 0.008 (2.42), 2.044 (0.47), 2.054 (0.42), 2.066 (0.71), 2.080 (0.65), 2.169 (0.68), 2.183 (0.74), 2.202 (0.45), 2.219 (0.41), 2.523 (0.83), 4.253 (1.55), 4.266 (2.43), 4.279 (1.48), 4.798 (2.52), 4.830 (5.19), 4.861 (2.27), 5.198 (0.90), 5.217 (0.92), 5.754 (0.78), 6.795 (1.66), 6.815 (1.81), 6.902 (0.81), 6.918 (1.67), 6.937 (0.99), 7.155 (0.84), 7.159 (0.87), 7.176 (1.38), 7.194 (0.66), 7.340 (1.43), 7.359 (1.33), 7.517 (1.16), 7.535 (1.55), 7.538 (1.50), 7.556 (1.38), 7.620 (16.00), 7.779 (1.90), 7.795 (1.64), 8.074 (1.60), 8.093 (1.48), 8.170 (0.52), 8.557 (5.90), 9.136 (1.49), 9.156 (1.43).
396		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.18 分; MS (ESIpos): m/z = 526 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (3.25), 1.618 (0.63), 1.631 (0.69), 1.648 (0.77), 1.909 (0.75), 1.922 (0.75), 1.930 (0.75), 1.943 (0.59), 2.327 (0.50), 2.366 (0.50), 2.669 (0.53), 2.710 (0.51), 3.929 (0.61), 3.951 (1.23), 3.972 (0.85), 4.084 (0.88), 4.094 (0.85), 4.102 (1.06), 4.122 (0.64), 4.979 (0.55), 4.994 (1.22), 5.013 (1.22), 5.028 (0.55), 6.717 (2.55), 6.737 (2.73), 6.787 (5.10), 6.797 (4.07), 7.101 (0.99), 7.113 (1.39), 7.123 (1.52), 7.134 (1.07), 7.144 (0.75), 7.421 (1.35), 7.489 (1.36), 7.580 (1.91), 7.601 (2.47), 7.699 (16.00), 7.717 (2.39), 7.739 (1.49), 7.940 (2.48), 7.956 (2.12), 8.753 (1.33), 8.764 (1.43), 8.806 (1.46), 8.817 (1.31), 8.867 (1.92), 8.888 (1.86), 9.071 (6.62).
397		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.05 分; MS (ESIpos): m/z = 541 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.62), 0.844 (1.37), 0.859 (1.40), 1.235 (0.54), 1.800 (0.44), 2.047 (0.57), 2.523 (1.33), 2.670 (0.42), 4.167 (0.67), 5.116 (0.76), 6.516 (0.46), 6.737 (2.19), 6.757 (2.43), 6.847 (1.09), 6.865 (0.73), 7.118 (1.00), 7.136 (1.73), 7.154 (0.84), 7.465 (0.93), 7.679 (16.00), 7.726 (1.42), 7.747 (2.19), 7.765 (2.16), 7.869 (2.66), 7.890 (1.84), 7.917 (2.54), 7.920 (2.39), 7.934 (2.12), 8.852 (1.93), 8.873 (1.95), 8.981 (6.99).
398		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.38 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.48), 0.008 (2.72), 2.032 (0.71), 2.039 (0.77), 2.052 (0.85), 2.067 (1.16), 2.074 (0.99), 2.082 (0.73), 2.181 (0.77), 2.192

	(ESIpos): m/z = 568 $[M+H]^+$	
404	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.37 分; MS (ESIpos): m/z = 503 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.92), −0.008 (7.44), 0.008 (8.20), 0.146 (0.97), 1.759 (0.46), 1.783 (1.32), 1.806 (1.48), 1.830 (0.56), 2.045 (1.32), 2.071 (2.55), 2.096 (1.99), 2.117 (0.82), 2.179 (1.12), 2.191 (1.17), 2.201 (1.07), 2.270 (0.97), 2.295 (1.43), 2.322 (2.50), 2.327 (2.39), 2.347 (1.43), 2.366 (1.99), 2.523 (4.48), 2.605 (1.22), 2.626 (2.60), 2.650 (2.45), 2.669 (2.29), 2.710 (1.58), 4.221 (0.61), 4.241 (1.89), 4.249 (1.68), 4.260 (2.80), 4.269 (3.26), 4.283 (1.73), 4.301 (0.61), 4.343 (0.41), 4.366 (1.02), 4.387 (1.63), 4.407 (0.97), 5.218 (0.82), 5.233 (1.73), 5.252 (1.78), 5.266 (0.82), 6.781 (3.26), 6.801 (3.62), 6.902 (1.68), 6.921 (3.46), 6.940 (2.09), 7.145 (1.68), 7.149 (1.83), 7.166 (2.75), 7.187 (1.38), 7.342 (2.90), 7.359 (2.70), 7.630 (8.76), 7.635 (16.00), 7.645 (4.54), 7.649 (3.52), 7.654 (1.58), 7.684 (2.39), 7.702 (3.26), 7.705 (3.11), 7.723 (3.11), 7.828 (3.87), 7.831 (4.23), 7.846 (3.16), 7.849 (3.26), 8.185 (3.31), 8.203 (2.96), 8.747 (11.87), 9.091 (3.11), 9.111 (3.01).
406	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.27 分; MS (ESIpos): m/z = 457 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (1.56), 0.008 (1.55), 1.529 (14.85), 1.546 (16.00), 1.555 (15.65), 1.573 (14.94), 2.014 (0.47), 2.030 (1.05), 2.038 (1.09), 2.048 (1.15), 2.056 (1.17), 2.065 (1.65), 2.072 (1.41), 2.080 (1.01), 2.089 (0.68), 2.171 (0.64), 2.181 (1.09), 2.193 (1.44), 2.204 (1.41), 2.214 (1.31), 2.228 (0.85), 2.236 (0.73), 2.248 (0.47), 3.830 (0.61), 3.848 (1.53), 3.866 (2.04), 3.884 (1.51), 3.902 (0.60), 4.211 (0.53), 4.219 (0.74), 4.239 (2.42), 4.247 (2.13), 4.258 (3.89), 4.267

			(4.11), 4.282 (2.22), 4.294 (0.55), 4.301 (0.71), 4.310 (0.46), 5.261 (1.00), 5.276 (2.23), 5.296 (2.26), 5.310 (1.00), 6.781 (4.24), 6.801 (4.69), 6.910 (2.06), 6.912 (2.10), 6.928 (4.40), 6.930 (4.40), 6.947 (2.64), 6.949 (2.57), 7.146 (2.14), 7.149 (2.30), 7.167 (3.62), 7.185 (1.70), 7.188 (1.71), 7.348 (3.81), 7.366 (3.51), 7.449 (0.88), 7.454 (1.79), 7.459 (1.26), 7.468 (3.22), 7.473 (6.43), 7.478 (6.93), 7.497 (7.07), 7.516 (3.62), 7.521 (3.95), 7.525 (5.85), 7.529 (3.35), 7.539 (1.50), 7.542 (2.10), 7.547 (1.25), 7.624 (6.23), 7.709 (2.59), 7.726 (4.37), 7.748 (4.22), 7.789 (5.28), 7.791 (5.67), 7.806 (3.43), 7.809 (3.21), 8.415 (3.92), 8.434 (3.66), 8.730 (14.75), 9.099 (3.83), 9.120 (3.74).
407		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.31 分; MS (ESIpos): m/z = 507 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.46), 0.008 (4.67), 0.146 (0.51), 1.530 (14.63), 1.548 (16.00), 1.557 (15.62), 1.575 (14.69), 2.030 (1.04), 2.039 (1.13), 2.056 (1.22), 2.065 (1.66), 2.073 (1.40), 2.081 (1.00), 2.172 (0.67), 2.181 (1.08), 2.193 (1.51), 2.205 (1.40), 2.214 (1.35), 2.229 (0.87), 2.248 (0.49), 2.327 (0.62), 2.366 (0.53), 2.670 (0.66), 2.710 (0.58), 3.830 (0.62), 3.849 (1.53), 3.866 (2.02), 3.885 (1.48), 3.903 (0.58), 4.217 (0.77), 4.237 (2.46), 4.245 (2.06), 4.257 (3.81), 4.266 (3.83), 4.283 (2.19), 4.302 (0.77), 5.262 (1.00), 5.276 (2.28), 5.296 (2.28), 5.310 (1.00), 6.781 (4.30), 6.802 (4.74), 6.912 (2.10), 6.928 (4.43), 6.947 (2.61), 7.147 (2.22), 7.150 (2.30), 7.167 (3.61), 7.185 (1.73), 7.189 (1.71), 7.344 (3.83), 7.362 (3.72), 7.399 (2.33), 7.415 (2.61), 7.478 (0.44), 7.498 (0.67), 7.561 (4.92), 7.579 (1.68), 7.598 (6.14), 7.608 (4.99), 7.615 (10.39), 7.627 (1.57), 7.706 (0.73), 7.720 (3.01), 7.738 (4.46), 7.760 (4.03), 7.815 (5.50), 7.830 (3.57), 8.429 (3.90), 8.448 (3.68), 8.717 (14.67), 9.099 (3.86), 9.120 (3.81).
408		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.26 分; MS (ESIpos): m/z = 509 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.533 (14.48), 1.551 (16.00), 1.559 (15.43), 1.577 (14.51), 2.019 (1.10), 2.027 (1.16), 2.037 (1.29), 2.043 (1.30), 2.053 (1.77), 2.061 (1.48), 2.069 (1.06), 2.170 (1.16), 2.182 (1.57), 2.193 (1.49), 2.204 (1.42), 2.216 (0.97), 2.669 (0.41), 3.835 (0.65), 3.852 (1.60), 3.870 (2.11), 3.888 (1.53), 3.906 (0.64), 4.206 (0.81), 4.227 (2.52), 4.234 (2.16), 4.247 (3.95), 4.256 (3.84), 4.273 (2.27), 4.292 (0.78), 5.247 (1.07), 5.261 (2.45), 5.280 (2.43), 5.295 (1.05), 6.773 (4.46), 6.793 (5.02), 6.899 (2.19), 6.917 (4.73), 6.936 (2.74), 7.142 (2.33), 7.161

			(3.88), 7.179 (1.81), 7.338 (4.13), 7.357 (3.80), 7.499 (2.10), 7.518 (4.65), 7.538 (2.73), 7.571 (0.56), 7.591 (1.20), 7.610 (0.68), 7.746 (2.26), 7.763 (5.20), 7.774 (3.98), 7.784 (4.83), 7.806 (5.93), 7.826 (3.63), 7.848 (3.46), 7.865 (1.75), 7.910 (0.66), 7.926 (0.75), 7.945 (0.64), 8.492 (3.95), 8.513 (3.73), 8.684 (13.95), 9.126 (4.03), 9.147 (3.92).
409		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.24 分; MS (ESIpos): m/z = 475 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.49), −0.008 (4.30), 0.008 (4.43), 0.146 (0.48), 1.531 (14.92), 1.549 (16.00), 1.558 (15.65), 1.576 (14.94), 2.016 (1.06), 2.025 (1.12), 2.034 (1.15), 2.041 (1.17), 2.051 (1.63), 2.059 (1.41), 2.067 (1.01), 2.163 (0.62), 2.172 (1.08), 2.184 (1.45), 2.196 (1.41), 2.205 (1.30), 2.219 (0.84), 2.226 (0.75), 2.239 (0.48), 2.327 (0.49), 2.366 (0.70), 2.669 (0.59), 2.709 (0.71), 3.828 (0.60), 3.845 (1.48), 3.863 (1.98), 3.881 (1.45), 3.899 (0.57), 4.202 (0.55), 4.210 (0.79), 4.230 (2.42), 4.238 (2.09), 4.249 (3.86), 4.258 (3.99), 4.275 (2.18), 4.286 (0.59), 4.294 (0.75), 4.302 (0.48), 5.250 (0.99), 5.264 (2.18), 5.284 (2.22), 5.298 (0.99), 6.774 (4.12), 6.792 (4.36), 6.795 (4.54), 6.900 (2.03), 6.902 (2.11), 6.919 (4.30), 6.921 (4.32), 6.937 (2.60), 6.940 (2.56), 7.140 (2.12), 7.144 (2.29), 7.161 (3.50), 7.179 (1.70), 7.182 (1.70), 7.309 (2.18), 7.329 (5.82), 7.339 (3.97), 7.348 (4.54), 7.357 (3.62), 7.384 (2.38), 7.388 (2.82), 7.399 (2.69), 7.403 (3.70), 7.418 (1.65), 7.423 (1.54), 7.628 (1.94), 7.633 (2.05), 7.648 (3.06), 7.666 (1.81), 7.670 (1.70), 7.730 (2.00), 7.748 (4.98), 7.768 (6.90), 7.771 (6.96), 7.776 (6.74), 7.788 (2.22), 7.793 (1.39), 8.470 (3.41), 8.475 (3.42), 8.491 (3.33), 8.495 (3.17), 8.692 (14.76), 9.114 (3.73), 9.135 (3.70).
410		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.26 分; MS (ESIpos): m/z = 475 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (3.13), 0.008 (3.29), 0.146 (0.40), 1.528 (14.85), 1.546 (16.00), 1.555 (15.61), 1.573 (15.00), 2.001 (0.49), 2.016 (1.06), 2.025 (1.11), 2.035 (1.18), 2.042 (1.17), 2.052 (1.64), 2.059 (1.39), 2.067 (1.00), 2.163 (0.65), 2.173 (1.07), 2.185 (1.47), 2.197 (1.40), 2.207 (1.31), 2.218 (0.85), 2.327 (0.48), 2.366 (0.42), 2.669 (0.53), 2.709 (0.46), 3.821 (0.64), 3.839 (1.49), 3.857 (1.95), 3.874 (1.44), 3.892 (0.60), 4.202 (0.56), 4.210 (0.78), 4.230 (2.43), 4.238 (2.08), 4.249 (3.91), 4.259 (3.92), 4.275 (2.22), 4.294 (0.76), 5.251 (1.01), 5.265 (2.22), 5.285 (2.26), 5.300 (0.99), 6.774 (4.47), 6.795 (4.89), 6.900 (2.08),

		6.903 (2.17), 6.921 (4.49), 6.937 (2.63), 6.940 (2.65), 7.141 (2.17), 7.144 (2.30), 7.162 (3.63), 7.179 (1.71), 7.183 (1.71), 7.323 (3.21), 7.338 (4.16), 7.345 (6.69), 7.355 (3.75), 7.368 (3.97), 7.485 (2.85), 7.492 (4.04), 7.500 (2.96), 7.507 (4.05), 7.515 (2.58), 7.522 (2.10), 7.525 (2.92), 7.533 (1.86), 7.536 (2.35), 7.544 (1.88), 7.547 (2.22), 7.554 (1.51), 7.721 (2.43), 7.739 (4.57), 7.760 (4.71), 7.785 (5.80), 7.799 (2.83), 8.463 (3.64), 8.466 (3.77), 8.484 (3.54), 8.487 (3.37), 8.687 (15.55), 9.113 (3.86), 9.133 (3.75).
411	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.31 分; MS (ESIpos): m/z = 491 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.52), −0.008 (4.69), 0.008 (4.82), 0.146 (0.52), 1.534 (14.70), 1.552 (16.00), 1.560 (15.73), 1.578 (14.85), 2.031 (1.01), 2.039 (1.07), 2.056 (1.17), 2.066 (1.67), 2.074 (1.42), 2.170 (0.64), 2.191 (1.44), 2.203 (1.40), 2.213 (1.34), 2.225 (0.87), 2.328 (0.66), 2.366 (0.78), 2.670 (0.70), 2.710 (0.72), 3.840 (0.62), 3.856 (1.50), 3.874 (2.00), 3.892 (1.50), 3.909 (0.58), 4.216 (0.76), 4.236 (2.41), 4.245 (2.10), 4.256 (3.85), 4.265 (3.95), 4.282 (2.20), 4.300 (0.76), 5.259 (0.97), 5.274 (2.22), 5.293 (2.27), 5.308 (1.01), 6.781 (4.32), 6.801 (4.72), 6.910 (2.06), 6.928 (4.39), 6.945 (2.59), 7.145 (2.20), 7.149 (2.33), 7.167 (3.62), 7.184 (1.71), 7.188 (1.69), 7.347 (3.77), 7.364 (3.48), 7.511 (0.54), 7.694 (1.57), 7.713 (4.35), 7.732 (6.71), 7.750 (4.76), 7.754 (5.35), 7.759 (5.37), 7.771 (4.57), 7.836 (5.46), 7.852 (3.71), 7.874 (3.95), 7.897 (7.35), 8.441 (3.99), 8.461 (3.67), 8.721 (15.16), 9.107 (3.85), 9.128 (3.77).
412	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.12 分; MS (ESIpos): m/z = 542 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.146 (0.43), 1.233 (0.49), 1.756 (0.67), 1.768 (0.74), 1.784 (0.78), 2.002 (0.81), 2.015 (0.83), 2.023 (0.78), 2.037 (0.56), 2.327 (0.67), 2.366 (0.58), 2.669 (0.76), 2.709 (0.61), 3.946 (0.74), 3.967 (1.32), 3.988 (0.85), 4.134 (0.94), 4.152 (1.10), 4.171 (0.72), 5.059 (0.65), 5.074 (1.28), 5.093 (1.21), 5.107 (0.54), 6.729 (2.29), 6.749 (2.44), 6.854 (0.94), 6.874 (2.31), 6.892 (1.77), 6.932 (2.42), 6.949 (1.39), 7.094 (5.94), 7.108 (1.79), 7.130 (1.99), 7.147 (1.01), 7.685 (16.00), 7.719 (1.55), 7.738 (2.20), 7.758 (2.11), 7.861 (2.62), 7.880 (1.93), 7.921 (2.62), 7.938 (2.15), 8.272 (1.86), 8.864 (2.29), 8.884 (2.13), 8.993 (6.79).
418	LC-MS (方法 L1):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (1.65), 0.008 (1.55), 1.529 (9.91), 1.546

	R_t= 1.23 分; MS (ESIpos): m/z = 475 $[M+H]^+$	(10.68), 1.556 (11.45), 1.574 (10.97), 2.011 (0.79), 2.019 (0.83), 2.029 (0.86), 2.036 (0.88), 2.046 (1.25), 2.054 (1.05), 2.061 (0.78), 2.070 (0.55), 2.085 (16.00), 2.158 (0.47), 2.167 (0.82), 2.180 (1.09), 2.191 (1.07), 2.201 (0.98), 2.212 (0.63), 2.523 (0.80), 3.816 (0.45), 3.833 (1.04), 3.851 (1.38), 3.869 (1.03), 3.887 (0.42), 4.208 (0.56), 4.228 (1.84), 4.236 (1.62), 4.247 (2.92), 4.255 (3.09), 4.271 (1.69), 4.283 (0.43), 4.290 (0.53), 5.247 (0.74), 5.261 (1.64), 5.281 (1.65), 5.295 (0.75), 6.771 (3.27), 6.791 (3.58), 6.894 (1.53), 6.897 (1.53), 6.913 (3.26), 6.932 (1.99), 6.934 (1.87), 7.137 (1.66), 7.141 (1.75), 7.158 (2.68), 7.175 (1.32), 7.179 (1.28), 7.258 (1.26), 7.279 (1.22), 7.293 (1.89), 7.301 (1.38), 7.315 (2.98), 7.323 (2.78), 7.331 (2.81), 7.336 (2.95), 7.344 (2.35), 7.349 (2.44), 7.577 (1.76), 7.590 (1.90), 7.599 (1.75), 7.612 (1.58), 7.682 (1.73), 7.686 (2.13), 7.700 (4.61), 7.703 (4.23), 7.717 (3.84), 7.738 (3.71), 7.756 (1.81), 8.452 (2.70), 8.456 (2.79), 8.473 (2.60), 8.477 (2.48), 8.660 (9.72), 9.115 (2.91), 9.136 (2.80).
419	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.30 分; MS (ESIpos): m/z = 475 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.50), −0.008 (4.19), 0.008 (4.14), 0.146 (0.48), 1.525 (14.78), 1.543 (16.00), 1.552 (15.64), 1.569 (14.85), 2.030 (1.00), 2.038 (1.03), 2.048 (1.12), 2.055 (1.12), 2.065 (1.63), 2.073 (1.39), 2.081 (1.00), 2.171 (0.65), 2.180 (1.08), 2.192 (1.46), 2.204 (1.39), 2.214 (1.24), 2.228 (0.84), 2.327 (0.79), 2.366 (0.62), 2.669 (0.84), 2.709 (0.67), 3.832 (0.62), 3.848 (1.48), 3.866 (2.03), 3.884 (1.48), 3.902 (0.60), 4.210 (0.55), 4.219 (0.79), 4.239 (2.42), 4.247 (2.06), 4.258 (3.87), 4.267 (3.99), 4.283 (2.18), 4.302 (0.72), 4.311 (0.50), 5.260 (0.96), 5.275 (2.20), 5.294 (2.22), 5.309 (0.98), 6.781 (4.28), 6.802 (4.71), 6.911 (2.01), 6.913 (2.08), 6.932 (4.35), 6.948 (2.63), 6.951 (2.58), 7.147 (2.13), 7.151 (2.32), 7.169 (3.54), 7.186 (1.70), 7.190 (1.75), 7.350 (3.71), 7.368 (3.44), 7.419 (3.16), 7.423 (2.92), 7.444 (3.09), 7.447 (3.04), 7.457 (2.15), 7.462 (3.32), 7.467 (2.25), 7.479 (1.87), 7.484 (3.52), 7.489 (2.87), 7.496 (5.60), 7.500 (7.01), 7.624 (0.55), 7.717 (2.82), 7.735 (4.69), 7.756 (4.26), 7.838 (5.41), 7.854 (3.78), 7.856 (3.73), 8.442 (3.97), 8.461 (3.61), 8.753 (15.50), 9.106 (3.90), 9.126 (3.80).
420	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.27 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (3.45), 0.008 (3.55), 0.146 (0.41), 1.529 (9.38), 1.539 (9.80), 1.547 (11.02), 1.559 (16.00), 1.578 (11.91), 1.581 (11.87),

	(ESIpos): m/z = 525 $[M+H]^+$	2.011 (1.20), 2.030 (1.39), 2.039 (1.60), 2.046 (1.79), 2.054 (1.43), 2.085 (5.81), 2.174 (1.52), 2.186 (1.56), 2.196 (1.37), 2.327 (0.68), 2.366 (0.75), 2.669 (0.68), 2.710 (0.73), 3.848 (1.31), 3.865 (1.68), 3.878 (1.31), 4.199 (0.71), 4.219 (1.78), 4.227 (2.57), 4.241 (3.61), 4.250 (4.05), 4.267 (2.68), 4.285 (0.85), 5.257 (2.24), 5.271 (2.20), 5.754 (2.22), 6.767 (5.06), 6.788 (5.62), 6.888 (1.37), 6.892 (1.52), 6.906 (2.91), 6.911 (3.15), 6.925 (1.81), 6.929 (1.89), 7.135 (2.64), 7.155 (4.03), 7.174 (2.05), 7.319 (2.22), 7.337 (4.15), 7.354 (2.18), 7.424 (0.50), 7.440 (0.83), 7.444 (0.87), 7.458 (0.42), 7.475 (0.42), 7.487 (0.77), 7.505 (0.62), 7.609 (0.89), 7.627 (2.80), 7.640 (3.51), 7.646 (3.20), 7.658 (5.83), 7.677 (3.53), 7.680 (3.53), 7.700 (1.81), 7.706 (2.86), 7.709 (3.38), 7.723 (7.68), 7.727 (7.16), 7.736 (5.71), 7.757 (5.40), 7.775 (2.37), 7.894 (0.44), 7.916 (4.48), 7.921 (4.48), 7.935 (3.88), 7.940 (3.80), 8.475 (4.00), 8.479 (4.25), 8.496 (3.88), 8.500 (3.84), 8.649 (8.55), 8.658 (9.36), 9.107 (2.39), 9.126 (3.82), 9.145 (2.35).
421	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.22 分; MS (ESIpos): m/z = 475 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (0.74), 0.008 (0.66), 1.398 (16.00), 1.531 (2.32), 1.549 (2.57), 1.558 (3.55), 1.576 (3.28), 2.044 (0.42), 3.853 (0.41), 4.226 (0.60), 4.235 (0.52), 4.245 (0.96), 4.254 (1.03), 4.270 (0.56), 5.259 (0.53), 5.278 (0.54), 6.770 (1.05), 6.790 (1.17), 6.894 (0.43), 6.913 (0.95), 6.931 (0.55), 7.136 (0.49), 7.139 (0.53), 7.157 (0.86), 7.175 (0.41), 7.178 (0.42), 7.223 (0.50), 7.329 (0.63), 7.348 (0.59), 7.451 (1.08), 7.460 (1.29), 7.472 (1.04), 7.479 (1.04), 7.685 (0.58), 7.688 (0.73), 7.702 (1.46), 7.706 (1.42), 7.723 (1.24), 7.744 (1.24), 7.762 (0.62), 8.461 (0.89), 8.464 (0.98), 8.482 (0.88), 8.485 (0.89), 8.653 (1.41), 9.113 (0.66), 9.133 (0.64).
422	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.26 分; MS (ESIpos): m/z = 457 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.40), 0.008 (2.26), 1.141 (0.70), 1.520 (7.81), 1.537 (8.37), 1.547 (8.11), 1.564 (7.78), 2.023 (0.54), 2.031 (0.58), 2.048 (0.63), 2.058 (0.85), 2.066 (0.74), 2.075 (0.59), 2.085 (6.90), 2.161 (16.00), 2.177 (0.76), 2.189 (0.78), 2.201 (0.76), 2.211 (0.70), 2.327 (0.45), 2.386 (0.52), 2.395 (0.44), 2.416 (12.94), 2.670 (0.45), 3.822 (0.75), 3.841 (1.02), 3.858 (0.72), 4.238 (1.26), 4.246 (1.09), 4.257 (2.03), 4.265 (2.14), 4.282 (1.14), 5.259 (0.50), 5.273 (1.16), 5.293 (1.14), 5.307 (0.53), 5.754 (0.60), 6.710 (3.80), 6.712 (3.83), 6.779

			(2.31), 6.799 (2.52), 6.911 (1.13), 6.927 (2.33), 6.946 (1.40), 7.145 (1.16), 7.149 (1.23), 7.167 (1.85), 7.184 (0.91), 7.341 (1.95), 7.359 (1.78), 7.624 (1.06), 7.628 (1.41), 7.642 (3.30), 7.646 (3.02), 7.655 (2.78), 7.676 (2.61), 7.694 (1.18), 8.342 (1.79), 8.346 (1.89), 8.363 (1.74), 8.367 (1.66), 8.686 (8.47), 9.079 (1.98), 9.100 (1.92).
423		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.35 分；MS (ESIpos)：m/z = 497 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：1.141 (0.76), 1.356 (1.34), 1.519 (14.63), 1.537 (16.00), 1.546 (15.53), 1.564 (14.65), 2.023 (1.05), 2.031 (1.09), 2.049 (1.27), 2.058 (1.67), 2.066 (1.49), 2.085 (11.52), 2.183 (1.31), 2.191 (1.53), 2.203 (1.48), 2.212 (1.37), 2.327 (0.60), 2.366 (0.65), 2.670 (0.66), 2.709 (0.66), 3.811 (0.65), 3.829 (1.53), 3.847 (2.05), 3.865 (1.54), 3.881 (0.61), 4.215 (0.80), 4.235 (2.49), 4.243 (2.19), 4.255 (3.96), 4.264 (3.93), 4.281 (2.31), 4.300 (0.76), 5.257 (1.04), 5.273 (2.31), 5.292 (2.38), 5.306 (1.02), 5.754 (1.15), 6.779 (4.42), 6.799 (4.85), 6.912 (2.14), 6.930 (4.56), 6.947 (2.64), 7.149 (2.39), 7.167 (3.78), 7.188 (1.87), 7.231 (13.75), 7.346 (3.92), 7.364 (3.67), 7.716 (2.56), 7.734 (4.37), 7.755 (4.14), 7.800 (5.63), 7.815 (3.43), 8.454 (3.95), 8.473 (3.67), 8.737 (14.24), 9.105 (3.82), 9.125 (3.71).
424		LC-MS（方法 L1）：R_t= 0.83 分；MS (ESIpos)：m/z = 492 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.149 (0.62), 0.146 (0.58), 2.082 (0.85), 2.092 (0.94), 2.118 (1.45), 2.126 (1.23), 2.220 (1.28), 2.232 (1.23), 2.242 (1.10), 2.328 (0.69), 2.366 (0.74), 2.670 (0.75), 2.710 (0.77), 3.046 (2.57), 3.168 (0.82), 3.426 (3.56), 3.443 (4.68), 4.227 (0.88), 4.247 (2.21), 4.256 (1.97), 4.267 (3.31), 4.275 (3.45), 4.292 (1.93), 4.310 (0.72), 5.298 (1.79), 5.314 (1.79), 6.790 (3.71), 6.811 (4.03), 6.913 (1.81), 6.931 (3.79), 6.949 (2.21), 7.158 (1.97), 7.176 (3.10), 7.196 (1.57), 7.376 (3.26), 7.394 (2.97), 7.646 (8.78), 7.650 (16.00), 7.658 (5.74), 7.662 (4.49), 7.772 (1.84), 7.790 (3.18), 7.811 (2.48), 7.898 (4.35), 7.915 (3.20), 8.337 (0.98), 8.400 (2.78), 8.421 (2.49), 8.895 (10.41), 9.594 (1.37).
425		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.26 分；MS (ESIpos)：m/z = 475 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：−0.008 (1.52), 0.008 (1.58), 1.509 (12.78), 1.527 (13.71), 1.536 (13.42), 1.554 (12.80), 2.013 (0.92), 2.022 (1.01), 2.032 (1.08), 2.039 (1.12), 2.049 (1.52), 2.056 (1.44), 2.085 (7.75), 2.172 (0.94), 2.184 (1.30), 2.196 (1.24), 2.206 (1.19), 2.219 (0.80), 2.240 (0.47), 2.327 (0.45), 2.366 (0.47), 2.423

			(16.00), 2.669 (0.46), 2.710 (0.40), 3.804 (0.54), 3.823 (1.32), 3.840 (1.76), 3.859 (1.30), 3.876 (0.52), 4.201 (0.51), 4.208 (0.72), 4.228 (2.09), 4.236 (1.71), 4.249 (2.84), 4.259 (2.77), 4.267 (1.88), 4.277 (1.91), 4.288 (0.56), 4.295 (0.68), 4.304 (0.47), 5.246 (0.87), 5.260 (1.95), 5.280 (1.96), 5.294 (0.85), 5.754 (7.58), 6.631 (2.13), 6.777 (3.89), 6.797 (4.26), 6.902 (1.75), 6.904 (1.90), 6.923 (3.94), 6.939 (2.29), 6.942 (2.32), 7.143 (1.85), 7.147 (2.06), 7.164 (3.17), 7.182 (1.50), 7.185 (1.53), 7.334 (3.33), 7.352 (3.03), 7.618 (2.57), 7.641 (4.67), 7.664 (2.68), 8.442 (2.31), 8.457 (2.47), 8.465 (2.46), 8.481 (2.28), 8.709 (12.28), 9.081 (3.16), 9.102 (3.09).
426		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.32 分; MS (ESIpos): m/z = 515 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.83), −0.008 (6.50), 0.008 (7.02), 0.146 (0.83), 1.235 (0.67), 1.508 (14.93), 1.526 (15.98), 1.534 (16.00), 1.552 (15.19), 2.051 (1.31), 2.073 (1.29), 2.085 (2.88), 2.185 (1.50), 2.198 (1.48), 2.207 (1.40), 2.220 (0.98), 2.327 (0.90), 2.366 (0.95), 2.669 (0.93), 2.710 (0.93), 3.828 (1.33), 3.846 (1.74), 3.863 (1.31), 4.206 (0.79), 4.225 (2.29), 4.233 (1.88), 4.252 (2.95), 4.259 (2.71), 4.267 (2.05), 4.276 (2.19), 4.295 (0.83), 5.245 (0.93), 5.259 (2.12), 5.278 (2.17), 5.292 (0.98), 6.776 (4.48), 6.796 (4.88), 6.905 (2.21), 6.924 (4.50), 6.940 (2.71), 7.144 (2.24), 7.147 (2.40), 7.165 (3.71), 7.186 (1.83), 7.205 (3.79), 7.230 (3.98), 7.333 (1.83), 7.346 (2.26), 7.362 (1.69), 7.687 (2.98), 7.710 (5.17), 7.732 (3.05), 8.553 (2.71), 8.568 (2.88), 8.577 (2.88), 8.593 (2.71), 8.764 (7.26), 9.111 (3.05), 9.132 (3.05).
428		LC-MS (L2): R_t= 3.893 分; m/z = 517/5519 $(M+H)^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.69 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.71 – 7.66 (m, 3H), 7.37 (d, J = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 8.5, 7.4, 1.7 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.4, 1.2 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.32 – 4.17 (m, 2H), 3.12 (s, 6H), 2.26 – 2.14 (m, 1H), 2.10 – 1.99 (m, 1H).
430		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.23 分; MS (ESIpos): m/z = 459 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (1.38), 1.526 (14.80), 1.543 (16.00), 1.552 (15.65), 1.570 (14.87), 2.029 (1.04), 2.038 (1.12), 2.047 (1.19), 2.055 (1.21), 2.064 (1.68), 2.072 (1.42), 2.080 (1.02), 2.087 (0.71), 2.172 (0.65), 2.181 (1.10), 2.193 (1.48), 2.205 (1.42), 2.215 (1.36), 2.228 (0.86), 3.828 (0.64), 3.845 (1.58), 3.863

			(2.07), 3.881 (1.54), 3.899 (0.60), 4.211 (0.56), 4.219 (0.77), 4.239 (2.44), 4.247 (2.13), 4.258 (3.96), 4.267 (4.09), 4.283 (2.26), 4.302 (0.73), 5.262 (1.01), 5.277 (2.33), 5.296 (2.31), 5.311 (1.05), 6.781 (4.65), 6.801 (5.20), 6.912 (2.17), 6.930 (4.68), 6.949 (2.74), 7.150 (2.33), 7.168 (3.75), 7.189 (1.74), 7.252 (1.63), 7.258 (1.26), 7.276 (3.15), 7.282 (3.16), 7.301 (6.35), 7.318 (6.19), 7.334 (1.02), 7.348 (4.05), 7.366 (3.67), 7.716 (2.63), 7.734 (4.12), 7.755 (3.67), 7.834 (5.55), 7.851 (4.00), 8.438 (4.18), 8.459 (3.86), 8.750 (14.88), 9.106 (3.97), 9.126 (3.90).
431		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.37 分; MS (ESIpos): m/z = 525 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (2.75), 1.530 (14.75), 1.548 (16.00), 1.556 (15.84), 1.574 (14.95), 2.034 (1.00), 2.043 (1.11), 2.053 (1.16), 2.059 (1.19), 2.069 (1.70), 2.077 (1.41), 2.085 (1.05), 2.191 (1.50), 2.203 (1.47), 2.213 (1.38), 2.226 (0.88), 2.328 (0.61), 2.366 (0.66), 2.670 (0.63), 2.710 (0.66), 3.843 (0.64), 3.860 (1.58), 3.878 (2.08), 3.896 (1.53), 3.914 (0.61), 4.209 (0.61), 4.217 (0.75), 4.237 (2.49), 4.245 (2.13), 4.257 (3.91), 4.266 (4.02), 4.282 (2.22), 4.301 (0.75), 5.258 (1.02), 5.273 (2.30), 5.292 (2.31), 5.307 (1.03), 6.782 (4.49), 6.802 (4.96), 6.913 (2.21), 6.931 (4.58), 6.950 (2.69), 7.151 (2.39), 7.168 (3.68), 7.190 (1.78), 7.351 (3.93), 7.370 (3.58), 7.740 (2.83), 7.758 (4.07), 7.761 (3.88), 7.779 (3.71), 7.891 (10.85), 7.902 (6.54), 7.909 (5.57), 7.968 (6.30), 8.471 (4.19), 8.492 (3.75), 8.752 (15.12), 9.117 (4.02), 9.138 (3.91).
432		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.93 分; MS (ESIpos): m/z = 506 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.063 (0.44), 2.074 (1.74), 2.085 (0.57), 2.091 (0.49), 2.154 (16.00), 2.213 (0.54), 2.223 (0.51), 2.230 (0.52), 3.994 (3.21), 4.221 (0.41), 4.226 (0.88), 4.232 (0.59), 4.243 (0.65), 4.249 (0.52), 4.271 (0.53), 4.278 (0.67), 4.284 (0.59), 4.291 (0.69), 5.297 (0.75), 5.313 (0.74), 6.792 (1.44), 6.793 (1.49), 6.808 (1.59), 6.810 (1.58), 6.918 (0.74), 6.920 (0.73), 6.933 (1.47), 6.935 (1.43), 6.948 (0.86), 6.950 (0.81), 7.160 (0.72), 7.163 (0.74), 7.177 (1.18), 7.191 (0.60), 7.194 (0.57), 7.404 (1.21), 7.418 (1.15), 7.646 (0.87), 7.655 (9.82), 7.725 (1.04), 7.739 (1.43), 7.741 (1.26), 7.756 (1.25), 7.863 (1.61), 7.866 (1.64), 7.877 (1.33), 7.880 (1.26), 8.164 (1.66), 8.523 (1.33), 8.526 (1.33), 8.540 (1.27), 8.543 (1.20), 8.920 (5.25), 9.432 (1.31), 9.448 (1.27).
438		LC-MS (方法 L1):	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.41), −0.008 (3.62), 0.008 (3.26), 1.356

	R_t= 1.37 分; MS (ESIpos): m/z = 509 $[M+H]^+$	(1.83), 1.523 (14.77), 1.541 (16.00), 1.550 (15.57), 1.568 (14.88), 2.032 (1.00), 2.041 (1.04), 2.051 (1.14), 2.058 (1.11), 2.067 (1.68), 2.073 (2.66), 2.084 (1.01), 2.170 (0.66), 2.183 (1.20), 2.192 (1.42), 2.203 (1.34), 2.213 (1.30), 2.225 (0.81), 2.323 (0.49), 2.327 (0.62), 2.366 (0.55), 2.523 (1.52), 2.670 (0.68), 2.709 (0.55), 3.833 (0.60), 3.851 (1.50), 3.869 (2.02), 3.887 (1.45), 3.905 (0.60), 4.211 (0.54), 4.219 (0.74), 4.239 (2.40), 4.247 (2.04), 4.258 (3.83), 4.267 (3.95), 4.283 (2.15), 4.301 (0.70), 5.260 (0.98), 5.274 (2.17), 5.294 (2.20), 5.308 (0.96), 5.754 (6.17), 6.780 (4.02), 6.782 (4.25), 6.800 (4.58), 6.803 (4.65), 6.912 (2.09), 6.915 (2.10), 6.931 (4.36), 6.933 (4.28), 6.949 (2.67), 6.952 (2.58), 7.148 (2.17), 7.152 (2.29), 7.169 (3.48), 7.187 (1.71), 7.190 (1.68), 7.351 (3.62), 7.370 (3.40), 7.717 (2.99), 7.735 (4.36), 7.738 (3.68), 7.756 (4.00), 7.786 (15.35), 7.802 (15.29), 7.853 (5.04), 7.855 (5.31), 7.870 (4.03), 7.873 (3.81), 7.907 (0.55), 7.923 (0.54), 8.444 (3.89), 8.464 (3.67), 8.762 (15.95), 9.108 (3.86), 9.129 (3.76).
439	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.10 分; MS (ESIpos): m/z = 560 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.89), 0.008 (3.10), 1.826 (0.43), 2.073 (1.46), 2.086 (0.91), 2.327 (0.43), 2.366 (0.59), 2.670 (0.47), 2.710 (0.59), 4.178 (0.90), 5.127 (1.22), 5.141 (1.19), 6.747 (2.96), 6.767 (3.31), 6.836 (0.98), 6.920 (0.57), 7.045 (0.47), 7.124 (1.50), 7.145 (2.50), 7.162 (1.27), 7.258 (0.57), 7.333 (0.67), 7.467 (0.72), 7.672 (7.22), 7.676 (16.00), 7.682 (6.08), 7.685 (3.72), 7.732 (2.26), 7.750 (2.96), 7.753 (3.13), 7.771 (3.12), 7.911 (3.10), 7.929 (5.80), 7.932 (5.43), 7.946 (3.43), 8.870 (1.48), 8.885 (1.41), 9.005 (5.27), 12.563 (0.65).
444	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.30 分; MS (ESIpos): m/z = 489 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (3.30), 0.008 (2.88), 1.528 (9.79), 1.546 (10.48), 1.555 (10.17), 1.573 (9.77), 2.017 (0.68), 2.025 (0.71), 2.035 (0.76), 2.043 (0.78), 2.052 (1.09), 2.060 (0.90), 2.068 (0.66), 2.162 (0.45), 2.171 (0.73), 2.184 (1.01), 2.196 (0.94), 2.205 (0.87), 2.219 (0.57), 2.327 (0.73), 2.346 (16.00), 2.366 (0.80), 2.523 (1.25), 2.665 (0.40), 2.669 (0.54), 2.710 (0.61), 3.841 (0.97), 3.859 (1.27), 3.877 (0.94), 4.211 (0.50), 4.231 (1.58), 4.239 (1.35), 4.250 (2.53), 4.259 (2.64), 4.275 (1.46), 4.294 (0.47), 5.249 (0.64), 5.264 (1.44), 5.283 (1.46), 5.297 (0.61), 6.775 (2.69), 6.793 (2.86), 6.795 (2.95), 6.901 (1.37), 6.904 (1.39), 6.920 (2.83), 6.922 (2.83), 6.938 (1.75), 6.941 (1.70), 7.141 (1.39), 7.145 (1.49), 7.162

		(2.34), 7.180 (2.86), 7.183 (2.93), 7.195 (1.84), 7.199 (1.79), 7.340 (2.41), 7.357 (2.27), 7.451 (1.63), 7.455 (1.58), 7.468 (1.65), 7.472 (1.56), 7.716 (1.16), 7.734 (3.42), 7.753 (6.32), 7.756 (5.45), 7.768 (1.30), 8.457 (2.15), 8.462 (2.08), 8.476 (2.08), 8.482 (1.96), 8.687 (9.91), 9.113 (2.57), 9.133 (2.50).
446		^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.006 (0.83), 1.528 (15.59), 1.542 (16.00), 1.554 (15.53), 1.569 (15.22), 2.022 (0.59), 2.029 (0.75), 2.035 (1.20), 2.042 (1.26), 2.049 (1.35), 2.055 (1.35), 2.063 (1.74), 2.069 (1.50), 2.076 (1.05), 2.082 (0.74), 2.178 (0.75), 2.185 (1.16), 2.195 (1.62), 2.205 (1.56), 2.212 (1.50), 2.222 (1.07), 2.229 (0.80), 2.239 (0.53), 3.836 (0.65), 3.851 (1.49), 3.865 (1.95), 3.879 (1.44), 3.893 (0.59), 4.218 (0.74), 4.224 (0.93), 4.240 (2.73), 4.246 (2.13), 4.256 (2.85), 4.261 (3.43), 4.268 (2.78), 4.274 (2.18), 4.281 (2.36), 4.290 (0.72), 4.296 (0.86), 4.303 (0.60), 5.266 (1.16), 5.278 (2.45), 5.293 (2.39), 5.305 (1.07), 5.753 (2.04), 6.783 (4.78), 6.799 (5.11), 6.916 (2.31), 6.931 (4.75), 6.945 (2.64), 7.151 (2.25), 7.154 (2.34), 7.168 (3.85), 7.182 (1.85), 7.184 (1.80), 7.350 (4.06), 7.364 (3.73), 7.492 (2.91), 7.509 (5.77), 7.528 (4.33), 7.571 (2.42), 7.575 (2.60), 7.581 (2.67), 7.585 (2.75), 7.593 (1.86), 7.598 (1.61), 7.602 (1.61), 7.712 (2.90), 7.726 (4.39), 7.743 (3.94), 7.772 (3.91), 7.776 (3.80), 7.786 (3.97), 7.790 (3.76), 7.806 (5.60), 7.819 (3.92), 8.418 (4.24), 8.434 (3.91), 8.736 (14.80), 9.100 (4.07), 9.116 (3.94).
	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.28 分; MS (ESIpos): m/z = 475 $[M+H]^+$	
447		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (1.67), 0.008 (1.74), 1.531 (11.51), 1.549 (12.60), 1.558 (16.00), 1.576 (15.03), 1.860 (10.28), 1.875 (10.05), 2.011 (1.17), 2.019 (1.28), 2.028 (1.43), 2.035 (1.35), 2.045 (1.78), 2.053 (1.52), 2.061 (1.12), 2.069 (0.78), 2.085 (3.05), 2.168 (3.67), 2.179 (1.64), 2.191 (1.75), 2.201 (1.41), 2.214 (1.00), 2.234 (0.57), 2.285 (12.65), 2.292 (14.54), 2.327 (0.48), 2.669 (0.41), 3.818 (0.64), 3.835 (1.53), 3.853 (2.04), 3.871 (1.49), 3.888 (0.61), 4.199 (0.69), 4.207 (0.86), 4.227 (2.74), 4.235 (2.35), 4.247 (4.38), 4.256 (4.48), 4.272 (2.50), 4.284 (0.69), 4.290 (0.91), 4.299 (0.59), 5.246 (1.09), 5.260 (2.43), 5.280 (2.46), 5.294 (1.09), 5.754 (9.81), 6.772 (4.79), 6.792 (5.26), 6.894 (1.96), 6.912 (4.26), 6.932 (4.96), 6.950 (2.92), 7.005 (0.53), 7.090 (2.60), 7.109 (4.90), 7.141 (3.48), 7.155 (5.80), 7.175 (3.08), 7.303 (0.65), 7.324 (3.77), 7.343 (2.96), 7.412 (0.62),
	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.27 分; MS (ESIpos): m/z = 451 $[M+H]^+$	

			7.431 (0.77), 7.562 (4.28), 7.565 (4.58), 7.580 (5.85), 7.582 (5.76), 7.673 (4.25), 7.691 (3.82), 7.694 (4.77), 7.712 (3.30), 8.378 (4.53), 8.397 (4.13), 8.616 (12.23), 9.077 (4.12), 9.098 (4.04).
448		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.27 分; MS (ESIpos): m/z = 455 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.15), 0.008 (2.01), 1.526 (8.21), 1.543 (8.87), 1.552 (8.65), 1.570 (8.25), 2.028 (0.57), 2.037 (0.60), 2.047 (0.61), 2.053 (0.63), 2.063 (0.89), 2.071 (0.76), 2.079 (0.53), 2.179 (0.59), 2.192 (0.77), 2.203 (0.76), 2.213 (0.69), 2.227 (0.52), 2.366 (0.49), 2.388 (16.00), 3.842 (0.82), 3.860 (1.10), 3.878 (0.79), 4.239 (1.31), 4.248 (1.14), 4.258 (2.05), 4.267 (2.19), 4.282 (1.16), 5.261 (0.56), 5.276 (1.18), 5.295 (1.18), 5.310 (0.53), 6.778 (2.20), 6.781 (2.35), 6.799 (2.50), 6.801 (2.55), 6.909 (1.16), 6.912 (1.18), 6.928 (2.39), 6.930 (2.36), 6.946 (1.47), 6.949 (1.40), 7.052 (1.36), 7.076 (1.37), 7.146 (1.22), 7.150 (1.28), 7.167 (3.29), 7.190 (2.18), 7.204 (3.78), 7.346 (1.99), 7.365 (1.85), 7.691 (1.43), 7.709 (2.47), 7.731 (2.48), 7.763 (2.94), 7.766 (3.19), 7.781 (1.79), 7.784 (1.62), 8.393 (2.00), 8.396 (2.06), 8.415 (1.96), 8.418 (1.84), 8.721 (8.75), 9.097 (2.09), 9.117 (2.02).
449		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.27 分; MS (ESIpos): m/z = 477 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.44), −0.008 (3.46), 0.008 (3.37), 0.146 (0.41), 1.522 (14.76), 1.540 (16.00), 1.548 (15.61), 1.566 (14.88), 2.014 (0.46), 2.030 (1.02), 2.038 (1.07), 2.048 (1.14), 2.055 (1.14), 2.064 (1.61), 2.072 (1.35), 2.080 (0.98), 2.088 (0.68), 2.171 (0.62), 2.181 (1.07), 2.193 (1.41), 2.205 (1.37), 2.214 (1.27), 2.229 (0.85), 2.235 (0.72), 2.248 (0.46), 2.327 (0.52), 2.366 (0.54), 2.669 (0.59), 2.710 (0.55), 3.826 (0.62), 3.843 (1.51), 3.861 (2.02), 3.879 (1.48), 3.896 (0.57), 4.210 (0.55), 4.218 (0.76), 4.238 (2.44), 4.246 (2.05), 4.258 (3.89), 4.267 (3.93), 4.283 (2.16), 4.295 (0.59), 4.302 (0.73), 5.261 (0.98), 5.276 (2.18), 5.296 (2.20), 5.310 (0.99), 6.782 (4.05), 6.802 (4.47), 6.911 (2.03), 6.914 (2.08), 6.930 (4.31), 6.932 (4.24), 6.948 (2.63), 6.951 (2.50), 7.148 (2.11), 7.152 (2.23), 7.169 (3.50), 7.187 (1.71), 7.190 (1.69), 7.348 (3.67), 7.366 (3.41), 7.538 (4.10), 7.546 (1.25), 7.555 (4.44), 7.561 (4.49), 7.578 (4.34), 7.587 (0.80), 7.594 (0.47), 7.716 (2.81), 7.734 (4.18), 7.737 (3.56), 7.756 (3.90), 7.834 (4.93), 7.836 (5.20), 7.851 (3.82), 8.441 (3.93), 8.460 (3.67), 8.754 (14.49), 9.107 (3.76), 9.128 (3.64).

450	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.22 分；MS (ESIpos)：m/z = 477 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (3.44), 0.008 (2.25), 1.528 (14.93), 1.546 (16.00), 1.555 (15.22), 1.573 (14.27), 2.003 (0.56), 2.018 (1.14), 2.027 (1.17), 2.036 (1.20), 2.044 (1.21), 2.053 (1.64), 2.061 (1.36), 2.069 (0.97), 2.077 (0.66), 2.165 (0.73), 2.174 (1.14), 2.187 (1.49), 2.198 (1.42), 2.208 (1.32), 2.219 (0.87), 2.229 (0.70), 2.241 (0.45), 2.524 (1.57), 3.824 (0.68), 3.841 (1.51), 3.859 (1.93), 3.877 (1.40), 3.895 (0.55), 4.203 (0.69), 4.210 (0.92), 4.230 (2.57), 4.238 (2.17), 4.250 (3.83), 4.260 (3.63), 4.267 (2.17), 4.276 (2.10), 4.288 (0.60), 4.295 (0.73), 4.304 (0.47), 5.251 (1.07), 5.266 (2.23), 5.285 (2.13), 5.300 (0.94), 6.774 (3.85), 6.776 (3.91), 6.794 (4.27), 6.796 (4.17), 6.902 (2.14), 6.905 (2.10), 6.921 (4.27), 6.923 (4.08), 6.939 (2.56), 6.942 (2.34), 7.142 (2.24), 7.146 (2.30), 7.163 (3.45), 7.181 (1.81), 7.185 (1.77), 7.207 (1.78), 7.215 (1.67), 7.229 (1.65), 7.241 (0.79), 7.340 (3.62), 7.359 (3.30), 7.567 (0.70), 7.575 (0.84), 7.582 (0.97), 7.590 (1.44), 7.595 (1.32), 7.603 (1.42), 7.610 (1.33), 7.616 (1.34), 7.623 (0.84), 7.631 (0.75), 7.639 (0.66), 7.743 (2.63), 7.761 (4.44), 7.782 (4.33), 7.815 (5.04), 7.818 (5.19), 7.832 (3.04), 8.495 (3.72), 8.498 (3.67), 8.516 (3.54), 8.519 (3.18), 8.716 (13.80), 9.126 (3.72), 9.146 (3.50).
451	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.32 分；MS (ESIpos)：m/z = 505 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (2.87), 0.008 (2.99), 1.535 (13.93), 1.553 (15.28), 1.562 (16.00), 1.580 (15.01), 2.015 (11.45), 2.043 (1.86), 2.073 (0.70), 2.086 (1.48), 2.156 (0.80), 2.165 (1.28), 2.178 (1.76), 2.190 (1.65), 2.199 (1.57), 2.211 (1.06), 2.220 (0.84), 2.233 (0.55), 2.301 (1.08), 2.327 (0.40), 3.833 (0.67), 3.851 (1.64), 3.868 (2.17), 3.886 (1.60), 3.904 (0.65), 4.194 (0.64), 4.202 (0.82), 4.222 (2.46), 4.230 (2.05), 4.244 (3.50), 4.254 (3.47), 4.261 (2.45), 4.271 (2.47), 4.282 (0.76), 4.289 (0.90), 4.298 (0.61), 5.241 (1.14), 5.256 (2.55), 5.275 (2.57), 5.290 (1.14), 5.754 (11.28), 6.769 (4.42), 6.771 (4.75), 6.789 (5.07), 6.792 (5.21), 6.890 (2.32), 6.892 (2.35), 6.909 (4.87), 6.911 (4.82), 6.927 (2.95), 6.930 (2.82), 7.136 (2.44), 7.140 (2.63), 7.157 (4.04), 7.175 (2.01), 7.178 (1.96), 7.323 (4.16), 7.341 (3.86), 7.398 (0.50), 7.402 (0.46), 7.439 (2.71), 7.483 (0.53), 7.535 (2.86), 7.555 (3.81), 7.665 (5.56), 7.668 (4.53), 7.683 (8.94), 7.719 (5.14), 7.737 (3.59), 7.741 (5.33), 7.758 (3.09), 8.445 (4.24), 8.448 (4.48), 8.467 (4.12), 8.469 (3.99),

		8.640 (15.04), 9.087 (2.78), 9.107 (2.71).
453	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.29 分; MS (ESIpos): m/z = 491 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.92), 0.008 (2.81), 1.528 (13.71), 1.546 (14.79), 1.555 (16.00), 1.573 (15.23), 1.995 (0.48), 2.011 (1.10), 2.019 (1.19), 2.029 (1.25), 2.037 (1.25), 2.046 (1.76), 2.054 (1.47), 2.062 (1.08), 2.158 (0.66), 2.167 (1.14), 2.179 (1.56), 2.191 (1.52), 2.201 (1.38), 2.215 (0.95), 2.224 (0.79), 2.234 (0.51), 2.327 (0.53), 2.366 (0.64), 2.522 (1.30), 2.669 (0.57), 2.710 (0.64), 3.818 (0.59), 3.836 (1.47), 3.854 (1.91), 3.871 (1.43), 3.889 (0.57), 4.199 (0.57), 4.207 (0.81), 4.227 (2.55), 4.235 (2.24), 4.246 (4.18), 4.255 (4.37), 4.271 (2.40), 4.283 (0.66), 4.290 (0.79), 4.299 (0.51), 5.245 (1.03), 5.259 (2.33), 5.279 (2.42), 5.294 (1.12), 6.771 (4.44), 6.792 (4.88), 6.895 (2.11), 6.897 (2.18), 6.913 (4.53), 6.916 (4.55), 6.932 (2.84), 6.934 (2.70), 7.137 (2.24), 7.141 (2.42), 7.158 (3.78), 7.176 (1.82), 7.179 (1.82), 7.331 (3.49), 7.349 (3.32), 7.446 (2.55), 7.457 (3.58), 7.470 (1.80), 7.478 (1.08), 7.484 (1.54), 7.489 (1.34), 7.495 (1.12), 7.505 (4.07), 7.511 (3.08), 7.526 (6.37), 7.533 (5.60), 7.585 (4.48), 7.599 (1.47), 7.607 (2.68), 7.622 (0.88), 7.693 (1.47), 7.698 (2.37), 7.711 (6.81), 7.716 (6.90), 7.719 (7.23), 7.739 (5.49), 7.757 (2.24), 8.456 (3.58), 8.460 (3.76), 8.476 (3.45), 8.480 (3.43), 8.661 (11.47), 8.729 (0.46), 9.113 (4.07), 9.134 (4.00).
454	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.13 分; MS (ESIpos): m/z = 515 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 13.33 (brs, 1H), 8.92 (s, 1H), 8.75 (d, 1H), 8.12-7.96 (m, 2H), 7.90 (dd, 1H), 7.73-7.66 (m, 5H), 7.12 (t, 1H), 6.92 (d, 1H), 6.83 (t, 1H), 6.73 (dd, 1H), 5.12-5.06 (m, 1H), 4.18-4.07 (m, 1H), 3.99 (ddd, 1H), 2.56-2.52 (m, 1H), 2.09-1.96 (m, 1H), 1.78 (td, 1H)
455	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.36 分; MS (ESIpos): m/z = 509 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.81), 0.008 (2.57), 0.853 (0.46), 1.235 (2.17), 1.300 (0.52), 1.316 (0.51), 1.398 (1.60), 1.513 (14.80), 1.531 (16.00), 1.540 (15.55), 1.558 (14.28), 2.016 (1.21), 2.023 (1.32), 2.033 (1.33), 2.040 (1.33), 2.050 (1.72), 2.057 (1.47), 2.181 (1.67), 2.194 (1.60), 2.203 (1.49), 2.216 (1.01), 2.327 (0.52), 2.669 (0.63), 2.710 (0.49), 3.829 (0.77), 3.847 (1.66), 3.865 (2.13), 3.882 (1.55), 3.900 (0.64), 4.205 (1.06), 4.225 (2.72), 4.233 (2.29), 4.246 (3.46), 4.265 (2.32), 4.274 (2.31), 4.293 (0.84), 5.242 (1.17), 5.256 (2.44), 5.276 (2.34), 5.290 (1.06), 5.754 (5.78), 6.776 (4.38), 6.795 (4.71), 6.900 (2.25), 6.919 (4.51), 6.937

			(2.66), 7.146 (2.46), 7.164 (3.72), 7.181 (1.83), 7.335 (3.97), 7.353 (3.56), 7.505 (11.79), 7.509 (11.98), 7.682 (3.19), 7.692 (4.34), 7.697 (7.04), 7.702 (5.43), 7.705 (5.86), 7.728 (2.85), 8.525 (2.64), 8.540 (2.80), 8.549 (2.69), 8.564 (2.43), 8.745 (13.37), 9.099 (3.97), 9.120 (3.77).
477		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.26 分；MS (ESIpos)：m/z = 509 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：0.837 (0.43), 0.854 (0.54), 0.891 (0.49), 1.141 (0.54), 1.235 (1.16), 1.317 (0.60), 1.343 (0.89), 1.359 (1.03), 1.519 (11.49), 1.522 (11.46), 1.536 (12.92), 1.541 (13.45), 1.548 (16.00), 1.566 (14.61), 2.000 (1.38), 2.008 (1.47), 2.024 (1.68), 2.035 (2.05), 2.174 (1.95), 2.186 (1.92), 2.196 (1.86), 2.210 (1.48), 2.328 (0.62), 2.366 (0.58), 2.669 (0.65), 2.710 (0.54), 3.849 (1.72), 3.858 (1.72), 4.196 (1.05), 4.216 (3.08), 4.224 (2.77), 4.240 (4.11), 4.265 (2.93), 4.284 (1.16), 5.232 (1.14), 5.247 (2.57), 5.264 (2.59), 6.767 (4.85), 6.787 (5.50), 6.888 (2.50), 6.906 (5.25), 6.924 (3.19), 7.137 (2.79), 7.155 (4.52), 7.172 (2.28), 7.316 (2.70), 7.326 (2.95), 7.333 (2.84), 7.343 (2.62), 7.358 (2.21), 7.361 (2.23), 7.380 (4.65), 7.399 (3.04), 7.403 (2.97), 7.457 (2.43), 7.469 (2.86), 7.477 (4.20), 7.489 (4.31), 7.496 (2.32), 7.508 (2.35), 7.694 (3.04), 7.717 (5.27), 7.739 (7.60), 7.758 (4.31), 7.762 (4.11), 8.555 (2.91), 8.570 (3.22), 8.579 (3.15), 8.594 (2.82), 8.675 (6.93), 8.686 (7.13), 9.115 (4.16), 9.135 (3.98).
478		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.31 分；MS (ESIpos)：m/z = 475 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]：-0.008 (1.30), 0.008 (1.39), 1.157 (0.78), 1.175 (1.56), 1.192 (0.80), 1.398 (0.65), 1.988 (3.13), 2.002 (0.44), 2.012 (0.46), 2.019 (0.47), 2.029 (0.65), 2.036 (0.56), 2.044 (0.40), 2.086 (1.10), 2.135 (0.42), 2.148 (0.61), 2.160 (0.56), 2.169 (0.53), 4.021 (0.69), 4.038 (0.69), 4.216 (0.98), 4.223 (0.77), 4.236 (1.07), 4.243 (1.18), 4.250 (1.04), 4.257 (0.80), 4.266 (0.84), 5.227 (0.88), 5.247 (0.89), 5.677 (1.55), 5.681 (1.65), 5.722 (1.60), 5.725 (1.76), 5.754 (2.74), 5.810 (1.65), 5.813 (1.59), 5.839 (1.68), 5.842 (1.68), 6.775 (1.68), 6.796 (1.85), 6.899 (0.83), 6.917 (1.72), 6.934 (1.01), 7.142 (0.82), 7.146 (0.88), 7.163 (1.40), 7.180 (0.67), 7.184 (0.68), 7.305 (1.47), 7.324 (1.41), 7.331 (1.46), 7.360 (1.32), 7.376 (1.31), 7.405 (1.17), 7.664 (16.00), 7.741 (1.18), 7.759 (1.71), 7.780 (1.56), 7.895 (1.87), 7.898 (2.02), 7.913 (1.52), 7.916 (1.50), 8.242 (1.70), 8.245 (1.76), 8.262 (1.59), 8.266 (1.54), 8.909 (5.42), 9.001 (1.53), 9.021 (1.48).

479	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.29 分；MS（ESIpos）：m/z = 525 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：1.519（14.64），1.536（16.00），1.545（15.88），1.563（14.91），2.013（1.08），2.021（1.17），2.031（1.28），2.038（1.29），2.048（1.72），2.055（1.49），2.063（1.07），2.071（0.76），2.161（0.68），2.170（1.10），2.182（1.58），2.194（1.51），2.203（1.44），2.216（1.01），2.237（0.51），3.827（0.66），3.845（1.63），3.863（2.19），3.881（1.61），3.898（0.66），4.196（0.63），4.203（0.84），4.223（2.53），4.230（2.07），4.249（3.21），4.256（2.97），4.264（2.19），4.273（2.28），4.284（0.71），4.292（0.84），4.300（0.57），5.244（1.06），5.258（2.41），5.277（2.44），5.292（1.07），6.774（4.57），6.795（5.08），6.898（2.22），6.916（4.75），6.935（2.76），7.143（2.39），7.162（3.87），7.182（1.81），7.329（4.15），7.348（3.78），7.421（5.41），7.454（3.25），7.466（3.77），7.486（4.52），7.607（4.06），7.627（6.11），7.646（2.60），7.677（2.67），7.700（5.22），7.723（2.75），8.510（2.55），8.525（2.75），8.534（2.70），8.549（2.46），8.707（13.60），9.091（4.09），9.111（3.99）.
487	LC-MS（方法 L12）：R_t= 1.56 分；MS（ESIpos）：m/z = 495 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：-0.150（0.50），0.146（0.45），0.852（0.69），1.234（3.42），1.299（0.54），1.518（13.51），1.536（14.79），1.544（16.00），1.562（14.83），2.006（1.08），2.014（1.24），2.023（1.45），2.031（1.35），2.040（1.61），2.049（1.65），2.056（1.35），2.182（1.69），2.194（1.63），2.203（1.56），2.217（1.13），2.327（0.52），2.669（0.48），3.839（1.13），3.857（1.54），3.866（1.54），3.884（1.08），4.197（0.78），4.223（2.32），4.246（3.38），4.255（2.97），4.263（2.34），4.272（2.41），4.291（0.93），5.256（2.25），5.270（2.26），6.773（4.60），6.793（5.14），6.897（2.13），6.916（4.58），6.934（2.71），7.144（2.47），7.162（4.06），7.180（1.89），7.279（1.78），7.323（2.19），7.342（4.10），7.360（2.08），7.638（0.65），7.646（0.80），7.661（1.58），7.674（1.60），7.687（1.61），7.702（0.89），7.710（0.84），7.724（2.62），7.747（4.86），7.770（2.69），8.596（2.77），8.611（2.95），8.620（2.95），8.635（2.69），8.736（6.87），8.747（7.18），9.121（4.19），9.142（4.12）.
488	LC-MS（方法 L12）：R_t= 1.60 分；MS（ESIpos）：m/z = 509 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：-0.149（0.83），-0.008（6.41），0.008（6.73），0.146（0.80），1.141（0.40），1.157（0.99），1.175（1.92），1.193（0.96），1.235（0.88），1.398（2.11），1.522（14.80），1.540（16.00），1.548（15.71），1.566（14.90），1.988（3.66），2.013（1.04），2.022（1.15），2.031（1.20），2.048（1.63），2.056（1.39），2.180（1.52），2.192（1.44），2.202（1.39），2.215（0.91），2.327（0.75），2.670（0.83），3.836（0.59），

		3.853 (1.50), 3.871 (2.03), 3.889 (1.44), 3.907 (0.59), 4.021 (0.83), 4.038 (0.83), 4.202 (0.85), 4.222 (2.51), 4.230 (1.98), 4.248 (2.86), 4.255 (2.80), 4.263 (2.06), 4.272 (2.16), 4.291 (0.88), 5.240 (0.99), 5.255 (2.16), 5.275 (2.22), 5.290 (1.04), 6.774 (4.51), 6.795 (4.99), 6.895 (2.11), 6.897 (2.19), 6.916 (4.43), 6.932 (2.70), 6.935 (2.62), 7.140 (2.22), 7.143 (2.32), 7.161 (3.58), 7.178 (1.82), 7.182 (1.84), 7.330 (3.69), 7.348 (3.42), 7.691 (2.96), 7.714 (6.17), 7.737 (5.96), 7.752 (11.25), 7.767 (7.93), 7.802 (3.53), 7.817 (2.03), 8.524 (2.59), 8.538 (2.78), 8.547 (2.83), 8.563 (2.59), 8.710 (15.17), 9.096 (3.79), 9.117 (3.69).
489	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.38 分; MS (ESIpos): m/z = 531 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.670 (0.68), 1.681 (1.19), 1.688 (1.28), 1.692 (1.29), 1.700 (1.35), 1.704 (1.28), 1.710 (0.81), 1.938 (0.60), 1.946 (0.88), 1.952 (1.34), 1.960 (1.43), 1.966 (1.42), 1.975 (1.17), 1.980 (0.77), 1.983 (0.76), 1.988 (0.57), 3.957 (1.00), 3.961 (1.18), 3.975 (2.40), 3.989 (1.44), 3.993 (1.28), 4.105 (1.24), 4.110 (1.53), 4.116 (1.46), 4.122 (2.04), 4.128 (1.21), 4.135 (1.18), 4.139 (1.00), 5.034 (0.99), 5.044 (2.14), 5.057 (2.17), 5.067 (0.99), 5.747 (5.67), 6.713 (4.06), 6.726 (4.34), 6.811 (1.78), 6.823 (4.08), 6.835 (2.55), 6.899 (3.76), 6.912 (2.80), 7.101 (1.95), 7.113 (3.41), 7.126 (1.67), 7.259 (4.11), 7.267 (4.21), 7.669 (9.16), 7.672 (9.94), 7.681 (16.00), 7.684 (12.40), 7.691 (2.86), 7.705 (4.02), 7.717 (3.37), 7.795 (5.01), 7.798 (4.25), 7.803 (4.06), 7.806 (6.59), 7.892 (4.03), 7.894 (4.31), 7.904 (3.65), 7.906 (3.78), 8.700 (3.70), 8.714 (3.63), 8.975 (11.32).
493	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.07 分; MS (ESIpos): m/z = 494 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (1.23), 0.008 (1.23), 1.235 (0.64), 2.073 (0.59), 3.063 (16.00), 3.283 (0.84), 3.332 (1.24), 3.707 (0.83), 3.726 (0.96), 3.735 (0.87), 3.754 (0.75), 5.790 (0.75), 5.810 (0.75), 7.121 (0.41), 7.124 (0.46), 7.140 (0.96), 7.143 (1.04), 7.158 (0.66), 7.161 (0.71), 7.229 (0.45), 7.248 (1.01), 7.266 (0.67), 7.288 (1.37), 7.306 (0.61), 7.389 (1.07), 7.408 (0.94), 7.640 (7.94), 7.651 (2.13), 7.655 (2.38), 7.673 (1.13), 7.798 (1.17), 7.801 (1.35), 7.816 (1.24), 7.819 (1.23), 8.233 (0.99), 8.236 (1.09), 8.254 (0.96), 8.258 (0.98), 8.581 (0.48), 8.683 (3.65), 9.242 (0.98), 9.263 (0.98).
494	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.44 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.50), 1.234 (1.19), 1.797 (2.72), 1.813 (2.16), 1.831 (1.22), 2.017 (3.78), 2.027 (5.23), 2.042 (4.61), 2.052 (4.11), 2.118

	(ESIpos): m/z = 517 $[M+H]^+$	(2.71), 2.141 (2.97), 2.166 (2.48), 2.174 (2.13), 2.187 (2.12), 2.198 (1.81), 2.209 (1.47), 2.242 (0.49), 3.802 (1.35), 3.825 (1.96), 3.849 (1.31), 4.211 (0.45), 4.219 (0.64), 4.238 (2.26), 4.247 (2.23), 4.257 (3.32), 4.265 (3.75), 4.279 (2.16), 4.297 (0.65), 4.306 (0.41), 5.268 (0.94), 5.283 (2.12), 5.303 (2.15), 5.317 (0.95), 5.754 (0.50), 6.780 (3.97), 6.800 (4.42), 6.906 (1.93), 6.924 (4.12), 6.943 (2.41), 7.146 (1.92), 7.150 (2.10), 7.167 (3.36), 7.185 (1.57), 7.188 (1.61), 7.334 (3.58), 7.352 (3.29), 7.615 (11.95), 7.620 (16.00), 7.643 (3.83), 7.648 (5.15), 7.652 (2.49), 7.709 (2.30), 7.728 (3.62), 7.749 (3.21), 7.835 (4.99), 7.853 (3.64), 8.277 (3.63), 8.297 (3.29), 8.751 (13.22), 9.097 (3.72), 9.117 (3.65).
519	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.91 分; MS (ESIpos): m/z = 518 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.157 (2.50), 1.175 (5.02), 1.193 (2.67), 1.234 (1.23), 1.540 (3.03), 1.988 (9.10), 2.063 (2.50), 2.079 (2.80), 2.198 (2.93), 2.221 (2.26), 2.328 (0.95), 2.366 (0.77), 2.670 (0.84), 2.694 (0.44), 2.710 (0.45), 2.961 (1.24), 2.983 (1.72), 3.003 (1.27), 3.192 (2.79), 3.209 (2.69), 3.510 (0.78), 3.568 (1.00), 3.687 (1.02), 3.944 (1.29), 3.964 (1.72), 3.984 (1.23), 4.003 (1.27), 4.020 (2.57), 4.038 (2.55), 4.056 (1.22), 4.264 (6.12), 5.271 (1.44), 5.287 (3.19), 5.305 (3.16), 5.320 (1.42), 6.779 (5.67), 6.799 (6.10), 6.907 (2.67), 6.926 (5.43), 6.944 (3.19), 7.147 (3.24), 7.166 (5.08), 7.185 (2.43), 7.345 (4.52), 7.364 (4.26), 7.621 (16.00), 7.641 (6.46), 7.646 (7.29), 7.666 (3.01), 7.691 (2.20), 7.711 (3.99), 7.731 (3.09), 7.832 (6.29), 7.849 (4.99), 7.890 (0.71), 7.908 (0.56), 8.417 (0.70), 8.654 (2.62), 8.675 (2.44), 8.759 (14.38), 8.912 (1.06), 9.129 (2.46), 9.139 (2.89), 9.149 (2.97), 9.159 (2.67).
520	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.26 分; MS (ESIpos): m/z = 565 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.735 (0.54), 1.741 (0.60), 1.753 (0.64), 1.769 (0.75), 1.775 (0.68), 1.785 (0.45), 1.982 (0.46), 1.994 (0.70), 2.008 (0.73), 2.016 (0.72), 2.029 (0.56), 3.944 (0.51), 3.950 (0.61), 3.972 (1.26), 3.993 (0.80), 3.999 (0.65), 4.118 (0.63), 4.125 (0.83), 4.134 (0.77), 4.142 (0.98), 4.153 (0.60), 4.162 (0.60), 4.169 (0.47), 5.070 (0.51), 5.084 (1.14), 5.104 (1.15), 5.118 (0.50), 5.754 (1.74), 6.728 (2.15), 6.748 (2.40), 6.803 (0.98), 6.822 (2.24), 6.840 (1.42), 6.951 (2.12), 6.969 (1.59), 7.106 (1.04), 7.127 (1.79), 7.145 (0.87), 7.684 (16.00), 7.737 (1.24), 7.757 (2.35), 7.776 (1.77), 7.862 (1.30), 7.929 (2.60), 7.940 (3.02), 7.943

		(2.91), 7.961 (2.06), 8.010 (7.93), 8.156 (1.16), 8.519 (6.04), 8.866 (2.07), 8.886 (2.02), 8.999 (6.20).
539	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.28 分; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (2.51), 1.235 (0.43), 1.676 (1.54), 1.713 (2.60), 1.751 (1.67), 2.057 (0.97), 2.072 (1.11), 2.085 (1.87), 2.218 (1.33), 2.231 (1.31), 2.240 (1.26), 2.252 (0.92), 2.327 (0.56), 2.366 (0.60), 2.429 (2.14), 2.460 (2.25), 2.670 (0.69), 2.710 (0.67), 3.464 (1.07), 3.493 (1.97), 3.520 (2.14), 3.546 (2.15), 3.575 (1.18), 3.738 (1.26), 4.010 (3.17), 4.023 (2.81), 4.038 (2.85), 4.219 (0.82), 4.240 (2.21), 4.247 (1.78), 4.260 (2.15), 4.268 (2.70), 4.279 (2.21), 4.295 (1.97), 5.293 (0.94), 5.307 (2.08), 5.327 (2.08), 5.342 (0.90), 5.754 (5.00), 6.785 (3.97), 6.804 (4.38), 6.918 (1.97), 6.937 (4.07), 6.956 (2.40), 7.158 (2.10), 7.176 (3.37), 7.193 (1.61), 7.405 (3.52), 7.423 (3.20), 7.613 (13.15), 7.617 (16.00), 7.648 (4.20), 7.653 (5.68), 7.748 (2.29), 7.766 (3.65), 7.787 (3.20), 7.856 (4.95), 7.874 (3.52), 8.510 (3.43), 8.531 (3.17), 8.777 (12.63), 9.140 (3.54), 9.161 (3.54).
552	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.16 分; MS (ESIpos): m/z = 463 [M+H]+	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.006 (2.45), 2.035 (0.75), 2.042 (0.79), 2.050 (0.83), 2.056 (0.84), 2.063 (1.08), 2.070 (0.92), 2.076 (0.65), 2.084 (0.55), 2.177 (0.48), 2.184 (0.73), 2.194 (0.96), 2.204 (0.93), 2.212 (0.89), 2.222 (0.61), 2.361 (0.44), 2.635 (0.42), 2.784 (16.00), 4.218 (0.41), 4.240 (1.35), 4.253 (2.26), 4.260 (2.33), 4.273 (1.44), 4.289 (0.47), 5.276 (0.62), 5.288 (1.38), 5.303 (1.35), 5.315 (0.58), 5.753 (1.80), 6.779 (2.82), 6.795 (3.02), 6.899 (1.36), 6.913 (2.78), 6.928 (1.56), 7.147 (1.37), 7.161 (2.32), 7.175 (1.13), 7.336 (2.58), 7.342 (1.47), 7.351 (3.50), 7.367 (1.58), 7.434 (1.15), 7.440 (1.23), 7.450 (1.98), 7.456 (2.00), 7.465 (1.00), 7.471 (0.96), 7.698 (2.97), 7.701 (2.98), 7.714 (4.43), 7.727 (3.55), 7.729 (3.39), 7.757 (2.79), 7.773 (3.09), 7.788 (1.77), 8.296 (2.65), 8.299 (2.73), 8.313 (2.51), 8.315 (2.43), 8.725 (3.78), 8.730 (3.80), 9.066 (1.31), 9.073 (1.41), 9.083 (1.35), 9.089 (1.27).
554	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.11 分; MS (ESIpos): m/z = 449 [M+H]+	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.040 (0.54), 2.049 (0.56), 2.058 (0.59), 2.066 (0.62), 2.075 (0.86), 2.084 (0.82), 2.199 (0.74), 2.211 (0.72), 2.221 (0.67), 2.791 (16.00), 4.239 (1.25), 4.248 (1.18), 4.258 (1.91), 4.266 (2.10), 4.281 (1.17), 5.278 (0.52), 5.292 (1.15), 5.311 (1.17), 5.326 (0.53), 5.754 (2.08), 6.782 (2.11), 6.802

		(2.36), 6.902 (1.03), 6.921 (2.23), 6.939 (1.30), 7.149 (1.12), 7.167 (1.84), 7.184 (0.89), 7.228 (0.92), 7.240 (0.93), 7.250 (0.92), 7.346 (1.97), 7.365 (1.80), 7.584 (0.41), 7.599 (0.74), 7.612 (0.76), 7.624 (0.74), 7.639 (0.41), 7.779 (1.17), 7.798 (2.28), 7.818 (2.13), 7.853 (2.63), 7.868 (1.51), 8.336 (2.03), 8.339 (2.04), 8.357 (1.93), 8.795 (6.37), 9.088 (1.87), 9.109 (1.81).	
555	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.11 分; MS (ESIpos): m/z = 504 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (0.81), 0.008 (0.91), 1.235 (0.83), 1.583 (5.80), 1.773 (0.41), 1.790 (0.55), 1.800 (0.64), 2.756 (0.59), 2.782 (0.54), 2.812 (0.68), 2.820 (0.83), 2.977 (16.00), 7.042 (0.46), 7.061 (1.18), 7.070 (0.71), 7.072 (0.72), 7.087 (0.98), 7.090 (1.00), 7.106 (0.45), 7.109 (0.43), 7.131 (0.52), 7.150 (0.77), 7.502 (1.01), 7.520 (0.90), 7.610 (0.79), 7.628 (1.21), 7.632 (1.38), 7.638 (10.75), 7.649 (1.14), 7.771 (1.14), 7.774 (1.26), 7.789 (0.96), 7.792 (0.96), 8.202 (1.03), 8.205 (1.09), 8.223 (0.99), 8.227 (0.96), 8.645 (3.75), 8.744 (1.76).
562	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.74 分; MS (ESIpos): m/z = 533 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.58), −0.008 (5.47), 0.008 (4.38), 0.146 (0.61), 1.235 (1.34), 2.036 (1.59), 2.073 (0.95), 2.159 (1.17), 2.172 (1.51), 2.183 (1.48), 2.193 (1.40), 2.327 (1.17), 2.366 (0.64), 2.523 (2.77), 2.670 (1.31), 2.710 (0.67), 3.996 (0.51), 4.032 (9.72), 4.078 (0.42), 4.203 (0.70), 4.243 (3.57), 4.252 (4.02), 4.267 (2.26), 4.285 (0.76), 4.941 (4.22), 4.966 (2.98), 5.213 (0.97), 5.228 (2.18), 5.247 (2.17), 5.261 (0.90), 5.754 (8.48), 6.780 (4.08), 6.800 (4.58), 6.885 (1.79), 6.903 (3.77), 6.922 (2.20), 7.146 (2.20), 7.164 (3.60), 7.182 (1.68), 7.304 (3.88), 7.322 (3.85), 7.353 (2.26), 7.415 (1.60), 7.427 (2.01), 7.435 (2.80), 7.447 (3.08), 7.454 (1.54), 7.466 (1.53), 7.649 (1.29), 7.666 (5.30), 7.676 (5.97), 7.684 (13.71), 7.689 (6.43), 7.705 (4.35), 7.709 (4.08), 8.136 (4.77), 8.308 (0.72), 8.317 (3.74), 8.325 (3.26), 8.334 (3.46), 8.342 (3.29), 8.630 (16.00), 8.707 (5.45), 9.196 (1.74), 9.214 (2.90), 9.233 (1.90).
563	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.85 分; MS (ESIpos): m/z = 567 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (1.20), −0.008 (9.34), 0.008 (9.02), 0.146 (1.08), 0.854 (0.58), 1.148 (0.41), 1.235 (3.04), 2.039 (1.61), 2.085 (3.50), 2.183 (1.52), 2.194 (1.37), 2.327 (1.81), 2.366 (0.93), 2.669 (2.04), 2.709 (1.02), 3.508 (0.47), 4.039 (9.81), 4.253 (3.88), 4.268 (2.28), 4.948 (4.73), 4.972 (2.77), 5.225 (2.25), 5.243 (2.22), 5.754 (7.04), 6.782 (4.76), 6.803 (5.23), 6.888 (2.10), 6.907

			(4.29), 6.925 (2.45), 7.149 (2.36), 7.167 (3.91), 7.184 (1.96), 7.305 (3.50), 7.325 (3.18), 7.454 (2.39), 7.477 (2.69), 7.483 (2.60), 7.652 (2.51), 7.670 (4.47), 7.691 (4.44), 7.721 (5.26), 7.737 (2.92), 7.910 (8.35), 7.916 (8.23), 8.163 (2.04), 8.338 (4.35), 8.341 (4.50), 8.359 (4.20), 8.362 (3.94), 8.642 (16.00), 8.717 (5.69), 9.213 (2.63), 9.233 (2.51).
569		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.78 分; MS (ESIpos): m/z = 549 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.40), 0.008 (2.06), 2.061 (1.27), 2.185 (1.12), 2.327 (0.94), 2.669 (0.87), 4.025 (5.86), 4.065 (0.57), 4.238 (1.84), 4.258 (2.64), 4.266 (2.99), 4.913 (1.72), 4.926 (3.39), 4.946 (3.52), 4.959 (1.75), 5.246 (1.74), 5.266 (1.56), 6.792 (3.51), 6.813 (3.85), 6.904 (1.66), 6.922 (3.36), 6.939 (2.06), 7.158 (1.80), 7.175 (2.74), 7.197 (1.28), 7.321 (2.74), 7.338 (2.56), 7.392 (1.86), 7.411 (2.11), 7.578 (2.92), 7.588 (4.18), 7.597 (5.85), 7.616 (4.05), 7.627 (5.32), 7.647 (1.93), 7.652 (2.84), 7.670 (3.21), 7.691 (2.98), 7.814 (3.61), 7.817 (3.83), 7.832 (3.05), 8.291 (3.30), 8.310 (3.02), 8.706 (16.00), 9.217 (2.96), 9.237 (2.95).
570		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.27 分; MS (ESIpos): m/z = 493 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (0.87), 0.008 (0.82), 1.308 (6.89), 1.327 (16.00), 1.345 (7.07), 2.024 (0.53), 2.039 (1.21), 2.049 (1.28), 2.058 (1.29), 2.066 (1.35), 2.075 (1.94), 2.083 (1.61), 2.090 (1.19), 2.099 (0.77), 2.180 (0.74), 2.190 (1.30), 2.203 (1.54), 2.213 (1.54), 2.225 (1.35), 2.243 (0.95), 2.256 (0.53), 3.233 (1.89), 3.252 (5.94), 3.271 (5.86), 3.289 (1.97), 4.220 (0.46), 4.229 (0.69), 4.249 (2.90), 4.258 (4.37), 4.268 (5.05), 4.275 (4.55), 4.284 (2.85), 4.302 (0.68), 5.294 (1.14), 5.309 (2.53), 5.329 (2.56), 5.344 (1.15), 6.785 (4.65), 6.805 (5.16), 6.910 (2.22), 6.913 (2.38), 6.931 (4.95), 6.948 (2.88), 6.950 (2.91), 7.148 (2.35), 7.152 (2.57), 7.169 (4.01), 7.187 (1.89), 7.190 (1.93), 7.348 (4.27), 7.366 (3.97), 7.402 (2.57), 7.421 (3.07), 7.587 (3.08), 7.606 (10.61), 7.626 (5.62), 7.636 (4.50), 7.639 (7.18), 7.658 (2.73), 7.756 (2.88), 7.774 (4.86), 7.795 (4.63), 7.845 (5.60), 7.847 (6.27), 7.862 (3.86), 7.865 (3.83), 8.305 (4.57), 8.324 (4.08), 8.326 (4.06), 8.800 (15.69), 9.096 (4.36), 9.117 (4.28).
571		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.21 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.051 (0.52), 2.060 (0.52), 2.087 (0.83), 2.095 (0.71), 2.206 (0.69), 2.217 (0.69), 2.227 (0.59), 2.793 (16.00), 4.247 (1.21), 4.266

	(ESIpos): m/z = 479 $[M+H]^+$	(1.74), 4.272 (1.87), 4.287 (1.09), 5.288 (0.50), 5.303 (1.10), 5.323 (1.10), 5.338 (0.49), 6.788 (2.15), 6.808 (2.34), 6.911 (1.04), 6.927 (2.14), 6.946 (1.29), 7.154 (1.12), 7.171 (1.74), 7.189 (0.83), 7.350 (1.84), 7.369 (1.70), 7.405 (1.21), 7.425 (1.42), 7.591 (1.39), 7.610 (5.39), 7.629 (2.38), 7.646 (3.07), 7.665 (1.25), 7.758 (1.35), 7.776 (2.19), 7.797 (2.04), 7.857 (2.46), 7.860 (2.60), 7.875 (1.77), 7.878 (1.68), 8.268 (2.07), 8.271 (2.11), 8.289 (1.94), 8.292 (1.85), 8.810 (6.83), 9.075 (1.81), 9.095 (1.79).
572	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.26 分; MS (ESIpos): m/z = 497 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.032 (0.65), 2.041 (0.71), 2.050 (0.76), 2.058 (0.79), 2.067 (1.04), 2.075 (0.91), 2.172 (0.41), 2.181 (0.73), 2.193 (0.92), 2.204 (0.91), 2.215 (0.83), 2.787 (16.00), 4.216 (0.41), 4.236 (1.41), 4.254 (2.29), 4.261 (2.58), 4.276 (1.47), 4.294 (0.44), 5.271 (0.58), 5.286 (1.35), 5.304 (1.38), 5.320 (0.61), 6.778 (2.39), 6.799 (2.67), 6.897 (1.24), 6.915 (2.63), 6.934 (1.54), 7.145 (1.36), 7.163 (2.20), 7.184 (1.05), 7.337 (2.34), 7.355 (2.19), 7.495 (2.29), 7.502 (1.52), 7.657 (0.42), 7.771 (6.93), 7.779 (3.68), 7.787 (3.32), 7.805 (0.67), 7.922 (2.71), 7.928 (2.67), 8.315 (1.92), 8.324 (1.81), 8.332 (1.66), 8.340 (1.74), 8.751 (4.10), 9.078 (2.11), 9.099 (2.06).
573	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.32 分; MS (ESIpos): m/z = 511 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.08), 0.008 (1.69), 1.311 (7.04), 1.329 (16.00), 1.348 (7.23), 2.018 (1.23), 2.028 (1.39), 2.037 (1.33), 2.053 (2.00), 2.062 (1.64), 2.188 (1.63), 2.198 (1.61), 2.210 (1.49), 2.229 (1.04), 2.241 (0.61), 2.327 (0.71), 2.670 (0.76), 3.241 (3.86), 3.260 (3.83), 4.217 (0.70), 4.236 (2.98), 4.246 (4.20), 4.256 (5.08), 4.263 (4.65), 4.272 (2.85), 4.290 (0.68), 5.274 (1.17), 5.289 (2.57), 5.308 (2.57), 5.323 (1.14), 6.776 (5.42), 6.796 (5.89), 6.897 (2.61), 6.899 (2.58), 6.915 (5.46), 6.934 (3.26), 7.140 (2.67), 7.144 (2.76), 7.161 (4.38), 7.179 (2.11), 7.332 (4.46), 7.351 (4.10), 7.492 (4.02), 7.498 (7.24), 7.504 (4.01), 7.755 (2.30), 7.767 (14.83), 7.772 (8.12), 7.785 (6.89), 7.803 (1.92), 7.919 (10.30), 7.925 (9.81), 8.348 (4.00), 8.355 (3.95), 8.367 (3.57), 8.373 (3.60), 8.742 (7.68), 8.747 (7.69), 9.108 (3.20), 9.127 (3.19).
574	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.91 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.196 (5.36), 1.216 (11.90), 1.234 (5.37), 2.071 (0.42), 2.613 (1.31), 2.632 (3.68), 2.651 (3.53), 2.669 (1.23), 3.055 (16.00), 4.243

	(ESIpos): m/z = 480 $[M+H]^+$	(0.61), 4.251 (0.57), 4.262 (0.88), 4.270 (0.97), 4.284 (0.51), 5.245 (0.56), 5.264 (0.54), 6.788 (1.10), 6.806 (1.17), 6.902 (0.54), 6.905 (0.53), 6.921 (1.09), 6.939 (0.67), 6.942 (0.61), 7.064 (1.62), 7.148 (0.57), 7.152 (0.61), 7.169 (0.97), 7.191 (3.92), 7.351 (0.92), 7.368 (0.83), 7.588 (0.68), 7.606 (1.18), 7.626 (1.17), 7.657 (1.35), 7.661 (1.40), 7.675 (0.81), 7.679 (0.68), 8.153 (1.09), 8.156 (1.06), 8.173 (0.99), 8.177 (0.92), 8.573 (4.21), 9.076 (0.96), 9.096 (0.92).
575	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.22 分; MS (ESIpos): m/z = 477 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.315 (7.37), 1.334 (16.00), 1.352 (7.13), 2.016 (1.34), 2.026 (1.38), 2.034 (1.42), 2.051 (2.04), 2.060 (1.67), 2.188 (1.64), 2.210 (1.45), 2.224 (1.01), 2.327 (0.50), 2.669 (0.61), 3.238 (3.99), 3.257 (4.06), 4.245 (4.33), 4.256 (5.35), 4.271 (2.97), 5.276 (1.22), 5.290 (2.56), 5.309 (2.47), 5.324 (1.11), 6.773 (5.14), 6.792 (5.52), 6.895 (2.45), 6.913 (5.11), 6.932 (2.89), 7.141 (2.70), 7.159 (4.13), 7.176 (1.99), 7.330 (4.58), 7.349 (6.16), 7.359 (3.61), 7.363 (4.57), 7.425 (2.86), 7.431 (3.07), 7.444 (4.36), 7.451 (4.11), 7.464 (2.31), 7.470 (2.10), 7.693 (6.38), 7.697 (6.72), 7.702 (4.33), 7.705 (4.53), 7.713 (6.16), 7.717 (7.18), 7.719 (7.98), 7.723 (6.68), 7.752 (5.37), 7.772 (5.59), 7.790 (3.08), 8.326 (4.48), 8.329 (4.58), 8.347 (4.17), 8.718 (7.77), 8.724 (7.76), 9.099 (4.38), 9.120 (4.17).
582	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.99 分; MS (ESIpos): m/z = 514 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.161 (1.21), 1.180 (2.69), 1.196 (3.31), 1.216 (3.24), 1.230 (2.47), 1.235 (1.47), 1.249 (1.09), 1.356 (0.40), 2.044 (0.41), 2.184 (0.41), 2.595 (0.99), 2.609 (1.17), 2.628 (1.01), 2.728 (0.96), 2.745 (1.23), 2.763 (0.79), 3.065 (16.00), 4.229 (0.62), 4.237 (0.58), 4.248 (0.91), 4.256 (1.04), 4.270 (0.58), 5.227 (0.48), 5.241 (0.48), 6.774 (1.04), 6.794 (1.15), 6.883 (0.48), 6.902 (1.01), 6.920 (0.59), 6.967 (0.72), 6.972 (0.72), 6.996 (0.74), 7.001 (0.75), 7.138 (0.56), 7.156 (0.90), 7.174 (0.45), 7.218 (1.64), 7.223 (1.57), 7.331 (0.76), 7.350 (0.71), 7.550 (0.70), 7.567 (1.32), 7.595 (1.22), 7.616 (1.30), 7.633 (0.71), 8.199 (1.07), 8.203 (1.13), 8.220 (1.01), 8.224 (1.00), 8.506 (2.86), 9.055 (0.47), 9.073 (0.74), 9.092 (0.49).
583	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.20 分; MS	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (1.62), 1.142 (0.89), 1.161 (6.60), 1.180 (13.02), 1.195 (16.00), 1.216 (15.26), 1.229 (11.19), 1.234 (6.42), 1.248 (5.03),

	(ESIpos): m/z = 556 $[M+H]^+$	1.356 (2.57), 2.034 (1.17), 2.061 (1.72), 2.182 (1.53), 2.194 (1.58), 2.207 (1.56), 2.217 (1.57), 2.327 (0.56), 2.366 (0.40), 2.578 (1.59), 2.596 (4.14), 2.610 (4.95), 2.629 (4.33), 2.648 (1.32), 2.709 (1.71), 2.728 (3.88), 2.745 (4.90), 2.763 (3.19), 3.875 (11.89), 4.211 (0.84), 4.232 (2.57), 4.252 (3.80), 4.262 (3.67), 4.279 (2.36), 5.242 (2.14), 5.256 (2.13), 6.776 (4.90), 6.796 (5.51), 6.892 (1.72), 6.910 (3.66), 6.929 (2.06), 6.969 (3.24), 6.974 (3.27), 7.000 (3.63), 7.005 (3.58), 7.141 (2.39), 7.161 (3.89), 7.180 (2.02), 7.225 (7.39), 7.230 (6.95), 7.352 (4.16), 7.370 (3.84), 7.591 (3.42), 7.607 (5.69), 7.646 (5.21), 7.667 (5.45), 7.685 (3.27), 8.243 (4.62), 8.246 (4.72), 8.263 (4.30), 8.267 (4.07), 8.566 (8.87), 8.571 (9.34), 9.136 (2.13), 9.154 (3.49), 9.173 (2.18).
585	LC-MS (方法 L4): R_t= 3.93 分; MS (ESIpos): m/z = 520 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (0.77), 0.008 (0.70), 2.009 (0.45), 2.124 (0.42), 2.137 (0.56), 2.159 (0.67), 2.173 (0.54), 2.729 (16.00), 3.132 (8.33), 3.140 (9.59), 4.242 (1.09), 4.256 (1.79), 4.268 (1.30), 4.285 (0.74), 4.304 (0.47), 4.313 (0.51), 5.228 (0.59), 5.244 (0.74), 5.261 (0.70), 5.277 (0.49), 5.754 (5.28), 6.788 (0.97), 6.800 (1.15), 6.807 (1.12), 6.818 (1.26), 6.861 (0.47), 6.879 (1.00), 6.898 (0.64), 6.905 (0.63), 6.923 (1.16), 6.942 (0.70), 7.145 (0.53), 7.163 (1.32), 7.184 (1.31), 7.201 (1.14), 7.217 (0.79), 7.322 (0.99), 7.341 (0.88), 7.673 (1.37), 7.677 (3.00), 7.682 (2.18), 7.707 (7.29), 7.712 (5.77), 7.789 (0.70), 7.809 (2.12), 7.827 (3.94), 7.832 (2.99), 7.849 (0.62), 7.852 (0.68), 7.975 (1.92), 7.980 (1.72), 7.991 (1.71), 7.996 (1.45), 9.158 (4.20), 9.183 (4.34), 9.199 (1.01).
586	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.98 分; MS (ESIpos): m/z = 494 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.313 (16.00), 2.359 (3.34), 3.056 (5.98), 4.262 (0.45), 4.271 (0.52), 6.788 (0.52), 6.809 (0.57), 6.924 (0.54), 7.173 (1.16), 7.218 (0.69), 7.346 (0.96), 7.367 (0.45), 7.611 (0.52), 7.631 (0.52), 7.659 (0.59), 8.157 (0.42), 8.564 (1.24), 9.083 (0.42), 9.103 (0.42).
587	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.18 分; MS (ESIpos): m/z = 536 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.295 (2.20), 1.313 (16.00), 2.360 (4.01), 3.276 (1.42), 3.287 (1.54), 3.875 (2.03), 4.268 (0.54), 6.789 (0.67), 6.810 (0.75), 6.932 (0.71), 6.950 (0.41), 7.156 (0.40), 7.175 (1.57), 7.225 (0.98), 7.349 (1.06), 7.373 (0.71), 7.392 (0.66), 7.659 (0.78), 7.679 (0.75), 7.698 (0.86), 7.712 (0.44), 8.213 (0.58), 8.230 (0.53), 8.623 (1.85), 9.157 (0.60), 9.178 (0.59).

588	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.14 分；MS（ESIpos）：m/z = 522 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：-0.008（1.01），0.008（0.99），1.197（7.08），1.216（16.00），1.234（7.43），2.089（0.55），2.096（0.46），2.208（0.52），2.220（0.48），2.230（0.47），2.327（0.44），2.522（1.17），2.615（1.76），2.634（5.17），2.653（5.02），2.671（1.92），3.243（0.45），3.262（1.26），3.275（2.62），3.287（2.82），3.874（4.06），4.245（0.80），4.253（0.63），4.267（1.07），4.277（1.01），4.293（0.68），5.259（0.75），5.278（0.75），5.754（1.39），6.789（1.42），6.810（1.58），6.913（0.73），6.932（1.50），6.948（0.89），6.951（0.88），7.073（2.20），7.152（0.74），7.156（0.80），7.173（1.25），7.194（5.31），7.373（1.25），7.391（1.18），7.638（0.84），7.656（1.64），7.676（1.69），7.695（1.79），7.699（2.07），7.713（0.99），7.717（0.85），8.208（1.34），8.212（1.38），8.229（1.26），8.233（1.22），8.629（5.50），9.153（1.39），9.173（1.34）。
592	LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.14 分；MS（ESIpos）：m/z = 479 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR（500 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：1.234（0.47），2.106（0.61），2.117（0.70），2.129（0.79），2.134（0.71），2.262（0.49），2.273（0.68），2.283（0.72），2.290（0.70），2.301（0.52），4.035（0.41），4.195（0.49），4.200（0.56），4.218（1.25），4.235（0.87），4.240（0.70），4.289（0.70），4.295（0.92），4.301（0.85），4.308（0.93），4.318（0.57），4.323（0.56），4.330（0.43），4.742（1.91），5.390（0.52），5.400（1.12），5.416（1.11），5.427（0.51），5.554（0.98），6.793（2.09），6.808（2.27），6.937（1.02），6.952（2.13），6.966（1.23），7.163（1.03），7.166（1.07），7.180（1.76），7.194（0.87），7.197（0.82），7.410（1.80），7.424（1.69），7.665（16.00），7.737（1.30），7.752（2.11），7.768（1.83），7.845（2.28），7.848（2.39），7.860（1.82），7.862（1.73），7.967（1.51），7.984（1.29），8.488（0.66），9.045（5.88），9.260（1.85），9.277（1.82）。
593	1.18 分；MS（ESIpos）：m/z = 493 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR（500 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：1.190（0.46），2.062（0.53），2.068（0.53），2.076（0.53），2.090（0.66），2.096（0.59），2.213（0.59），2.223（0.59），2.230（0.53），2.362（0.53），2.519（0.72），2.522（0.53），2.636（0.53），3.460（0.99），3.473（2.24），3.487（1.32），3.780（1.05），3.790（1.51），3.799（0.99），4.230（0.46），4.246（1.12），4.253（0.79），4.263（1.05），4.268（1.32），4.275（0.99），4.281（0.79），4.288（0.86），5.091（0.86），5.101（1.78），5.111（0.79），5.286（0.40），5.297（0.86），5.314（0.86），6.786（1.91），6.789（1.91），6.803（2.17），6.805（2.11），6.906（1.05），6.908（1.12），6.921（1.91），6.923（1.84），6.935（1.19），6.938（1.12），7.153（0.99），7.156（0.99），7.170（1.51），7.184（0.79），7.352（1.12），7.359（1.58），7.374（1.38），7.537（0.40），7.648

			(4.54), 7.651 (16.00), 7.654 (3.23), 7.659 (0.72), 7.693 (0.66), 7.754 (1.45), 7.769 (1.91), 7.771 (1.65), 7.786 (1.78), 7.877 (2.17), 7.880 (2.24), 7.891 (1.78), 7.894 (1.65), 8.359 (1.58), 8.362 (1.65), 8.377 (1.58), 8.869 (7.57), 9.225 (1.65), 9.242 (1.58).
594		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.04 分; MS (ESIpos): m/z = 505 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.050 (0.60), 2.058 (0.65), 2.069 (0.70), 2.085 (0.97), 2.092 (0.83), 2.100 (0.60), 2.197 (0.65), 2.209 (0.88), 2.221 (0.86), 2.230 (0.81), 2.243 (0.56), 2.252 (0.44), 2.327 (0.42), 2.429 (16.00), 2.670 (0.44), 3.252 (0.90), 3.272 (2.69), 3.283 (5.98), 3.295 (7.10), 3.867 (4.41), 3.878 (7.26), 3.889 (4.17), 4.224 (0.46), 4.245 (1.41), 4.252 (1.14), 4.266 (1.97), 4.275 (1.86), 4.292 (1.23), 4.311 (0.44), 5.243 (0.60), 5.257 (1.32), 5.276 (1.32), 5.290 (0.58), 6.788 (2.37), 6.809 (2.62), 6.914 (1.18), 6.916 (1.21), 6.933 (2.50), 6.951 (1.48), 7.153 (1.23), 7.156 (1.30), 7.174 (2.09), 7.192 (1.02), 7.195 (1.00), 7.376 (2.23), 7.394 (2.09), 7.685 (3.87), 7.702 (2.60), 7.723 (2.30), 7.741 (3.73), 7.802 (2.78), 7.805 (2.92), 7.820 (2.32), 7.823 (2.62), 7.831 (3.66), 8.267 (2.32), 8.270 (2.39), 8.288 (2.20), 8.291 (2.13), 8.679 (8.26), 9.161 (2.34), 9.182 (2.30).
598		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.84 分; MS (ESIpos): m/z = 463 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (0.75), 0.008 (0.48), 2.068 (0.58), 2.076 (0.47), 2.175 (0.42), 2.188 (0.51), 2.199 (0.49), 2.209 (0.45), 2.427 (9.40), 2.523 (1.01), 3.070 (16.00), 4.242 (0.87), 4.250 (0.80), 4.261 (1.24), 4.269 (1.37), 4.284 (0.72), 5.241 (0.79), 5.261 (0.75), 6.785 (1.39), 6.787 (1.45), 6.805 (1.56), 6.808 (1.54), 6.905 (0.76), 6.908 (0.76), 6.924 (1.51), 6.926 (1.43), 6.942 (0.91), 6.945 (0.84), 7.149 (0.77), 7.153 (0.79), 7.170 (1.19), 7.187 (0.59), 7.191 (0.55), 7.354 (1.25), 7.372 (1.15), 7.632 (1.11), 7.650 (1.59), 7.654 (1.36), 7.672 (1.79), 7.680 (1.98), 7.737 (2.19), 7.739 (2.19), 7.762 (1.69), 7.766 (1.74), 7.780 (1.33), 7.783 (1.21), 7.828 (2.17), 8.220 (1.41), 8.223 (1.38), 8.241 (1.29), 8.244 (1.19), 8.613 (3.96), 9.082 (1.26), 9.103 (1.19).
600		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.13 分; MS (ESIpos): m/z = 447 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.033 (0.49), 2.041 (0.52), 2.068 (0.76), 2.076 (0.68), 2.195 (0.64), 2.205 (0.65), 2.216 (0.57), 2.783 (16.00), 4.236 (1.14), 4.255 (1.65), 4.262 (1.79), 4.276 (1.08), 5.274 (0.47), 5.288 (1.06), 5.308 (1.05), 5.323 (0.49), 6.778 (2.06), 6.799 (2.26), 6.898 (1.00), 6.914 (2.08), 6.933 (1.25), 7.141

			(1.01), 7.145 (1.08), 7.163 (1.66), 7.180 (0.81), 7.266 (1.14), 7.274 (1.67), 7.289 (1.20), 7.296 (1.69), 7.303 (1.14), 7.311 (0.77), 7.324 (1.88), 7.333 (2.15), 7.345 (1.33), 7.354 (2.23), 7.584 (1.59), 7.597 (1.64), 7.606 (1.48), 7.619 (1.41), 7.717 (1.13), 7.720 (1.36), 7.734 (2.93), 7.738 (2.68), 7.753 (2.46), 7.773 (2.49), 7.791 (1.20), 8.293 (1.91), 8.297 (2.02), 8.314 (1.85), 8.318 (1.75), 8.738 (6.49), 9.072 (1.70), 9.093 (1.64).
601		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.01 分; MS (ESIpos): m/z = 528 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.79), 0.008 (0.75), 1.270 (12.17), 1.284 (12.89), 2.388 (3.41), 2.401 (3.26), 2.523 (0.94), 3.065 (16.00), 4.232 (0.55), 4.245 (0.88), 4.255 (1.03), 4.270 (0.61), 5.224 (0.60), 5.243 (0.60), 5.754 (1.14), 6.774 (1.15), 6.795 (1.28), 6.885 (0.58), 6.903 (1.22), 6.922 (0.69), 7.096 (0.63), 7.102 (0.70), 7.123 (0.72), 7.128 (0.75), 7.135 (0.65), 7.139 (0.65), 7.156 (0.97), 7.178 (0.46), 7.331 (0.94), 7.350 (0.87), 7.411 (1.63), 7.416 (1.58), 7.550 (0.92), 7.565 (1.38), 7.601 (1.33), 7.621 (1.46), 7.639 (0.85), 8.203 (1.13), 8.206 (1.22), 8.224 (1.07), 8.228 (1.06), 8.503 (1.65), 8.508 (1.79), 9.069 (1.03), 9.089 (1.02).
602		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.72 分; MS (ESIpos): m/z = 517 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.43), 0.008 (2.43), 2.005 (1.56), 2.014 (1.65), 2.040 (2.57), 2.048 (2.04), 2.174 (2.09), 2.186 (2.16), 2.196 (2.02), 2.327 (0.80), 2.366 (0.85), 2.669 (0.73), 2.710 (0.83), 4.032 (11.82), 4.207 (1.19), 4.227 (3.60), 4.235 (3.19), 4.246 (5.44), 4.254 (6.06), 4.270 (3.19), 4.287 (1.12), 4.938 (5.67), 4.956 (5.44), 5.217 (1.58), 5.231 (3.35), 5.251 (3.28), 5.265 (1.40), 6.782 (6.82), 6.803 (7.51), 6.889 (3.33), 6.907 (6.61), 6.924 (4.02), 7.145 (3.35), 7.149 (3.63), 7.166 (5.42), 7.187 (2.64), 7.252 (2.89), 7.274 (2.87), 7.293 (2.71), 7.307 (6.36), 7.314 (5.28), 7.323 (7.92), 7.335 (2.94), 7.343 (2.32), 7.576 (3.70), 7.589 (4.11), 7.598 (3.56), 7.611 (3.28), 7.650 (2.62), 7.667 (7.67), 7.686 (13.61), 7.701 (2.46), 8.132 (3.35), 8.319 (5.26), 8.325 (4.96), 8.338 (4.77), 8.344 (4.55), 8.642 (16.00), 8.708 (6.38), 9.213 (4.73), 9.234 (4.61).
603		LC-MS (方法 L1): R_t= 1.20 分; MS (ESIpos): m/z = 461 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.312 (7.07), 1.330 (16.00), 1.349 (7.30), 2.004 (0.55), 2.019 (1.26), 2.030 (1.33), 2.038 (1.35), 2.047 (1.47), 2.055 (2.00), 2.063 (1.72), 2.071 (1.26), 2.079 (0.81), 2.167 (0.77), 2.178 (1.39), 2.190 (1.60), 2.200 (1.63), 2.212 (1.45), 2.226 (1.03), 2.243 (0.57), 3.220 (1.71), 3.238 (4.68), 3.256

			(4.64), 3.274 (1.72), 4.218 (0.71), 4.237 (3.03), 4.246 (4.63), 4.256 (5.41), 4.263 (4.80), 4.272 (3.05), 4.291 (0.73), 5.278 (1.19), 5.293 (2.62), 5.312 (2.65), 5.328 (1.20), 6.775 (4.64), 6.795 (5.15), 6.897 (2.35), 6.900 (2.37), 6.916 (5.03), 6.934 (3.02), 7.139 (2.49), 7.143 (2.59), 7.160 (4.16), 7.178 (2.02), 7.181 (1.96), 7.269 (2.88), 7.276 (4.09), 7.292 (3.57), 7.299 (6.76), 7.307 (2.30), 7.321 (4.84), 7.330 (5.77), 7.342 (3.34), 7.350 (5.55), 7.436 (0.55), 7.444 (0.73), 7.460 (2.03), 7.470 (1.50), 7.483 (0.63), 7.488 (0.63), 7.582 (3.46), 7.595 (3.67), 7.604 (3.36), 7.617 (3.13), 7.635 (0.42), 7.708 (2.96), 7.712 (3.38), 7.726 (6.55), 7.729 (6.17), 7.751 (5.10), 7.772 (5.47), 7.790 (2.85), 8.326 (4.37), 8.329 (4.51), 8.347 (4.16), 8.350 (4.04), 8.731 (14.58), 9.104 (4.09), 9.124 (3.99).
604	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.76分; MS (ESIpos): m/z = 517 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.57), 0.008 (3.20), 2.011 (1.02), 2.020 (1.09), 2.046 (1.71), 2.054 (1.42), 2.167 (1.15), 2.178 (1.46), 2.189 (1.42), 2.200 (1.38), 2.327 (1.33), 2.366 (0.84), 2.523 (2.88), 2.669 (1.31), 2.710 (0.80), 3.998 (0.69), 4.038 (7.81), 4.078 (0.67), 4.210 (0.82), 4.230 (2.51), 4.238 (2.22), 4.249 (3.71), 4.258 (4.19), 4.272 (2.17), 4.927 (2.42), 4.940 (4.59), 4.963 (4.55), 4.975 (2.31), 5.221 (1.04), 5.234 (2.24), 5.255 (2.20), 5.268 (0.95), 6.785 (4.62), 6.806 (4.88), 6.892 (2.31), 6.911 (4.53), 6.929 (2.71), 6.954 (0.51), 6.961 (0.47), 6.974 (0.51), 6.980 (0.47), 7.149 (2.60), 7.170 (3.77), 7.187 (1.84), 7.191 (1.80), 7.200 (0.51), 7.313 (4.11), 7.320 (3.57), 7.330 (3.82), 7.342 (6.10), 7.365 (3.68), 7.486 (3.11), 7.493 (4.44), 7.502 (3.13), 7.508 (4.84), 7.522 (3.02), 7.529 (1.75), 7.533 (2.37), 7.540 (1.93), 7.544 (2.24), 7.551 (1.58), 7.650 (3.11), 7.667 (4.50), 7.671 (3.77), 7.688 (4.24), 7.776 (4.79), 7.791 (3.62), 8.133 (0.44), 8.323 (4.42), 8.326 (4.28), 8.344 (4.04), 8.347 (3.75), 8.661 (16.00), 8.710 (5.68), 9.208 (3.97), 9.228 (3.79), 10.355 (1.09).
605	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.16分; MS (ESIpos): m/z = 447 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.038 (0.55), 2.048 (0.59), 2.057 (0.62), 2.064 (0.65), 2.074 (0.89), 2.082 (0.75), 2.089 (0.55), 2.185 (0.61), 2.197 (0.74), 2.209 (0.73), 2.219 (0.68), 2.787 (16.00), 4.239 (1.30), 4.248 (1.30), 4.258 (1.93), 4.265 (2.14), 4.279 (1.20), 5.277 (0.53), 5.292 (1.20), 5.311 (1.21), 5.326 (0.54), 6.780 (2.05), 6.800 (2.32), 6.901 (1.05), 6.920 (2.28), 6.938 (1.33), 7.148 (1.14), 7.166

			(1.88), 7.183 (0.88), 7.333 (1.49), 7.343 (2.14), 7.356 (3.17), 7.378 (1.66), 7.505 (1.11), 7.511 (1.81), 7.526 (2.33), 7.534 (1.46), 7.545 (1.03), 7.556 (1.03), 7.562 (0.70), 7.757 (1.11), 7.776 (2.36), 7.796 (2.24), 7.821 (2.68), 7.836 (1.38), 8.304 (2.03), 8.325 (1.92), 8.769 (6.05), 9.077 (1.92), 9.097 (1.89).
607	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.26 分; MS (ESIpos): m/z = 570 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.149 (0.48), −0.008 (3.63), 0.008 (3.53), 0.146 (0.46), 1.175 (0.42), 1.269 (14.91), 1.283 (16.00), 1.398 (0.57), 1.988 (0.79), 2.065 (0.44), 2.195 (0.48), 2.327 (0.69), 2.366 (0.79), 2.388 (4.14), 2.401 (3.93), 2.669 (0.75), 2.709 (0.77), 3.283 (1.88), 3.876 (3.43), 4.231 (0.63), 4.252 (1.03), 4.279 (0.69), 5.238 (0.73), 5.258 (0.77), 5.754 (0.79), 6.776 (1.43), 6.797 (1.53), 6.891 (0.65), 6.910 (1.35), 6.928 (0.81), 7.102 (0.85), 7.131 (0.91), 7.143 (0.77), 7.161 (1.15), 7.180 (0.54), 7.353 (1.27), 7.370 (1.19), 7.418 (2.00), 7.424 (1.98), 7.590 (1.03), 7.607 (1.61), 7.652 (1.47), 7.673 (1.61), 7.690 (1.01), 8.250 (1.37), 8.267 (1.23), 8.564 (1.86), 8.572 (2.04), 9.148 (1.21), 9.168 (1.17).
608	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.12 分; MS (ESIpos): m/z = 559 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (2.94), 0.008 (2.84), 2.026 (1.36), 2.034 (1.46), 2.045 (1.57), 2.061 (2.14), 2.068 (1.86), 2.076 (1.39), 2.183 (1.38), 2.196 (1.99), 2.207 (1.94), 2.217 (1.90), 2.230 (1.30), 2.252 (0.65), 2.327 (0.62), 2.366 (0.58), 2.669 (0.72), 2.710 (0.61), 3.254 (1.39), 3.294 (9.84), 3.879 (15.30), 4.202 (0.81), 4.209 (1.06), 4.230 (3.23), 4.238 (2.57), 4.251 (4.00), 4.263 (3.86), 4.279 (2.90), 4.298 (1.09), 4.306 (0.75), 5.239 (2.49), 5.253 (2.51), 5.754 (2.12), 6.778 (5.59), 6.798 (6.16), 6.895 (2.42), 6.913 (5.26), 6.932 (3.13), 7.142 (2.78), 7.146 (3.03), 7.164 (4.72), 7.181 (2.33), 7.185 (2.30), 7.354 (5.00), 7.372 (4.65), 7.706 (2.07), 7.724 (7.43), 7.737 (7.97), 7.742 (16.00), 7.754 (2.22), 7.888 (2.90), 7.892 (3.07), 7.917 (3.30), 7.921 (3.26), 8.052 (0.43), 8.297 (0.70), 8.310 (4.84), 8.316 (4.51), 8.328 (4.39), 8.334 (4.48), 8.342 (7.65), 8.347 (7.65), 8.604 (10.28), 8.706 (0.70), 9.165 (3.36), 9.184 (3.22).
624	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.97 分; MS (ESIpos): m/z = 517 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.008 (1.20), 0.008 (1.22), 2.044 (0.43), 2.185 (0.41), 2.195 (0.40), 3.080 (16.00), 4.227 (0.67), 4.246 (1.04), 4.254 (1.15), 4.269 (0.62), 5.235 (0.51), 5.754 (3.68), 6.776 (1.33), 6.796 (1.47), 6.887 (0.57), 6.905 (1.24), 6.924 (0.75), 7.142 (0.65), 7.159 (1.03), 7.180 (0.52), 7.331 (0.80), 7.350

		(0.73), 7.652 (0.64), 7.670 (1.58), 7.690 (2.46), 7.697 (1.81), 7.710 (0.61), 7.882 (0.81), 7.908 (0.84), 8.278 (1.17), 8.283 (1.16), 8.298 (1.11), 8.303 (1.04), 8.333 (2.42), 8.337 (2.34), 8.531 (4.40), 9.078 (0.75), 9.098 (0.70).
628	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.22 分; MS (ESIpos): m/z = 461 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.308 (7.60), 1.326 (16.00), 1.345 (7.79), 2.061 (2.32), 2.203 (2.13), 2.327 (0.52), 2.670 (0.63), 3.243 (6.84), 3.262 (6.74), 3.280 (2.77), 4.260 (6.66), 5.298 (3.26), 5.314 (3.18), 6.777 (5.35), 6.797 (5.91), 6.903 (2.66), 6.921 (5.56), 6.940 (3.25), 7.145 (3.07), 7.163 (4.94), 7.182 (2.42), 7.339 (6.05), 7.354 (9.10), 7.375 (3.63), 7.511 (5.22), 7.526 (7.31), 7.550 (2.82), 7.756 (2.29), 7.774 (5.35), 7.794 (5.18), 7.810 (7.32), 7.827 (3.38), 8.338 (4.91), 8.358 (4.55), 8.763 (13.33), 9.106 (4.65), 9.126 (4.63).
631	LC-MS 法 L4): R_t= 3.90 分; MS (ESIpos): m/z = 534 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.091 (0.41), 1.235 (1.08), 1.259 (0.68), 1.299 (0.43), 2.066 (16.00), 2.100 (0.88), 2.214 (0.78), 2.226 (0.77), 2.235 (0.72), 2.268 (1.76), 2.328 (0.58), 2.669 (0.60), 2.750 (15.89), 4.208 (0.55), 4.228 (1.45), 4.249 (1.16), 4.258 (1.27), 4.269 (1.15), 4.286 (1.02), 5.143 (5.73), 5.250 (0.77), 5.282 (1.13), 5.301 (1.12), 6.790 (2.18), 6.810 (2.37), 6.917 (1.17), 6.935 (2.21), 6.953 (1.25), 7.157 (1.18), 7.177 (1.96), 7.195 (0.95), 7.381 (1.90), 7.400 (1.94), 7.654 (11.00), 7.658 (5.85), 7.723 (1.28), 7.741 (1.94), 7.762 (1.68), 7.882 (2.40), 7.898 (1.87), 8.251 (2.03), 8.270 (1.81), 8.917 (0.60), 8.948 (6.71), 9.278 (1.90), 9.298 (1.82).
643	LC-MS (方法 L1): R_t= 0.91 分; MS (ESIpos): m/z = 520 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (0.88), 2.089 (0.52), 2.238 (16.00), 2.669 (1.25), 3.317 (2.60), 3.422 (1.31), 3.438 (1.42), 3.460 (1.08), 4.250 (0.72), 4.269 (1.14), 4.278 (1.25), 4.293 (0.65), 5.290 (0.69), 5.310 (0.69), 5.754 (0.94), 6.792 (1.36), 6.812 (1.48), 6.900 (0.70), 6.919 (1.32), 6.937 (0.81), 7.158 (0.66), 7.175 (1.10), 7.193 (0.52), 7.366 (1.17), 7.383 (1.06), 7.654 (11.60), 7.771 (0.81), 7.789 (1.28), 7.810 (1.17), 7.885 (1.61), 7.900 (1.17), 8.145 (3.08), 8.283 (1.19), 8.302 (1.09), 8.871 (4.70), 9.325 (1.18), 9.345 (1.13).
645	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.18 分; MS (ESIpos): m/z =	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.039 (0.59), 2.046 (0.63), 2.054 (0.65), 2.059 (0.66), 2.067 (0.88), 2.072 (1.06), 2.080 (0.51), 2.186 (0.59), 2.196 (0.76), 2.205 (0.79), 2.212 (0.72), 2.224 (0.47), 2.229 (0.41), 2.335 (10.23), 2.779 (16.00), 4.223

	443 $[M+H]^+$	(0.40), 4.239 (1.31), 4.246 (1.16), 4.254 (2.05), 4.261 (2.12), 4.274 (1.15), 5.280 (0.52), 5.292 (1.13), 5.307 (1.10), 5.319 (0.50), 6.780 (2.18), 6.795 (2.35), 6.900 (1.09), 6.901 (1.08), 6.915 (2.22), 6.929 (1.29), 6.931 (1.20), 7.145 (1.11), 7.147 (1.14), 7.161 (1.96), 7.176 (3.03), 7.178 (3.05), 7.239 (1.53), 7.242 (1.36), 7.255 (1.82), 7.258 (1.60), 7.338 (1.91), 7.353 (1.78), 7.411 (2.22), 7.427 (1.81), 7.663 (1.80), 7.666 (1.84), 7.677 (2.62), 7.680 (2.49), 7.731 (2.08), 7.746 (1.86), 7.748 (2.32), 7.762 (1.51), 8.260 (2.18), 8.262 (2.20), 8.277 (2.05), 8.279 (1.93), 8.716 (5.69), 9.065 (1.86), 9.082 (1.80).
646	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.24 分; MS (ESIpos): m/z = 457 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 9.10 (brd, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.25 (dd, 1H), 7.19-7.14 (m, 2H), 6.92 (t, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.33-5.28 (m, 1H), 4.29-4.22 (m, 2H), 3.36 (brs, 1H), 3.28-3.20 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.27-2.16 (m, 1H), 2.05 (ddd, 1H), 1.33 (t, 3H)
653	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.20 分; MS (ESIpos): m/z = 531 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.160 (0.41), 1.175 (1.01), 1.189 (0.61), 1.235 (0.61), 1.397 (2.84), 1.988 (3.65), 2.004 (2.63), 2.085 (7.09), 2.155 (2.63), 2.165 (2.63), 2.172 (2.43), 2.362 (1.01), 2.432 (3.04), 2.636 (0.81), 3.375 (0.61), 3.904 (2.23), 4.023 (0.61), 4.037 (0.61), 4.219 (4.46), 4.242 (6.08), 4.249 (6.08), 4.256 (5.47), 4.263 (5.87), 4.278 (3.24), 5.233 (3.44), 5.247 (3.44), 5.752 (2.23), 5.856 (5.06), 6.764 (9.32), 6.766 (9.72), 6.780 (10.33), 6.782 (10.33), 6.888 (2.84), 6.902 (5.87), 6.918 (3.24), 7.138 (4.25), 7.141 (4.46), 7.155 (7.29), 7.169 (3.65), 7.334 (6.08), 7.349 (6.48), 7.375 (4.46), 7.441 (3.85), 7.447 (4.46), 7.457 (6.48), 7.463 (6.89), 7.472 (3.24), 7.478 (3.44), 7.708 (11.75), 7.711 (11.75), 7.724 (15.39), 7.728 (16.00), 7.738 (14.38), 7.742 (12.96), 7.751 (12.76), 7.767 (12.35), 7.781 (5.67), 8.059 (9.11), 8.062 (9.11), 8.075 (7.90), 8.078 (7.49), 8.819 (13.57), 8.827 (13.57), 8.933 (5.27), 8.949 (4.25).
654	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.17 分; MS (ESIpos): m/z = 587 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (500 MHz, クロロホルム-d) δ [ppm]: 0.006 (1.86), 1.222 (0.43), 1.255 (1.78), 1.549 (4.29), 2.005 (0.63), 2.009 (0.62), 2.025 (0.45), 2.034 (0.78), 2.038 (0.71), 2.170 (2.80), 2.175 (0.46), 2.270 (0.45), 2.281 (0.47), 2.285 (0.45), 2.292 (0.67), 2.302 (0.60), 3.056 (15.99), 3.423 (4.44), 3.459 (16.00), 3.534 (4.30), 4.074 (0.85), 4.079 (0.78), 4.097 (1.34), 4.101 (1.18), 4.119 (0.75), 4.124 (0.61), 4.294 (0.63),

			4.302 (1.10), 4.311 (0.65), 4.317 (0.54), 4.325 (0.84), 4.333 (0.42), 5.348 (0.49), 5.358 (0.84), 5.367 (0.90), 5.375 (0.81), 5.385 (0.43), 6.731 (0.89), 6.733 (0.88), 6.746 (1.75), 6.760 (1.01), 6.762 (0.97), 6.823 (2.09), 6.840 (2.28), 6.922 (0.50), 7.080 (1.31), 7.092 (1.92), 7.099 (1.43), 7.105 (1.69), 7.178 (1.13), 7.181 (0.97), 7.195 (1.67), 7.209 (1.14), 7.212 (1.11), 7.220 (5.56), 7.282 (0.46), 7.376 (1.54), 7.423 (2.79), 7.427 (3.79), 7.430 (1.97), 7.526 (2.61), 7.532 (7.59), 7.536 (6.59), 7.590 (1.03), 7.604 (1.42), 7.607 (1.87), 7.621 (2.19), 7.645 (2.30), 7.648 (2.42), 7.656 (0.71), 7.662 (1.26), 7.665 (1.03), 7.736 (2.01), 7.739 (1.84), 7.749 (2.20), 7.752 (1.94), 7.764 (0.48), 7.766 (0.43), 7.818 (0.54), 7.821 (0.50), 7.835 (0.46), 9.108 (1.57), 9.133 (5.65).
655	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.18 分; MS (ESIpos): m/z = 463 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.311 (7.80), 1.327 (16.00), 1.341 (7.58), 2.033 (1.52), 2.041 (1.61), 2.047 (1.74), 2.054 (1.78), 2.061 (2.13), 2.067 (1.87), 2.198 (1.93), 2.207 (1.91), 2.215 (1.83), 3.235 (2.53), 3.250 (6.81), 3.265 (6.83), 3.279 (3.01), 4.227 (1.01), 4.244 (3.29), 4.258 (5.03), 4.264 (5.39), 4.276 (3.07), 4.290 (0.97), 5.288 (1.40), 5.300 (2.99), 5.315 (2.94), 5.327 (1.35), 6.781 (5.15), 6.797 (5.61), 6.909 (2.60), 6.924 (5.33), 6.939 (3.03), 7.151 (2.73), 7.165 (4.53), 7.180 (2.23), 7.228 (2.53), 7.236 (2.62), 7.345 (4.77), 7.360 (4.45), 7.601 (2.02), 7.607 (2.10), 7.614 (2.02), 7.782 (2.66), 7.797 (5.11), 7.813 (4.47), 7.845 (6.38), 7.857 (3.89), 8.374 (4.77), 8.389 (4.49), 8.789 (13.74), 9.121 (4.49), 9.137 (4.40).
676	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.27 分; MS (ESIpos): m/z = 437 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.319 (6.59), 1.334 (14.59), 1.349 (6.59), 1.869 (13.65), 2.031 (1.41), 2.052 (1.88), 2.059 (1.41), 2.200 (1.41), 2.292 (16.00), 2.362 (1.41), 2.636 (1.88), 3.236 (3.29), 3.251 (3.76), 3.375 (0.94), 3.418 (0.94), 4.238 (2.35), 4.253 (3.29), 4.259 (3.76), 4.271 (2.35), 5.282 (0.94), 5.295 (1.88), 5.310 (1.88), 6.778 (4.24), 6.793 (4.71), 6.901 (1.88), 6.916 (4.24), 6.931 (2.35), 6.962 (5.18), 7.099 (2.35), 7.114 (4.24), 7.147 (2.35), 7.157 (5.18), 7.171 (3.29), 7.330 (3.29), 7.345 (2.82), 7.590 (4.24), 7.592 (4.24), 7.604 (5.18), 7.606 (4.71), 7.712 (4.24), 7.726 (3.76), 7.729 (4.24), 7.743 (3.29), 8.252 (3.76), 8.254 (4.24), 8.269 (3.76), 8.689 (13.65), 9.070 (2.35), 9.088 (1.88).
684	LC-MS (方法 L1):		^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.120 (0.78), −0.007 (5.46), 0.007 (3.90), 0.117

	R_t= 1.28分; MS (ESIpos): m/z = 469 $[M+H]^+$	(0.39), 1.520 (12.10), 1.523 (11.71), 1.534 (12.49), 1.538 (11.71), 1.548 (14.05), 1.563 (13.66), 1.866 (16.00), 1.884 (16.00), 2.036 (1.56), 2.176 (1.56), 2.281 (16.00), 2.294 (16.00), 2.362 (1.95), 2.636 (1.56), 3.363 (1.17), 3.853 (1.95), 4.219 (2.34), 4.245 (2.34), 4.252 (2.73), 4.259 (2.34), 4.266 (2.34), 5.248 (2.73), 5.264 (2.34), 6.771 (5.46), 6.786 (5.85), 6.892 (2.73), 6.906 (5.46), 6.924 (5.46), 6.948 (3.51), 7.131 (3.51), 7.138 (3.12), 7.142 (3.90), 7.147 (5.07), 7.169 (2.34), 7.206 (3.90), 7.215 (3.90), 7.221 (2.73), 7.230 (2.73), 7.318 (3.90), 7.333 (3.51), 7.642 (3.51), 7.660 (5.46), 7.678 (3.51), 8.473 (3.12), 8.484 (3.51), 8.492 (3.51), 8.504 (3.12), 8.640 (11.32), 8.643 (10.54), 9.075 (2.73), 9.082 (2.73), 9.092 (2.73), 9.098 (2.73).
685	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.18分; MS (ESIpos): m/z = 423 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: −0.007 (1.56), 0.006 (1.12), 1.861 (5.14), 2.038 (0.49), 2.044 (0.51), 2.052 (0.51), 2.058 (0.54), 2.066 (0.72), 2.072 (0.58), 2.079 (0.42), 2.185 (0.47), 2.195 (0.63), 2.205 (0.63), 2.212 (0.58), 2.297 (7.94), 2.778 (16.00), 4.237 (0.98), 4.243 (0.79), 4.254 (1.52), 4.261 (1.45), 4.268 (0.93), 4.275 (0.98), 5.278 (0.42), 5.290 (0.91), 5.306 (0.89), 5.317 (0.40), 6.779 (1.89), 6.781 (1.96), 6.796 (2.10), 6.798 (2.06), 6.899 (0.84), 6.915 (1.68), 6.929 (0.96), 6.965 (2.03), 7.101 (1.03), 7.116 (1.78), 7.145 (1.00), 7.148 (1.10), 7.157 (2.34), 7.172 (1.31), 7.179 (0.84), 7.335 (1.31), 7.350 (1.19), 7.599 (1.92), 7.602 (1.92), 7.613 (2.38), 7.616 (2.27), 7.714 (1.96), 7.728 (1.78), 7.731 (2.15), 7.745 (1.64), 8.219 (2.08), 8.222 (2.13), 8.236 (1.96), 8.239 (1.82), 8.701 (6.47), 9.043 (1.66), 9.060 (1.66).
686	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.14分; MS (ESIpos): m/z = 479 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.005 (1.04), 2.043 (0.47), 2.048 (0.60), 2.053 (0.96), 2.058 (1.04), 2.065 (1.12), 2.069 (1.07), 2.077 (1.37), 2.081 (1.20), 2.087 (2.11), 2.092 (0.63), 2.193 (0.58), 2.199 (0.86), 2.202 (0.81), 2.207 (1.32), 2.213 (0.97), 2.216 (1.31), 2.221 (1.32), 2.230 (0.99), 2.236 (0.64), 2.239 (0.62), 2.244 (0.46), 2.793 (0.55), 3.345 (8.00), 4.220 (0.71), 4.225 (0.87), 4.234 (0.90), 4.239 (2.32), 4.244 (1.61), 4.253 (1.77), 4.258 (1.47), 4.268 (1.42), 4.273 (1.80), 4.279 (1.58), 4.285 (1.91), 4.292 (0.78), 4.298 (0.84), 4.303 (0.65), 5.037 (16.00), 5.287 (0.91), 5.297 (1.95), 5.310 (1.96), 5.320 (0.92), 6.790 (3.66), 6.791 (3.76), 6.803

			(4.00), 6.804 (3.99), 6.917 (1.85), 6.918 (1.84), 6.929 (3.75), 6.931 (3.68), 6.942 (2.14), 6.943 (2.05), 7.159 (1.78), 7.161 (1.80), 7.173 (3.01), 7.184 (1.56), 7.187 (1.49), 7.259 (1.51), 7.267 (1.49), 7.274 (1.49), 7.376 (3.08), 7.388 (2.95), 7.609 (0.49), 7.614 (0.63), 7.619 (0.75), 7.624 (1.18), 7.628 (1.14), 7.633 (1.23), 7.638 (1.18), 7.642 (1.18), 7.646 (0.74), 7.651 (0.65), 7.657 (0.56), 7.800 (2.66), 7.812 (3.85), 7.814 (3.18), 7.826 (3.61), 7.873 (4.17), 7.875 (4.29), 7.885 (3.06), 7.887 (2.94), 8.416 (3.61), 8.418 (3.65), 8.430 (3.48), 8.432 (3.27), 8.890 (12.74), 9.184 (3.52), 9.197 (3.43).
687	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.24 分; MS (ESIpos): m/z = 445 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.306 (6.83), 1.321 (15.00), 1.336 (6.50), 2.030 (0.50), 2.043 (1.17), 2.050 (1.17), 2.058 (1.17), 2.064 (1.33), 2.072 (6.00), 2.078 (1.33), 2.084 (1.00), 2.091 (0.67), 2.187 (0.67), 2.194 (1.17), 2.205 (1.33), 2.214 (1.33), 2.222 (1.17), 2.234 (0.83), 2.248 (0.50), 2.363 (0.50), 2.637 (0.50), 3.235 (1.83), 3.250 (5.50), 3.265 (5.67), 3.280 (2.50), 3.352 (3.17), 3.358 (2.17), 3.365 (1.17), 3.376 (0.83), 3.429 (0.50), 4.236 (0.83), 4.251 (2.67), 4.261 (2.83), 4.266 (3.50), 4.270 (3.67), 4.274 (3.67), 4.282 (2.33), 4.297 (0.67), 5.298 (1.00), 5.310 (2.17), 5.326 (2.17), 5.337 (1.00), 6.786 (4.17), 6.788 (4.33), 6.802 (4.67), 6.804 (4.50), 6.916 (2.17), 6.918 (2.17), 6.931 (4.33), 6.933 (4.17), 6.945 (2.67), 6.948 (2.50), 7.153 (2.17), 7.156 (2.17), 7.170 (3.50), 7.184 (1.83), 7.187 (1.67), 7.257 (0.83), 7.261 (1.67), 7.266 (1.33), 7.276 (1.67), 7.280 (3.50), 7.285 (2.33), 7.294 (1.00), 7.299 (1.67), 7.304 (1.17), 7.333 (4.67), 7.337 (5.17), 7.350 (8.83), 7.364 (3.83), 7.757 (3.17), 7.771 (4.50), 7.774 (3.83), 7.788 (4.17), 7.868 (5.17), 7.871 (5.17), 7.882 (4.00), 7.885 (3.67), 8.316 (4.00), 8.318 (4.00), 8.333 (3.83), 8.335 (3.50), 8.828 (16.00), 9.103 (3.67), 9.120 (3.67).
688	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.21 分; MS (ESIpos): m/z = 463 $[M+H]^+$		^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6): d [ppm] = 9.15 (d, 1H), 8.78 (s, 1H), 8.37 (dd, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.47-7.40 (m, 1H), 7.37-7.31 (m, 2H), 7.17 (t, 1H), 6.93 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.33-5.29 (m, 1H), 4.30-4.22 (m, 2H), 3.33-3.20 (m, 2H), 2.24-2.17 (m, 1H), 2.09-2.01 (m, 1H), 1.33 (t, 3H)
695	LC-MS (方法 L1): R_t= 1.17 分; MS		^{1}H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.063 (0.84), 2.069 (0.94), 2.074 (0.95), 2.081 (1.08), 2.086 (1.02), 2.209 (1.01), 2.217 (1.02), 2.223 (0.98), 2.231 (0.76), 2.790

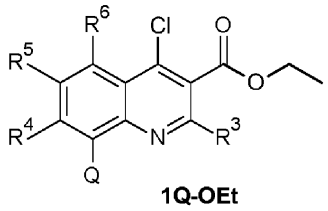
	(ESIpos): m/z = 431 $[M+H]^+$	(16.00), 4.237 (0.59), 4.250 (1.61), 4.255 (1.39), 4.269 (2.17), 4.275 (1.71), 4.280 (1.46), 4.286 (1.51), 4.299 (0.61), 5.297 (0.70), 5.307 (1.52), 5.319 (1.53), 5.329 (0.70), 5.762 (2.23), 6.793 (2.52), 6.807 (2.70), 6.919 (1.29), 6.932 (2.60), 6.944 (1.48), 7.162 (1.32), 7.174 (2.26), 7.187 (1.14), 7.280 (0.92), 7.295 (1.78), 7.311 (0.98), 7.349 (3.64), 7.358 (5.29), 7.369 (3.11), 7.762 (1.45), 7.774 (2.50), 7.788 (1.76), 7.885 (2.83), 7.897 (2.35), 8.285 (2.53), 8.299 (2.38), 8.841 (5.87), 9.107 (2.25), 9.120 (2.21).

【０６９８】

表３ａ～３ｅ：中間体

表３ａ

【化１８６】



1Q-OEt

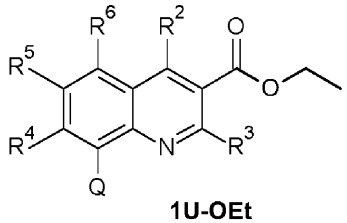
【表５】

番号	R3	R4	R5	R6	Q
1Q-1	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1Q-2	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1Q-3	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1Q-4	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1Q-5	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1Q-6	H	H	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1Q-7	H	F	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1Q-8	H	F	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1Q-9	H	F	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1Q-10	H	F	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1Q-11	H	F	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1Q-12	H	F	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1Q-13	H	H	H	H	3,5-ジメチルフェニル

【０６９９】

表３ｂ

【化１８７】



1U-OEt

【表６】

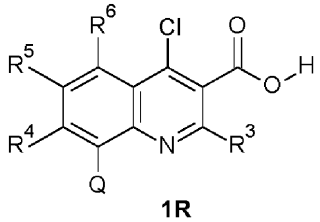
番号	R2	R3	R4	R5	R6	Q
1U-1	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1U-2	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1U-3	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1U-4	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1U-5	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1U-6	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1U-7	ジメチルアミノ	H	F	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1U-8	ジメチルアミノ	H	F	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1U-9	ジメチルアミノ	H	F	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1U-10	ジメチルアミノ	H	F	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1U-11	ジメチルアミノ	H	F	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1U-12	ジメチルアミノ	H	F	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1U-13	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1U-14	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1U-15	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1U-16	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1U-17	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1U-18	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジフルオロフェニル

ル							
1U-19	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1U-20	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1U-21	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1U-22	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1U-23	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1U-24	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	H	2,3-ジフルオロフェニル

【０７００】

表３ｃ

【化１８８】



1R

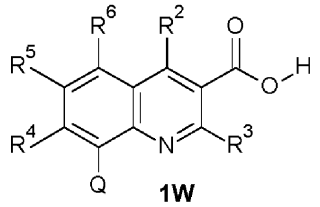
【表７】

番号	R3	R4	R5	R6	Q
1R-1	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1R-2	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1R-3	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1R-4	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1R-5	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1R-6	H	H	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1R-7	H	F	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1R-8	H	F	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1R-9	H	F	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1R-10	H	F	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1R-11	H	F	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1R-12	H	F	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1R-13	H	H	H	H	3,5-ジメチルフェニル

【０７０１】

表３ｄ

【化１８９】



1W

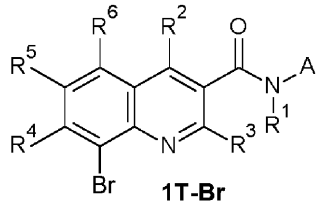
【表８】

例	R2	R3	R4	R5	R6	Q
1W-1	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1W-2	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1W-3	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1W-4	ジメチルアミノ	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1W-5	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1W-6	ジメチルアミノ	H	H	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1W-7	ジメチルアミノ	H	F	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1W-8	ジメチルアミノ	H	F	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1W-9	ジメチルアミノ	H	F	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1W-10	ジメチルアミノ	H	F	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1W-11	ジメチルアミノ	H	F	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1W-12	ジメチルアミノ	H	F	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1W-13	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1W-14	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1W-15	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1W-16	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1W-17	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3,5-トリフルオロフェ

1W-18	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	2,3-ジフルオロフェニル
1W-19	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	3,5-ジクロロフェニル
1W-20	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	2,3,5-トリクロロフェニル
1W-21	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	2,3-ジクロロフェニル
1W-22	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	3,5-ジフルオロフェニル
1W-23	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	2,3,5-トリフルオロフェニル
1W-24	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	2,3-ジフルオロフェニル

【０７０２】
表３ｅ

【化１９０】



1T-Br

【表９】

番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	A
1T-1	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
1T-2	H	ジメチルアミノ	H	H	H	H	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
1T-3	H	ジメチルアミノ	H	F	H	H	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
1T-4	H	ジメチルアミノ	H	F	H	H	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
1T-5	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
1T-6	H	モルホリン-4-イル	H	H	H	H	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル
1T-7	H	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	(4S)-3,4-ジヒドロ-2H-クロメン-4-イル
1T-8	H	モルホリン-4-イル	H	F	H	H	(1S)-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル

【０７０３】

表４：中間体のＬＣ－ＭＳ及びＮＭＲ又はＮＭＲピークリスト
【表１０】

実施例番号	logP（方法 L0）[a]	LC-MS（方法 L2-L5）	NMR 又は NMR ピークリスト
1-Q3	5.19		^{1}H-NMR(400.0MHz, d_6-DMSO):δ=9.100(11.2);8.521(2.9);8.516(3.1);8.501(3.1);8.496(3.3);7.983(1.5);7.965(4.5);7.945(9.0);7.941(6.3);7.928(1.8);7.756(2.9);7.752(3.4);7.736(3.6);7.732(3.8);7.504(2.2);7.485(5.2);7.465(3.5);7.434(4.1);7.431(4.7);7.415(2.5);7.412(2.4);4.454(2.4);4.436(7.3);4.418(7.3);4.400(2.5);3.321(80.5);2.891(0.5);2.731(0.5);2.672(1.1);2.502(195.0);2.329(1.1);2.075(1.2);1.387(7.9);1.369(16.0);1.351(7.7);0.146(0.4);0.000(90.1);-0.150(0.5)
1Q-13		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.43分；MS（ESIpos）：m/z = 340 [M+H]+	^{1}H-NMR（400MHz，DMSO-d6）：δ [ppm] = 9.13（s，1H），8.42（dd，1H），7.87 – 7.96（m，2H），7.20（s，2H），7.07（s，1H），4.44（q，2H），2.35（s，6H），1.38（t，3H）.
1U-5	2.40		^{1}H-NMR（400MHz，DMSO-d6）：δ [ppm] = 8.73（s，1H），8.35（d，1H），7.83（d，1H），7.72 – 7.69（t，1H），7.61 – 7.58（m，1H），7.24 – 7.22（m，1H），4.41 – 4.35（q，2H），3.09（s，6H），1.36（t，3H）.
1U-8	4.57		^{1}H-NMR(400.0MHz, d_6-DMSO):δ=8.857(1.9);8.703(3.6);8.425(0.7);8.409(0.8);8.401(0.8);8.386(0.7);8.305(0.4);8.290(0.5);8.281(0.5);8.266(0.5);7.967(2.0);7.961(2.1);7.687(0.8);7.664(1.2);7.647(0.5);7.641(0.8);7.626(0.5);7.623(0.5);7.603(0.4);7.586(2.0);7.580(2.0);5.758(5.2);4.420(0.4);4.403(1.3);4.391(0.8);4.385(1.4);4.374(2.3);4.367(0.6);4.356(2.3);4.338(0.7);3.326(10.9);3.094(16.0);3.071(9.4);2.514(7.9);2.509(15.9);2.505(21.1);2.500(15.4);2.496(7.6);1.382(1.4);1.364(3.0);1.357(2.6);1.346(1.6);1.339(5.3);1.321(2.4);1.299(0.5);1.269(0.5);0.008(0.8);0.000(20.5);-0.008(0.9)
1U-11	2.40		^{1}H-NMR(400.0MHz, d_6-DMSO):δ=8.730(3.6);8.348(1.0);8.345(0.9);8.327(1.1);7.828(0.9);7.813(1.3);7.725(1.0);7.707(1.0);7.704(1.0);7.686(0.7);7.607(0.4);7.601(0.4);7.594(0.4);7.586(0.4);7.581(0.4);7.243(0.5);7.233(0.4);7.221(0.5);4.40

			7(0.8);4.390(2.4);4.372(2.4);4.354(0.8);3.327(5.3);3.089(16.0);2.509(10.6);2.505(13.3);2.501(9.7);1.397(10.3);1.372(2.5);1.355(5.2);1.337(2.4);0.008(0.5);0.000(10.8);-0.009(0.5)
1U-13	5,19	LC-MS（方法 1）：R_t= 2.36 分；m/z = 431/433 $(M+H)^+$	^{1}H-NMR(400.0MHz, d_6-DMSO):δ=8.829(5.1);8.335(1.1);8.332(1.2);8.314(1.2);8.311(1.2);7.900(1.1);7.897(1.2);7.882(1.5);7.879(1.4);7.759(1.2);7.740(1.3);7.737(1.4);7.719(0.9);7.646(16.0);4.441(0.9);4.423(3.1);4.405(3.1);4.388(1.0);3.896(2.6);3.885(3.5);3.874(2.7);3.320(6.3);3.273(2.7);3.262(3.4);3.251(2.4);2.525(0.6);2.511(14.8);2.507(30.3);2.503(39.9);2.498(28.5);2.494(13.8);1.397(6.5);1.376(7.1);1.359(3.3);0.000(3.3)
1U-15	3,90	LC-MS（方法 1）：R_t= 2.17 分；m/z = 431/433 $(M+H)^+$	^{1}H-NMR(400.0MHz, d_6-DMSO):δ=8.726(8.4);8.345(1.6);8.337(1.6);8.327(1.7);8.320(1.8);7.768(0.8);7.751(3.0);7.740(3.4);7.733(6.7);7.723(1.0);7.713(2.2);7.709(2.3);7.693(2.5);7.689(2.5);7.468(1.8);7.448(3.6);7.429(2.2);7.369(2.7);7.366(2.8);7.350(1.9);7.347(1.7);4.427(1.5);4.409(4.8);4.391(4.9);4.373(1.6);3.899(4.4);3.887(8.0);3.876(4.6);3.321(37.8);3.293(2.5);3.282(5.5);3.270(5.3);3.259(2.2);3.239(0.6);2.671(0.4);2.506(61.9);2.502(81.2);2.498(60.0);2.329(0.5);1.397(16.0);1.380(5.5);1.362(11.1);1.344(5.2);0.008(2.2);0.000(45.4)
1R-1		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.16 分；MS (ESIpos)：m/z = 352 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：-0.008（1.29），0.008（1.20），1.760（0.44），2.329（0.64），2.367（0.44），2.524（2.38），2.671（0.63），2.711（0.43），3.601（0.50），7.654（1.72），7.660（4.30），7.664（6.77），7.669（16.00），7.673（7.64），7.804（1.91），7.823（3.49），7.843（3.22），7.887（3.53），7.890（3.71），7.904（2.79），8.354（3.04），8.357（3.11），8.375（2.85），8.378（2.73），8.907（6.32）.
1R-3		LC-MS（方法 L1）：R_t= 1.05 分；MS (ESIpos)：m/z = 352 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：1.175（0.47），1.356（0.45），1.989（0.90），2.074（8.95），2.329（0.81），2.369（0.60），2.671（0.95），2.711（0.65），2.865（0.47），3.092（0.78），7.362（0.70），7.381（1.05），7.409（6.34），7.427（11.32），7.462（7.73），7.481（11.58），7.500（5.55），7.530（1.06），7.550（0.60），7.585（0.87），7.693（1.21），7.728（9.06），7.747（7.85），7.895（5.45），7.911（13.10），7.923（10.39），7.943（10.33），7.961（4.26），7.992（0.98），8.009（0.69），8.448（0.92），8.485（8.46），8.505（8.03），9.072（16.00），9.141（1.24），14.022（0.91）.
1R-13		LC-MS（方法 L1）：	^{1}H-NMR（400 MHz，DMSO-d6）δ [ppm]：2.346（16.00），7.062（1.52），7.189（3.52），7.205（3.52），7.208（3.52），7.211（3.52），7.214（3.52），7.217（3.52），7.220（3.52），7.223（3.52），7.226（3.52），7.229（3.52），7.232（3.52），7.235（3.52），7.238（3.52），7.241（3.52），7.244（3.52），7.247（3.52），7.250（3.52），7.253（3.52），7.256（3.52），7.259（3.52），7.262（3.52），7.265（3.52），7.268（3.52），7.271（3.52），7.274（3.52），7.277（3.52），7.280（3.52），7.283（3.52），7.286（3.52），7.289（3.52），7.292（3.52），7.295（3.52），7.298（3.52），7.301（3.52），7.304（3.52），7.307（3.52），7.310（3.52），7.313（3.52），7.316（3.52），7.319（3.52），7.322（3.52），7.325（3.52），7.328（3.52），7.331（3.52），7.334（3.52），7.337（3.52），7.340（3.52），7.343（3.52），7.346（3.52），7.349（3.52），7.352（3.52），7.355（3.52），7.358（3.52），7.361（3.52），7.364（3.52），7.367（3.52），7.370（3.52），7.373（3.52），7.376（3.52），7.379（3.52），7.382（3.52），7.385（3.52），7.388（3.52），7.391（3.52），7.394（3.52），7.397（3.52），7.400（3.52），7.403（3.52），7.406（3.52），7.409（3.52），7.412（3.52），7.415（3.52），7.418（3.52），7.421（3.52），7.424（3.52），7.427（3.52），7.430（3.52），7.433（3.52），7.436（3.52），7.439（3.52），7.442（3.52），7.445（3.52），7.448（3.52），7.451（3.52），7.454（3.52），7.457（3.52），7.460（3.52），7.463（3.52），7.466（3.52），7.469（3.52），7.472（3.52），7.475（3.52），7.478（3.52），7.481（3.52），7.484（3.52），7.487（3.52），7.490（3.52），7.493（3.52），7.496（3.52），7.499（3.52），7.502（3.52），7.505（3.52），7.508（3.52），7.511（3.52），7.514（3.52），7.517（3.52），7.520（3.52），7.523（3.52），7.526（3.52），7.529（3.52），7.532（3.52），7.535（3.52），7.538（3.52），7.541（3.52），7.544（3.52），7.547（3.52），7.550（3.52），7.553（3.52），7.556（3.52），7.559（3.52），7.562（3.52），7.565（3.52），7.568（3.52），7.571（3.52），7.574（3.52），7.577（3.52），7.580（3.52），7.583（3.52），7.586（3.52），7.589（3.52），7.592（3.52），7.595（3.52），7.598（3.52），7.601（3.52），7.604（3.52），7.607（3.52），7.610（3.52），7.613（3.52），7.616（3.52），7.619（3.52），7.622（3.52），7.625（3.52），7.628（3.52），7.631（3.52），7.634（3.52），7.637（3.52），7.640（3.52），7.643（3.52），7.646（3.52），7.649（3.52），7.652（3.52），7.655（3.52），7.658（3.52），7.661（3.52），7.664（3.52），7.667（3.52），7.670（3.52），7.673（3.52），7.676（3.52），7.679（3.52），7.682（3.52），7.685（3.52），7.688（3.52），7.691（3.52），7.694（3.52），7.697（3.52），7.700（3.52），7.703（3.52），7.706（3.52），7.709（3.52），7.712（3.52），7.715（3.52），7.718（3.52），7.721（3.52），7.724（3.52），7.727（3.52），7.730（3.52），7.733（3.52），7.736（3.52），7.739（3.52），7.742（3.52），7.745（3.52），7.748（3.52），7.751（3.52），7.754（3.52），7.757（3.52），7.760（3.52），7.763（3.52），7.766（3.52），7.769（3.52），7.772（3.52），7.775（3.52），7.778（3.52），7.781（3.52），7.784（3.52），7.787（3.52），7.790（3.52），7.793（3.52），7.796（3.52），7.799（3.52），7.802（3.52），7.805（3.52），7.808（3.52），7.811（3.52），7.814（3.52），7.817（3.52），7.820（3.52），7.823（3.52），7.826（3.52），7.829（3.52），7.832（3.52），7.835（3.52），7.838（3.52），7.841（3.52），7.844（3.52），7.847（3.52），7.850（3.52），7.853（3.52），7.856（3.52），7.859（3.52），7.862（3.52），7.865（3.52），7.868（3.52），7.871（3.52），7.874（3.52），7.877（3.52），7.880（3.52），7.883（3.52），7.886（3.52），7.889（3.52），7.892（3.52），7.895（3.52），7.898（3.52），7.901（3.52），7.904（3.52），7.907（3.52），7.910（3.52），7.913（3.52），7.916（3.52），7.919（3.52），7.922（3.52），7.925（3.52），7.928（3.52），7.931（3.52），7.934（3.52），7.937（3.52），7.940（3.52），7.943（3.52），7.946（3.52），7.949（3.52），7.952（3.52），7.955（3.52），7.958（3.52），7.961（3.52），7.964（3.52），7.967（3.52），7.970（3.52），7.973（3.52），7.976（3.52），7.979（3.52），7.982（3.52），7.985（3.52），7.988（3.52），7.991（3.52），7.994（3.52），7.997（3.52），8.000（3.52），8.003（3.52），8.006（3.52），8.009（3.52），8.012（3.52），8.015（3.52），8.018（3.52），8.021（3.52），8.024（3.52），8.027（3.52），8.030（3.52），8.033（3.52），8.036（3.52），8.039（3.52），8.042（3.52），8.045（3.52），8.048（3.52），8.051（3.52），8.054（3.52），8.057（3.52），8.060（3.52），8.063（3.52），8.066（3.52），8.069（3.52），8.072（3.52），8.075（3.52），8.078（3.52），8.081（3.52），8.084（3.52），8.087（3.52），8.090（3.52），8.093（3.52），8.096（3.52），8.099（3.52），8.102（3.52），8.105（3.52），8.108（3.52），8.111（3.52），8.114（3.52），8.117（3.52），8.120（3.52），8.123（3.52），8.126（3.52），8.129（3.52），8.132（3.52），8.135（3.52），8.138（3.52），8.141（3.52），8.144（3.52），8.147（3.52），8.150（3.52），8.153（3.52），8.156（3.52），8.159（3.52），8.162（3.52），8.165（3.52），8.168（3.52），8.171（3.52），8.174（3.52），8.177（3.52），8.180（3.52），8.183（3.52），8.186（3.52），8.189（3.52），8.192（3.52），8.195（3.52），8.198（3.52），8.201（3.52），8.204（3.52），8.207（3.52），8.210（3.52），8.213（3.52），8.216（3.52），8.219（3.52），8.222（3.52），8.225（3.52），8.228（3.52），8.231（3.52），8.234（3.52），8.237（3.52），8.240（3.52），8.243（3.52），8.246（3.52），8.249（3.52），8.252（3.52），8.255（3.52），8.258（3.52），8.261（3.52），8.264（3.52），8.267（3.52），8.270（3.52），8.273（3.52），8.276（3.52），8.279（3.52），8.282（3.52），8.285（3.52），8.288（3.52），8.291（3.52），8.294（3.52），8.297（3.52），8.300（3.52），8.303（3.52），8.306（3.52），8.309（3.52），8.312（3.52），8.315（3.52），8.318（3.52），8.321（3.52），8.324（3.52），8.327（3.52），8.330（3.52），8.333（3.52），8.336（3.52），8.339（3.52），8.342（3.52），8.345（3.52），8.348（3.52），8.351（3.52），8.354（3.52），8.357（3.52），8.360（3.52），8.363（3.52），8.366（3.52），8.369（3.52），8.372（3.52），8.375（3.52），8.378（3.52），8.381（3.52），8.384（3.52），8.387（3.52），8.390（3.52），8.393（3.52），8.396（3.52），8.399（3.52），8.402（3.52），8.405（3.52），8.408（3.52），8.411（3.52），8.414（3.52），8.417（3.52），8.420（3.52），8.423（3.52），8.426（3.52），8.429（3.52），8.432（3.52），8.435（3.52），8.438（3.52），8.441（3.52），8.444（3.52），8.447（3.52），8.450（3.52），8.453（3.52），8.456（3.52），8.459（3.52），8.462（3.52），8.465（3.52），8.468（3.52），8.471（3.52），8.474（3.52），8.477（3.52），8.480（3.52），8.483（3.52），8.486（3.52），8.489（3.52），8.492（3.52），8.495（3.52），8.498（3.52），8.501（3.52），8.504（3.52），8.507（3.52），8.510（3.52），8.513（3.52），8.516（3.52），8.519（3.52），8.522（3.52），8.525（3.52），8.528（3.52），8.531（3.52），8.534（3.52），8.537（3.52），8.540（3.52），8.543（3.52），8.546（3.52），8.549（3.52），8.552（3.52），8.555（3.52），8.558（3.52），8.561（3.52），8.564（3.52），8.567（3.52），8.570（3.52），8.573（3.52），8.576（3.52），8.579（3.52），8.582（3.52），8.585（3.52），8.588（3.52），8.591（3.52），8.594（3.52），8.597（3.52），8.600（3.52），8.603（3.52），8.606（3.52），8.609（3.52），8.612（3.52），8.615（3.52），8.618（3.52），8.621（3.52），8.624（3.52），8.627（3.52），8.630（3.52），8.633（3.52），8.636（3.52），8.639（3.52），8.642（3.52），8.645（3.52），8.648（3.52），8.651（3.52），8.654（3.52），8.657（3.52），8.660（3.52），8.663（3.52），8.666（3.52），8.669（3.52），8.672（3.52），8.675（3.52），8.678（3.52），8.681（3.52），8.684（3.52），8.687（3.52），8.690（3.52），8.693（3.52），8.696（3.52），8.699（3.52），8.702（3.52），8.705（3.52），8.708（3.52），8.711（3.52），8.714（3.52），8.717（3.52），8.720（3.52），8.723（3.52），8.726（3.52），8.729（3.52），8.732（3.52），8.735（3.52），8.738（3.52），8.741（3.52），8.744（3.52），8.747（3.52），8.750（3.52），8.753（3.52），8.756（3.52），8.759（3.52），8.762（3.52），8.765（3.52），8.768（3.52），8.771（3.52），8.774（3.52），8.777（3.52），8.780（3.52），8.783（3.52），8.786（3.52），8.789（3.52），8.792（3.52），8.795（3.52），8.798（3.52），8.801（3.52），8.804（3.52），8.807（3.52），8.810（3.52），8.813（3.52），8.816（3.52），8.819（3.52），8.822（3.52），8.825（3.52），8.828（3.52），8.831（3.52），8.834（3.52），8.837（3.52），8.840（3.52），8.843（3.52），8.846（3.52），8.849（3.52），8.852（3.52），8.855（3.52），8.858（3.52），8.861（3.52），8.864（3.52），8.867（3.52），8.870（3.52），8.873（3.52），8.876（3.52），8.879（3.52），8.882（3.52），8.885（3.52），8.888（3.52），8.891（3.52），8.894（3.52），8.897（3.52），8.900（3.52），8.903（3.52），8.906（3.52），8.909（3.52），8.912（3.52），8.915（3.52），8.918（3.52），8.921（3.52），8.924（3.52），8.927（3.52），8.930（3.52），8.933（3.52），8.936（3.52），8.939（3.52），8.942（3.52），8.945（3.52），8.948（3.52），8.951（3.52），8.954（3.52），8.957（3.52），8.960（3.52），8.963（3.52），8.966（3.52），8.969（3.52），8.972（3.52），8.975（3.52），8.978（3.52），8.981（3.52），8.984（3.52），8.987（3.52），8.990（3.52），8.993（3.52），8.996（3.52），8.999（3.52），9.002（3.52），9.005（3.52），9.008（3.52），9.011（3.52），9.014（3.52），9.017（3.52），9.020（3.52），9.023（3.52），9.026（3.52），9.029（3.52），9.032（3.52），9.035（3.52），9.038（3.52），9.041（3.52），9.044（3.52），9.047（3.52），9.050（3.52），9.053（3.52），9.056（3.52），9.059（3.52），9.062（3.52），9.065（3.52），9.068（3.52），9.071（3.52），9.074（3.52），9.077（3.52），9.080（3.52），9.083（3.52），9.086（3.52），9.089（3.52），9.092（3.52），9.095（3.52），9.098（3.52），9.101（3.52），9.104（3.52），9.107（3.52），9.110（3.52），9.113（3.52），9.116（3.52），9.119（3.52），9.122（3.52），9.125（3.52），9.128（3.52），9.131（3.52），9.134（3.52），9.137（3.52），9.140（3.52），9.143（3.52），9.146（3.52），9.149（3.52），9.152（3.52），9.155（3.52），9.158（3.52），9.161（3.52），9.164（3.52），9.167（3.52），9.170（3.52），9.173（3.52），9.176（3.52），9.179（3.52），9.182（3.52），9.185（3.52），9.188（3.52），9.191（3.52），9.194（3.52），9.197（3.52），9.200（3.52），9.203（3.52），9.206（3.52），9.209（3.52），9.212（3.52），9.215（3.52），9.218（3.52），9.221（3.52），9.224（3.52），9.227（3.52），9.230（3.52），9.233（3.52），9.236（3.52），9.239（3.52），9.242（3.52），9.245（3.52），9.248（3.52），9.251（3.52），9.254（3.52），9.257（3.52），9.260（3.52），9.263（3.52），9.266（3.52），9.269（3.52），9.272（3.52），9.275（3.52），9.278（3.52），9.281（3.52），9.284（3.52），9.287（3.52），9.290（3.52），9.293（3.52），9.296（3.52），9.299（3.52），9.302（3.52），9.305（3.52），9.308（3.52），9.311（3.52），9.314（3.52），9.317（3.52），9.320（3.52），9.323（3.52），9.326（3.52），9.329（3.52），9.332（3.52），9.335（3.52），9.338（3.52），9.341（3.52），9.344（3.52），9.347（3.52），9.350（3.52），9.353（3.52），9.356（3.52），9.359（3.52），9.362（3.52），9.365（3.52），9.368（3.52），9.371（3.52），9.374（3.52），9.377（3.52），9.380（3.52），9.383（3.52），9.386（3.52），9.389（3.52），9.392（3.52），9.395（3.52），9.398（3.52），9.401（3.52），9.404（3.52），9.407（3.52），9.410（3.52），9.413（3.52），9.416（3.52），9.419（3.52），9.422（3.52），9.425（3.52），9.428（3.52），9.431（3.52），9.434（3.52），9.437（3.52），9.440（3.52），9.443（3.52），9.446（3.52），9.449（3.52），9.452（3.52），9.455（3.52），9.458（3.52），9.461（3.52），9.464（3.52），9.467（3.52），9.470（3.52），9.473（3.52），9.476（3.52），9.479（3.52），9.482（3.52），9.485（3.52），9.488（3.52），9.491（3.52），9.494（3.52），9.497（3.52），9.500（3.52），9.503（3.52），9.506（3.52），9.509（3.52），9.512（3.52），9.515（3.52），9.518（3.52），9.521（3.52），9.524（3.52），9.527（3.52），9.530（3.52），9.533（3.52），9.536（3.52），9.539（3.52），9.542（3.52），9.545（3.52），9.548（3.52），9.551（3.52），9.554（3.52），9.557（3.52），9.560（3.52），9.563（3.52），9.566（3.52），9.569（3.52），9.572（3.52），9.575（3.52），9.578（3.52），9.581（3.52），9.584（3.52），9.587（3.52），9.590（3.52），9.593（3.52），9.596（3.52），9.599（3.52），9.602（3.52），9.605（3.52），9.608（3.52），9.611（3.52），9.614（3.52），9.617（3.52），9.620（3.52），9.623（3.52），9.626（3.52），9.629（3.52），9.632（3.52），9.635（3.52），9.638（3.52），9.641（3.52），9.644（3.52），9.647（3.52），9.650（3.52），9.653（3.52），9.656（3.52），9.659（3.52），9.662（3.52），9.665（3.52），9.668（3.52），9.671（3.52），9.674（3.52），9.677（3.52），9.680（3.52），9.683（3.52），9.686（3.52），9.689（3.52），9.692（3.52），9.695（3.52），9.698（3.52），9.701（3.52），9.704（3.52），9.707（3.52），9.710（3.52），9.713（3.52），9.716（3.52），9.719（3.52），9.722（3.52），9.725（3.52），9.728（3.52），9.731（3.52），9.734（3.52），9.737（3.52），9.740（3.52），9.743（3.52），9.746（3.52），9.749（3.52），9.752（3.52），9.755（3.52），9.758（3.52），9.761（3.52），9.764（3.52），9.767（3.52），9.770（3.52），9.773（3.52），9.776（3.52），9.779（3.52），9.782（3.52），9.785（3.52），9.788（3.52），9.791（3.52），9.794（3.52），9.797（3.52），9.800（3.52），9.803（3.52），9.806（3.52），9.809（3.52），9.812（3.52），9.815（3.52），9.818（3.52），9.821（3.52），9.824（3.52），9.827（3.52），9.830（3.52），9.833（3.52），9.836（3.52），9.839（3.52），9.842（3.52），9.845（3.52），9.848（3.52），9.851（3.52），9.854（3.52），9.857（3.52），9.860（3.52），9.863（3.52），9.866（3.52），9.869（3.52），9.872（3.52），9.875（3.52），9.878（3.52），9.881（3.52），9.884（3.52），9.887（3.52），9.890（3.52），9.893（3.52），9.896（3.52），9.899（3.52），9.902（3.52），9.905（3.52），9.908（3.52），9.911（3.52），9.914（3.52），9.917（3.52），9.920（3.52），9.923（3.52），9.926（3.52），9.929（3.52），9.932（3.52），9.935（3.52），9.938（3.52），9.941（3.52），9.944（3.52），9.947（3.52），9.950（3.52），9.953（3.52），9.956（3.52），9.959（3.52），9.962（3.52），9.965（3.52），9.968（3.52），9.971（3.52），9.974（3.52），9.977（3.52），9.980（3.52），9.983（3.52），9.986（3.52），9.989（3.52），9.992（3.52），9.995（3.52），9.998（3.52），10.001（3.52），10.004（3.52），10.007（3.52），10.010（3.52），10.013（3.52），10.016（3.52），10.019（3.52），10.022（3.52），10.025（3.52），10.028（3.52），10.031（3.52），10.034（3.52），10.037（3.52），10.040（3.52），10.043（3.52），10.046（3.52），10.049（3.52），10.052（3.52），10.055（3.52），10.058（3.52），10.061（3.52），10.064（3.52），10.067（3.52），10.070（3.52），10.073（3.52），10.076（3.52），10.079（3.52），10.082（3.52），10.085（3.52），10.088（3.52），10.091（3.52），10.094（3.52），10.097（3.52），10.100（3.52），10.103（3.52），10.106（3.52），10.109（3.52），10.112（3.52），10.115（3.52），10.118（3.52），10.121（3.52），10.124（3.52），10.127（3.52），10.130（3.52），10.133（3.52），10.136（3.52），10.139（3.52），10.142（3.52），10.145（3.52），10.148（3.52），10.151（3.52），10.154（3.52），10.157（3.52），10.160（3.52），10.163（3.52），10.166（3.52），10.169（3.52），10.172（3.52），10.175（3.52），10.178（3.52），10.181（3.52），10.184（3.52），10.187（3.52），10.190（3.52），10.193（3.52），10.196（3.52），10.199（3.52），10.202（3.52），10.205（3.52），10.208（3.52），10.211（3.52），10.214（3.52），10.217（3.52），10.220（3.52），10.223（3.52），10.226（3.52），10.229（3.52），10.232（3.52），10.235（3.52），10.238（3.52），10.241（3.52），10.244（3.52），10.247（3.52），10.250（3.52），10.253（3.52），10.256（3.52），10.259（3.52），10.262（3.52），10.265（3.52），10.268（3.52），10.271（3.52），10.274（3.52），10.277（3.52），10.280（3.52），10.283（3.52），10.286（3.52），10.289（3.52），10.292（3.52），10.295（3.52），10.298（3.52），10.301（3.52），10.304（3.52），10.307（3.52），10.310（3.52），10.313（3.52），10.316（3.52），10.319（3.52），10.322（3.52），10.325（3.52），10.328（3.52），10.331（3.52），10.334（3.52），10.337（3.52），10.340（3.52），10.343（3.52），10.346（3.52），10.349（3.52），10.352（3.52），10.355（3.52），10.358（3.52），10.361（3.52），10.364（3.52），10.367（3.52），10.370（3.52），10.373（3.52），10.376（3.52），10.379（3.52），10.382（3.52），10.385（3.52），10.388（3.52），10.391（3.52），10.394（3.52），10.397（3.52），10.400（3.52），10.403（3.52），10.406（3.52），10.409（3.52），10.412（3.52），10.415（3.52），10.418（3.52），10.421（3.52），10.424（3.52），10.427（3.52），10.430（3.52），10.433（3.52），10.436（3.52），10.439（3.52），10.442（3.52），10.445（3.52），10.448（3.52），10.451（3.52），10.454（3.52），10.457（3.52），10.460（3.52），10.463（3.52），10.466（3.52），10.469（3.52），10.472（3.52），10.475（3.52），10.478（3.52），10.481（3.52），10.484（3.52），10.487（3.52），10.490（3.52），10.493（3.52），10.496（3.52），10.499（3.52），10.502（3.52），10.505（3.52），10.508（3.52），10.511（3.52），10.514（3.52），10.517（3.52），10.520（3.52），10.523（3.52），10.526（3.52），10.529（3.52），10.532（3.52），10.535（3.52），10.538（3.52），10.541（3.52），10.544（3.52），10.547（3.52），10.550（3.52），10.553（3.52），10.556（3.52），10.559（3.52），10.562（3.52），10.565（3.52），10.568（3.52），10.571（3.52），10.574（3.52），10.577（3.52），10.580（3.52），10.583（3.52），10.586（3.52），10.589（3.52），10.592（3.52），10.595（3.52），10.598（3.52），10.601（3.52），10.604（3.52），10.607（3.52），10.610（3.52），10.613（3.52），10.616（3.52），10.619（3.52），10.622（3.52），10.625（3.52），10.628（3.52），10.631（3.52），10.634（3.52），10.637（3.52），10.640（3.52），10.643（3.52），10.646（3.52），10.649（3.52），10.652（3.52），10.655（3.52），10.658（3.52），10.661（3.52），10.664（3.52），10.667（3.52），10.670（3.52），10.673（3.52），10.676（3.52），10.679（3.52），10.682（3.52），10.685（3.52），10.688（3.52），10.691（3.52），10.694（3.52），10.697（3.52），10.700（3.52），10.703（3.52），10.706（3.52），10.709（3.52），10.712（3.52），10.715（3.52），10.718（3.52），10.721（3.52），10.724（3.52），10.727（3.52），10.730（3.52），10.733（3.52），10.736（3.52），10.739（3.52），10.742（3.52），10.745（3.52），10.748（3.52），10.751（3.52），10.754（3.52），10.757（3.52），10.760（3.52），10.763（3.52），10.766（3.52），10.769（3.52），10.772（3.52），10.775（3.52），10.778（3.52），10.781（3.52），10.784（3.52），10.787（3.52），10.790（3.52），10.793（3.52），10.796（3.52），10.799（3.52），10.802（3.52），10.805（3.52），10.808（3.52），10.811（3.52），10.814（3.52），10.817（3.52），10.820（3.52），10.823（3.52），10.826（3.52），10.829（3.52），10.832（3.52），10.835（3.52），10.838（3.52），10.841（3.52），10.844（3.52），10.847（3.52），10.850（3.52），10.853（3.52），10.856（3.52），10.859（3.52），10.862（3.52），10.865（3.52），10.868（3.52），10.871（3.52），10.874（3.52），10.877（3.52），10.880（3.52），10.883（3.52），10.886（3.52），10.889（3.52），10.892（3.52），10.895（3.52），10.898（3.52），10.901（3.52），10.904（3.52），10.907（3.52），10.910（3.52），10.913（3.52），10.916（3.52），10.919（3.52），10.922（3.52），10.925（3.52），10.928（3.52），10.931（3.52），10.934（3.52），10.937（3.52），10.940（3.52），10.943（3.52），10.946（3.52），10.949（3.52），10.952（3.52），10.955（3.52），10.958（3.52），10.961（3.52），10.964（3.52），10.967（3.52），10.970（3.52），10.973（3.52），10.976（3.52），10.979（3.52），10.982（3.52），10.985（3.52），10.988（3.52），10.991（3.52），10.994（3.52），10.997（3.52），11.000（3.52），11.003（3.52），11.006（3.52），11.009（3.52），11.012（3.52），11.015（3.52），11.018（3.52），11.021（3.52），11.024（3.52），11.027（3.52），11.030（3.52），11.033（3.52），11.036（3.52），11.039（3.52），11.042（3.52），11.045（3.52），11.048（3.52），11.051（3.52），11.054（3.52），11.057（3.52），11.060（3.52），11.063（3.52），11.066（3.52），11.069（3.52），11.072（3.52），11.075（3.52），11.078（3.52），11.081（3.52），11.084（3.52），11.087（3.52），11.090（3.52），11.093（3.52），11.096（3.52），11.099（3.52），11.102（3.52），11.105（3.52），11.108（3.52），11.111（3.52），11.114（3.52），11.117（3.52），11.120（3.52），11.123（3.52），11.126（3.52），11.129（3.52），11.132（3.52），11.135（3.52），11.138（3.52），11.141（3.52），11.144（3.52），11.147（3.52），11.150（3.52），11.153（3.52），11.156（3.52），11.159（3.52），11.162（3.52），11.165（3.52），11.168（3.52），11.171（3.52），11.174（3.52），11.177（3.52），11.180（3.52），11.183（3.52），11.186（3.52），11.189（3.52），11.192（3.52），11.195（3.52），11.198（3.52），11.201（3.52），11.204（3.52），11.207（3.52），11.210（3.52），11.213（3.52），11.216（3.52），11.219（3.52），11.222（3.52），11.225（3.52），11.228（3.52），11.231（3.52），11.234（3.52），11.237（3.52），11.240（3.52），11.243（3.52），11.246（3.52），11.249（3.52），11.252（3.52），11.255（3.52），11.258（3.52），11.261（3.52），11.264（3.52），11.267（3.52），11.270（3.52），11.273（3.52），11.276（3.52），11.279（3.52），11.282（3.52），11.285（3.52），11.288（3.52），11.291（3.52），11.294（3.52），11.297（3.52），11.300（3.52），11.303（3.52），11.306（3.52），11.309（3.52），11.312（3.52），11.315（3.52），11.318（3.52），11.321（3.52），11.324（3.52），11.327（3.52），11.330（3.52），11.333（3.52），11.336（3.52），11.339（3.52），11.342（3.52），11.345（3.52），11.348（3.52），11.351（3.52），11.354（3.52），11.357（3.52），11.360（3.52），11.363（3.52），11.366（3.52），11.369（3.52），11.372（3.52），11.375（3.52），11.378（3.52），11.381（3.52），11.384（3.52），11.387（3.52），11.390（3.52），11.393（3.52），11.396（3.52），11.399（3.52），11.402（3.52），11.405（3.52），11.408（3.52），11.411（3.52），11.414（3.52），11.417（3.52），11.420（3.52），11.423（3.52），11.426（3.52），11.429（3.52），11.432（3.52），11.435（3.52），11.438（3.52），11.441（3.52），11.444（3.52），11.447（3.52），11.450（3.52），11.453（3.52），11.456（3.52），11.459（3.52），11.462（3.52），11.465（3.52），11.468（3.52），11.471（3.52），11.474（3.52），11.477（3.52），11.480（3.52），11.483（3.52），11.486（3.52），11.489（3.52），11.492（3.52），11.495（3.52），11.498（3.52），11.501（3.52），11.504（3.52），11.507（3.52），11.510（3.52），11.513（3.52），11.516（3.52），11.519（3.52），11.522（3.52），11.525（3.52），11.528（3.52），11.531（3.52），11.534（3.52），11.537（3.52），11.540（3.52），11.543（3.52），11.546（3.52），11.549（3.52），11.552（3.52），11.555（3.52），11.558（3.52），11.561（3.52），11.564（3.52），11.567（3.52），11.570（3.52），11.573（3.52），11.576（3.52），11.579（3.52），11.582（3.52），11.585（3.52），11.588（3.52），11.591（3.52），11.594（3.52），11.597（3.52），11.600（3.52），11.603（3.52），11.606（3.52），11.609（3.52），11.612（3.52），11.615（3.52），11.618（3.52），11.621（3.52），11.624（3.52），11.627（3.52），11.630（3.52），11.633（3.52），11.636（3.52），11.639（3.52），11.642（3.52），11.645（3.52），11.648（3.52），11.651（3.52），11.654（3.52），11.657（3.52），11.660（3.52），11.663（3.52），11.666（3.52），11.669（3.52），11.672（3.52），11.675（3.52），11.678（3.52），11.681（3.52），11.684（3.52），11.687（3.52），11.690（3.52），11.693（3.52），11.696（3.52），11.699（3.52），11.702（3.52），11.705（3.52），11.708（3.52），11.711（3.52），11.714（3.52），11.717（3.52），11.720（3.52），11.723（3.52），11.726（3.52），11.729（3.52），11.732（3.52），11.735（3.52），11.738（3.52），11.741（3.52），11.744（3.52），11.747（3.52），11.750（3.52），11.753（3.52），11.756（3.52），11.759（3.52），11.762（3.52），11.765（3.52），11.768（3.52），11.771（3.52），11.774（3.52），11.777（3.52），11.780（3.52），11.783（3.52），11.786（3.52），11.789（3.52），11.792（3.52），11.795（3.52），11.798（3.52），11.801（3.52），11.804（3.52），11.807（3.52），11.810（3.52），11.813（3.52），11.816（3.52），11.819（3.52），11.822（3.52），11.825（3.52），11.828（3.52），11.831（3.52），11.834（3.52），11.837（3.52），11.840（3.52），11.843（3.52），11.846（3.52），11.849（3.52），11.852（3.52），11.855（3.52），11.858（3.52），11.861（3.52），11.864（3.52），11.867（3.52），11.870（3.52），11.873（3.52），11.876（3.52），11.879（3.52），11.882（3.52），11.885（3.52），11.888（3.52），11.891（3.52），11.894（3.52），11.897（3.52），11.900（3.52），11.903（3.52），11.906（3.52），11.909（3.52），11.912（3.52），11.915（3.52），11.918（3.52），11.921（3.52），11.924（3.52），11.927（3.52），11.930（3.52），11.933（3.52），11.936（3.52），11.939（3.52），11.942（3.52），11.945（3.52），11.948（3.52），11.951（3.52），11.954（3.52），11.957（3.52），11.960（3.52），11.963（3.52），11.966（3.52），11.969（3.52），11.972（3.52），11.975（3.52），11.978（3.52），11.981（3.52），11.984（3.52），11.987（3.52），11.990（3.52），11.993（3.52），11.996（3.52），11.999（3.52），12.002（3.52），12.005（3.52），12.008（3.52），12.011（3.52），12.014（3.52），12.017（3.52），12.020（3.52），12.023（3.52），12.026（3.52），12.029（3.52），12.032（3.52），12.035（3.52），12.038（3.52），12.041（3.52），12.044（3.52），12.047（3.52），12.050（3.52），12.053（3.52），12.056（3.52），12.059（3.52），12.062（3.52），12.065（3.52），12.068（3.52），12.071（3.52），12.074（3.52），12.077（3.52），12.080（3.52），12.083（3.52），12.086（3.52），12.089（3.52），12.092（3.52），12.095（3.52），12.098（3.52），12.101（3.52），12.104（3.52），12.107（3.52），12.110（3.52），12.113（3.52），12.116（3.52），12.119（3.52），12.122（3.52），12.125（3.52），12.128（3.52），12.131（3.52），12.134（3.52），12.137（3.52），12.140（3.52），12.143（3.52），12.146（3.52），12.149（3.52），12.152（3.52），12.155（3.52），12.158（3.52），12.161（3.52），12.164（3.52），12.167（3.52），12.170（3.52），12.173（3.52），12.176（3.52），12.179（3.52），12.182（3.52），12.185（3.52），12.188（3.52），12.191（3.52），12.194（3.52），12.197（3.52），12.200（3.52），12.203（3.52），12.206（3.52），12.209（3.52），12.212（3.52），12.215（3.52），12.218（3.52），12.221（3.52），12.224（3.52），12.227（3.52），12.230（3.52），12.233（3.52），12.236（3.52），12.239（3.52），12.242（3.52），12.245（3.52），12.248（3.52），12.251（3.52），12.254（3.52），12.257（3.52），12.260（3.52），12.263（3.52），12.266（3.52），12.269（3.52），12.272（3.52），12.275（3.52），12.278（3.52），12.281（3.52），12.284（3.52），12.287（3.52），12.290（3.52），12.293（3.52），12.296（3.52），12.299（3.52），12.302（3.52），12.305（3.52），12.308（3.52），12.311（3.52），12.314（3.52），12.317（3.52），12.320（3.52），12.323（3.52），12.326（3.52），12.329（3.52），12.332（3.52），12.335（3.52），12.338（3.52），12.341（3.52），12.344（3.52），12.347（3.52），12.350（3.52），12.353（3.52），12.356（3.52），12.359（3.52），12.362（3.52），12.365（3.52），12.368（3.52），12.371（3.52），12.374（3.52），12.377（3.52），12.380（3.52），12.383（3.52），12.386（3.52），12.389（3.52），12.392（3.52），12.395（3.52），12.398（3.52），12.401（3.52），12.404（3.52），12.407（3.52），12.410（3.52），12.413（3.52），12.416（3.52），12.419（3.52），12.422（3.52），12.425（3.52），12.428（3.52），12.431（3.52），12.434（3.52），12.437（3.52），12.440（3.52），12.443（3.52），12.446（3.52），12.449（3.52），12.452（3.52），12.455（3.52），12.458（3.52），12.461（3.52），12.464（3.52），12.467（3.52），12.470（3.52），12.473（3.52），12.476（3.52），12.479（3.52），12.482（3.52），12.485（3.52），12.488（3.52），12.491（3.52），12.494（3.52），12.497（3.52），12.500（3.52），12.503（3.52），12.506（3.52），12.509（3.52），12.512（3.52），12.515（3.52），12.518（3.52），12.521（3.52），12.524（3.52），12.527（3.52），12.530（3.52），12.533（3.52），12.536

		R_t= 1.15 分; MS (ESIpos): m/z = 312 $[M+H]^+$	7.884 (1.52), 7.895 (1.68), 7.902 (3.49), 8.396 (0.99), 8.403 (0.92), 8.414 (0.88), 8.421 (0.87), 9.116 (2.83).
1W-8	2, 17		^{1}H-NMR (400.0MHz, d_6-DMSO): δ=8.717 (3.1); 8.422 (0.7); 8.406 (0.8); 8.399 (0.9); 8.383 (0.8); 7.965 (2.0); 7.960 (2.1); 7.823 (0.5); 7.815 (0.5); 7.809 (0.5); 7.796 (0.6); 7.783 (0.6); 7.675 (0.9); 7.652 (1.4); 7.630 (0.9); 7.586 (2.0); 7.580 (2.0); 7.502 (0.4); 7.478 (0.7); 7.466 (1.1); 7.385 (0.6); 7.344 (0.6); 6.579 (0.3); 3.328 (75.7); 3.106 (16.0); 3.077 (0.5); 2.671 (0.7); 2.549 (1.8); 2.503 (106.1); 2.339 (0.8); 2.329 (0.8); 2.324 (0.7); 1.271 (0.7); 1.170 (2.7); 0.146 (0.4); 0.000 (76.2); -0.150 (0.4)
1W-15	1, 86	LC-MS (方法 1): R_t= 1.78 分; m/z = 403/405 (M+H)+ [遊離塩基の質量]	^{1}H-NMR (400.0MHz, d_6-DMSO): δ=8.449 (15.5); 8.278 (3.9); 8.275 (4.0); 8.257 (4.4); 8.254 (4.3); 7.688 (4.2); 7.684 (4.3); 7.668 (5.2); 7.664 (5.0); 7.603 (3.0); 7.586 (4.8); 7.565 (4.2); 7.502 (5.2); 7.499 (5.4); 7.484 (3.9); 7.481 (3.6); 7.447 (3.6); 7.428 (7.2); 7.408 (4.5); 7.343 (5.4); 7.339 (5.5); 7.324 (4.0); 7.320 (3.6); 3.823 (9.2); 3.812 (16.0); 3.801 (9.9); 3.601 (0.4); 3.353 (665.1); 3.325 (9.0); 3.314 (7.9); 2.672 (0.7); 2.508 (106.3); 2.503 (137.7); 2.499 (101.0); 2.330 (0.8); 1.759 (0.5); 0.000 (19.5)
1-T1		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.73 分; MS (ESIpos): m/z = 426 $[M+H]^+$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.050 (16.00), 4.241 (0.59), 4.249 (0.48), 4.262 (0.64), 4.268 (0.76), 4.276 (0.62), 4.283 (0.49), 4.292 (0.50), 5.245 (0.56), 5.264 (0.55), 6.794 (0.98), 6.814 (1.10), 6.919 (0.49), 6.938 (1.05), 6.956 (0.61), 7.163 (0.52), 7.181 (0.86), 7.198 (0.40), 7.362 (0.91), 7.381 (0.84), 7.441 (0.75), 7.461 (1.18), 7.481 (0.82), 8.082 (1.07), 8.099 (1.02), 8.159 (1.09), 8.180 (1.03), 8.680 (3.34), 9.095 (0.82), 9.115 (0.80).
1-T5		LC-MS (方法 L1): R_t= 0.92 分; MS (ESIneg): m/z = 466 $[M-H]^-$	^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.41), -0.008 (4.42), 0.008 (3.18), 2.041 (0.54), 2.048 (0.76), 2.056 (1.13), 2.063 (1.19), 2.076 (1.30), 2.091 (1.80), 2.098 (1.57), 2.106 (1.11), 2.197 (0.74), 2.206 (1.17), 2.218 (1.70), 2.231 (1.59), 2.240 (1.58), 2.253 (1.13), 2.262 (0.74), 2.274 (0.52), 2.327 (0.60), 2.366 (0.49), 2.523 (2.30), 2.669 (0.66), 2.710 (0.48), 3.217 (0.69), 3.228 (1.18), 3.248 (4.71), 3.258 (11.00), 3.269 (11.28), 3.279 (5.00), 3.842 (8.92), 3.853 (14.13), 3.864 (8.07), 4.214 (0.80), 4.221 (1.01), 4.242 (2.68), 4.249 (2.03), 4.263 (2.41), 4.271 (2.08), 4.276 (2.00), 4.286 (2.44), 4.293

			(2.07), 4.302 (2.18), 4.314 (0.86), 4.321 (0.96), 4.329 (0.65), 5.245 (1.10), 5.259 (2.45), 5.279 (2.44), 5.292 (1.06), 6.797 (4.29), 6.815 (4.84), 6.927 (2.26), 6.929 (2.16), 6.946 (4.75), 6.964 (2.87), 7.164 (2.33), 7.167 (2.40), 7.185 (3.85), 7.202 (1.91), 7.206 (1.79), 7.385 (4.05), 7.403 (3.77), 7.499 (3.74), 7.518 (5.40), 7.538 (4.06), 8.123 (4.80), 8.125 (5.04), 8.142 (4.71), 8.144 (4.51), 8.197 (4.92), 8.199 (4.64), 8.218 (4.71), 8.753 (16.00), 9.177 (3.99), 9.197 (3.89).
			^{1}H-NMR (400.0MHz, d_6-DMSO) : δ =9.220 (2.1) ; 9.200 (2.1) ; 8.789 (9.2) ; 8.283 (1.8) ; 8.268 (1.9) ; 8.260 (2.0) ; 8.244 (1.9) ; 7.671 (2.0) ; 7.650 (2.6) ; 7.627 (1.8) ; 7.402 (2.0) ; 7.385 (2.2) ; 7.203 (1.1) ; 7.186 (2.2) ; 7.169 (1.3) ; 7.165 (1.3) ; 6.964 (1.6) ; 6.945 (2.6) ; 6.929 (1.3) ; 6.926 (1.2) ; 6.819 (2.9) ; 6.798 (2.7) ; 5.286 (0.6) ; 5.272 (1.3) ; 5.252 (1.3) ; 5.238 (0.6) ; 4.329 (0.4) ; 4.320 (0.5) ; 4.312 (0.5) ; 4.301 (1.1) ; 4.292 (1.1) ; 4.284 (1.3) ; 4.276 (1.0) ; 4.267 (1.1) ; 4.260 (1.3) ; 4.246 (1.1) ; 4.238 (1.4) ; 4.218 (0.5) ; 4.211 (0.5) ; 3.865 (4.4) ; 3.854 (7.4) ; 3.843 (4.7) ; 3.726 (3.9) ; 3.715 (4.8) ; 3.703 (4.1) ; 3.568 (16.0) ; 3.487 (0.4) ; 3.332 (12.7) ; 3.280 (4.6) ; 3.270 (7.3) ; 3.259 (6.7) ; 3.229 (1.2) ; 3.023 (3.6) ; 3.011 (4.6) ; 2.999 (3.4) ; 2.675 (0.7) ; 2.671 (0.9) ; 2.666 (0.7) ; 2.510 (61.4) ; 2.506 (124.6) ; 2.502 (165.2) ; 2.497 (119.8) ; 2.329 (1.0) ; 2.272 (0.4) ; 2.261 (0.5) ; 2.250 (0.6) ; 2.237 (0.9) ; 2.228 (0.9) ; 2.215 (1.0) ; 2.202 (0.7) ; 2.193 (0.4) ; 2.103 (0.6) ; 2.095 (0.8) ; 2.088 (1.0) ; 2.071 (0.8) ; 2.060 (0.7) ; 2.053 (0.6) ; 1.470 (0.4) ; 0.936 (0.4) ; 0.008 (1.0) ; 0.000 (24.6) ; −0.008 (1.1)
1−T7	2, 69		

【０７０４】

実験の部－生物アッセイ

実施例を、選択された生物アッセイで１回以上試験を行った。複数回試験を行った場合、データは平均値として、又はメジアンとして報告される。

【０７０５】

・算術平均値とも称される平均値は、得られた値の合計を試験回数によって割った値を表す。

【０７０６】

・メジアンは、昇順又は降順で順位付けした場合の値の群のメジアンを表す。データセ

ット中の値の数が奇数である場合、メジアンは中央値である。データセット中の値の数が偶数である場合、メジアンは二つの中央値の算術平均である。

【０７０７】

実施例は複数回合成した。複数回合成する場合、生物アッセイからのデータは、１以上の合成バッチの試験から得られたデータセットを用いて計算された平均値又はメジアン値を表す。

【０７０８】

本発明の化合物のイン・ビトロ活性は、下記のアッセイで示すことができる。

【０７０９】

イン・ビトロアッセイ１：組み換えＣ．エレガンス（Ｃ．　ｅｌｅｇａｎｓ）細胞系でのＣ．エレガンス（Ｃ．　ｅｌｅｇａｎｓ）Ｓｌｏ－１ａ－作用

安定なＣ．エレガンス（Ｃ．　ｅｌｅｇａｎｓ）ＣＨＯ細胞系の発生

ＣＨＯ細胞系を、ＡＴＣＣ、コードＡＴＣＣ　ＣＲＬ－９０９６から得た。プラスミドＤＮＡによるトランスフェクションによってＣ．エレガンス（Ｃ．　ｅｌｅｇａｎｓ）Ｓｌｏ－１ａ（寄託番号ＡＡＬ２８１０２）を発現させるため、ＣＨＯ細胞を４０％集密度まで継代培養してから、トランスフェクション溶液を細胞培養物に加えた。トランスフェクション溶液は、ＯｐｔｉＭＥＭ（Ｌｉｆｅ　Ｔｅｃｈｎｏｌｏｇｉｅｓ，　Ｎｒ．：３１９８５）３００μＬ、Ｃ．エレガンス（Ｃ．　ｅｌｅｇａｎｓ）Ｓｌｏ　１ａ遺伝子を含むプラスミドＤＮＡ　２μＬ（＝６μｇ）、及びＦｕｇｅｎｅＨＤ（Ｐｒｏｍｅｇａ，　Ｎｒ．：Ｅ２３１１）９μＬを含み、細胞に加えてから、３７℃、５％CO_2で４８時間インキュベートした。トランスフェクション培地を、追加のＧ４１８（２ｍｇ／ｍＬ、Ｉｎｖｉｔｒｏｇｅｎ，　Ｎｒ．：１０１３１）を含む選択培地に換え、細胞を３８４ウェルプレートに播種した（３００細胞／ウェル）。数週間後、残った生存細胞について、Ｋ＋チャンネル発現に関して電圧感受性色素（Ｍｅｍｂｒａｎｅ　Ｐｏｔｅｎｔｉａｌ　Ａｓｓａｙ　Ｋｉｔ、Ｍｏｌｅｃｕｌａｒ　Ｄｅｖｉｃｅｓ　Ｎｒ．：Ｒ８０３４）で調べた。陽性細胞クローンを、限定された希釈技術によって精製した。これに関しては、電圧感受性色素アッセイで最も高く且つ最も強いシグナルを有するクローンを、３８４ウェルプレートでさらにサブクローニング（インキュベート）して（０．７細胞／ウェル）、クローン純度を得た。これによって、Ｃ．エレガンス（Ｃ．　ｅｌｅｇａｎｓ）Ｓｌｏ－１ａを発現する最終の安定なＣＨＯ細胞系を得た。

【０７１０】

細胞培養条件

細胞を、１０％（体積）熱失活ウシ胎仔血清（Ｉｎｖｉｔｒｏｇｅｎ、Ｎｒ．：１０５００）、Ｇ４１８（1ｍｇ／ｍＬ、Ｉｎｖｉｔｒｏｇｅｎ、Ｎｒ．：１０１３１）を補充したＧｕｔａｍａｘ　Ｉを含むＭＥＭａｌｐｈａ（Ｉｎｖｉｔｒｏｇｅｎ、Ｎｒ．：３２５７１）で３７℃及び５％CO_2で培養した。細胞を、Ａｃｃｕｔａｓｅ（Ｓｉｇｍａ、Ｎｒ．：Ａ６９６４）を用いて剥離した。

【０７１１】

膜電位測定

実験化合物試験を、３８４ウェルマイクロタイタープレート（ＭＴＰｓ、Ｇｒｅｉｎｅｒ、Ｎｒ．：７８１０９２）で行った。８０００細胞／ウェルを３８４ウェルＭＴＰｓ上に蒔き、３７℃及び５％CO_2で２０～２４時間培養した。細胞培地除去後、細胞をタイロード液（１５０ｍＭ　ＮａＣｌ、０．３ｍＭ　ＫＣｌ、２ｍＭ　$CaCl_2$、１ｍＭ　$MgCl_2$、０．８ｍＭ　NaH_2PO_4、５ｍＭグルコース、２８ｍＭ　Ｈｅｐｅｓ、ｐＨ７．４）で１回洗浄し、次にタイロード液で希釈したＭｅｍｂｒａｎｅ　Ｐｏｔｅｎｔｉａｌ　Ａｓｓａｙ　Ｋｉｔの電圧感受性色素を加え室温で１時間経過させた。

【０７１２】

ＦＬＩＰＲ　Ｔｅｔｒａ（Ｍｏｌｅｃｕｌａｒ　Ｄｅｖｉｃｅｓ、Ｅｘｃ．５１０－５４５ｎｍ、Ｅｍｍ．５６５－６２５ｎｍ）を用いる蛍光の測定を開始した後、試験化合物を加え、次にＫＣｌタイロード液（最終アッセイ濃度：７０ｍＭ　ＫＣｌ、２ｍＭ　ＣａＣｌ

$_2$、１ｍＭ　ＭｇＣｌ$_2$、０．８ｍＭ　ＮａＨ$_2$ＰＯ$_4$、５ｍＭグルコース、２８ｍＭ　Ｈｅｐｅｓ、ｐＨ７．４、電圧感受性色素含有）を加えた。７分後に測定を行った。

【０７１３】

統計

曲線適合及び最大半減有効濃度（ＥＣ$_{50}$）の計算にＡｃｔｉｖｉｔｙＢａｓｅ　ＸＬｆｉｔソフトウェア（ＩＤＢＳ）を用いることでデータを評価し、負の１０を底とする対数（ｐＥ$_{50}$）として報告する。

【０７１４】

次の実施例：２７、２８、８５、８７、８８、１０９、１３１、１８２、１８３、２４３、３４５、３６１、３６３、４０２、４２４、４４０、５１０、５１１、５２１、５３４、５４７、５５５、５８０、５９２、５９９、６５６に関して、ｐＥ$_{50}$＞５．３～６．５が認められた。

【０７１５】

次の実施例：１、６２、６８、６９、７１、９５、１１４、１２０、１２２、１２５、１２９、１３６、１４８、１８５、２１６、２３０、２４１、２４２、２４６、２６４、２７６、２８９、２９９、３２４、３４６、３５４、３７２、３７９、３８９、３９０、３９９、４０１、４２４、４３２、４３９、４５６、４５９、４７４、５１２、５１３、５１４、５１９、５４６、５６０、５６８、５７８、５８１、５８４、６２５、６３２、６３４、６５４、６６５に関して、ｐＥ$_{50}$＞６．５～７．５が認められた。

【０７１６】

次の実施例：２、３、４、５、６、２３、５５、５８、６３、６４、６５、６６、７３、７４、９０、９３、９８、１０２、１１０、１１７、１１９、１２４、１２７、１２８、１４４、１４５、１４７、１５０、１５２、１５４、１５８、１５９、１６３、１７３、１８０、１８８、１９５、１９６、２０３、２０４、２１２、２１３、２１８、２１９、２２４、２２９、２３１、２３２、２３６、２４５、２５２、２５３、２５５、２５７、２５８、２５９、２６３、２６６、２６８、２６９、２７０、２７３、２８０、２８４、２８７、２８８、２９１、２９５、２９７、３０１、３０４、３０８、３１１、３１２、３１７、３１９、３２０、３２１、３２３、３２５、３４２、３４３、３４４、３４８、３６０、３７０、３７５、３７８、３８０、３８１、３８３、３８４、３８５、３８６、３９１、３９２、３９３、３９４、３９７、４０３、４０５、４１２、４２９、４３３、４３４、４４３、４４７、４５４、４５７、４５８、４６０、４６１、４６３、４６４、４６６、４７１、４７２、４７３、４７５、４７６、４８０、４８１、４８２、４８３、４８４、４８６、４９３、４９４、４９５、４９９、５００、５０１、５０２、５０３、５０７、５０８、５０９、５１５、５１７、５１８、５２２、５２３、５２４、５２５、５２６、５２７、５２８、５２９、５３０、５３１、５３２、５３３、５３５、５３６、５３７、５３８、５４１、５４５、５５０、５５１、５５９、５６１、５６２、５６３、５６６、５６７、５６９、５７０、５７１、５７２、５７３、５７４、５７５、５７７、５７９、５８５、５９０、５９３、５９５、５９７、６０２、６１５、６１９、６２０、６２１、６２２、６２３、６２６、６３０、６３３、６３５、６４０、６４３、６６１に関して、ｐＥ$_{50}$＞７．５～８．５が認められた。

【０７１７】

次の実施例：７、８、９、１０、１１、１２、１３、１４、１５、１６、１７、１８、１９、２０、２１、２２、２４、２５、２６、２９、３０、３１、３２、３３、３４、３５、３６、３７、３９、４０、４１，４２、４３、４４、４５、４６、４７、４８、４９、５０、５１、５２、５３、５４、５６、５７、６０、６１、７０、７２、７５、７６、７７、８０、８１、８２、８３、８９、１００、１０１、１０８、１１２、１１５、１２１、１３０、１３２、１３３、１３４、１３５、１３７、１３８、１３９、１４０、１４１、１４２、１４３、１４６、１５１、１５３、１５５、１５６、１５７、１６０、１６１、１６２、１６４、１６５、１６６、１６７、１６８、１６９、１７０、１７１、１７２、１７４、１７５、１７６、１７７、１７８、１７９、１８１、１８４、１８６、１８

７、１８９、１９０、１９１、１９２、１９３、１９４、１９７、２００、２０１、２０５、２０６、２０７、２０８、２０９、２１０、２１１、２１４、２１５、２１７、２２０、２２１、２２２、２２３、２２５、２２６、２２７、２２８、２３３、２３４、２３５、２３７、２３８、２３９、２４０、２４４、２４７、２４８、２４９、２５０、２５１、２５４、２５６、２６０、２６１、２６２、２６５、２６７、２７１、２７２、２７４、２７５、２７７、２７８、２７９、２８１、２８２、２８３、２９０、２９２、２９３、２９４、２９６、２９８、３００、３０２、３０５、３０７、３０９、３１０、３１３，３１４、３１５、３１６、３１８、３２２、３２６、３２７、３２８、３２９、３３０、３３１、３３２、３３３、３３４、３３５、３３８、３３９、３４０、３４１、３４９、３５０、３５１、３５２、３５３、３５５、３５６、３５７、３５８、３５９、３６２、３６４、３６５、３６６、３６７、３６８、３６９、３７１、３７３、３７４、３７６、３７７、３８２、３８７、３８８、３９５、３９６、３９８、４００、４０４、４０６、４０７、４０８、４０９、４１０、４１１、４１３、４１４、４１５、４１６、４１７、４１８、４１９、４２０、４２１、４２２、４２３、４２５、４２６、４２７、４２８、４２９、４３０、４３１、４３５、４３６、４３７、４３８、４４１、４４２、４４４、４４５、４４６、４４８、４４９、４５０、４５１、４５２、４５３、４５５、４６２、４６５、４６７、４６８、４６９、４７０、４７７、４７８、４７９、４８５、４８７、４８８、４８９、４９０、４９１、４９２、４９６、４９７、４９８、５０４、５０５、５０６、５１６、５１７、５２０、５３９、５４０、５４２、５４３、５４４、５４８、５４９、５５２、５５３、５５４、５５６、５５７、５５８、５６４、５６５、５７６、５８２、５８３、５８６、５８７、５８８、５８９、５９１、５９４、５９６、５９８、６００、６０１、６０３、６０４、６０５、６０６、６０７、６０８、６０９、６１０、６１１、６１２、６１３、６１４、６１６、６１７、６１８、６２４、６２７、６２８、６２９、６３１、６３６、６３７、６３８、６３９、６４１、６４２、６４４、６４５、６４６、６４７、６４８、６４９、６５０、６５１、６５２、６５３、６５５、６５７、６５８、６５９、６６０、６６２、６６３、６６４、６６６に関して、ｐＥ$_{５０}$＞８．５が認められた。

【０７１８】

<u>イン・ビトロアッセイ２：ニッポストロンギルス・ブラシリエンシス（Ｎｉｐｐｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ ｂｒａｓｉｌｉｅｎｓｉｓ）（ＮＩＰＯＢＲ）</u>

ニッポストロンギルス・ブラシリエンシス（Ｎｉｐｐｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ ｂｒａｓｉｌｉｅｎｓｉｓ）成虫を、１００Ｕ／ｍＬのペニシリン、０．１ｍｇ／ｍＬのストレプトマイシン及び２．５μｇ／ｍＬのアンホテリシンＢを含む生理食塩水緩衝液で洗浄した。被験化合物をＤＭＳＯに溶かし、蠕虫を１０μｇ／ｍＬ（１０ｐｐｍ）それぞれ１μｇ／ｍＬ（１ｐｐｍ）の最終濃度の培地中でインキュベートした。その培地の小分け分を用いて、陰性対照と比較して、アセチルコリンエステラーゼ活性を測定した。駆虫薬活性に関する読み出し値としてアセチルコリンエステラーゼを測定する原理は、Ｒａｐｓｏｎ ｅｔ ａｌ （１９８６）及びＲａｐｓｏｎ ｅｔ ａｌ （１９８７）に記載されている。

【０７１９】

次の実施例：８、９、１１、１２、１３、１５、１６、１７、１８、１９、２０、２１、２２、２３、２４、２５、２６、２９、３１、３２、３３、３４、３５、３６、３７、３９、４０、４１、４２、４３、４４、４５、４６、４７、４８、４９、５０、５１、５２、５３、５４、５７、５８、５９、６０、６１、６２、６４、６５、６６、６７、６９、７０、７１、７２、７３、７４、７５、７６、７７、７８、８１、８２、８３、８７、８９、９５、１００、１０１、１０４、１０８、１１２、１１５、１１６、１１９、１２２、１２３、１２７、１２８、１３０、１３２、１３３、１３４、１３５、１３６、１３７、１３８、１３９、１４１、１４２、１４３、１４４、１４６、１４７、１４８、３３３、３３４、３３６、３３８、３３９、３４０、３４１、３４９、３６２、３６３、３６４、３７３、６０９、６１０、６１１、６１２、６１３、６１４、６１５、６１７、６１８、６１９、６２０、６２３、６３０に関して、活性（陰性対照と比較したＡＣｈＥの低

減）は、１０μｇ／ｍＬで８０％より高かった。

【０７２０】

次の実施例：８、９、１２、１３、１５、１６、１７、１８、１９、２０、２１、２２、２３、２４、２５、２６、２９、３１、３２、３３、３４、３５、３６、３７、３９、４０、４１、４２、４３、４４、４５、４６、４７、４８、４９、５０、５１、５２、５３、５４、５７、５８、６０、６１、６５、６７、６９、７０、７３、７４、７５、７６、７７、８０、８１、８２、８３、８４、８９、９２、９３、９５、１００、１０１、１０８、１１２、１１４、１１５、１１６、１１７、１１８、１１９、１２２、１２４、１２５、１２６、１２７、１２８、１２９、１３０、１３２、１３３、１３４、１３５、１３６、１３７、１３８、１３９、１４２、１４３、１４４、１４６、１４９、１５０、１５１、１５２、１５３、１５４、１５５、１５６、１５７、１５８、１６０、１６１、１６２、１６３、１６５、１６６、１６７、１６８、１６９、１７０、１７１、１７２、１７６、１７８、１８１、１８２、１８５、１８６、１８７、１８９、１９０、１９１、１９２、１９３、１９４、１９５、１９７、１９８、２００、２０１、２０３、２０４、２０５、２０６、２０７、２０８、２０９、２１０、２１１、２１２、２１４、２１５、２１７、２１８、２２０、２２１、２２２、２２３、２２４、２２５、２２６、２２７、２２８、２２９、２３１、２３２、２３３、２３４、２３５、２３６、２３７、２３８、２３９、２４０、２４７、２４９、２５０、２５１、２５４、２５６、２５７、２６０、２６１、２６２、２６３、２６５、２６６、２６８、２７１、２７２、２７３、２７４、２７５、２７６、２７７、２７９、２８０、２８１、２８２、２８３、２８４、２８５、２８７、２８８、２８９、２９０、２９１、２９２、２９３、２９４、３０１、３０２、３０７、３０８、３０９、３１０、３１１、３１３、３１４、３１５、３１８、３１９、３２１、３２２、３２６、３２７、３２８、３２９、３３０、３３１、３３２、３３３、３３４、３３６、３３８、３３９、３４０、３４１、３４２、３４７、３４９、３５０、３５２、３５３、３５５、３５６、３５７、３５８、３５９、３６０、３６２、３６４、３６５、３６７、３６９、３７０、３７３、３７４、３７５、３７７、３８２、３８４、３８５、３８６、３８８、３９２、３９４、３９５、３９６、３９７、４００、４０３、４０４、４０６、４０７、４０８、４０９、４１０、４１１、４１３、４１４、４１５、４１７、４１８、４１９、４２０、４２１、４２２、４２４、４２５、４２６、４２７、４２８、４２９、４３０、４３１、４３２、４３３、４３４、４３５、４３６、４３７、４４１、４４３、４４４、４４５、４４６、４４７、４４８、４４９、４５０、４５１、４５２、４５３、４５４、４５５、４５８、４６０、４６１、４６２、４６３、４６４、４６５、４６６、４６７、４６８、４６９、４７０、４７１、４７２、４７３、４７６、４７７、４７８、４７９、４８２、４８５、４８６、４８７、４８８、４９０、４９１、４９２、４９５、４９６、４９７、４９８、４９９、５００、５０１、５０４、５０５、５０６、５０７、５０８、５０９、５１６、５１７、５２０、５２７、５２８、５２９、５３０、５３１、５３２、５３３、５３５、５３６、５３７、５３８、５４０、５４１、５４２、５４３、５４４、５４５、５４８、５４９、５５０、５５１、５５２、５５３、５５４、５５６、５５７、５５８、５６１、５６２、５６３、５６４、５６５、５６６、５６９、５７０、５７１、５７２、５７３、５７４、５７５、５７６、５７７、５７８、５７９、５８１、５８２、５８３、５８５、５８６、５８７、５８８、５９０、５９４、５９６、５９７、５９８、６０１、６０２、６０３、６０４、６０５、６０６、６０７、６０８、６０９、６１０、６１１、６１２、６１３、６１４、６１５、６１７、６１８、６１９、６２０、６２３、６２４、６２６、６２７、６２８、６２９、６３１、６３２、６３３、６３４、６３５、６３６、６３７、６３８、６３９、６４０、６４１、６４２、６４５、６４６、６４７、６４８、６４９、６５０、６５１、６５２、６５３、６５５、６５７、６５８、６６０に関して、活性（陰性対照と比較したＡＣｈＥの低減）は、１μｇ／ｍＬで８０％より高かった。

【０７２１】

<u>イン・ビトロアッセイ３：ディロフィラリア・イミチス（Ｄｉｒｏｆｉｌａｒｉａ　ｉｍ</u>

ｍｉｔｉｓ）ミクロフィラリア（ＤＩＲＯＩＭ　Ｌ１）

血液から精製したばかりの≧２５０ディロフィラリア・イミチス（Ｄｉｒｏｆｉｌａｒｉａ　ｉｍｍｉｔｉｓ）ミクロフィラリアを、栄養培地及びＤＭＳＯ中の試験化合物を含むマイクロタイタープレートのウェルに加えた。化合物について、二連で、濃度－応答アッセイで試験を行った。ＤＭＳＯに曝露した幼虫及び試験化合物無しを陰性対照として用いた。化合物とのインキュベーション７２時間後に、幼虫を評価した。陰性対照と比較した運動性の低下として、効力を求めた。広い濃度範囲の評価に基づいて、濃度－応答曲線並びにEC_{50}値を計算した。

【０７２２】

次の実施例：１、４、５、６、７、８、９、１０、１２、１３、１５、１６、１７、２２、２３、２４、２５、２６、２９、３０、３１、３２、３３、３４、３５、３６、３７、３９、４０、４１、４２、４３、４４、４５、４６、４７、４８、５０、５１、５２、５３、５４、５６、５７、５８、６０、６１、６４、６５、６９、７３、７４、７６、７７、８０、８１、８２、８３、８４、８９、１０１、１０３、１０８、１１１、１１２、１１５、１１７、１１９、１２４、１２５、１２７、１２８、１２９、１３０、１３２、１３３、１３４、１３８、１３９、１４０、１４１、１４２、１４３、１４４、１４５、１４６、１４７、１５０、１５１、１５２、１５３、１５４、１５５、１５６、１５７、１５８、１５９、１６０、１６１、１６２、１６３、１６４、１６５、１６６、１６７、１６８、１６９、１７０、１７１、１７２、１７３、１７４、１７５、１７６、１７７、１７８、１７９、１８０、１８１、１８５、１８６、１８７、１８８、１８９、１９０、１９１、１９２、１９４、１９６、１９７、２００、２０１、２０３、２０４、２０５、２０６、２０７、２０８、２０９、２１０、２１１、２１２、２１４、２１５、２１７、２１８、２１９、２２０、２２１、２２２、２２３、２２４、２２５、２２６、２２７、２２８、２２９、２３１、２３２、２３３、２３４、２３５、２３６、２３７、２３８、２３９、２４０、２４４、２４７、２４８、２４９、２５０、２５１、２５３、２５５、２５６、２５７、２５８、２５９、２６０、２６１、２６２、２６５、２６６、２６７、２６８、２６９、２７０、２７１、２７２、２７３、２７４、２７５、２７６、２７７、２７８、２７９、２８０、２８１、２８３、２９０、２９２、２９３、２９６、３００、３０３、３０４、３０５、３０６、３０７、３０８、３０９、３１０、３１１、３１２、３１３、３１４、３１５、３１７、３１９、３２２、３２６、３２７、３２９、３３０、３３１、３３２、３３３、３３４、３３８、３３９、３４０、３４０、３４１、３４２、３４４、３５０、３５１、３５２、３５３、３５５、３５６，３５７、３５８、３５９、３６０、３６２、３６４、３６５、３６６、３６７、３６８、３６９、３７３、３７４、３７５、３７６、３７７、３８１、３８２、３８３、３８４、３８５、３８６、３８８、３９０、３９１、３９２、３９４、３９５、３９６、４００、４０３、４０４、４０５、４０６、４０７、４０８、４０９、４１０、４１１、４１３、４１４、４１５、４１７、４１８、４１９、４２０、４２１、４２２、４２３、４２５、４２６、４２７、４２８、４２９、４３０、４３１、４３３、４３４、４３５、４３６、４３７、４３８、４４１、４４２、４４３、４４４、４４５、４４６、４４７、４４８、４４９、４５０、４５１、４５２、４５３、４５４、４５５、４５７、４５８、４５９、４６０、４６１、４６２、４６３、４６４、４６５、４６６、４６７、４６８、４６９、４７０、４７１、４７２、４７３、４７４、４７５、４７６、４７７、４７８、４７９、４８０、４８２、４８３、４８５、４８６、４８７、４８８、４９０、４９１、４９２、４９３、４９５、４９７、４９８、４９９、５００、５０１、５０３、５０４、５０５、５０６、５０７，５０８、５０９、５１６、５１７、５２１、５２２、５２３、５２４、５２５、５２７、５２８、５２９、５３０、５３１、５３２、５３３、５３６、５３７、５３８、５３９、５４０、５４１、５４２、５４３、５４４、５４５、５４６、５４７、５４８、５４９、５５０、５５１、５５２、５５３、５５４、５５６、５５７、５５８、５５９、５６０、５６１、５６２、５６３、５６４、５６５、５６６、５６７、５６８、５６９、５７０、５７１、５７２、５７３、５７４、５７５、５７６、５７７、５７８、５７９、５８１、５８２、

５８３、５８４、５８６、５８７、５８８、５８９、５９０、，５９１，５９４、５９６、５９７、５９８、６００、６０１、６０２、６０３、６０４、６０５、６０６、６０７、６０８、６０９、６１０、６１１、６１２、６１３、６１４、６１５、６１６、６１７、６１８、６１９、６２０、６２２、６２３，６２４，６２６，６２７、６２８、６２９、６３２、６３３、６３４、６３５、６３６、６３８、６３９、６４１、６４２、６４５、６４６、６４７、６４８、６４９、６５０、６５１、６５２、６５３、６５５、６５７、６５８、６６０に関して、ＥＣ$_{50}$が＜０．１ｐｐｍであった。

【０７２３】

次の実施例：３、１１、１９、４９、５５、６２、６３、６６、６７、７０、７１、７２、７５、８６、９０、９３、９４、９５、９９－１、１００、１０２、１０４、１０５、１１６、１３５、１３６、１３７、１４８、１８２、１８３、１８４、１９３、１９５、１９９、２１３、２１６、２３０、２４１、２４２、２４３、２４５、２４６、２５２、２５４、２６３、２８２、２８８、２８９、２９１、２９２、２９４、２９５、２９９、３１６、３２０、３２１、３２３、３２５、３４３、３４５、３４８、３５４、３６１、３７０、３７１、３７２、３７３、３７８、３７９、３８０、４０１、４１６、４２４、４４０、４５６、５８０、５８５、６２１、６３０、６５４に関して、ＥＣ$_{50}$が＜１ｐｐｍであった。

【０７２４】

次の実施例：２、９、１３、１４、１８、２０、２１、２７、２８、５９、６７、６８、７８、８７、８８、９１、９２、９６、９９－２、１０６、１１３、１１４、１１８、１２０、１２２、１２３、１２６、１３１、１４９、１９８、２０２、２６４、２８４、２８５、２８６、２８７、２８８、３０１、３０２、３１８、３２４、３２８、３３５、３３６、３３７、３４６３４７、３４９、３６３、３８７、３８９、３９３、３９７、３９８、３９９、４０２、４１２、４３２、４３９、４８１、４８４、４８５、４８９、４９１、４９２、４９４、５１０、５１１、５１２、５１３、５１４、５１５、５１８、５１９、５２０、５２６、５３４、５３５、５５５、５９５、５９９、６２５、６３１、６３７、６４０、６４３、６４４、６５６、６５９に関して、ＥＣ$_{50}$が＜１０ｐｐｍであった。

【０７２５】

<u>イン・ビトロアッセイ４：ディロフィラリア・イミチス（Ｄｉｒｏｆｉｌａｒｉａ ｉｍｍｉｔｉｓ）（ＤＩＲＯＩＭ Ｌ４）</u>

ベクター（中間宿主）から単離したばかりのディロフィラリア・イミチス（Ｄｉｒｏｆｉｌａｒｉａ ｉｍｍｉｔｉｓ）第３期幼虫１０匹を、栄養培地及びＤＭＳＯ中の試験化合物を含むマイクロタイタープレートのウェルに加えた。化合物について、二連で、濃度－応答アッセイで試験を行った。ＤＭＳＯに曝露した幼虫及び試験化合物無しを陰性対照として用いた。化合物とのインキュベーション７２時間後に、幼虫を評価した。これらの７２時間インキュベーション中に、陰性対照の幼虫の大半が脱皮して第４期幼虫となった。陰性対照と比較した運動性の低下として、効力を求めた。広い濃度範囲の評価に基づいて、濃度－応答曲線並びにＥＣ$_{50}$値を計算した。

【０７２６】

次の実施例：７、８、９、１０、１１、１２、１３、１５、１６、１７、１８、１９、２１、２２、２３、２４、２５、２６、２９、３０、３１、３２、３３、３４、３５、３６、３７、３９、４０、４１、４２、４３、４４、４５、４６、４７、４８、４９、５０、５１、５２、５３、５４、５５、５６、５７、５８、５９、６０、６１、６２、６３、６４、６５、６６、６９、７３、７４、７５、７６、７７、８１、８２、８３、８９、１０１、１０８、１１２、１１７、１１９、１２４、１２５、１２７、１３０、１３２、１３３、１３４、１３８、１３９、１４０、１４１、１４２、１４３、１４４、１４６、１５１、１５２、１５３、１５４、１５５、１５６、１５７、１５８、１５９、１６０、１６１、１６２、１６３、１６４、１６５、１６６、１６７、１６８、１６９、１７０、１７１、１７２、１７４、１７５、１７６、１７７、１７８、１７９、１８１、１８６、１

９０、１９１、１９２、１９４、１９６、１９７、２００、２０３、２０４、２０５、２０６、２０７、２０８、２０９、２１０、２１１、２１２、２１４、２１５、２１７、２１８、２２０、２２１、２２２、２２３、２２４、２２５、２２６、２２７、２２８、２２９、２３１、２３２、２３３、２３４、２３５、２３６、２３７、２３８、２３９、２４０、２４７、２４８、２４９、２５０、２５１、２５３、２５６、２５７、２５８、２５９、２６０、２６１、２６２、２６５、２６７、２６８、２７１、２７２、２７５、２７７、２７８、２７９、２８０、２８１、２８３、２９０、３００、３０４、３０９、３１０、３１３、３１４、３１５、３１９、３２２、３２６、３２７、３３０、３３１、３３２、３３３、３３４、３３６、３３８、３３９、３４０、３４１、３５０、３５１、３５２、３５３、３５５、３５６、３５７、３５８、３５９、３６０、３６２、３６５、３６６、３６７、３７４、３７６、３７７、３８２、３８４、３８５、３８６、３８８、３９０、３９２、３９４、３９５、３９６、４００、４０３、４０４、４０５、４０６、４０７、４０８、４０９、４１０、４１１、４１３、４１４、４１５、４１７、４１８、４１９、４２０、４２１、４２２、４２３、４２５、４２６、４２７、４２９、４３０、４３１、４３３、４３４、４３６、４３７、４３８、４４１、４４２、４４３、４４４、４４６、４４７、４４８、４４９、４５０、４５１、４５２、４５３、４５４、４５５、４５７、４６２、４６３、４６５、４６６、４６７、４６８、４６９、４７０、４７６、４７７、４７８、４７９、４８０、４８２、４８５、４８６、４８７、４８８、４９０、４９１、４９２、４９３、４９５、４９６、４９７、４９８、４９９、５０４、５０５、５０６、５０７、５１６、５１７、５２３、５２５、５２７、５２８、５２９、５３０、５３１、５３２、５３３、５３６、５３７、５３８、５３９、５４０、５４１、５４２、５４３、５４４、５４５、５４８、５４９、５５０、５５１、５５２、５５３、５５４、５５６、５５７、５５８、５５９、５６１、５６２、５６３、５６４、５６５、５６６、５６７、５６８、５７０、５７１、５７２、５７３、５７５、５７６、５７７、５７８、５７９、５８２、５８３、５８４、５８７、５８９、５９０、５９１、５９６、５９７、６００、６０２、６０３、６０４、６０５、６０６、６０７、６０８、６０９、６１０、６１１、６１２、６１３、６１４、６１５、６１７、６１８、６１９、６２８、６２９、６３５、６３８、６６０に関して、ＥＣ$_{50}$が＜０．１ｐｐｍであった。．

次の実施例：１、２、３、１４、２０、５４、８０、１１５、１５０、２０１、２４４、２６６、３６４、３７３に関して、ＥＣ$_{50}$が＜１ｐｐｍであった。

【０７２７】

次の実施例：１３３、１８７に関して、ＥＣ$_{50}$が＜１０ｐｐｍであった。

【０７２８】

<u>イン・ビトロアッセイ５：リトモソイデス・シグモドンチス（Ｌｉｔｏｍｏｓｏｉｄｅｓ ｓｉｇｍｏｄｏｎｔｉｓ）（ＬＴＭＯＳＩ Ｌ３）</u>

感染齧歯類の胸腔から単離したばかりのリトモソイデス・シグモドンチス（Ｌｉｔｏｍｏｓｏｉｄｅｓ ｓｉｇｍｏｄｏｎｔｉｓ）第３期幼虫１０匹を、栄養培地及びＤＭＳＯ中の試験化合物を含むマイクロタイタープレートのウェルに加えた。化合物について、二連で、濃度－応答アッセイで試験を行った。ＤＭＳＯに曝露した幼虫及び試験化合物無しを陰性対照として用いた。化合物とのインキュベーション７２時間後に、幼虫を評価した。陰性対照と比較した運動性の低下として、効力を求めた。広い濃度範囲の評価に基づいて、濃度－応答曲線並びにＥＣ$_{50}$値を計算した。

【０７２９】

次の実施例：８、９、１０、１２、１３、１６、１７、１８、１９、２０、２１、２２、２３、２４、２５、２９、３２、３３、３４、３５、３６、３７、４５、４６、４８、５２、５３、５４、７４、７６、７７、１１２、１３３、１３４、１４１、１４３、３３９、３４１、３５０、３７６、３８２、３８４、３８５、３８６、３９４、３９５、３９６に関して、ＥＣ$_{50}$が＜０．１ｐｐｍであった。

【０７３０】

次の実施例：３、１５、４４、７３、３７３に関して、ＥＣ$_{50}$が＜１ｐｐｍであった。

【０７３１】

インビトロアッセイ６：クーペリア・クルチセイ（Ｃｏｏｐｅｒｉａ ｃｕｒｔｉｃｅｉ）（ＣＯＯＰＣＵ Ｌ３）

溶媒：ジメチルスルホキシド

活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物１０ｍｇを溶媒０．５ｍＬに溶かし、得られた濃厚液を「リンゲル液」で希釈して所望の濃度とする。

【０７３２】

線虫（クーペリア・クルチセイ（Ｃｏｏｐｅｒｉａ ｃｕｒｔｉｃｅｉ））幼虫約４０匹を、化合物溶液の入った試験管に移し入れる。

【０７３３】

５日後、幼虫の死亡率を記録する。１００％効力は、全ての幼虫が死んだことを意味し、０％効力は、死んだ幼虫がなかったことを意味する。

【０７３４】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：８、９、１０，１３、１７、２２、２３、２４、２９、３２、３３、３４、３６、３７、４５、４６、５２、５３、５７、７６、７７、８１、８３、１３２、１３３、１３４、１３９、１４３、１５０、１５３、１５５、１５６、１５７、１６６、１６７、１６９、１７０、１７２、１９１、１９２、１９３、１９４、１９５、１９６、１９７、２００、２０４、２０５、２０６、２０７、２０８、２０９、２１０、２１４、２１５、２１７、２１８、２２１、２２２、２２４、２２６、２３５、２３６、２３７、２４７、２６５、２６６、２７４、２８０、３００、３０９、３２６、３２７、３２９、３３２、３４１、３５０、３５３、３５６、３５７、３５９、３７３、３７７、３８４、３８５、３８６、３９５、３９６、４０７、４０８、４１０、４１１、４１５、４１９、４２０、４２１、４２６、４３１、４３８、４４５、４４９、４５０、４５１、４５３、４５４、４５５、４６４、４７７、４７９、４８６、４８７、４８８、４９６、４９７、５０４、５０５、５０６、５０７、５１６、５２８、５２９、５３０、５３１、５３２、５３３、５３６、５３７、５３８、５３９、５４１、５４２、５４５、５５１、５５４、５５７、５５８、５６２、５６３、５６４、５６５、５６９、５７２、５７３、５７５、５７６、５９６、６００、６０３、６０４、６０５、６０７、６０８、６２４、６２８、６３１、６３７、６３８、６３９、６４２、６４７、６５１、６５２、６５５、６５７、６５８、６５９、６６０は、施用量２０ｐｐｍで、１００％の良好な活性を示した。

【０７３５】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：１６、３１、４０、４８、５０、５４、６０、８０、１０８、１２５、１４２、１５２、１７６、１７８、１７９、１９１、２０１、２０３、２２０、２２３、２２９、２４０、２５１、２５７、２５９、２６０、２７１、２７５、２７６、２８１、２９２、３１４、３３０、３３１、３３３、３３８、３３９、３５８、３８２、４００、４０６、４３５、４４４、４４６、４６２、４６５、４６７、４６９、４７３、４７６、４９１、５００、５０９、５４０、５４３、５４８、５５２、５５３、６０１、６０２、６１５、６４０、６４８は、施用量２０ｐｐｍで、９０％の良好な活性を示した。

【０７３６】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：１５、２１、３０、４１、４２、４４、４７、４９、５１、５８、６５、７０、７５、８９、１３５、１４６、１５４、１６２、１６３、１８１、２１１、２１２、２２８、２３８、２３９、２５０、２７２、２９４、２９８、３０７、３１０、３１５、３１８、３２２、３２８、３６７、３９４、４０４、４０９、４１８、４２４、４３２、４６０、４７１、４８２、４８５、４９０、４９２、４９５、５０８、５５６、５８３、５８７、６１４、６５０は、施用量２０ｐｐｍで、８０％の良好な活性を示した。

【０７３７】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：８、１３、１７、２２、２３、

２４、３２、３３、３４、３６、３７、４５、４６、５２、５３、５７、７６、７７、８１、８３、１３２、１３３、１３４、１４３、１５１、１５３、１５５、１６７、１６９、１７０、１７２、１９２、１９４、１９５、１９７、２００、２０５、２０７、２０９、２１０、２１４、２１５、２１７、２２２、２２６、２３７、２６５、２６６、２７３，２７４、３００、３０９、３２７、３２９、３３２、３５０、３５３、３５９、３７３、３８４、３８５、３８６、３９５、３９５、３９６、４０７、４０８、４１０、４１１、４１５、４２０、４２１、４２６、４３１、４３８、４４５、４４９、４５０、４５１、４５３、４５５、４７７、４７９、４８７、４８８、４９６、４９７、４９９、５０４、５０５、５２９、５３０、５３１、５３２、５３３、５３６、５３９、５４１、５４２、５４５、５５４、５５７、５５８、５６２、５６３、５６４、５６５、５６９、５７２、５７３、５７５、５７６、５９６、６００、６０４、６０７、６０８、６２８、６３１、６３７、６３８、６３９、６４２、６４７、６５１、６５２、６５５、６５７、６５８、６５９、６６０は、施用量４ｐｐｍで、１００％の良好な活性を示した。

【０７３８】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：９、２９、３１、４０、５４、６０、１２５、１３９、１４２、１５２、１５６、１５７、１６６、１９１、１９３、１９６、２０８、２１８、２２１、２２３、２２９、２３５、２３６、２４７、２７１、２７５、２９２、３２６、３３０、３３８、３４１、３５６、３５７、３５８、４１９、４３５、４４６、４６２、４６４、４６９、４７６、５００、５０６、５０７、５４０、５５１、５５２、６０１、６０３、６０５、６４８は、施用量４ｐｐｍで、９０％の良好な活性を示した。

【０７３９】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：１０、１６、３９、４２、４４、４７、４８、５０、５１、５８、８０、１０８、１４６、１６３、１７１、１７８、２０１、２０３、２０６、２１１、２１２、２２４、２４０、２５８、２６０、２８０、２８１、２８６、３１８、３３３、３３９、４００、４０６、４０９、４３０、４３７、４４４、４６５、４６７、４８６、４９１、５０８、５０９、５１６、５２８、５３７、５４８、５８３、６０２、６１４、６２４、６４０は、施用量４ｐｐｍで、８０％の良好な活性を示した。

【０７４０】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：１９０、５４９は、施用量０．８ｐｐｍで、８０％の良好な活性を示した。

【０７４１】

<u>イン・ビトロアッセイ７：捻転胃虫（Ｈａｅｍｏｎｃｈｕｓ　ｃｏｎｔｏｒｔｕｓ）（ＨＡＥＭＣＯ　Ｌ３）</u>

溶媒：ジメチルスルホキシド

活性化合物の好適な製剤を製造するため、活性化合物１０ｍｇを溶媒０．５ｍＬに溶かし、得られた濃厚液を「リンゲル液」で希釈して所望の濃度とする。

【０７４２】

捻転胃虫（Ｈａｅｍｏｎｃｈｕｓ　ｃｏｎｔｏｒｔｕｓ）幼虫約４０匹を、化合物溶液の入った試験管に移し入れる。

【０７４３】

５日後、幼虫の死亡率パーセントを記録する。１００％効力は、全ての幼虫が死んだことを意味し、０％効力は、死んだ幼虫がなかったことを意味する。

【０７４４】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：８、１３、１５、１７、２２、２３、２４、２９、３２、３３、３４、３６、３７、４６、４７、４８、５０、５２、５３、５７、６０、７６、７７、８１、８３、１３２、１３３、１３４、１３５、１３９、１４２、１４３、１５３、１５５、１６６、１６７、１６９、１７０、１７２、１９２、１９４、１９７、２００、２０５、２０６、２０７、２１４、２１５、２１８、２２１、

２２２、２２４、２２６、２３５、２３７、２４７、２６５、２６６、２７４、２７５、２８０、３００、３０９、３１２、３２６、３２９、３３０、３３１、３３２、３５０、３５３、３５９、３７３、３７７、３８４、３８５、３８６、３９５、３９６、４０７、４１０、４１１、４１５、４５０、４５５、４７７、４８６、４８７、４８８、４９６、４９７、５０４、５０５、５０６、５０９、５２８、５２９、５３０、５３１、５３３、５３７、５３８、５３９、５４１、５４２、５４５、５５１、５５２、５５４、５５８、５６２、５６３、５６４、５６５、５６９、５７２、５７３、５７５、５７６、５９６、６０４、６０５、６０８、６２８、６３１、６３７、６３８、６４７、６５１、６５２、６５５、６５８、６５９、６６０は、施用量２０ｐｐｍで、１００％の良好な活性を示した。

【０７４５】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：１０、３１、４４、４５、５１、７４、７５、１３６、１４６、１５０、１５６、１７９、１９１、２０３、２０４、２０９、２１０、２１７、２２０、２２３、２２９、２３６、２４９、２５０、２５１、２５８、２６０、２７１、２７２、３２７、３５６、３５７、３５８、４００、４０８、４２１、４３５、４３８、４４４、４４５、４４９、４５１、４５３、４６０、４６９、４７６、５０８、５３２、５４０、５４８、５５３、５５７、６００、６０２、６０３、６１５、６４０、６４２、６４８、６５７は、施用量２０ｐｐｍで、９０％の良好な活性を示した。

【０７４６】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：１２、１６、３９、４０、４２、７０、１２５、１３７、１３８、１５２、１５７、１７６、１７８、１８０、２０８、２５７、２５９、２７３、２７６、２８１、２９２、３０７、３１０、３３３、３４１、３８８、３９２、３９４、４１９、４２０、４３２、４３４、４４６、４６４、４７３、４７９、４９１、４９９、５００、５０７、５１６、５３５、５４３、６１９、６２４、６４５、６４６、６５０は、施用量２０ｐｐｍで、８０％の良好な活性を示した。

【０７４７】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：８、９、１３、１７、２２、２３、２４、２９、３２、３４、３６、３７、４０、４６、５２、５７、６０、７６、７７、８１、１３２、１３３、１３４、１３９、１４２、１４３、１５３、１５５、１７０、１９２、１９７、２００、２０５、２１４、２２２、２３７、２４７、２６５、２６６、２７４、３０９、３３０、３３２、３３９、３５０、３５９、３７３、３８４、３８５、３８６、３９５、４１０、４１１、４５５、４７７、４８８、４９６、４９７、５０４、５０９、５３０、５３１、５３９、５４１、５４２、５４５、５５４、５５８、５６２、５６３、５６４、５６５、５６９、５７２、５７３、５７５、５７６、５９６、６０５、６０８、６２８、６３１、６３７、６３９、６４７、６５１、６５２、６５５、６５８、６５９、６６０は、施用量４ｐｐｍで、１００％の良好な活性を示した。

【０７４８】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：１０、１５、３１、３３、４５、４７、５０、８３、１３５、１４６、１５１、１６６、１６７、１６９、１９１、１９４、２０７、２０９、２２１、２２６、２２９、２３５、２３６、２７１、２７２、２７５、３００、３２６、３２９、３５３、３５７、３５８、３９６、４００，４０７、４０８、４１５、４２１、４３５、４３６、４３８、４４５、４５０、４５１、４７６、４８７、５０５、５０８、５２８、５２９、５３３、５３６、５３７、５４０、５５２、６００、６０３、６０４、６３８、６４０、６４８は、施用量４ｐｐｍで、９０％の良好な活性を示した。

【０７４９】

この試験において、例えば、製造例からの次の化合物：４２、４４、４８、５１、５３、７４、７５、１５０、１５６、１７２、１９５、２０６、２１０、２１５、２１７、２１８、２２３、２３２、２６０、２８１、３０７、３２７、３４１、３５６、３７７、３

９２、３９４、４０３、４１９、４２、４２６、４４４、４４９、４５３、４６９、４７０、４７１、４７９、４８６、５００、５０６、５０７、５５１、５５７、６４２、６４５、６５０、６５７は、施用量４ｐｐｍで、８０％の良好な活性を示した。

【０７５０】

製剤例

製剤例は、１０％Ｔｒａｎｓｃｕｔｏｌ、１０％Ｃｒｅｍｏｐｈｏｒ　ＥＬ及び８０％等張性生理食塩水中の活性物質からなるものであった。最初に、活性物質をＴｒａｎｓｃｕｔｏｌに溶かした。Ｔｒａｎｓｃｕｔｏｌ中溶液の後に、Ｃｒｅｍｏｐｈｏｒ及び等張性生理食塩水を加えた。これらの製剤を、次のイン・ビボアッセイにおける使用製剤として用いた。

【０７５１】

本発明による製剤の１例は、下記の製剤例Ｆ１である。その場合、活性物質をＴｒａｎｓｃｕｔｏｌに溶かして、原液Ａを形成した。次に、この原液Ａ　０．１００ｍＬを取り、Ｃｒｅｍｏｐｈｏｒ　ＥＬ　０．１００ｍＬ及び等張性生理食塩水０．８００ｍＬを加えた。得られた液体製剤（製剤Ｆ１）の体積は１ｍＬであった。

【０７５２】

原液Ａ：

４．０ｍｇ：実施例８の化合物、

０．１００ｍＬ：Ｔｒａｎｓｃｕｔｏｌ。

【０７５３】

製剤例Ｆ１：

０．１００ｍＬ：原液Ａ、

０．１００ｍＬ：Ｃｒｅｍｏｐｈｏｒ　ＥＬ、及び

０．８００ｍＬ：等張性生理食塩水。

【０７５４】

イン・ビボアッセイ

捻転胃虫（Ｈａｅｍｏｎｃｈｕｓ　ｃｏｎｔｏｒｔｕｓ）／蛇状毛様線虫（Ｔｒｉｃｈｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ　ｃｏｌｕｂｒｉｆｏｒｍｉｓ）／アレチネズミ（ｇｅｒｂｉｌ）

捻転胃虫（Ｈａｅｍｏｎｃｈｕｓ）及び／又は蛇状毛様線虫（Ｔｒｉｃｈｏｓｔｒｏｎｇｙｌｕｓ）で実験的に感染させたアレチネズミを、潜伏後期（ｌａｔｅ　ｐｒｅｐａｔｅｎｃｙ）中に１回処理した。試験化合物を液剤又は懸濁液として製剤し、そして経口若しくは腹腔内投与した。両方の使用に、同一の使用製剤を用いた。使用体積は、合計で、通常、最大で２０ｍＬ／ｋｇとなった。例えば、体重４０ｇのアレチネズミは、製剤例Ｆ１の製剤０．２００ｍＬで処理した。これは、２０ｍｇ／ｋｇ体重による処理に相当した。

【０７５５】

効力は、感染したプラシーボ処理対照群における蠕虫カウントと比較した剖検後の、それぞれ胃及び小腸における蠕虫カウントの低減として、群ごとに求めた。

【０７５６】

下記実施例について試験を行ったところ、所定の処理で７０％以上の活性を有していた。

【表１１】

処理	ﾍﾓﾝｸｽ･ｺﾝﾄﾙﾂｽ (Haemonchus contortus)	ﾄﾘｺｽﾄﾛﾝｷﾞﾙｽ･ｺﾙﾌﾞﾘﾌｫﾙﾐｽ (Trichostrongylus colubriformis)
≤2.5 mg/kg 腹腔内	実施例番号 8, 9, 13, 15, 17, 18, 21, 22, 23, 24, 25, 33, 34, 36, 37, 44, 46, 52, 54, 130, 153, 156, 166, 167, 168, 181, 192, 200, 201, 203, 205, 206, 209, 214, 220, 221, 222, 232, 233, 234, 235, 237, 238, 239, 250, 251, 300, 301, 309, 310, 322, 326, 327, 330, 331, 355, 357, 358, 359, 360, 374, 385, 386, 392, 395, 409, 410, 411, 413, 415, 419, 427, 430, 431, 438, 444, 450, 455 462, 465, 467, 468, 477, 485, 487, 491, 492, 496, 516, 530, 533, 538, 540, 543, 548, 553, 557, 558, 564, 565, 660	実施例番号8, 13, 17, 22, 37, 51, 52, 132, 133, 134, 142, 143, 168, 169, 170, 200 206, 222, 235, 251, 359, 395, 660

フロントページの続き

(51)国際特許分類		FI	
A61K	*31/5377(2006.01)*	A61K	31/5377
A61K	*31/5386(2006.01)*	A61K	31/5386
A61K	*31/541(2006.01)*	A61K	31/541
A61P	*33/10 (2006.01)*	A61P	33/10
C07D	*215/56 (2006.01)*	C07D	215/56
C07D	*401/04 (2006.01)*	C07D	401/04
C07D	*401/12 (2006.01)*	C07D	401/12
C07D	*405/04 (2006.01)*	C07D	405/04
C07D	*405/12 (2006.01)*	C07D	405/12
C07D	*405/14 (2006.01)*	C07D	405/14
C07D	*409/04 (2006.01)*	C07D	409/04
C07D	*409/12 (2006.01)*	C07D	409/12
C07D	*413/04 (2006.01)*	C07D	413/04
C07D	*417/04 (2006.01)*	C07D	417/04
C07D	*491/08 (2006.01)*	C07D	491/08
C07D	*498/08 (2006.01)*	C07D	498/08

(74)代理人 100129713
弁理士 重森 一輝
(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司
(74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦
(74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博
(74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵
(74)代理人 100196483
弁理士 川嵜 洋祐
(74)代理人 100203035
弁理士 五味渕 琢也
(74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和
(74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一
(74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔
(74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩
(74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和
(74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文
(72)発明者 ヒュプシュ，ヴァルター
ドイツ国、４２１１３・ヴッパータール、ヴィルトシュタイク・２２
(72)発明者 ケーベルリング，ヨハネス
ドイツ国、４１４６６・ノイス、アツァリエンシュトラーセ・３０
(72)発明者 コーラー，アドリーヌ
ドイツ国、４０７６４・ランゲンフェルト、ハイムヘンヴェーク・９
(72)発明者 シュヴアルツ，ハンス－ゲオルク
ドイツ国、４６２８２・ドルステン、アウフ・デム・ベーアーエンカンプ・８２・ベー

(72)発明者　クルケ，ダニエル
ドイツ国、５１３７５・レーバークーゼン、デイリンガー・シュトラーセ・１３
(72)発明者　ヴェルツ，クラウディア
ドイツ国、４０５９３・デュッセルドルフ、アン・デア・ツィーゲライ・１４
(72)発明者　イルク，トマス
ドイツ国、４０７８９・モーンハイム、プレッツェンセアー・シュトラーセ・１６
(72)発明者　ベルンゲン，キルステン
ドイツ国、５０８５９・ケルン、フェルトハセンヴェーク・２３
(72)発明者　チュワン，ウェイ
ドイツ国、４０７８９・モーンハイム、シュタウフェンベルクシュトラーセ・１３
(72)発明者　グリーベノー，ニルス
ドイツ国、４１５４１・ドルマーゲン、クアフュルステンシュトラーセ・３９
(72)発明者　ベーム，クラウディア
ドイツ国、３０４５７・ハノーファー、イム・ゼーフェルデ・４・アー
(72)発明者　リントナー，ニールス
ドイツ国、４２１１５・ヴッパータール、ボーデルシュヴィングヴェーク・４
(72)発明者　ヒンク，マイケ
ドイツ国、７１６６５・ファイインゲン／エンツ、オイゲン－アイゼレ－ヴェーク・６
(72)発明者　ゲルゲンス，ウルリッヒ
ドイツ国、４０８８２・ラーティンゲン、フェスター・シュトラーセ・３７
審査官　鳥居 福代

(56)参考文献　米国特許第０４３４３８０４（ＵＳ，Ａ）
国際公開第２００６／１０３１２０（WO，Ａ１）
国際公開第２０１５／１４４００１（WO，Ａ１）
Journal of the Chemical Society，1950年，p.464-468
Journal of Medicinal Chemistry，1971年，Vol.14, No.1，p.17-24
European Journal of Medicinal Chemistry，1979年，Vo.14, No.6，p.499-506
Bioorg Med Chem Lett，2003年，Vol.13, No.8，p.1487-90
DATABASE REGISTRY RN 1981585-74-3，2016年08月，DATABASE REGISTRY RN 1981585-74-3
DATABASE REGISTRY RN 1981582-55-1，2016年08月，DATABASE REGISTRY RN 1981582-55-1
DATABASE REGISTRY RN 1974807-38-9，2016年08月，DATABASE REGISTRY RN 1974807-38-9

(58)調査した分野　(Int.Cl.，ＤＢ名)
Ｃ０７Ｄ
ＣＡｐｌｕｓ／ＲＥＧＩＳＴＲＹ（ＳＴＮ）