

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和1年5月23日(2019.5.23)

【公表番号】特表2018-513180(P2018-513180A)

【公表日】平成30年5月24日(2018.5.24)

【年通号数】公開・登録公報2018-019

【出願番号】特願2017-555303(P2017-555303)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)
A 6 1 K 31/4745 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
C 0 7 D 519/00 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 5/00 (2006.01)
A 6 1 P 3/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 37/02 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 1/02 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 27/06 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 25/14 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 5/14 (2006.01)
A 6 1 P 5/38 (2006.01)
A 6 1 P 5/18 (2006.01)
A 6 1 P 15/08 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 9/04 (2006.01)
A 6 1 P 19/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	471/04	1 1 2 Z
A 6 1 K	31/4745	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/5377	
C 0 7 D	519/00	3 0 1
C 0 7 D	519/00	C S P
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	5/00	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	5/14	
A 6 1 P	5/38	
A 6 1 P	5/18	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	19/06	

【手続補正書】

【提出日】平成31年4月5日(2019.4.5)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

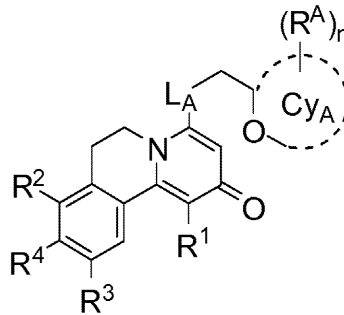
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物：

【化1】



I

(式中

L_A は、O又はNHであり；

Cy_A は、1個又は2個のO原子を含む単環式4～6員ヘテロシクロアルキルであり；

各々の R^A は独立して、ハロ及び C_{1-3} アルキルから選択され；

下付き文字 n は、0、1、又は2であり；

R^1 は、H又は C_{1-3} アルキルであり；

R^2 は、H、-OH、又は C_{1-3} アルコキシであり；

R^3 は、H又は C_{1-3} アルコキシであり；

R^4 は、

H、

-CN、

-OH、

1個以上の独立して選択されるハロで任意に置換された-O-S(=O)₂- C_{1-4} アルキル、又は
- L_1 - W_1 - G_1 であり；

L_1 は、直接結合、-O-、-S-、-SO₂-、-C(=O)NR^{5a}-、-NR^{5b}C(=O)-、又は-NR^{5c}-であり；

R^{5a} 、 R^{5b} 、及び R^{5c} は独立して、H又は C_{1-4} アルキルであり；

W_1 は、直接結合又は1個以上の独立して選択されるハロで任意に置換された C_{1-2} アルキレンであり；

G_1 は、

1個以上の独立して選択されるハロで任意に置換された C_{3-6} シクロアルキル、

独立してN、O、及びSから選択される1～4個のヘテロ原子を含む5～6員ヘテロアリール
であって、1個以上の独立して選択される C_{1-4} アルキルで任意に置換された、前記ヘテロ
アリール、

1つの二重結合及び独立してN、O、及びSから選択される1～3個のヘテロ原子を含む5～7
員ヘテロシクロアルケニルであって、1個以上の独立して選択される R^6 で任意に置換され
た、前記ヘテロシクロアルケニル、

独立してN、O、及びSから選択される1～3個のヘテロ原子を含む単環式又はスピロ二環
式4～8員ヘテロシクロアルキルであって、1個以上の独立して選択される R^6 で任意に置換
された、前記ヘテロシクロアルキル、

1個又は2個のフェニルに縮合した、独立してN、O、及びSから選択される1～3個のヘテ
ロ原子を含む単環式4～6員ヘテロシクロアルキル、

1個以上の独立して選択されるハロ、-NR^{7a}R^{7b}、又は C_{1-4} アルコキシで任意に置換され

た C_{1-4} アルキルであって、該アルコキシが、1個以上の独立して選択されるハロで任意に置換されている、前記アルキル、又は

1個以上の独立して選択されるハロ又は C_{1-4} アルコキシで任意に置換されたフェニルであって、該アルコキシが、1個以上の独立して選択されるハロで任意に置換されている、前記フェニルであり；

R^6 は、

ハロ、

=O、

-CN、

-OH、

1個以上の独立して選択されるハロで任意に置換された $-C(=O)-C_{1-4}$ アルコキシ、

$-C(=O)-C_{3-4}$ シクロアルキル、

$-S(=O)_2-C_{1-4}$ アルキル、

1個以上の独立して選択される C_{1-3} アルコキシ、ハロ、又は-OHによって任意に置換された C_{1-4} アルキル、

C_{1-4} アルコキシ、

1個以上の独立して選択されるハロで任意に置換されたフェニル、

独立してN、O、及びSから選択される1～3個のヘテロ原子を含む $-C(=O)-$ 単環式4～6員ヘテロシクロアルキル、

$-C(=O)NR^{8a}R^{8b}$ 、又は

独立してN、O、及びSから選択される1～4個のヘテロ原子を含む5～7員ヘテロアリールであって、1個以上の独立して選択される C_{1-4} アルキルで任意に置換された、前記ヘテロアリールであり；

各々の R^{7a} 及び R^{7b} は独立して、H又は C_{1-4} アルキルであり；かつ

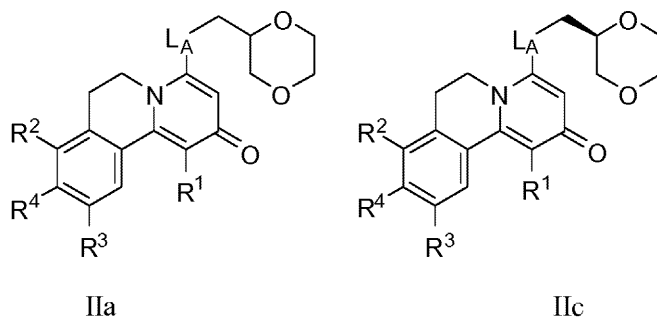
各々の R^{8a} 及び R^{8b} は独立して、H又は C_{1-3} アルキルである)；

又はその医薬として許容し得る塩、もしくは溶媒和物、もしくは溶媒和物の医薬として許容し得る塩。

【請求項2】

式IIa又はIIcのものである、請求項1記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩：

【化2】



。

【請求項3】

R^2 が、 $-OCH_3$ である、請求項1又は2記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩。

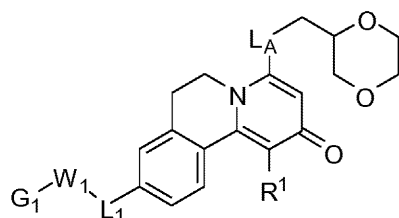
【請求項4】

R^3 が、 $-OCH_3$ である、請求項1～3のいずれか1項記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩。

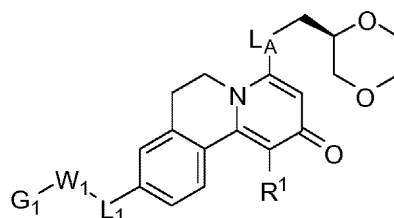
【請求項5】

式IIIa又はIIIcのものである、請求項1記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩：

【化 3】



IIIa



IIIc

。

【請求項 6】

R¹が、Hである、請求項1～5のいずれか1項記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩。

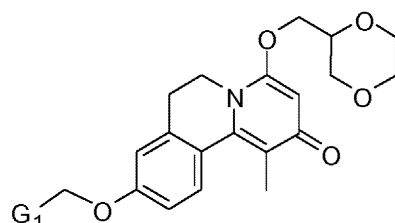
【請求項 7】

R¹が、-CH₃又は-CH₂CH₃である、請求項1～5のいずれか1項記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩。

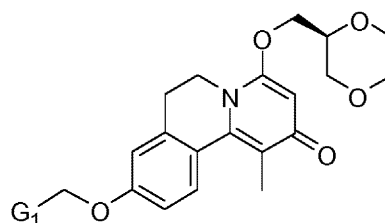
【請求項 8】

式Va又は式Vbのものである、請求項1記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩：

【化 4】



Va



Vb

。

【請求項 9】

G₁が、各々が1個以上のFで置換されたシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、又はシクロヘキシルである、請求項8記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩。

【請求項 10】

G₁が、-CF₃、-CHF₂、-CH₂-CHF₂、-CH₂-CF₃、-CH₂-CH₂-N(CH₃)₂、又は-CH₂-CH₂-OCF₃である、請求項8記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩。

【請求項 11】

請求項1～10のいずれか1項記載の化合物又はその医薬として許容し得る塩を含む医薬組成物。

【請求項 12】

前記化合物又はその医薬として許容し得る塩が、さらなる治療剤と組み合わせて投与されるように用いられる、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項 13】

医薬品として使用するための、請求項1～10のいずれか1項記載の化合物もしくはその医薬として許容し得る塩、又は請求項11又は12記載の医薬組成物。

【請求項 14】

炎症性コンディション、疼痛、神経炎症性コンディション、神経変性コンディション、感染性疾患、自己免疫疾患、内分泌及び/もしくは代謝性疾患、心血管系疾患、白血病、並びに/又は免疫細胞機能の障害が関与する疾患の治療及び/又は予防において使用するための、請求項1～10のいずれか1項記載の化合物もしくはその医薬として許容し得る塩、又は請求項11又は12記載の医薬組成物。

【請求項 15】

炎症性コンディション、疼痛、神経炎症性コンディション、神経変性コンディション、感染性疾患、自己免疫疾患、内分泌及び/もしくは代謝性疾患、心血管系疾患、白血病、並びに/又は免疫細胞機能の障害が関与する疾患の治療又は予防のための医薬品の製造における、請求項1～10のいずれか1項記載の化合物もしくはその医薬として許容し得る塩、又は請求項11又は12の医薬組成物の使用。

【請求項 16】

前記医薬品が、さらなる治療剤と組み合わせて投与されるものである、請求項15記載の使用。

【請求項 17】

前記炎症性コンディションが、関節リウマチ、慢性閉塞性肺疾患、喘息、特発性肺線維症、乾癬、クローン病、潰瘍性大腸炎、ブドウ膜炎、歯周炎、食道炎、及び/又は壊疽性膿皮症である、請求項14記載の化合物もしくはその医薬として許容し得る塩、又は医薬組成物。

【請求項 18】

前記炎症性コンディションが、関節リウマチ、慢性閉塞性肺疾患、喘息、特発性肺線維症、乾癬、クローン病、潰瘍性大腸炎、ブドウ膜炎、歯周炎、食道炎、及び/又は壊疽性膿皮症である、請求項15又は16記載の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0203

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0203】

経口投与に好適な液体形態としては、緩衝剤、懸濁化剤及び分散剤、着色料、香料などを含む好適な水性又は非水性のビヒクルを挙げることができる。固体形態としては、例えば、以下の成分:結合剤、例えば、微結晶性セルロース、トラガカントガム、もしくはゼラチン;賦形剤、例えば、デンプンもしくはラクトース、崩壊剤、例えば、アルギン酸、プリモゲル、もしくはトウモロコシデンプン;滑沢剤、例えば、ステアリン酸マグネシウム;流動化剤、例えば、コロイド状二酸化ケイ素;甘味剤、例えば、スクロースもしくはサッカリン;又は着香剤、例えば、ペパーミント、サリチル酸メチル、もしくはオレンジ香料のうちのいずれか、或いは類似の性質の化合物を挙げることができる。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0253

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0253】

一実施態様において、本発明の化合物は、喘息及び/又は鼻炎及び/又はCOPDの治療及び/又は予防のための別の治療剤と共投与され;特定の薬剤としては: β 2-アドレナリン受容体アゴニスト(例えば、サルブタモール、レバルブテロール、テルブタリン、及びビトルテロール)、エピネフリン(吸入又は錠剤)、抗コリン薬(例えば、臭化イプラトロピウム)、グルココルチコイド(経口又は吸入) 長時間作用型 β 2-作動薬(例えば、サルメテロール、ホルモテロール、バンブテロール、及び持続放出性経口アルブテロール)、吸入ステロイドと長時間作用型気管支拡張薬の組合せ(例えば、フルチカゾン/サルメテロール、ブデソニド/ホルモテロール)、ロイコトリエン拮抗薬及び合成阻害剤(例えば、モンテルカスト、ザフィルルカスト、及びジロートン)、メディエーター放出阻害剤(例えば、クロモグリケート及びケトチフェン)、ホスホジエステラーゼ-4阻害剤(例えば、ロフルミラスト)、IgE応答の生体調節因子(例えば、オマリズマブ)、抗ヒスタミン薬(例えば、セチリジン、シンナリジン、フェキソフェナジン)、並びに血管収縮薬(例えば、オキシメタゾリン

、キシロメタゾリン、ナファゾリン、及びトラマゾリン)が挙げられるが、これらに限定されない。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0273

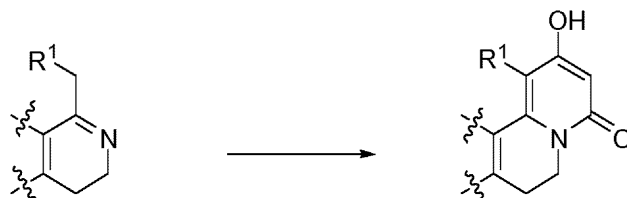
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0273】

(1.5. 方法4:マロン酸縮合)

【化31】



N₂下、冷却器を取り付けた丸底フラスコに、3,4-ジヒドロイソキノリン誘導体(1.0当量)、ジ-tBu-マロネート(4.0当量)、及び乾燥ジグリム(0.5mL/mmol)を入れる。混合物を凍結-ポンプ-融解サイクルで脱気し、出発材料が全て消費されるまで150℃で加熱する。混合物を10℃まで冷却し、MTBEを加える。沈殿物を濾過によって分離し、残渣を、MeCN/MTBE 1:4で洗浄する。沈殿物を真空下乾燥し、さらに精製することなく用いる。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0302

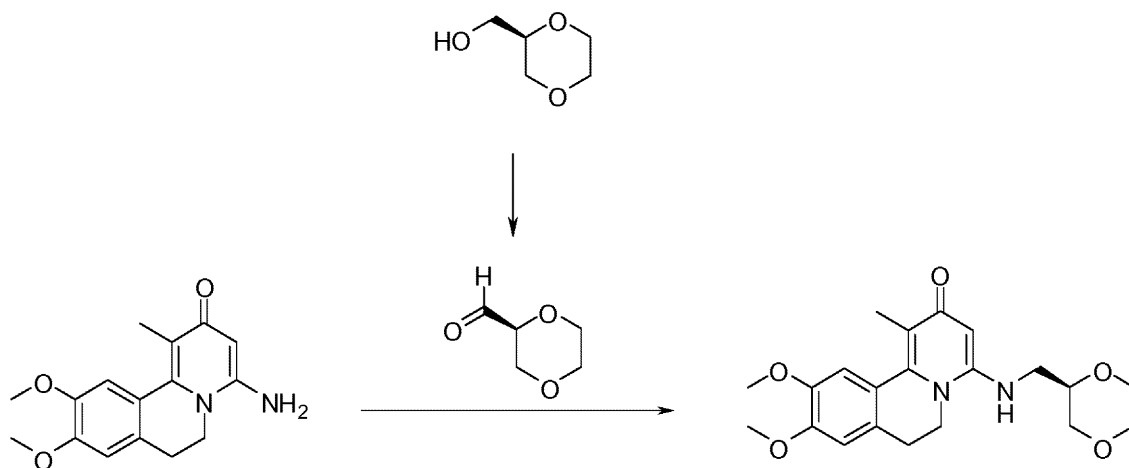
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0302】

(1.26. 4-[[[(2R)-1,4-ジオキササン-2-イル]メチルアミノ]-9,10-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン(化合物6)を用いての例示)

【化59】



化合物2の合成のために工程1で記載したものと同一手順に従い、(S)--1,4-ジオキササン-2-カルボキシアルデヒドを、(R)--1,4-ジオキササン-2-イル)メタノールの酸化によって合成する。この粗アルデヒドを、化合物2の合成のために工程2において記載した手順による4-アミノ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オンの還元的アルキル化においてさらに精製することなく用いる。粗生成物を分取HPLCによって精製して、所望の生成物を単離する。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0322

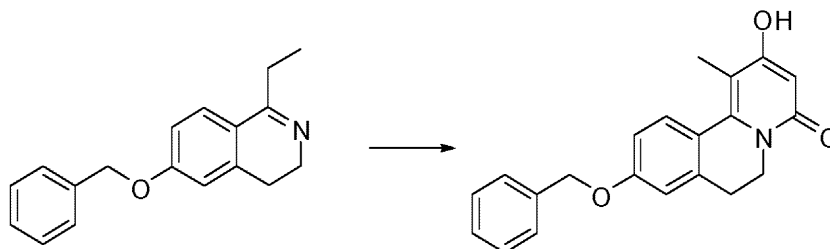
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0322】

(2.1.6.4. 9-ベンジルオキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2,4-ジオン：中間体15)

【化76】



N₂下、冷却器を取り付けた丸底フラスコに、6-ベンジルオキシ-1-エチル-3,4-ジヒドロイソキノリン(50g、0.189mol、1.0当量)、ジ-tBu-マロネート(163g、0.755mol、4.0当量)、及び乾燥ジグリム(94mL、0.5mL/mmol)を入れる。混合物を、凍結-ポンプ-融解法で脱気し、出発材料が全て消費されるまで150℃で加熱する。混合物を10℃まで冷却し、MTBE(200mL)を加える。沈殿物を濾過によって分離し、残渣をMeCN/MTBE 1:4(3×250mL)で洗浄する。沈殿物を真空下乾燥し、さらに精製することなく用いる。

【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0345

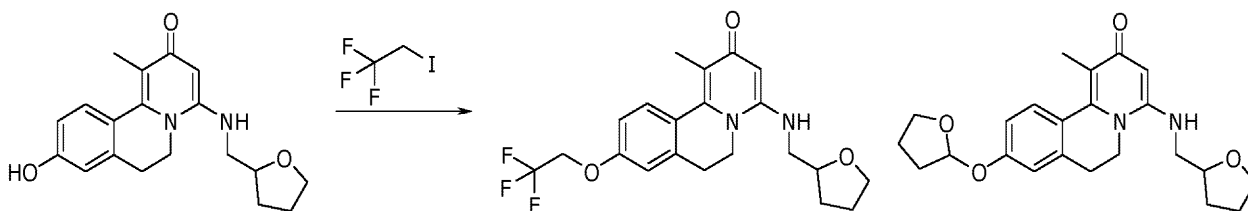
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0345】

(2.1.6.25. 1-メチル-4-(テトラヒドロフラン-2-イルメチルアミノ)-9-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン(化合物8)及び1-メチル-4-[(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-アミノ]-9-(テトラヒドロ-フラン-2-イルオキシ)-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-2-オン(化合物9))

【化100】



窒素雰囲気下、マイクロ波チューブ中で、中間体2(42mg、1.00当量)を、乾燥THF(0.5mL)、乾燥DMF(0.25mL)、及びK₂CO₃(28mg、2.00当量)と混合する。その後、1,1,1-トリフルオロ-2-ヨードエタン(10.3μL、1.05当量)を加える。チューブをシールし、室温で50時間攪拌する。温度を100℃まで上昇させ、攪拌をさらに92時間継続する。反応混合物を室温まで冷却し、EtOAc及び飽和NaHCO₃水間に分配する。有機層をNa₂SO₄で乾燥し、濾過し、真空下エバポレートして、残渣を得て、それを分取HPLCによって精製して、所望の生成物を得る。

表II. 本発明の例示的な化合物の合成のための中間体

【表 2】

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 1		2-(3-ベンジルオキシフェニル)エタンアミン	市販	-	-	-
中間体 2		N-[2-(3-ベンジルオキシフェニル) エチル]ブタンアミド	中間体 1	M2	207	-
中間体 3		6-ベンジルオキシ-1-プロピル-3,4- ジヒドロイソキノリン	中間体 2	M3	189	190
中間体 4		9-ベンジルオキシ-1-エチル-2- ヒドロキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a] キノリジン-4-オン	中間体 3	M4	347	348
中間体 5		9-ベンジルオキシ-2,4-ジクロロ-1-エチル- 6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5- イウム	中間体 4	M10	385	384/3 86

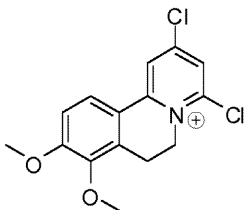
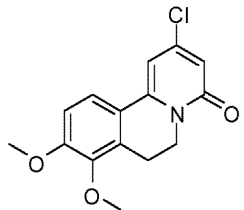
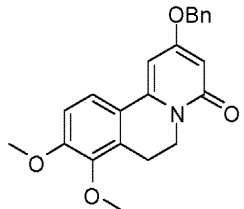
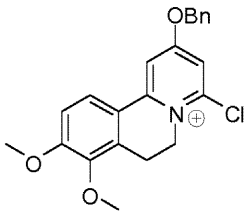
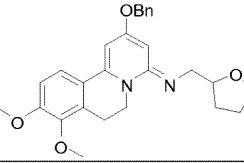
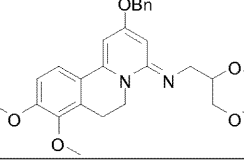
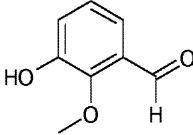
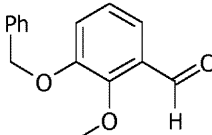
中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 6		9-ベンジルオキシ-2-クロロ-1-エチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 5	M11	366	366
中間体 7		2,9-ジベンジルオキシ-1-エチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 6	M12	438	438
中間体 8		2,9-ジベンジルオキシ-4-クロロ-1-エチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 7	M13	457	456
中間体 9		2,9-ジベンジルオキシ-1-エチル-N-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 8	M23	521	521
中間体 10		1-エチル-9-ヒドロキシ-4-(テトラヒドロフラン-2-イルメチルアミノ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 9	M24	340	341
中間体 11		3-ベンジルオキシフェニルアセトニトリル	市販	-	223	224
中間体 12		2-(3-ベンジルオキシフェニル)エタンアミン	中間体 11	M1	227	228
中間体 13		N-[2-(3-ベンジルオキシフェニル)エチル]プロパンアミド	中間体 12	M2	283	284
中間体 14		6-ベンジルオキシ-1-エチル-3,4-ジヒドロイソキノリン	中間体 13	M3	265	266
中間体 15		9-ベンジルオキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2,4-ジオン	中間体 14	M4	333	334
中間体 16		9-ベンジルオキシ-2,4-ジクロロ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリニリウム	中間体 15	M10	371	370 / 372 (Cl)

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 17		9-ベンジルオキシ-2-クロロ-1-メチル- 6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1- a]イソキノリン-4-オン	中間体 16	M11	352	352/3 54 (Cl)
中間体 18		2,9-ビス-ベンジルオキシ-1-メチル-6,7- ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン- 4-オン	中間体 17	M12	424	424
中間体 19		2-メトキシ-9-ベンジルオキシ-1-メチル- 6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4- オン	中間体 15	M7	347	348
中間体 20		9-ベンジルオキシ-4-クロロ-2-メトキシ- 1-メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム クロリド	中間体 19	M8	366	366/3 68 (Cl)
中間体 21		2,9-ビス-ベンジルオキシ-4-クロロ-1- メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1- a]イソキノリニリウム	中間体 18	M13	443	442/4 47 (Cl)
中間体 22		[2,9-ビス-ベンジルオキシ-1-メチル-6,7- ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン- (4E)-イリデン]-(テトラヒドロ-フラン-2- イルメチル)-アミン	中間体 21	M23	506	507
中間体 23		9-ヒドロキシ-1-メチル-4- [(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)- アミノ]-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1- a]イソキノリン-2-オン	中間体 22	M24	326	327
中間体 24		9-ベンジルオキシ-4-クロロ-1-メチル- 6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2- オン	中間体 20	M9	351	352/3 54 (Cl)
中間体 25		9-ヒドロキシ-1-メチル-4- (テトラヒドロフラン-2-イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 108	M16	327	328
中間体 26		9-ヒドロキシ-1-メチル-4- (テトラヒドロピラン-2-イルメトキシ)- 6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2- オン	化合物 109	M16	341	342

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 27		2,9-ジベンジルオキシ-N-[[2R)-1,4-ジオキサン-2-イル]メチル]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 1	M23	523	523
中間体 28		4-[[2R)-1,4-ジオキサン-2-イル]メチルアミノ]-9-ヒドロキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 27	M24	342	343
中間体 29		4-(1,4-ジオキサン-2-イルメトキシ)-1-メチル-9-(1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 74	M27	408	409
中間体 30		4-(1,4-ジオキサン-2-イルメトキシ)-1-メチル-9-(4-ピペリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 75	M27	411	411
中間体 31		9-(アゼチジン-3-イルオキシ)-4-[[2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 104	M27	398	399
中間体 32		4-[[2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-ピロリジン-3-イルオキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 127	M27	412	413
中間体 33		9-(アゼチジン-3-イル)-4-[[2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 71	M27	382	383
中間体 34		N-[2-(3-メトキシフェニル)エチル]プロパンアミド	(市販)	M2	207	-
中間体 35		1-エチル-6-メトキシ-3,4-ジヒドロイソキノリン	中間体 34	M3	279	280
中間体 36		2-ヒドロキシ-9-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 35	M4	257	258
中間体 37		2,9-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 36	M7	271	272

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 38		4-クロロ-2,9-ジメトキシ-1-メチル- 6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5- イウム	中間体 37	M8	291	292
中間体 39		4-クロロ-9-メトキシ-1-メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 38	M9	276	276
中間体 40		N-[2-(2,3- ジメトキシフェニル)エチル]プロパン アミド	(市販)	M2	237	-
中間体 41		1-エチル-5,6-ジメトキシ-3,4- ジヒドロイソキノリン	中間体 40	M3	219	220
中間体 42		2-ヒドロキシ-8,9-ジメトキシ-1- メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 41	M4	287	288
中間体 43		2,4-ジクロロ-8,9-ジメトキシ-1- メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 42	M10	325	324/3 26
中間体 44		2-クロロ-8,9-ジメトキシ-1-メチル- 6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4- オン	中間体 43	M11	306	306
中間体 45		2-ベンジルオキシ-8,9-ジメトキシ-1- メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 44	M12	377	378

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 46		2-ベンジルオキシ-4-クロロ-8,9-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 45	M13	397	396
中間体 47		4-クロロ-8,9-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 46	M14	306	306
中間体 48		2-ベンジルオキシ-8,9-ジメトキシ-1-メチル-N-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 46	M23	461	461
中間体 49		2-ベンジルオキシ-N-(1,4-ジオキサン-2-イルメチル)-8,9-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 46	M23	477	477
中間体 50		2-ベンジルオキシ-8,9-ジメトキシ-1-メチル-N-(テトラヒドロピラン-2-イルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 46	M23	475	475
中間体 51		N-[2-(2,3-ジメトキシフェニル)エチル]アセトアミド	(市販)	M2	223	-
中間体 52		5,6-ジメトキシ-1-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン	中間体 51	M3	205	206
中間体 53		2-ヒドロキシ-8,9-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 52	M4	273	274

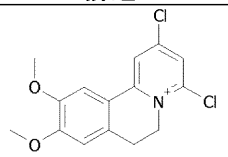
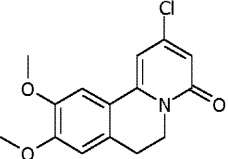
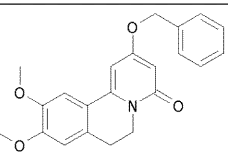
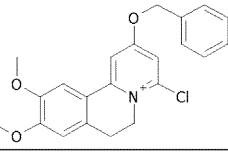
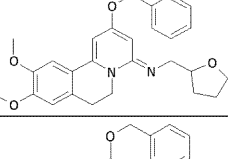
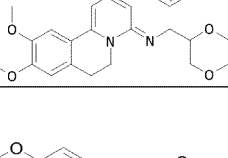
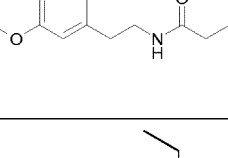
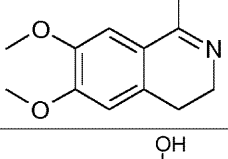
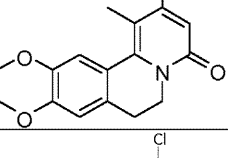
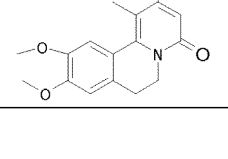
中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 54		2,4-ジクロロ-8,9-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 53	M10	311	310/3 12
中間体 55		2-クロロ-8,9-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 54	M11	292	292
中間体 56		2-ベンジルオキシ-8,9-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 55	M12	363	364
中間体 57		2-ベンジルオキシ-4-クロロ-8,9-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 56	M13	383	382
中間体 58		2-ベンジルオキシ-8,9-ジメトキシ-N-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 57	M23	447	447
中間体 59		2-ベンジルオキシ-N-(1,4-ジオキサン-2-イルメチル)-8,9-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 57	M23	463	463
中間体 60		3-ヒドロキシ-2-メトキシ-ベンズアルデヒド	市販	-	152	N/A
中間体 61		3-ベンジルオキシ-2-メトキシ-ベンズアルデヒド	中間体 60	上述	242	N/A

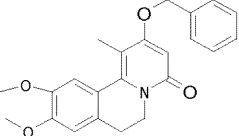
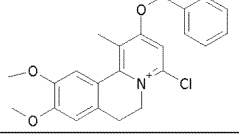
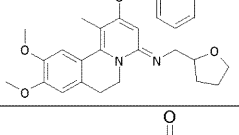
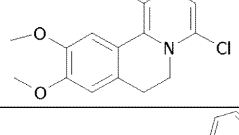
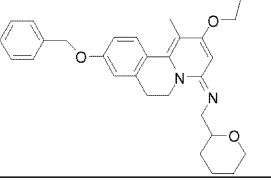
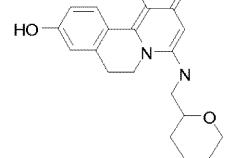
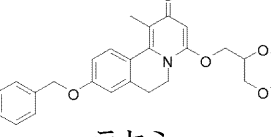
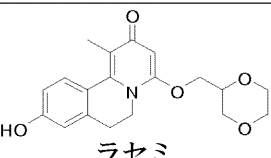
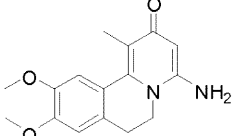
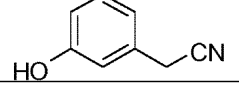
中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 62		1-ベンジルオキシ-2-メトキシ-3-(2-ニトロ-ビニル)-ベンゼン	中間体 61	上述	285	N/A
中間体 63		2-(3-ベンジルオキシ-2-メトキシ-フェニル)-エチルアミン	中間体 62	上述	257	258
中間体 64		N-[2-(3-ベンジルオキシ-2-メトキシ-フェニル)-エチル]-プロピオンアミド	中間体 63	M2	313	314
中間体 65		6-ベンジルオキシ-1-エチル-5-メトキシ-3,4-ジヒドロ-イソキノリン	中間体 64	M3	295	296
中間体 66		9-ベンジルオキシ-8-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-2,4-ジオン	中間体 65	M4	363	364
中間体 67		-ベンジルオキシ-2,4-ジクロロ-8-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリニリウム	中間体 66	M10	401	400/402 (Cl ₂ ⁺)
中間体 68		9-ベンジルオキシ-2-クロロ-8-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-4-オン	中間体 67	M11	382	382/384 (Cl)
中間体 69		2,9-ビス-ベンジルオキシ-8-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-4-オン	中間体 68	M12	454	454
中間体 70		2,9-ビス-ベンジルオキシ-4-クロロ-8-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリニリウム	中間体 69	M13	473	472/474 (Cl ⁺)

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 71		[2,9-ビス-ベンジルオキシ-8-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-(4E)-イリデン]-[1,4]ジオキサン-2-イルメチル-アミン	中間体 70	M23	553	553
中間体 72		4-[[[1,4]ジオキサン-2-イルメチル)-アミノ]-9-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-2-オン	中間体 71	M24	372	373
中間体 73		[2,9-ビス-ベンジルオキシ-8-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-(4E)-イリデン]-(テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-アミン	中間体 69	M23	537	537
中間体 74		9-ヒドロキシ-8-メトキシ-1-メチル-4-[[[テトラヒドロ-フラン-2-イルメチル)-アミノ]-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-2-オン	中間体 73	M24	356	357
中間体 75		N-[2-(3,5-ジメトキシフェニル)エチル]アセトアミド	(市販)	M2	223	-
中間体 76		6,8-ジメトキシ-1-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン	中間体 75	M3	205	206
中間体 77		2-ヒドロキシ-9,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 76	M4	273	274
中間体 78		2,4-ジクロロ-9,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 77	M10	311	310/312
中間体 79		2-クロロ-9,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 78	M11	292	292

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 80		2-ベンジルオキシ-9,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 79	M12	363	364
中間体 81		2-ベンジルオキシ-4-クロロ-9,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 80	M13	383	382
中間体 82		2-ベンジルオキシ-9,11-ジメトキシ-N-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 81	M23	447	447
中間体 83		N-[2-(2,5-ジメトキシフェニル)エチル]アセトアミド	(市販)	M2	223	-
中間体 84		5,8-ジメトキシ-1-メチル-3,4-ジヒドロイソキノリン	中間体 83	M3	205	206
中間体 85		2-ヒドロキシ-8,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 84	M4	273	274
中間体 86		4-クロロ-8,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 85	M13	292	292
中間体 87		2,4-ジクロロ-8,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 86	M10	311	310/3 12

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 88		2-クロロ-8,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 87	M11	292	292
中間体 89		2-ベンジルオキシ-8,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 88	M12	363	364
中間体 90		2-ベンジルオキシ-4-クロロ-8,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 89	M13	383	382
中間体 91		2-ベンジルオキシ-8,11-ジメトキシ-N-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 90	M23	447	447
中間体 92		2-ベンジルオキシ-8,11-ジメトキシ-N-(テトラヒドロピラン-2-イルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 90	M23	461	461
中間体 93		2-ベンジルオキシ-N-(1,4-ジオキサン-2-イルメチル)-8,11-ジメトキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 90	M23	463	463
中間体 94		6,7-ジメトキシ-1-メチル-3,4-ジヒドロ-イソキノリン	N.A. (市販)	N.A. (市販)	205	206
中間体 95		2-ヒドロキシ-9,10-ジメトキシ-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-4-オン	中間体 94	M4	273	274

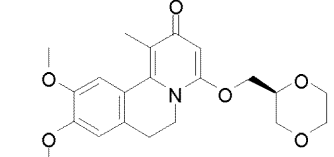
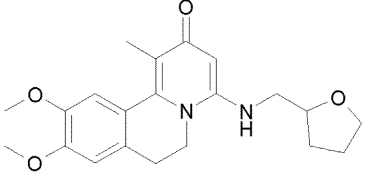
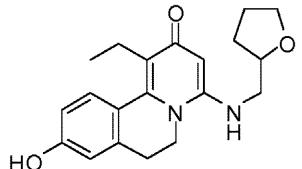
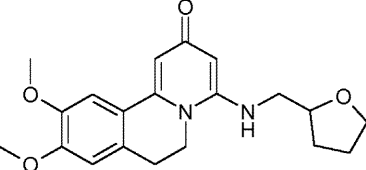
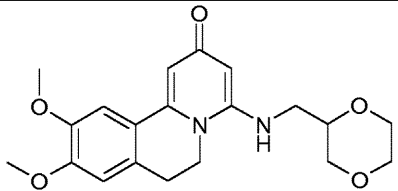
中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 96		2,4-ジクロロ-9,10-ジメトキシ-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリニリウム	中間体 95	M10	311	310/312 (Cl ₂ ⁺)
中間体 97		2-クロロ-9,10-ジメトキシ-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-4-オン	中間体 96	M11	292	292/94 (Cl)
中間体 98		2-ベンジルオキシ-9,10-ジメトキシ-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-4-オン	中間体 97	M12	363	364
中間体 99		2-ベンジルオキシ-4-クロロ-9,10-ジメトキシ-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリニリウム	中間体 98	M13	383	382/84 (Cl ⁺)
中間体 100		[2-ベンジルオキシ-9,10-ジメトキシ-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-(4E)-イリデン]-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-アミン	中間体 99	M23	447	447
中間体 101		[2-ベンジルオキシ-9,10-ジメトキシ-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-(4E)-イリデン]-[1,4]ジオキサン-2-イルメチル-アミン	中間体 99	M23	463	463
中間体 102		N-[2-(3,4ジメトキシフェニル)エチル]プロパンアミド	2-(3,4-ジメトキシフェニル)-エチルアミン	M2	237	238.1
中間体 103		6,7-ジメトキシ-1-エチル-3,4-ジヒドロイソキノリン	中間体 102	M3	219	220.2
中間体 104		2-ヒドロキシ-9,10-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 103	M4	287	288
中間体 105		2-クロロ-9,10-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 104	M10 +11	305	306

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 106		2-ベンジルオキシ-9,10-ジメトキシ-1- メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 105	M12	377	378
中間体 107		2-ベンジルオキシ-4-クロロ-9,10- ジメトキシ-1-メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 106	M13	396	397
中間体 108		2-ベンジルオキシ-9,10-ジメトキシ-1- メチル-N-(テトラヒドロフラン-2- イルメチル)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 107	M21	460	461
中間体 109		4-クロロ-9,10-ジメトキシ-1-メチル- 6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2- オン	中間体 114	M6	305	306
中間体 110		2,9-ジベンジルオキシ-1-メチル-N- (テトラヒドロピラン-2-イルメチル)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 21	M23	520	521
中間体 111		9-ヒドロキシ-1-メチル-4- (テトラヒドロピラン-2- イルメチルアミノ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 110	M24	340	341
中間体 112	 ラセミ	9-ベンジルオキシ-4-[[1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 24	M15	434	434
中間体 113	 ラセミ	4-[[1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9- ヒドロキシ-1-メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 112	M16	343	344
中間体 114		9,10-ジメトキシ-1-メチル-4-アミノ- 6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2- オン	中間体 103	M5	286	287
中間体 115		メタ-ヒドロキシベンジルシアニド	市販	NA	133	NA

中間体#	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
中間体 116		3-(2,2-ジフルオロエトキシ)フェニルアセトニトリル	中間体 115	M0	197	198
中間体 117		2-(3-(2,2-ジフルオロエトキシ)フェニル)エタンアミン	中間体 116	M1	201	202
中間体 118		N-[2-(3-(2,2-ジフルオロエトキシ)フェニル)エチル]プロパンアミド	中間体 117	M2	257	258
中間体 119		6-(2,2-ジフルオロエトキシ)-1-エチル-3,4-ジヒドロイソキノリン	中間体 118	M3	239	240
中間体 120		2-ヒドロキシ-9-(2,2-ジフルオロエトキシ)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 119	M4	307	308
中間体 121		2-クロロ-9-(2,2-ジフルオロエトキシ)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 120 +11	M10	325	326
中間体 122		2-ベンジルオキシ-9-(2,2-ジフルオロエトキシ)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-オン	中間体 121	M12	397	398
中間体 123		2-ベンジルオキシ-4-クロロ-9-(2,2-ジフルオロエトキシ)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-5-イウム	中間体 122	M13	416	416
中間体 124		2-ベンジルオキシ-9-(2,2-ジフルオロエトキシ)-1-メチル-N-(2-ピリジルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 123	M23	487	488
中間体 125		2-ベンジルオキシ-9-(2,2-ジフルオロエトキシ)-1-メチル-N-((2R)-1,4-ジオキサン-2-イルメチル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-4-イミン	中間体 123	M23	496	497
中間体 126		3-ブromo-4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ-1-メチル-9-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 18	上述	343	344

表III. 本発明の例示的な化合物

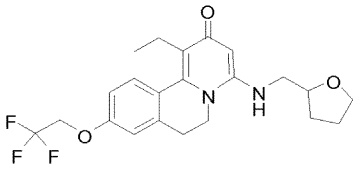
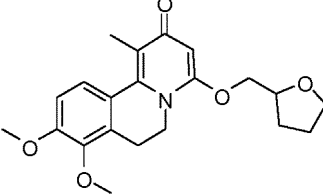
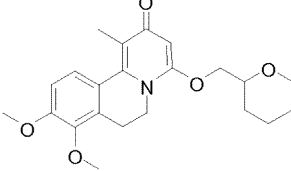
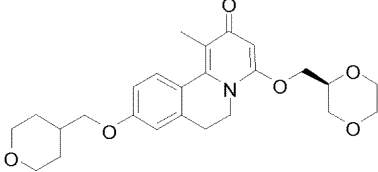
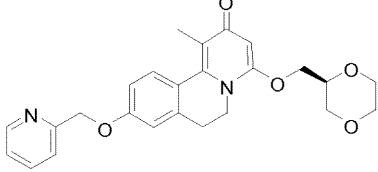
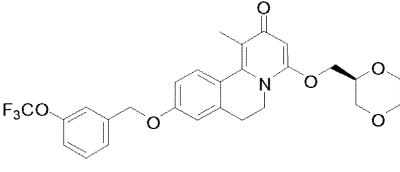
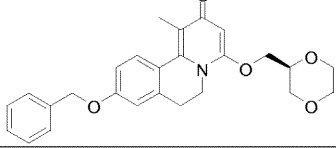
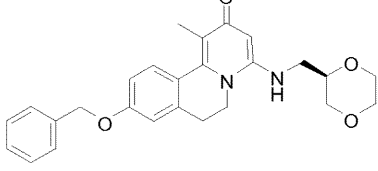
【表 3】

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
1		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9,10-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 109	上述	387	388
2		9,10-ジメトキシ-1-メチル-4-((テトラヒドロフラン-2-イルメチルアミノ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 108	上述	370	371
3		1-エチル-9-ヒドロキシ-4-((テトラヒドロフラン-2-イルメチルアミノ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 9	M24	340	341
4		9,10-ジメトキシ-4-((テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-アミノ)-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-2-オン	中間体 108	M24	356	357
5		4-[[[(1,4)ジオキサン-2-イルメチル]-アミノ]-9,10-ジメトキシ-6,7-ジヒドロ-ピリド[2,1-a]イソキノリン-2-オン	中間体 101	M24	372	373

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
6		4-[(2R)-1,4-ジオキサン-2-イル]メチルアミノ]-9,10-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 78 キラル	上述	386	387.0
7		9-(2,2-ジフルオロシクロプロピルメトキシ)-1-メチル-4-[(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)アミノ]-6,7-ジヒドロピリド[2,1-a]イソキノリン-2-オン	中間体 23	M17	416	417
8		1-メチル-4-(テトラヒドロフラン-2-イルメチルアミノ)-9-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 23	M17	408	409
9		-メチル-4-[(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)アミノ]-9-(テトラヒドロフラン-2-イルオキシ)-6,7-ジヒドロピリド[2,1-a]イソキノリン-2-オン	中間体 23	M17 (副生成物)	396	409, 398, 327
10		8,9-ジメトキシ-1-メチル-4-(テトラヒドロフラン-2-イルメチルアミノ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 58	M24	370	371
12		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-8,9-ジメトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 47	M15	387	388

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
13		9-(2,2-ジフルオロエトキシ)- 1-メチル-4- (テトラヒドロピラン-2- イルメチルアミノ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 111	M17	405	405
14		1-メチル-4- (テトラヒドロピラン-2- イルメチルアミノ)-9- (2,2,2-トリフルオロエトキシ)- 6,7-ジヒドロベンゾ [a]キノリジン-2-オン	中間体 111	M17	422	423
16		8,9-ジメトキシ-1- メチル-4- (テトラヒドロピラン-2- イルメチルアミノ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 50	M24	384	385
17		4-(1,4-ジオキサン-2- イルメチルアミノ)-8,9- ジメトキシ-1-メチル- 6,7-ジヒドロベンゾ [a]キノリジン-2-オン	中間体 49	M24	386	387
18		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル-9- (2,2,2-トリフルオロエトキシ)- 6,7-ジヒドロベンゾ [a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	425	426
19		4-(1,4-ジオキサン-2- イルメチルアミノ)-8,9- ジメトキシ-6,7- ジヒドロベンゾ [a]キノリジン-2-オン	中間体 59	M24	372	373

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
20		8,9-ジメトキシ-4- (テトラヒドロフラン-2- イルメチルアミノ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 58	M24	356	357
21		4-(1,4-ジオキサン-2- イルメチルアミノ)-9- ヒドロキシ-8-メトキシ-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 19	上述	358	359
22		4-(1,4-ジオキサン-2- イルメチルアミノ)-8- ヒドロキシ-9-メトキシ-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 19	上述	358	359
23		9-(2,2-ジフルオロ-エトキシ)- 4-([(1,4)ジオキサン-2- イルメチル)-アミノ]-8- メトキシ-1-メチル-6,7- ジヒドロ-ピリド[2,1- a]イソキノリン-2-オン	化合物 21	M17	436	437
24		9-(2,2-ジフルオロ-エトキシ)- 8-メトキシ-1-メチル-4- [(テトラヒドロ-フラン-2- イルメチル)-アミノ]-6,7- ジヒドロ-ピリド[2,1- a]イソキノリン-2-オン	中間体 74	M17	420	421
25		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ-1-メチル-2- オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ [a]キノリジン-9- カルボニトリル	化合物 37	M20	352	353
26		9-(2,2-ジフルオロエトキシ)- 1-エチル-4- (テトラヒドロフラン-2- イルメチルアミノ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 10	M17	404	405

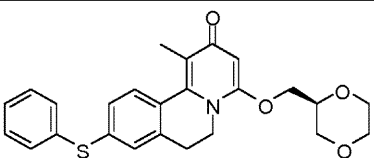
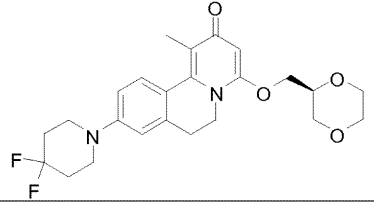
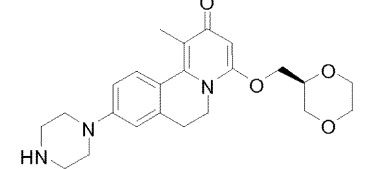
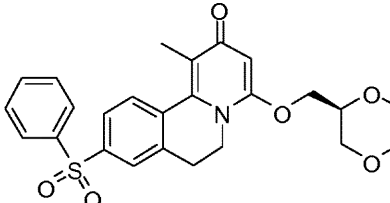
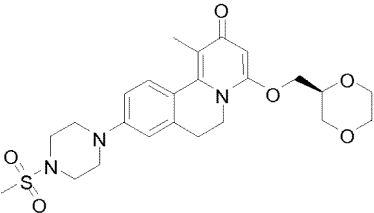
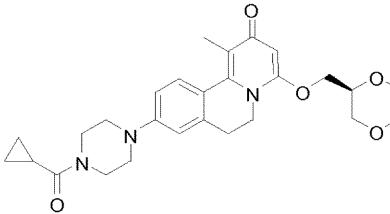
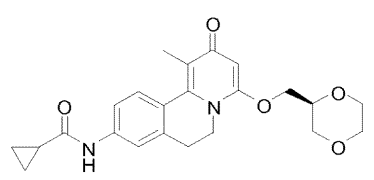
化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
27		1-エチル-4- (テトラヒドロフラン-2- イルメチルアミノ)-9- (2,2,2-トリフルオロエトキシ)- 6,7-ジヒドロベンゾ [a]キノリジン-2-オン	中間体 10	M17	422	423
28		8,9-ジメトキシ-1- メチル-4- (テトラヒドロフラン-2- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 47	M15	371	372
29		8,9-ジメトキシ-1- メチル-4- (テトラヒドロピラン-2- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 47	M15	385	386
30		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル-9- (テトラヒドロピラン-4- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 85	M17	442	442
31		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル-9- (2-ピリジルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 85	M17	434	435
32		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル-9- [[3-(トリフルオロメトキシ) フェニル]メトキシ]-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 85	M17	518	518
33		9-ベンジルオキシ-4-[[[(2S)- 1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル- 6,7-ジヒドロベンゾ [a]キノリジン-2-オン	中間体 24	M17	434	434
34		9-ベンジルオキシ-4-[[[(2R)- 1,4-ジオキサン-2- イル]メチルアミノ]-1- メチル-6,7- ジヒドロベンゾ [a]キノリジン-2-オン	中間体 28	M24	433	433

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
35		9-(2,2-ジフルオロエトキシ)- 4-[[[(2R)-1,4-ジオキサン-2- イル]メチルアミノ]-1- メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 28	M17	406	407
36		4-[[[(2R)-1,4-ジオキサン-2- イル]メチルアミノ]-1- メチル-9-(2,2,2- トリフルオロエトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 28	M17	424	425
37		[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル-2- オキソ-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-9-イル] トリフルオロメタンスルホ ネート	化合物 85	M18	475	
38		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル-9- [(1-メチルピラゾール-4- イル)メトキシ]-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 85	M17	438	438
39		9-(3,6-ジヒドロ-2H- ピラン-4-イル)-4-[[[(2S)-1,4- ジオキサン-2-イル]メトキシ]- 1-メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 37	M21	409	410
40		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-9-(1- エチルピラゾール-4-イル)-1- メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 37	M21	422	42
41		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2- イル]メトキシ]-1-メチル-9- テトラヒドロピラン-4-イル- 6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 39	M29	412	412

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
42		1-メチル-4-[[[(2S)- テトラヒドロフラン-2- イル]メチルアミノ]-9- (2,2,2-トリフルオロエトキシ)- 6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 23	M17	408	409
43		1-メチル-9-[(3-メチル- 1,2,4-オキサジアゾール-5- イル)メトキシ]-4- (テトラヒドロフラン-2- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 25	M17	423	424
44		1-メチル-9-[(3-メチル- 1,2,4-オキサジアゾール-5- イル)メトキシ]-4- (テトラヒドロピラン-2- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 26	M17	438	438
45		1-メチル-9-(2- ピリジルメトキシ)-4- (テトラヒドロフラン-2- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 25	M17	418	419
46		1-メチル-9-(2- ピリジルメトキシ)-4- (テトラヒドロピラン-2- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 26	M17	433	433
47		1-メチル-4- (テトラヒドロフラン-2- イルメトキシ)-9- (テトラヒドロピラン-3- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 25	M17	426	426
48		1-メチル-4- (テトラヒドロピラン-2- イルメトキシ)-9- (テトラヒドロピラン-3- イルメトキシ)-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	中間体 26	M17	440	440

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
49		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(テトラヒドロピラン-3-イルメトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	442	442
50		1-メチル-9-[(6-メチル-3-ピリジル)メトキシ]-4-(テトラヒドロフラン-2-イルメトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 25	M17	433	433
51		1-メチル-9-[(6-メチル-3-ピリジル)メトキシ]-4-(テトラヒドロピラン-2-イルメトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 26	M17	447	447
52		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[(6-メチル-3-ピリジル)メトキシ]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	449	449
53		9-(2-ジメチルアミノエチルオキシ)-1-メチル-4-(テトラヒドロフラン-2-イルメトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 25	M17	399	399
54		9-(2-ジメチルアミノエチルオキシ)-1-メチル-4-(テトラヒドロピラン-2-イルメトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 26	M17	413	413
55		9-(2-ジメチルアミノエチルオキシ)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	415	415

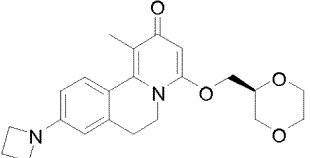
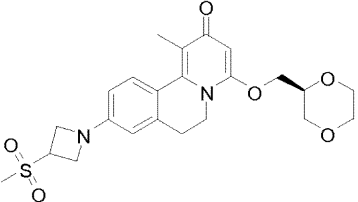
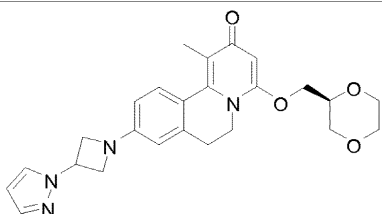
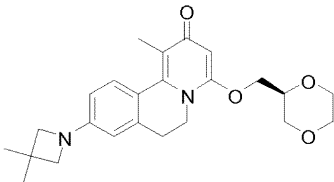
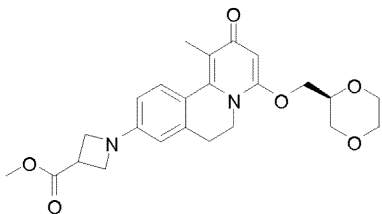
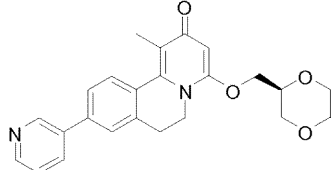
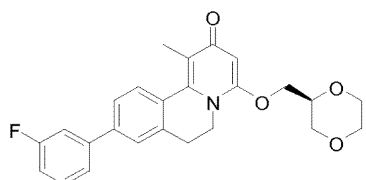
化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
56		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]メタンスルホネート	化合物 85	M17	421	422
57		1-メチル-9-(2-ピリジルメトキシ)-4-[[[(2S)-テトラヒドロフラン-2-イル]メトキシ]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 25	M17	418	419
58		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)メトキシ]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	439	440
59		9-(ジフルオロメトキシ)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	上述	393	394
60		tert-ブチル 4-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]ピペラジン-1-カルボキシレート	化合物 37	M19	512	512
61		9-(2,2-ジフルオロエトキシ)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	407	408
62		4,9-ビス[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	443	444
63		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-モルホリノ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	412	413

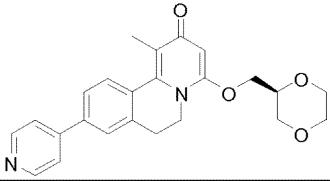
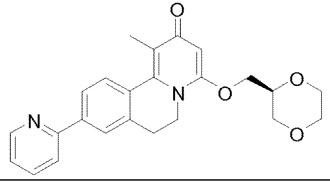
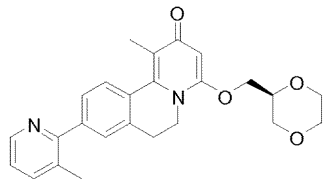
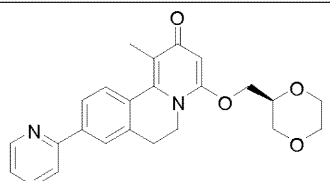
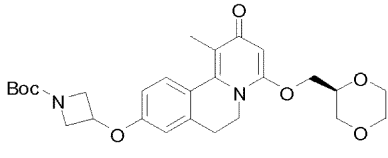
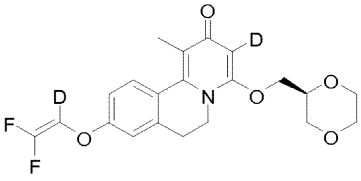
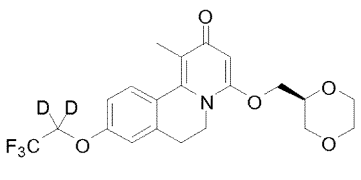
化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
64		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-フェニルスルファニル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	上述	436	436
65		9-(4,4-ジフルオロ-1-ピペリジル)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	446	447
66		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-ピペラジン-1-イル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 60	M27	412	412
67		9-(ベンゼンスルホニル)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 64	上述	468	468
68		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(4-メチルスルホニルピペラジン-1-イル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 66	M28	490	490
69		9-[4-(シクロプロパンカルボニル)ピペラジン-1-イル]-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 66	M28	480	480
70		N-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]シクロプロパンカルボキサミド	化合物 37	水 活性化 ブッフ バルト (Buch wald)	410	411

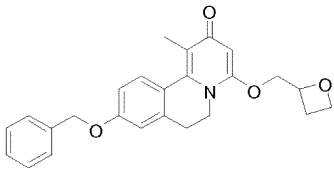
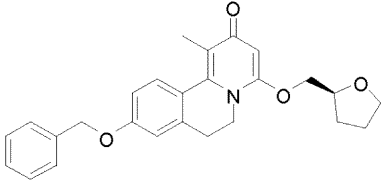
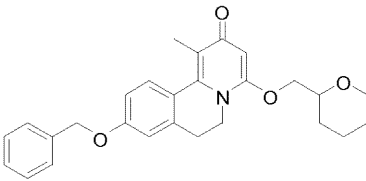
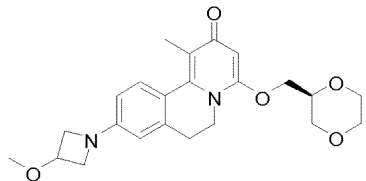
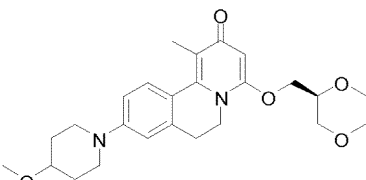
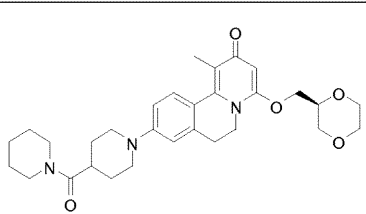
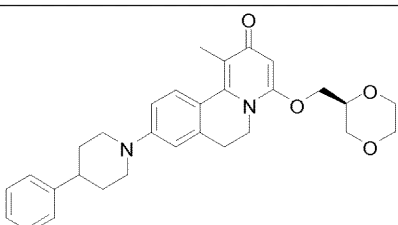
化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
71		tert-ブチル 3-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]アゼチジン-1-カルボキシレート	化合物 37	M22	483	483
72		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[2-(トリフルオロメトキシ)エトキシ]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	455	456
73		N-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-N-メチルシクロプロパンカルボキサミド	化合物 70	上述	425	425
74		tert-ブチル 4-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-カルボキシレート	化合物 37	M21	509	509
75		tert-ブチル 4-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]ピペリジン-1-カルボキシレート	化合物 74	M29	511	511
76		メチル 4-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-カルボキシレート	中間体 29	M28	467	467
77		エチル 4-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-カルボキシレート	中間体 29	M28	481	481

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
78		イソプロピル 4-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-カルボキシレート	中間体 29	M28	495	495
79		2,2,2-トリフルオロエチル 4-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-カルボキシレート	中間体 29	M28	535	535
80		メチル 4-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]ピペリジン-1-カルボキシレート	中間体 30	M28	469	469
81		エチル 4-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]ピペリジン-1-カルボキシレート	中間体 30	M28	483	483
82		イソプロピル 4-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]ピペリジン-1-カルボキシレート	中間体 30	M28	497	497
83		2,2,2-トリフルオロエチル 4-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]ピペリジン-1-カルボキシレート	中間体 30	M28	537	537
84		N-シクロプロピル-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-カルボキサミド	化合物 37	上述	410	411

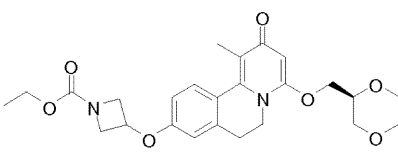
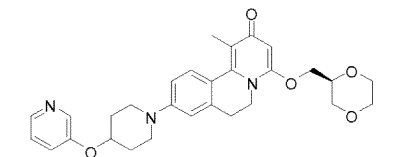
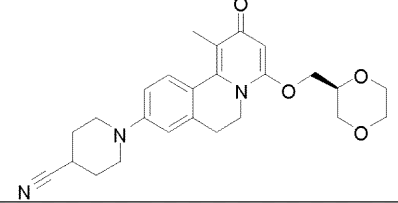
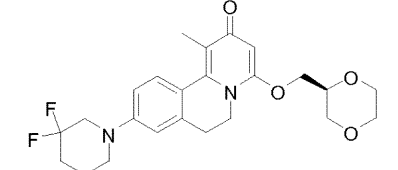
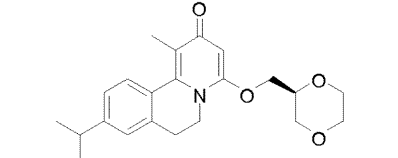
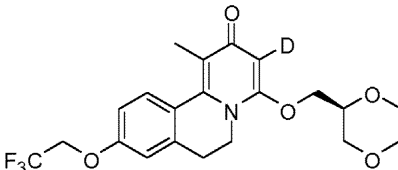
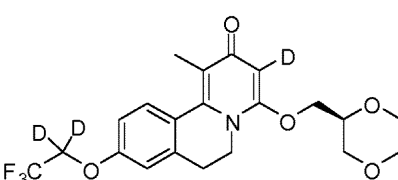
化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
85		4-[[<i>(2S)</i> -1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-ヒドロキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[<i>a</i>]キノリジン-2-オン	化合物 33	上述	343	344
86		9-(3,3-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-4-[[<i>(2S)</i> -1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[<i>a</i>]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	418	419
87		4-[[<i>(2S)</i> -1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(6-オキサ-2-アザスピロ[3.3]ヘプタン-2-イル)-6,7-ジヒドロベンゾ[<i>a</i>]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	424	425
88		N-シクロプロピル-4-[[<i>(2S)</i> -1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-N,1-ジメチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[<i>a</i>]キノリジン-9-カルボキサミド	化合物 37	Pd を触媒とするアミノカルボニル化	425	425
89		4-[[<i>(2S)</i> -1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-メトキシ-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[<i>a</i>]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	357	358
90		4-(1,4-ジオキサン-2-イルメトキシ)-1-メチル-9-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[<i>a</i>]キノリジン-2-オン	中間体 113	M17	425	426
91		4-[[<i>(2S)</i> -1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[<i>a</i>]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	400	401
92		4-[[<i>(2S)</i> -1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-[3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)アゼチジン-1-イル]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[<i>a</i>]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	441	441

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
93		9-(アゼチジン-1-イル)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	382	383
94		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(3-メチルスルホニルアゼチジン-1-イル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	461	461
95		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(3-ピラゾール-1-イルアゼチジン-1-イル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	449	449
96		9-(3,3-ジメチルアゼチジン-1-イル)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	411	411
97		メチル 1-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]アゼチジン-3-カルボキシレート	化合物 37	M19	440	441
98		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(3-ピリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M21	404	405
99		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-(3-フルオロフェニル)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M21	421	422

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
100		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(4-ピリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M21	404	405
101		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(2-ピリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M21	404	405
102		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(3-メチル-2-ピリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M21	418	419
103		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(4-メチル-2-ピリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M21	418	419
104		tert-ブチル 3-[[[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]オキシ]アゼチジン-1-カルボキシレート	化合物 85	M17	499	499
105		3-ジユウテリオ-9-(1-ジユウテリオ-2,2-ジフルオロビニルオキシ)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 18	リチオ 化- 重水素 化	407	408
106		9-(1,1-ジジユウテリオ-2,2,2-トリフルオロ-エトキシ)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	427	428

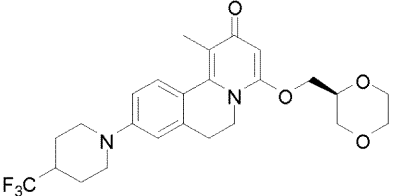
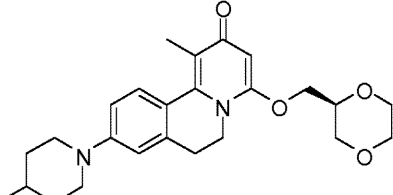
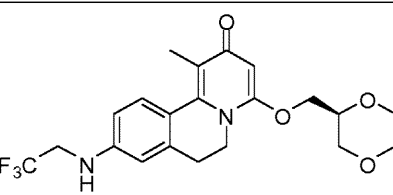
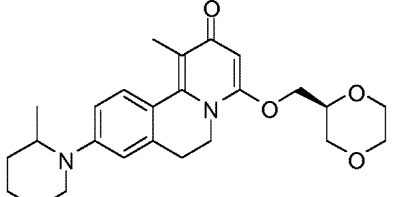
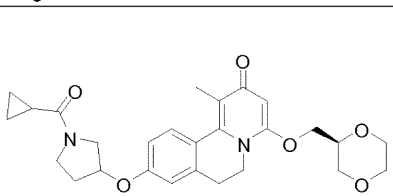
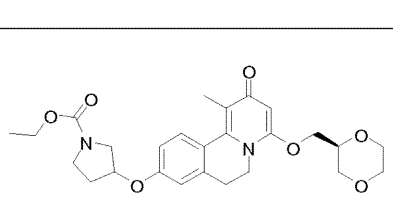
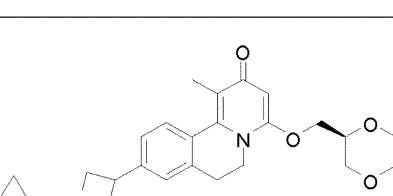
化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
107		9-ベンジルオキシ-1-メチル-4-(オキセタン-2-イルメトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 24	M15	403	404
108		9-ベンジルオキシ-1-メチル-4-[(2S)-テトラヒドロフラン-2-イル]メトキシ]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 24	M15	418	418
109		9-ベンジルオキシ-1-メチル-4-(テトラヒドロピラン-2-イルメトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 24	M15	432	432
110		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-(3-メトキシアゼチジン-1-イル)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	412	413
111		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-(4-メトキシ-1-ピペリジル)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	441	441
112		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[4-(ピペリジン-1-カルボニル)-1-ピペリジル]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	522	522
113		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(4-フェニル-1-ピペリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	487	487

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
114		メチル 1-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]ピペリジン-4-カルボキシレート	化合物 37	M19	469	469
114		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-[4-(エトキシメチル)-1-ピペリジル]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	469	469
115		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(1-ピペリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	411	411
116		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(3-メチル-1-ピペリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	425	425
117		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-[4-(4-フルオロフェニル)-1-ピペリジル]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	505	505
118		9-[1-(シクロプロパンカルボニル)アゼチジン-3-イル]オキシ-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 31	M28	467	467
119		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[1-(2,2,2-トリフルオロアセチル)アゼチジン-3-イル]オキシ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 31	M28	494	495

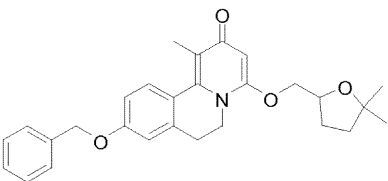
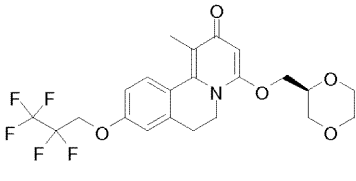
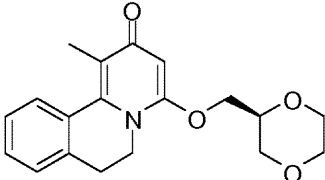
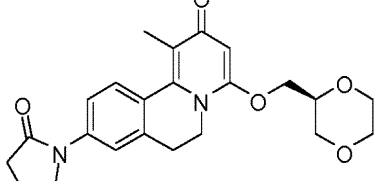
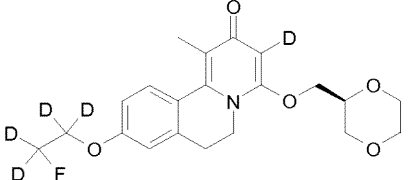
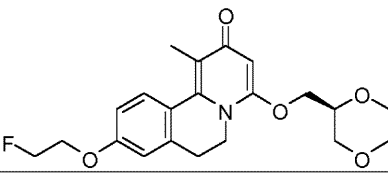
化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
120		エチル 3-[[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]オキシ]アゼチジン-1-カルボキシレート	中間体 31	M28	471	471
121		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[4-(3-ピリジルオキシ)-1-ピペリジル]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	504	504
122		1-[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]ピペリジン-4-カルボニトリル	化合物 37	M19	436	436
123		9-(3,3-ジフルオロ-1-ピペリジル)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	446	447
124		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-イソプロピル-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M22	369	370
125		3-ジュウテリオ-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 126	上述	426	427
126		3-ジュウテリオ-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(1,1,2,2-テトラジュウテリオ-2-フルオロ-エトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 105	上述	394	395

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
127		tert-ブチル 3-[[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]オキシ]ピロリジン-1-カルボキシレート	化合物 85	M17	513	513
128		tert-ブチル 4-[[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]オキシ]ピペリジン-1-カルボキシレート	化合物 85	M17	527	527
129		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[メチル(3,3,3-トリフルオロプロピル)アミノ]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	453	453
130		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-ピロリジン-1-イル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	396	397
131		9-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	432	433
132		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[3-(トリフルオロメチル)アゼチジン-1-イル]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	450	451
133		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[4-(トリフルオロメチル)-3,6-ジヒドロ-2H-ピリジン-1-イル]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	476	477

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
134		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9- [(2R)-2- メチルピロリジン-1-イル]- 6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 37	M19	411	411
135		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-(3-フルオロ- 1-ピペリジル)-1-メチル- 6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 37	M19	429	429
136		9-カルバゾール-9-イル-4- [[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル- 6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 37	M19	493	493
137		9-(3,5-ジメチル-1- ピペリジル)-4-[[[(2S)-1,4- ジオキサン-2-イル]メトキシ]- 1-メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 37	M19	439	439
138		9-(3,3- ジメチルピロリジン-1- イル)-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン- 2-イル]メトキシ]-1-メチル- 6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 37	M19	425	425
139		9-(4,4-ジメチル-1- ピペリジル)-4-[[[(2S)-1,4- ジオキサン-2-イル]メトキシ]- 1-メチル-6,7- ジヒドロベンゾ[a]キノリ ジン-2-オン	化合物 37	M19	439	439

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
140		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-[4-(トリフルオロメチル)-1-ピペリジル]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	479	479
141		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(4-メチル-1-ピペリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	425	425
142		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	424	425
143		4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(2-メチル-1-ピペリジル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	M19	425	426
144		9-[1-(シクロプロパンカルボニル)ピロリジン-3-イル]オキシ-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 32	M28	481	481
145		エチル 3-[[4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]オキシ]ピロリジン-1-カルボキシレート	中間体 32	M28	485	485
146		9-[1-(シクロプロパンカルボニル)アゼチジン-3-イル]-4-[[[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 33	M28	451	451

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
147		エチル 3-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]アゼチジン-1-カルボキシレート	中間体 33	M28	455	455
148		3-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-N,N-ジメチルアゼチジン-1-カルボキサミド	中間体 33	M28	454	454
149		3-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-N-イソプロピルアゼチジン-1-カルボキサミド	中間体 33	M28	468	468
150		3-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]オキシ]-N,N-ジメチルアゼチジン-1-カルボキサミド	中間体 33	M28	470	470
151		3-[4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-2-オキソ-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-9-イル]-N-イソプロピルアゼチジン-1-カルボキサミド	中間体 33	M28	484	484
152		9-ベンジルオキシ-4-[(4,4-ジメチルオキセタン-2-イル)メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 3	M15	432	432
153		9-ベンジルオキシ-1-メチル-4-[(2-メチルテトラヒドロフラン-2-イル)メトキシ]-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 24	M15	432	432

化合物 #	構造	名称	SM	方法	MW	Mes
154		9-ベンジルオキシ-4-[(5,5-ジメチルテトラヒドロフラン-2-イル)メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	中間体 24	M15	446	446
155		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	327	328
156		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	上述	327	328
157		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(2-オキソピロリジン-1-イル)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 37	上述	410	411
158		3-ジュウテリオ-4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-1-メチル-9-(1,1,2,2-テトラジュウテリオ-2-フルオロ-エトキシ)-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 105	上述	395	ND
159		4-[(2S)-1,4-ジオキサン-2-イル]メトキシ]-9-(2-フルオロエトキシ)-1-メチル-6,7-ジヒドロベンゾ[a]キノリジン-2-オン	化合物 85	M17	389	390

表IV. 本発明の例示的な化合物のNMRデータ

【表4】

化合物#	NMR
1	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.15, s, 1 H; 6.75, s, 1 H; 5.83, s, 1 H; 4.05, m, 1 H; 4.01, m, 2 H; 3.97, m, 2H; 3.92, s, 3H; 3.87, s, 3H; 3.83, m, 2H; 3.75, m, 2H; 3.65, m, 1 H, 3.50, m, 1 H; 2.84, t, 2H; 2.30, s, 3H
2	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.11 (1 H, s), 6.99 (1 H, s), 5.97 (1 H, t), 5.40 (1 H, s), 4.05 (1 H, m), 4.12 (1 H, m), 3.80 (3 H, s), 3.75 (3 H, s), 3.84-3.60 (3 H, m), 3.08 (2 H, m), 2.82 (2 H, t), 2.08 (3 H, s), 1.98 (1 H, m), 1.85 (2 H, m), 1.60 (1 H, m).

化合物#	NMR
3	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 8.50, s, 1 H; 7.50, d, 1 H; 6.85, d, 2H; 6.10, s, 1 H; 4.20, m, 1 H; 3.95, m, 3H; 3.80, q, 1 H; 3.40, dd, 1 H; 3.30, m, 1 H; 2.90, t, 2H; 2.70, q, 2H; 2.15, m, 1 H; 2.00, m, 2H; 1.70, m, 1 H; 1.30, t, 3H.
4	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.22, s, 1.0 H; 6.94, s, 1.0 H; 6.33, d, 1.0 H; 6.07, t, 1.0 H; 5.33, s, 1.0 H; 4.06, m, 1.0 H; 3.9÷3.75, m+d?, 9 H; 3.65, m, 1 H; 3.05, m, 2 H; 2.9, m, 2 H; 1.98, m, 1 H; 1.86, m, 2 H; 1.62, m, 1 H.
5	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.22, s, 1 H; 6.94, s, 1.0 H; 6.35, s, 1.0 H; 6.13, t, 1 H; 5.31, d, 1.0 H; 3.85-3.72, 様々なシグナル, 11 H; 3.72÷3.55, m, 2 H; 3.55÷3.45, m, 2 H; 3.05, m, 2 H; 2.90, m, 2 H.
6	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.11 (1 H, s), 6.99 (1 H, s), 6.04 (1 H, t), 5.39 (1 H, s), 3.82 (3 H, s), 3.75 (3 H, s), 3.85-3.60 (4 H, m), 3.59 (1 H, dt), 3.49 (2 H, m), 3.26 (2 H, AB system), 3.05 (2 H, m), 2.82 (2 H, t), 2.09 (3 H, s).
7	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.50, d, 1.0 H; 6.99, d, 1.0 H; 6.91, dd, 1.0 H; 5.97, t, 1 H; 5.38, s, 1 H; 4.22, m, 1 H; 4.05, m, 2 H; 3.78, m, 3 H; 3.65, m, 1 H; 3.07, m, 2 H; 2.85, m, 2 H; 2.25, m, 1 H; 2.0, s, 3.0 H; 2.0÷1.9, 1 H; 1.9÷1.68, m, 3 H; 1.68÷1.4, 2 m, 2 H.
8	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.55, d, 1.0 H; 7.10, d, 1 H; 7.02, dd, 1 H; 5.98, t, 1.0 H; 5.39, s, 1.0 H; 4.83, q, 2 H; 4.05, m, 1 H; 3.75, m, 3 H; 3.65, m, 1 H; 3.06, m, 2 H; 2.88, m, 2 H; 2.02, s, 3 H; 2.0÷1.9, m, 1 H; 2.9÷2.75, m, 2 H; 1.6, m, 1 H.
10	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.50, br, 1 H; 7.25, d, 1 H; 6.88, d, 1 H; 6.50, s, 1 H; 6.18, br, 1 H; 4.20, m, 1 H; 4.10-4.0, m, 1 H; 3.90, s, 3H; 3.90-3.80, m, 4H; 3.80-3.60, m, 1 H; 3.40-3.30, m, 1 H; 3.20-3.15, m, 1 H; 3.10-2.90, m, 2H; 2.22, s, 3H; 2.10-2.00, m, 1 H; 2.00-1.90, m, 2H; 1.70-1.60, m, 1 H.
12	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.81, s, 1 H; 7.44, d, 1 H; 6.98, d, 1 H; 4.33-4.36, m, 2 H; 4.20-4.24, m, 2 H; 4.02-4.06, m, 1 H; 3.98, s, 3 H; 3.88, s, 3 H; 3.81-3.84, m, 2 H; 3.75-3.80, m, 2 H; 3.62-3.68, m, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.08, t, 2 H; 2.39, s, 3 H.
13	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.53, d, 1 H; 6.89, dd, 1 H; 6.84, d, 1 H; 6.14, s, 1 H; 6.11, tt, CF ₂ H, 1 H; 5.42, b, 1 H; 4.24, td, 2H; 4.05, m, 1 H; 3.91, m, 2H; 3.63, m, 1 H; 3.43, m, 1 H; 3.22, m, 1 H; 3.10, m, 1 H; 2.95, t, 2H; 2.28, s, 3H; 1.84, b, 1 H; 1.65, d, 1 H; 1.52, b, 3H; 1.32, m, 1 H.
14	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.53, d, 1 H; 6.89, m, 2H; 6.14, s, 1 H; 5.50, b, 1 H; 4.41, q, 2H; 4.08, m, 1 H; 3.91, m, 2H; 3.63, t, 1 H; 3.43, m, 1 H; 3.22, m, 1 H; 3.10, m, 1 H; 2.95, t, 2H; 2.28, s, 3H; 1.84, b, 1 H; 1.65, d, 1 H; 1.52, b, 3H; 1.32, m, 1 H.
16	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.30, d, 1 H; 6.85, d, 1 H; 5.75, s, 1 H; 4.52, br, 1 H; 4.00-3.92, m, 1 H; 3.90, s, 3H; 3.90-3.85, m, 1 H; 3.82, s, 3H; 3.75-3.65, m, 1 H; 3.62-3.54, m, 1 H; 3.48-3.40, m, 1 H; 3.20-3.12, m, 1 H; 3.08-3.00, m, 3H; 2.97-2.90, m, 1 H; 2.23, s, 3H; 1.85, br, 1 H, 1.13, m, 1 H; 1.55-1.50, m, 2H; 1.90-1.80, m, 2H.
17	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.33, d, 1 H; 6.91, d, 1 H; 6.30, s, 1 H; 4.95, br, 1 H; 3.95, s, 3H; 3.85, s, 3H; 3.80-3.70, m, 4H; 3.65-3.60, m, 4H; 3.45, m, 1 H; 3.25, br, 1 H, 3.15-3.05, br, 2H; 3.00, br, 1 H; 2.30, s, 3H.
18	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.63, d, 1 H; 6.92, dd, 1 H; 6.88, d, 1 H; 6.14, s, 1 H; 4.42, q, 2H; 4.10, m, 2H; 4.02, m, 3H; 3.85, td, 2H, 3.80, dd, 1 H; 3.76, m, 1 H; 3.65, m, 1 H; 3.52, m, 1 H; 2.93, t, 2H; 2.29, s, 3H.
19	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.26, d, 1 H; 6.82, d, 1 H; 6.70, 1 H; 6.20, br, 1 H; 5.84, s, 1 H; 4.02-3.98, m, 2H; 3.98-3.84, m, 4H; 3.83, m, 1 H; 3.81, s, 3H; 3.80-3.74, m, 3H; 3.62-3.58, m, 1 H; 3.40, dd, 1 H; 3.20-3.10, br, 2H; 3.15-3.00, br t, 2H.
20	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.31, d, 1 H; 6.92, m, 2H; 6.28, br, 1 H; 6.10, s, 1 H; 4.20, br, 1 H; 4.10-4.00, m, 1 H; 4.00-3.90, m, 1 H; 3.78, s, 3H; 3.85, m, 1 H; 3.82, s, 3H; 3.81-3.75, m, 1 H; 3.30, br, 1 H; 3.20-3.00, br, 3H; 2.10, m, 1 H; 2.00-1.90, m, 2H; 1.70-1.50, m, 1 H.

化合物 #	NMR
23	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.32, d, 1.0 H; 7.10, d, 1.0 H; 6.46, tt, 1.0 H; 6.00, m, 1.0 H; 5.37, s, 1.0 H; 4.42, td, 2 H; 3.85, dd, 1 H; 3.82, s, 3 H; 3.76, m, 3 H; 3.7÷3.4, m's, 1+1+2 H; 3.3÷3.2, m, 1 H; 3.05, m, 2 H; 2.85, m, 2.0 H; 2.03, sm 3 H.
24	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.32, d, 1.0 H; 7.09, d, 1.0 H; 6.46, tt, 1 H; 5.95, m, 1.0 H; 5.39, s, 1.0 H; 4.43, td, 2 H; 4.04, m, 1 H; 3.85÷3.70, m+s, 3+3 H; 3.65, m, 1 H; 3.1, m, 2 H; 2.9, m, 2 H; 2.02, s, 3 H; 1.97, m, 1 H; 1.84, m, 2 H; 1.60, m, 1 H.
25	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.77, d, 1 H; 7.67, dd, 1 H; 7.61, d, 1 H; 6.19, s, 1 H; 4.09, m, 5H; 3.83, m, 4H; 3.65, td, 1 H; 3.52, t, 1 H; 2.99, t, 2H; 2.31, s, 3H.
26	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 6.88, d, 1 H; 6.82, s, 1 H; 6.30-5.95, tt, 1 H; 5.28, s, 1 H; 4.40, br, 1 H; 4.30-4.10, m, 3H; 4.00-3.90, m, 1 H; 3.90-3.65, m, 3H; 3.24, m, 1 H; 3.05, m, 1 H; 2.95-2.80, m, 2H; 2.80-2.60, m, 2H; 2.10-2.00, m, 1 H; 2.95, q, 2H; 1.65, m, 1 H; 1.68, t, 3H.
27	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.60, d, 1 H; 6.91, d, 1 H; 6.88, s, 1 H; 5.70, s, 1 H; 4.50, br, 1 H; 4.92, q, 2H; 4.17m, 1 H; 4.00, m, 1 H; 3.90-3.80, m, 1 H; 3.80-3.70, m, 2H; 3.30-3.20, m, 1 H; 3.10-3.00, m, 1 H; 2.95-2.85, m, 2H; 2.80-2.60, m, 2H; 2.10-2.00, m, 1 H; 1.95-1.90, q, 2H; 1.70-1.60, m, 1 H; 1.28, t, 3H.
28	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.40, d, 1 H; 6.80, d, 1 H; 5.95, s, 1 H; 4.30, qd, 1 H; 4.10, dd, 1 H; 4.05-3.95, m, 3H; 3.92-3.90, m, 5H; 3.85, s, 3H; 2.95, t, 2H; 2.28, s, 3H; 2.15-2.05, m, 1 H; 2.00-1.90, m, 2H; 1.75-1.65, m, 1 H.
29	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.40, d, 1 H; 6.90, d, 1 H; 5.92, s, 1 H; 4.05-3.95, m, 5H; 3.92, s, 3H; 3.85, s, 3H; 3.78-7.70, m, 1 H; 3.50-3.40, td, 1 H; 2.95, t, 2H; 2.28, s, 3H; 2.95-2.90, m, 1 H; 1.7-1.4, m, 5H
30	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.57, d, 1 H; 6.85, dd, 1 H; 6.78, d, 1 H; 5.93, s, 1 H; 3.98-4.09, m, 7 H; 3.81-3.90, m, 4 H; 3.74-3.79, m, 2 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.42-3.54, m, 3 H; 2.88, t, 2 H; 2.28, s, 3 H; 2.06-2.12, m, 1 H; 1.75-1.79, m, 2 H; 1.51, dd, 1 H; 1.44, dd, 1 H
31	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.62, d, 1 H; 7.75, td, 1 H; 7.59, d, 1 H; 7.52, d, 1 H; 7.27, d, 1 H; 6.97, dd, 1 H; 6.90, d, 1 H; 6.21, s, 1 H; 5.27, s, 2 H; 4.04-4.13, m, 2 H; 3.99-4.04, m, 3 H; 3.85-3.88, m, 1 H; 3.81-3.83, m, 1 H; 3.74-3.79, m, 2 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.89, t, 2 H; 2.29, s, 3 H
32	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.61, d, 1 H; 7.44, t, 1 H; 7.36, d, 1 H; 7.31, s, 1 H; 7.20, d, 1 H; 6.95, dd, 1 H; 6.89, d, 1 H; 6.28, s, 1 H; 5.14, s, 2 H; 4.10-4.14, m, 2 H; 3.99-4.08, m, 3 H; 3.81-3.89, m, 2 H; 3.75-3.79, m, 2 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.91, t, 2 H; 2.30, s, 3 H.
34	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.52, d, 1 H; 7.39-7.46, m, 4 H; 7.33-7.37, m, 1 H; 6.94, dd, 1 H; 6.88, d, 1 H; 6.06, s, 1 H; 5.31, br s, 1 H; 5.13, s, 2 H; 4.00-4.05, m, 1 H; 3.07-3.92, m, 2 H; 3.81, dd, 1 H; 3.69-3.75, m, 3 H; 3.57, ddd, 1 H; 3.41, dd, 1 H; 3.18-3.24, m, 1 H; 3.09-3.15, m, 1 H; 2.93, t, 2 H; 2.30, s, 3 H
35	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.52, d, 1 H; 6.88, dd, 1 H; 6.83, d, 1 H; 6.11, tt, 1 H; 6.01, s, 1 H; 5.68, b, 1 H; 4.24, td, 2H; 4.01, m, 1 H; 3.87, m, 2H; 3.80, m, 1 H; 3.75, m, 1 H; 3.68, d, 2H; 3.56, m, 1 H; 3.37, t, 1 H; 3.15, m, 2H; 2.93, t, 2H; 2.26, s, 3H
36	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.54, d, 1 H; 6.89, dd, 1 H; 6.86, d, 1 H; 5.78, s, 1 H; 4.60, br, 1 H; 4.41, q, 2 H; 3.93-3.99, m, 1 H; 3.85-3.90, m, 1 H; 3.76-3.82, m, 3 H; 3.71-3.74, m, 2 H; 3.60, ddd, 1 H; 3.42, dd, 1 H; 3.12-3.17, m, 1 H; 3.03-3.09, m, 1 H; 2.93, t, 2 H; 2.25, s, 3 H
38	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.60, d, 1 H; 7.57, s, 1 H; 7.47, s, 1 H; 6.94, dd, 1 H; 6.86, d, 1 H; 6.52, s, 1 H; 5.02, s, 2 H; 4.14-4.16, m, 2 H; 4.08-4.10, t, 2 H; 4.01-4.05, m, 1 H; 3.92, s, 3 H; 3.87, dd, 1 H; 3.81-3.84, m, 1 H; 3.75-3.79, m, 2 H; 3.66, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 2.91, t, 2 H; 2.32, s, 3 H.
39	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.63, d, 1 H; 7.39, dd, 1 H; 7.30, d, 1 H; 6.26-6.27, m, 1 H; 6.25, s, 1 H; 4.36, dd, 2 H; 4.01-4.13, m, 4 H; 3.96, t, 2 H; 3.75-3.89, m, 5 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.94, t, 2 H; 2.54-2.57, m, 2 H; 2.32, s, 3 H.

化合物 #	NMR
40	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.83, s, 1 H; 7.73, s, 1 H; 7.63, d, 1 H; 7.45, dd, 1 H; 7.39, d, 1 H; 6.21, s, 1 H; 4.23, q, 2 H; 4.00-4.14, m, 5 H; 3.85-3.89, m, 2 H; 3.77-3.82, m, 1 H; 3.74-3.77, m, 1 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.95, t, 2 H; 2.32, s, 3 H, 1.54, t, 3 H.
41	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.60, d, 1 H; 7.22, dd, 1 H; 7.14, d, 1 H; 6.23, s, 1 H; 4.09-4.14, m, 3 H; 4.00-4.07, m, 3 H; 3.81-3.89, m, 2 H; 3.75-3.80, m, 2 H; 3.50-3.67, m, 5 H; 2.92, t, 2 H; 2.79-2.84, m, 1 H; 2.32, s, 3 H; 1.78-1.87, m, 4 H.
42	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.54, d, 1 H; 6.89, dd, 1 H; 6.85, d, 1 H; 5.80, s, 1 H; 4.84, br, 1 H; 4.40, q, 2 H; 4.14-4.21, m, 1 H; 3.97-4.03, m, 1 H; 3.83-3.88, m, 1 H; 3.71-3.80, m, 2H; 3.22-3.27, m, ; 1.94, p, 2 H; 1.62-1.69, m, 1 H.
43	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.62, d, 1 H; 6.97, dd, 1 H; 6.92, d, 1 H; 6.31, s, 1 H; 5.33, s, 2 H; 4.32, ddd, 1 H; 4.10-4.17, m, 2 H; 4.03-4.07, m, 2 H; 3.83-3.93, m, 2H; 2.91, t, 2 H; 2.45, s, 3 H; 2.30, s, 3 H; 2.09-2.14, m, 1 H; 1.95-2.01, m, 2 H; 1.68-1.73, m, 1 H
44	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.62, d, 1 H; 6.96, dd, 1 H; 6.91, d, 1 H; 6.26, s, 1 H; 5.33, s, 2H; 4.00-4.13, m, 5H; 3.71-3.75, m, 1 H; 3.45-3.51, m, 1 H; 2.90, t, 2H; 2.45, s, 3H; 2.29, s, 3H; 1.91-1.94, m, 1 H; 1.54-1.66, m, 4H; 1.41-1.48, m, 1 H
45	¹ H NMR (CDCl ₃):8.6, d, 1 H; 7.7, m, 1 H; 7.51, dd, 2H; 7.23, 1 H; 6.92, d, 1 H; 6.85, s, 1 H; 5.95, s, 1 H; 5.22, s, 2H; 4.28, m, 1 H; 4.10-3.90, m, 4H; 3.90-3.75, m, 2H; 2.84, t, 2H; 2.22, s, 3H; 2.10-2.00, m, 1 H; 1.85-2.00, m, 2H; 1.70-1.60, m, 1 H.
47	¹ H NMR (CDCl ₃):7.55, d, 1 H; 6.85, d, 1 H; 6.78, s, 1 H; 6.03, s, 1 H; 4.30, qd, 1 H; 4.10-3.95, m, 5H; 3.95-3.80, m, 5H; 3.50-3.40, m, 1 H; 3.37, dd, 1 H; 2.85, t, 2H; 2.28, s, 3H; 2.20-2.00, m, 2H; 2.00-1.85, m, 3H; 1.70-1.60, m, 3H; 1.50-1.40, m, 1 H
50	¹ H NMR (CDCl ₃):8.58, s, 1 H; 7.75, d, 1 H; 7.68, d, 1 H; 7.19, d, 1 H; 6.90, d, 1 H; 6.81, s, 1 H; 5.99, s, 1 H; 5.10,s, 2H; 4.25, m, 1 H; 4.19-3.95, m, 4H; 3.94-3.80, m, 2H; 2.85, t, 2H; 2.78, s, 3H; 2.24, s, 3H; 2.20-2.00, m, 1 H; 2.00-1.90, m, 2H; 1.86-1.80, m, 1 H
53	¹ H NMR (CD ₃ OD): 7.72, d, 1 H; 7.06-7.09, m, 2 H; 6.04, s, 1 H; 4.47, t, 2 H; 4.37, ddd, 1 H; 4.26, dd, 1 H; 4.09-4.20, m, 3 H; 3.85-3.98, m, 2 H; 3.61, t, 2 H; 2.97-3.00, m, 2 H; 2.98, s, 6 H; 2.28, s, 3 H; 2.13-2.21, m, 1 H; 1.98-2.06, m, 2 H; 1.78-1.87, m, 1 H.
54	¹ H NMR (CD ₃ OD): 7.71, d, 1 H; 7.05-7.08, m, 2 H; 6.03, s, 1 H; 4.47, t, 2 H; 4.11-4.21, m, 4 H; 4.01-4.05, m, 1 H; 3.80-3.86, m, 1 H; 3.61, t, 2 H; 3.53-3.58, m, 1 H; 2.96-2.99, m, 2 H; 2.98, s, 6 H; 2.27, s, 3 H; 1.95-1.98, m, 1 H; 1.72-1.75, m, 1 H; 1.59-1.68, m, 3 H; 1.48-1.55, m, 1 H.
55	¹ H NMR (CD ₃ OD): 7.72, d, 1 H; 7.06-7.09, m, 2 H; 6.03, s, 1 H; 4.48, t, 2 H; 4.21, d, 2 H; 4.13, t, 2 H; 4.04-4.08, m, 1 H; 3.85-3.94, m, 2 H; 3.75-3.83, m, 2 H; 3.55-3.69, m, 4 H; 2.97-3.00, m, 2 H; 2.99, s, 6 H; 2.27, s, 3 H.
57	¹ H NMR (CDCl ₃):8.65-8.55, d, 1 H; 7.80-7.70, dd, 1 H; 7.62-7.58, d, 1 H; 7.54-7.50, d, 1 H; 7.30-7.20, m, 1 H; 6.98-6.92, dd, 1 H; 6.88, s, 1 H; 6.05, s, 1 H; 5.25, s, 2H; 4.38-4.28, m, 1 H; 4.20-4.00, m, 5H; 3.95-3.80, m, 2H; 2.85, t, 2H; 2.28, s, 3H; 2.15-2.05, m, 1 H; 2.00-1.90, m, 2H; 1.75-1.60, m, 1 H.
58	¹ H NMR (CDCl ₃):7.56, d, 1 H; 6.92, dd, 1 H; 6.86, d, 1 H; 5.82, s, 1 H; 5.28, s, 2H; 4.03-3.95, m, 5H; 3.84-3.69, m, 4H; 3.63-3.60, ddd, 1 H; 3.49-3.42, dd, 1 H; 2.87-2.71, t, 2H; 2.40, s, 3.H; 2.20, s, 3H.
61	¹ H NMR (CDCl ₃):7.59, d, 1 H; 6.88, dd, 1 H; 6.82, d, 1 H; 6.11-5.96, tt, 1 H; 5.81, s, 1 H; 4.24, td, 2H; 4.07-3.98, m, 5H; 3.89-3.73, m, 4H; 3.65, td, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.89, dd, 2H; 2.25, s, 3H.
62	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.56, d, 1 H; 6.86, dd, 1 H; 6.79, d, 1 H; 5.88, s, 1 H; 3.46-4.08, m, 20 H; 2.86, t, 2 H; 2.26, s, 3 H.
63	¹ H NMR (DMSO-d ₆): 7.51, d, 1 H; 6.89-6.94, m, 2 H; 5.669, s, 1 H; 4.03-4.10, m, 2 H; 3.88-3.96, m, 3 H; 3.61-3.88, m, 8 H; 3.45-3.53, m, 1 H; 3.42, dd, 1 H; 3.23, br t, 4 H; 2.84, t, 2 H; 2.08, s, 3 H.

化合物 #	NMR
64	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.66, s, 1 H; 7.51-7.56, m, 3 H; 7.42-7.45, m, 3 H; 7.13, d, 1 H; 7.10, s, 1 H; 4.31, br d, 4 H; 4.06, br s, 1 H; 3.72-3.89, m, 4 H; 3.63, td, 1 H; 3.51, t, 1 H; 2.96, br s, 2 H; 2.35, s, 3 H.
65	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.55, d, 1 H; 6.87, dd, 1 H; 6.76, d, 1 H; 6.26, s, 1 H; 3.95-4.14, m, 5 H; 3.74-3.88, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.49-3.54, m, 5 H; 2.88, t, 2 H; 2.29, s, 3 H; 2.05-2.15, m, 4 H.
66	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.53, d, 1 H; 6.82, dd, 1 H; 6.72, d, 1 H; 5.84, s, 1 H; 3.96-4.09, m, 5 H; 3.73-3.89, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 3.30, br t, 4 H; 3.06, br t, 4 H; 2.85, t, 2 H; 2.27, s, 3 H; NH 観察されず。
67	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.96-7.99, m, 2 H; 7.86-7.90, m, 2 H; 7.75, d, 1 H; 7.58-7.63, m, 1 H; 7.52-7.56, m, 2 H; 5.95, s, 1 H; 3.97-4.09, m, 5 H; 3.73-3.86, m, 4 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.49, dd, 1 H; 2.98, t, 2 H; 2.24, s, 3 H.
69	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.57, d, 1 H; 6.84, dd, 1 H; 6.74, d, 1 H; 6.17, s, 1 H; 3.99-4.13, m, 5 H; 3.74-3.88, m, 8 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 3.35, br d, 4 H; 2.88, t, 2 H; 2.30, s, 3 H; 1.74-1.81, m, 1 H; 1.01-1.05, m, 2 H; 0.79-0.85, m, 2 H.
70	¹ H NMR (CDCl ₃): 9.72, br s, 1 H; 7.91, s, 1 H; 7.51, d, 1 H; 7.39, dd, 1 H; 5.87, s, 1 H; 3.96-4.06, m, 5 H; 3.72-3.85, m, 4 H; 3.62, ddd, 1 H; 3.48, dd, 1 H; 2.86, t, 2 H; 2.27, s, 3 H; 1.84, septet, 1 H; 1.04-1.08, m, 2 H; 0.79-0.84, m, 2 H.
71	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.63, d, 1 H; 7.28, dd, 1 H; 7.26, d, 1 H; 6.10, s, 1 H; 4.37, t, 2 H; 3.98-4.12, m, 7 H; 3.75-3.89, m, 5 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.93, t, 2 H; 2.31, s, 3 H; 1.47, s, 9 H.
72	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 6.87, dd, 1 H; 6.82, d, 1 H; 5.88, s, 1 H; 4.30-4.33, m, 2 H; 4.24-4.27, m, 2 H; 3.98-4.08, m, 5 H; 3.73-3.87, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.88, t, 2 H; 2.27, s, 3 H.
73	¹ H NMR (CDCl ₃): 主回転異性体 : 7.72, d, 1 H; 7.32, dd, 1 H; 7.27, d, 1 H; 6.46, s, 1 H; 3.97-4.23, m, 5 H; 3.75-3.91, m, 5 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 2.36, s, 3 H; 2.98, t, 2 H; 2.36, s, 3 H; 1.07-1.11, m, 2 H; 0.70-0.74, m, 2 H; 副回転異性体は分離されず
74	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.61, d, 1 H; 7.35, d, 1 H; 7.27, s, 1 H; 6.15, br s, 1 H; 5.92, br s, 1 H; 4.02-4.10, m, 5 H; 3.73-3.88, m, 4 H; 3.63-3.66, m, 3 H; 3.47-3.53, m, 3 H; 2.92, t, 2 H; 2.54, br s, 2 H; 2.30, s, 3 H; 1.49, s, 9 H.
75	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.61, d, 1 H; 7.21, dd, 1 H; 7.14, d, 1 H; 6.48, br s, 1 H; 4.00-4.29, m, 7 H; 3.61-3.89, m, 5 H; 3.52, dd, 1 H; 2.93, t, 2 H; 2.82, br t, 2 H; 2.71, tt, 1 H; 2.34, s, 3 H; 1.85, br d, 2 H; 1.51-1.70, m, 2 H; 1.49, s, 9 H.
76	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.61, d, 1 H; 7.34, d, 1 H; 7.26, s, 1 H; 6.15, br s, 1 H; 5.95, s, 1 H; 4.15, br s, 2 H; 3.98-4.12, m, 5 H; 3.75-3.92, m, 4 H; 3.74, s, 3 H; 3.61-3.72, m, 3 H; 3.50, dd, 1 H; 2.91, t, 2 H; 2.56, br s, 2 H; 2.29, s, 3 H.
77	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.61, d, 1 H; 7.34, dd, 1 H; 7.26, s, 1 H; 6.15, br s, 1 H; 5.96, s, 1 H; 4.18, q, 2 H; 4.15-4.17, m, 1 H; 3.98-4.10, m, 5 H; 3.67-3.88, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.91, t, 2 H; 2.56, br s, 2 H; 2.29, s, 3 H; 1.28, t, 3 H.
78	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.62, d, 1 H; 7.35, dd, 1 H; 7.27, d, 1 H; 6.16, br s, 1 H; 6.00, s, 1 H; 4.97, septet, 1 H; 3.98-4.14, m, 7 H; 3.67-3.88, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.92, t, 2 H; 2.56, br s, 2 H; 2.29, s, 3 H; 1.27, d, 6 H.
79	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.62, d, 1 H; 7.34, d, 1 H; 7.26, s, 1 H; 6.15, dr d, 1 H; 5.94, s, 1 H; 4.52, q, 2 H; 4.19, d, 1 H; 4.18, d, 1 H; 3.97-4.10, m, 5 H; 3.72-3.87, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.92, t, 2 H; 2.59, br d, 2 H; 2.29, s, 3 H.
80	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 7.16, dd, 1 H; 7.08, d, 1 H; 5.88, s, 1 H; 4.29, s, 1 H; 3.97-4.07, m, 5 H; 3.80-3.87, m, 2 H; 3.73-3.78, m, 2 H; 3.71, s, 3 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.88, t, 2 H; 2.84-2.89, m, 1 H; 2.67-2.73, m, 1 H; 2.28, s, 3 H; 2.26-2.29, m, 2 H; 1.84-1.87, m, 2 H; 1.64, qd, 2 H.

化合物#	NMR
81	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.57, d, 1 H; 7.16, d, 1 H; 7.08, d, 1 H; 5.88, s, 1 H; 4.29-4.32, m, 2 H; 4.14, q, 2 H; 3.97-4.08, m, 5 H; 3.73-3.86, m, 4 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.49, dd, 1 H; 2.82-2.89, m, 4 H; 2.66-2.74, m, 1 H; 2.28, s, 3 H; 1.84-1.87, m, 2 H; 1.63, qd, 2 H; 1.27, t, 3 H.
82	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 7.16, dd, 1 H; 7.09, d, 1 H; 5.88, s, 1 H; 5.88, s, 1 H; 4.93, septet, 1 H; 4.29-4.31, m, 2 H; 3.97-4.09, m, 5 H; 3.73-3.87, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.81-2.90, m, 4 H; 2.70, tt, 1 H; 2.28, s+m, 5 H; 1.83-1.87, m, 2 H; 1.64, qd, 2 H; 1.25, d, 6 H.
83	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 7.16, dd, 1 H; 7.09, d, 1 H; 5.88, s, 1 H; 4.50, q, 2 H; 4.25-4.35, m, 2 H; 3.98-4.09, m, 5 H; 3.73-3.87, m, 4 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.89-3.01, m, 4 H; 2.73, tt, 1 H; 2.28, s, 3 H; 1.88-1.91, m, 2 H; 1.66-1.69, m, 2 H.
84	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.74, s, 1 H; 7.65, d, 2 H; 6.61, br s, 1 H; 5.90, s, 1 H; 3.99-4.07, m, 5 H; 3.74-3.83, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.91-2.97, m, 3 H; 2.25, s, 3 H; 0.87-0.92, m, 2 H; 0.64-0.68, m, 2 H.
86	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.56, d, 1 H; 6.45, dd, 1 H; 6.36, d, 1 H; 6.24, s, 1 H; 4.32, t, 4 H; 4.11-4.18, m, 2 H; 4.00-4.09, m, 3 H; 3.74-3.90, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.91, t, 2 H; 2.31, s, 3 H.
87	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.50, d, 1 H; 6.38, dd, 1 H; 6.26, d, 1 H; 6.09, s, 1 H; 4.86, s, 4 H; 4.12, s, 4 H; 4.06-4.11, m, 2 H; 3.99-4.06, m, 2 H; 3.81-3.88, m, 3 H; 3.74-3.79, m, 2 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.84, t, 2 H; 2.27, s, 3 H.
88	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.66, d, 1 H; 7.50, dd, 1 H; 7.44, s, 1 H; 5.99, s, 1 H; 3.99-4.11, m, 5 H; 3.75-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.11, br s, 3 H; 2.95, t, 2 H; 2.85, septet, 1 H; 2.31, s, 3 H; 0.64, br s, 2 H; 0.51, br s, 2 H.
89	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 6.88, dd, 1 H; 6.80, d, 1 H; 6.22, s, 1 H; 3.98-4.13, m, 5 H; 3.86, s, 3 H; 3.80-3.88, m, 2 H; 3.73-3.78, m, 2 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.89, t, 2 H; 2.29, s, 3 H.
91	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.50, d, 1 H; 6.39, dd, 1 H; 6.29, d, 1 H; 6.19, s, 1 H; 5.45, d x septet, 1 H; 4.22-4.31, m, 2 H; 3.99-4.12, m, 7 H; 3.73-3.88, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.85, t, 2 H; 2.27, s, 3 H.
92	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.44, d, 1 H; 6.33, dd, 1 H; 6.29, s, 1 H; 6.24, d, 1 H; 4.86, br s, 1 H; 4.07-4.10, m, 2 H; 3.92-4.02, m, 5 H; 3.73-3.89, m, 6 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.79-2.83, m, 3 H; 2.25, s, 3 H; 1.24, s, 6 H.
93	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.48, d, 1 H; 6.34, dd, 1 H; 6.23, d, 1 H; 6.18, s, 1 H; 3.92-4.12, m, 9 H; 3.74-3.88, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.84, t, 2 H; 2.42, pentet, 2 H; 2.28, s, 3 H.
94	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.53, d, 1 H; 6.42, dd, 1 H; 6.32, d, 1 H; 6.10, s, 1 H; 4.27-4.32, m, 4 H; 4.00-4.16, m, 6 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.98, s, 3 H; 3.86, t, 2 H; 2.28, s, 3 H.
95	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.59, d, 1 H; 7.57, dd, 1 H; 7.51, d, 1 H; 6.45, dd, 1 H; 6.35, d, 1 H; 6.32, t, 1 H; 6.24, s, 1 H; 5.27-5.32, m, 1 H; 4.45, t, 2 H; 4.37, d, 1 H; 4.34, d, 1 H; 3.98-4.13, m, 5 H; 3.73-3.88, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.86, t, 2 H; 2.28, s, 3 H.
96	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.47, d, 1 H; 6.36, s, 1 H; 6.33, dd, 1 H; 6.22, d, 1 H; 4.07-4.12, m, 2 H; 3.99-4.05, m, 3 H; 3.37-3.88, m, 4 H; 3.66, br s, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.84, t, 2 H; 2.84, t, 2 H; 2.28, s, 3 H; 1.34, s, 6 H.
97	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.50, d, 1 H; 6.40, s, 1 H; 6.39, dd, 1 H; 6.28, d, 1 H; 4.09-4.21, m, 6 H; 3.99-4.07, m, 3 H; 3.81-3.89, m, 3 H; 3.72-3.79, m, 1 H; 3.78, s, 3 H; 3.58-3.68, m, 2 H; 3.52, dd, 1 H; 2.86, t, 2 H; 2.30, s, 3 H.
98	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.92, d, 1 H; 8.66, d, 1 H; 7.99, dt, 1 H; 7.79, d, 1 H; 7.62, dd, 1 H; 7.55, d, 1 H; 7.48, dd, 1 H; 6.62, s, 1 H; 4.19-4.25, m, 4 H; 4.04-4.08, m, 1 H; 3.73-3.91, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 3.08, t, 2 H; 2.40, s, 3 H.

化合物 #	NMR
99	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.73, d, 1 H; 7.57, dd, 1 H; 7.40-7.49, m, 3 H; 7.31-7.34, m, 1 H; 7.06-7.11, m, 1 H; 5.98, s, 1 H; 4.00-4.14, m, 5 H; 3.74-3.90, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.00, t, 2 H; 2.35, s, 3 H.
100	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.71, d, 2 H; 7.79, d, 1 H; 7.64, dd, 1 H; 7.55-7.56, m, 3 H; 6.08, s, 1 H; 4.02-4.14, m, 5 H; 3.75-3.90, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 3.03, t, 2 H; 2.36, s, 3 H.
101	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.72-8.74, m, 1 H; 8.00, d, 1 H; 7.93, dd, 1 H; 7.75-7.84, m, 3 H; 7.29-7.32, m, 1 H; 6.22, s, 1 H; 4.01-4.15, m, 5 H; 3.75-3.90, m, 4 H; 3.66, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 3.03, t, 2 H; 2.36, s, 3 H.
102	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.02, d, 1 H; 7.97, dd, 1 H; 7.76, d, 1 H; 7.71, t, 1 H; 7.60, d, 1 H; 7.18, d, 1 H; 6.73, s, 1 H; 4.22-4.29, m, 4 H; 4.05-4.08, m, 1 H; 3.73-3.91, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 3.10, t, 2 H; 2.65, s, 3 H, 2.41, s, 3 H.
103	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.57, d, 1 H; 7.97, d, 1 H; 7.90, dd, 1 H; 7.74, d, 1 H; 7.74, d, 1 H; 7.61, d, 1 H; 7.11, d, 1 H; 5.88, s, 1 H; 4.00-4.09, m, 5 H; 3.75-3.89, m, 5 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.01, t, 2 H; 2.45, s, 3 H; 2.34, s, 3 H.
104	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 6.68, dd, 1 H; 6.65, d, 1 H; 5.87, s, 1 H; 4.90-4.94, m, 1 H; 4.34, d, 1 H; 4.31, d, 1 H; 3.98-4.06, m, 7 H; 3.74-3.85, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 2.87, t, 2 H; 2.27, s, 3 H; 1.45, s, 9 H.
105	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.62, d, 1 H; 6.99, dd, 1 H; 6.92, d, 1 H; 3.98-4.10, m, 5 H; 3.74-3.88, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H, 2.90, t, 2 H; 2.27, s, 3 H.
106	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.61, d, 1 H; 6.90, dd, 1 H; 6.86, d, 1 H; 5.84, s, 1 H; 3.98-4.07, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.89, t, 2 H; 2.67, s, 3 H.
107	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.55, d, 1 H; 7.26-7.42, m, 5 H; 6.90, dd, 1 H; 6.83, d, 1 H; 5.84, s, 1 H; 5.12-5.14, m, 1 H; 5.08, s, 2 H; 4.68-4.73, m, 1 H; 4.57-4.63, m, 1 H; 4.19, dd, 1 H; 4.11, dd, 1 H; 3.99-4.04, m, 2 H; 2.84, t, 2 H; 2.76-2.81, m, 2 H; 2.57-2.62, m, 1 H; 2.25, s, 3 H.
108	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.57, d, 1 H; 7.30-7.42, m, 5 H; 6.91, dd, 1 H; 6.84, d, 1 H; 5.83, s, 1 H; 5.09, s, 2 H; 4.28, ddd, 1 H; 3.92-4.06, m, 4 H; 3.79-3.86, m, 2 H; 2.84, t, 2 H; 2.26, s, 3 H; 2.03-2.12, m, 1 H; 1.90-1.97, m, 2 H; 1.63-1.71, m, 1 H.
109	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.57, d, 1 H; 7.31-7.44, m, 5 H; 6.92, dd, 1 H; 6.85, d, 1 H; 5.83, s, 1 H; 5.10, s, 2 H; 3.96-4.04, m, 5 H; 3.68-3.74, m, 1 H; 3.44-3.50, m, 1 H; 2.85, t, 2 H; 2.28, s, 3 H; 1.89-1.92, m, 1 H; 1.51-1.64, m, 4 H; 1.37-1.46, m, 1 H.
110	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.47, d, 1 H; 6.36, dd, 1 H; 6.26, d, 1 H; 6.16, s, 1 H; 4.35-4.38, m, 1 H; 4.14-4.18, m, 2 H; 3.98-4.11, m, 5 H; 3.73-3.87, m, 6 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.50, dd, 1 H; 3.34, s, 3 H; 2.83, t, 2 H; 2.27, s, 3 H.
111	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.49, d, 1 H; 6.82, dd, 1 H; 6.73, d, 1 H; 6.39, s, 1 H; 3.95-4.15, m, 5 H; 3.72-3.89, m, 4 H; 3.59-3.66, m, 3 H; 3.50, dd, 1 H; 3.42, septet, 1 H; 3.37, s, 1 H; 3.08-3.14, m, 2 H; 2.86, t, 2 H; 2.28, s, 3 H; 1.95-2.02, m, 2 H; 1.64-1.73, m, 2 H.
112	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.51, d, 1 H; 6.82, dd, 1 H; 6.73, d, 1 H; 6.27, s, 1 H; 3.98-4.13, m, 5 H; 3.73-3.94, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.47-3.57, m, 5 H; 2.84-2.95, m, 4 H; 2.68-2.75, m, 1 H; 2.29, s, 3 H; 1.97, dd, 1 H; 1.91, dd, 1 H; 1.79-1.82, m, 2 H; 1.54-1.68, m, 6 H.
113	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.55, d, 1 H; 7.31-7.35, m, 2 H; 7.21-7.26, m, 3 H; 6.89, dd, 1 H; 6.78, d, 1 H; 5.89, s, 1 H; 3.96-4.09, m, 7 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.95, dt, 2 H; 2.87, t, 2 H; 2.73, tt, 1 H; 2.30, s, 3 H; 1.97-2.00, m, 2 H; 1.90, dd, 1 H; 1.84, dd, 1 H.
114	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.53, d, 1 H; 6.85, dd, 1 H; 6.73, d, 1 H; 6.24, s, 1 H; 3.99-4.13, m, 5 H; 3.74-3.91, m, 6 H; 3.71, s, 3 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.92-2.99, m, 2 H; 2.86, t, 2 H; 2.50-2.58, m, 1 H; 2.30, s, 3 H; 2.02-2.06, m, 2 H; 1.78-1.90, m, 2 H.
114	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.50, d, 1 H; 6.83, dd, 1 H; 6.72, d, 1 H; 6.33, s, 1 H; 3.98-4.44, m, 5 H; 3.72-3.88, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 3.48, q, 2 H; 3.29-3.31, m, 2 H; 2.81-2.87, m, 4 H; 2.29, s, 3 H; 1.79-1.88, m, 3 H; 1.38, dd, 1 H; 1.32, dd, 1 H; 1.20, t, 3 H.

化合物 #	NMR
115	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.52, d, 1 H; 6.83, dd, 1 H; 6.72, d, 1 H; 6.34, s, 1 H; 3.96-4.15, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.31-3.34, m, 4 H; 2.86, t, 2 H; 2.31, s, 3 H; 1.65-1.71, m, 6 H.
116	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.51, d, 1 H; 6.83, dd, 1 H; 6.72, d, 1 H; 6.49, s, 1 H; 3.98-4.17, m, 5 H; 3.68-3.89, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.87, t, 2 H; 2.80, dt, 1 H; 2.49, dd, 1 H; 2.31, s, 3 H; 1.60-1.87, m, 4 H; 1.13, ddd, 1 H; 0.97, d, 3 H.
117	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.54, d, 1 H; 7.17-7.21, m, 2 H; 6.98-7.02, m, 2 H; 6.88, dd, 1 H; 6.78, d, 1 H; 6.14, s, 1 H; 3.93-4.12, m, 7 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.95, dt, 2 H; 2.87, t, 2 H; 2.71, tt, 1 H; 2.30, s, 3 H; 1.95-1.98, m, 2 H; 1.84, dd, 1 H; 1.78, dd, 1 H.
118	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.61, d, 1 H; 6.74, dd, 1 H; 6.71, d, 1 H; 6.44, s, 1 H; 5.03-5.06, m, 1 H; 4.68, t, 1 H; 4.34-4.45, m, 2 H; 3.99-4.17, m, 6 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.92, t, 2 H; 2.30, s, 3 H; 1.41-1.45, m, 1 H; 0.99-1.02, m, 2 H; 0.76-0.81, m, 2 H.
119	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.62, d, 1 H; 6.72, dd, 1 H; 6.70, d, 1 H; 6.29, s, 1 H; 5.09-5.13, m, 1 H; 4.80-4.84, m, 1 H; 4.56-4.60, m, 1 H; 4.47-4.50, m, 1 H; 4.25, dd, 1 H; 3.99-4.16, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.91, t, 2 H; 2.29, s, 3 H.
120	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.59, d, 1 H; 6.68, dd, 1 H; 6.65, d, 1 H; 5.85, s, 1 H; 4.94-4.98, m, 1 H; 4.40, d, 1 H; 4.37, d, 1 H; 4.13, q, 2 H; 3.98-4.09, m, 7 H; 3.74-3.90, m, 4 H; 6.34, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.87, t, 2 H; 2.27, s, 3 H; 1.25, t, 3 H.
121	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.23, s, 1 H; 7.54, d, 1 H; 7.29-7.30, m, 3 H; 6.87, dd, 1 H; 6.71, d, 1 H; 6.49, s, 1 H; 4.61, septet, 1 H; 3.99-4.17, m, 5 H; 3.74-3.90, m, 4 H; 3.61-3.67, m, 3 H; 3.52, dd, 1 H; 3.30-3.36, m, 2 H; 2.89, t, 2 H; 2.31, s, 3 H; 2.09-2.16, m, 2 H; 1.92-2.00, m, 2 H.
122	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.54, d, 1 H; 6.84, dd, 1 H; 6.74, d, 1 H; 6.20, s, 1 H; 3.93-4.12, m, 5 H; 3.73-3.88, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.48-3.58, m, 3 H; 3.25-3.31, m, 2 H; 2.84-2.90, m, 3 H; 2.28, s, 3 H; 1.95-2.11, m, 4 H.
123	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.53, d, 1 H; 6.84, d, 1 H; 6.75, d, 1 H; 6.28, s, 1 H; 3.98-4.14, m, 5 H; 3.75-3.88, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.48-3.56, m, 3 H; 3.36, t, 2 H; 2.87, t, 2 H; 2.28, s, 3 H; 2.02-2.12, m, 2 H; 1.88-1.94, m, 2 H.
124	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.59, d, 1 H; 7.24, dd, 1 H; 7.16, d, 1 H; 6.52, s, 1 H; 4.19, d, 2 H; 4.13, t, 2 H; 4.021-4.06, m, 1 H; 3.73-3.90, m, 4 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.92-2.99, m, 1 H; 2.95, t, 2 H; 2.35, s, 3 H, 1.29, d, 6 H.
125	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.67, d, 1 H; 7.00-7.02, dd+d, 2 H; 4.48, q, 2 H; 4.35-4.41, m, 2 H; 4.29, t, 2 H; 4.06-4.08, m, 1 H; 3.89, dd, 1 H; 3.71-3.81, m, 3 H; 3.62, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 3.08, t, 2 H; 2.35, s, 3 H.
126	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.69, d, 1 H; 6.98, dd, 1 H; 6.95, d, 1 H; 4.30-4.38, m, 2 H; 4.20-4.24, t, 2 H; 4.03-1.09, m, 1 H; 3.74-3.91, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.54, dd, 1 H; 3.00, t, 2 H; 2.37, s, 3 H.
127	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.57, d, 1 H; 6.83, dd, 1 H; 6.76, br s, 1 H; 6.18, s, 1 H; 4.94, s, 1 H; 4.78-4.80, m, 4 H; 3.98-4.12, m, 5 H; 3.73-3.86, m, 4 H; 3.60-3.65, m, 2 H; 3.51, dd+m, 2 H; 2.88, t, 2 H; 2.37, s, 3 H; 1.45, s, 9 H.
128	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 6.88, dd, 1 H; 6.81, d, 1 H; 6.36, s, 1 H; 4.54-4.58, m, 1 H; 3.99-4.15, m, 6 H; 3.61-3.88, m, 6 H; 3.51, dd, 1 H; 3.35-3.41, m, 2 H; 2.90, t, 2 H; 2.30, s, 3 H; 1.92-1.99, m, 2 H; 1.75-1.82, m, 2 H; 1.47, s, 9 H.
129	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.54, d, 1 H; 6.63, dd, 1 H; 6.50, d, 1 H; 6.35, s, 1 H; 4.01-4.13, m, 5 H; 3.64-3.89, m, 7 H; 3.52, dd, 1 H; 3.05, d, 3 H; 2.89, t, 2 H; 2.38-2.45, m, 2 H; 2.31, s, 3 H.
130	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.50, d, 1 H; 6.50, dd, 1 H; 6.39, s, 1 H; 6.38, d, 1 H; 4.02-4.12, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.36, t, 4 H; 2.87, t, 2 H; 2.31, s, 3 H; 2.03-2.06, m, 4 H.

化合物 #	NMR
131	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.54, d, 1 H; 6.50, dd, 1 H; 6.39, d, 1 H; 6.32, s, 1 H; 4.00-4.13, m, 5 H; 3.71-3.88, m, 6 H; 3.59-3.68, m, 3 H; 3.52, dd, 1 H; 2.89, t, 2 H; 2.51, heptet, 2 H; 2.29, s, 3 H.
132	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.51, d, 1 H; 6.38, dd, 1 H; 6.28, d, 1 H; 6.18, s, 1 H; 4.14, t, 2 H; 3.99-4.10, m, 7 H; 3.74-3.88, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 3.43-3.45, m, 1 H; 2.86, t, 2 H; 2.27, s, 3 H.
133	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.56, d, 1 H; 6.83, dd, 1 H; 6.73, d, 1 H; 6.44-6.45, m, 1 H; 6.11, s, 1 H; 4.00-4.10, m, 5 H; 3.93-3.95, m, 2 H; 3.74-3.86, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.56, t, 2 H; 3.52, dd, 1 H; 2.89, t, 2 H; 2.45-2.46, m, 2 H; 2.29, s, 3 H.
134	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.50, d, 1 H; 6.52, dd, 1 H; 6.42, s, 1 H; 6.39, d, 1 H; 3.96-4.13, m, 6 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.46-3.48, m, 1 H; 3.24-3.26, m, 1 H; 2.87, t, 2 H; 2.31, s, 3 H; 2.044-2.10, m, 3 H; 1.75-1.78, m, 1 H; 1.21, d, 3 H.
135	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.53, d, 1 H; 6.85, dd, 1 H; 6.75, d, 1 H; 6.35, s, 1 H; 4.78, d x heptet, 1 H; 3.96-4.15, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.43-3.57, m, 3 H; 3.27-3.37, m, 2 H; 2.87, t, 2 H; 2.30, s, 3 H; 1.89-2.02, m, 3 H; 1.65-1.73, m, 1 H.
136	¹ H NMR (CDCl ₃): 8.16, d, 2 H; 7.92, d, 1 H; 7.65, dd, 1 H; 7.58, d, 1 H; 7.52, d, 2 H; 7.45, td, 2 H; 7.32, td, 2 H; 6.47, s, 1 H; 4.24-4.25, m, 4 H; 4.04-4.09, m, 1 H; 3.75-3.93, m, 4 H; 3.66, ddd, 1 H; 3.55, dd, 1 H; 3.09, t, 2 H; 2.46, s, 3 H.
137	¹ H NMR (CDCl ₃): 主及び副異性体の混合物、主異性体 : 7.50, d, 1 H; 6.82, dd, 1 H; 6.71, d, 1 H; 6.35, s, 1 H; 3.96-4.16, m, 5 H; 3.73-3.88, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.87, t, 2 H; 2.35, t, 2 H; 2.30, s, 3 H; 1.71-1.86, m, 3 H; 0.95, d, 6 H; 0.77, s, 1 H.
138	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.49, d, 1 H; 6.46, dd, 1 H; 6.42, s, 1 H; 6.34, d, 1 H; 4.05-4.13, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.44, t, 2 H; 3.44, t, 2 H; 3.12, s, 2 H; 2.87, t, 2 H; 2.31, s, 3 H; 1.83, t, 2 H; 1.16, s, 6 H.
139	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.52, d, 1 H; 6.84, dd, 1 H; 6.73, d, 1 H; 6.30, s, 1 H; 3.99-4.15, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 3.32, t, 4 H; 2.87, t, 2 H; 2.31, s, 3 H; 1.52, t, 4 H; 1.01, s, 6 H.
140	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.53, d, 1 H; 6.84, dd, 1 H; 6.75, d, 1 H; 6.15, s, 1 H; 3.98-4.11, m, 5 H; 3.91-3.94, m, 2 H; 3.81-3.88, m, 2 H; 3.74-3.79, m, 2 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.87, t, 2 H; 2.81, dd, 2 H; 2.29, s, 3 H; 2.21-2.27, m, 1 H; 1.99, br d, 2 H; 1.74, dd, 1 H; 1.68, dd, 1 H.
141	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.52, d, 1 H; 6.83, dd, 1 H; 6.73, d, 1 H; 6.55, s, 1 H; 3.99-4.18, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.82-2.89, m, 4 H; 2.32, s, 3 H; 1.76, br d, 2 H; 1.56-1.66, m, 1 H; 1.33, dd, 1 H; 1.26, dd, 1 H; 0.98, d, 3 H.
142	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.49, d, 1 H; 6.65, dd, 1 H; 6.56, d, 1 H; 6.17, s, 1 H; 4.62, br s, 1 H; 3.98-4.12, m, 5 H; 3.74-3.88, m, 6 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.85, t, 2 H; 2.28, s, 3 H.
143	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.51, d, 1 H; 6.79, dd, 1 H; 6.68, d, 1 H; 5.80, s, 1 H; 4.18-4.22, m, 1 H; 3.90-4.07, m, 5 H; 3.74-3.88, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.48-3.54, m, 2 H; 2.99, dt, 1 H; 2.83, t, 2 H; 2.29, s, 3 H; 1.78-1.91, m, 2 H; 1.58-1.66, m, 4 H; 1.11, d, 3 H.
144	¹ H NMR (CDCl ₃): 2つの異性体の混合物 7.59+7.61, d, 1 H; 6.87+6.84, dd, 1 H; 6.80+6.77, d, 1 H; 6.18+6.19, s, 1 H; 5.08-5.10+4.98-5.00, m, 1 H; 3.54-4.13, m, 15 H; 3.52, dd, 1 H; 2.90-2.87, t, 2 H; 2.13-2.42, m, 1 H; 2.30+2.29, s, 3 H; 1.54-1.61+1.65-1.69, m, 1 H; 0.98-1.07, m, 2 H; 0.77-0.82, m, 2 H.
145	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.59, d, 1 H; 6.83, dd, 1 H; 6.77, d, 1 H; 6.17, s, 1 H; 4.97, br s, 1 H; 3.99-4.18, m, 7 H; 3.56-3.88, m, 9 H; 3.51, dd, 1 H; 2.89, t, 2 H; 2.29, s, 3 H; 2.13-2.25, m, 2 H; 1.26-1.29, m, 3 H.
146	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.67, d, 1 H; 7.34, dd, 1 H; 7.31, d, 1 H; 6.36, s, 1 H; 4.72, t, 1 H; 4.46, t, 1 H; 4.31, t, 1 H; 4.20, d, 2 H; 4.03-4.13, m, 4 H; 3.74-3.92, m, 5 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 3.00, t, 2 H; 2.35, s, 3 H; 1.43-1.50, m, 1 H; 1.00-1.03, m, 2 H; 0.78-0.82, m, 2 H.

化合物 #	NMR
147	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.65, d, 1 H; 7.30, dd, 1 H; 7.28, d, 1 H; 6.23, s, 1 H; 4.43, t, 2 H; 4.13-4.18, q+m, 4 H; 4.04-4.10, m, 4 H; 3.89, dd, 1 H; 3.74-3.85, m, 5 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.97, t, 2 H; 2.33, s, 3 H; 1.28, t, 3 H.
148	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.65, d, 1 H; 7.34, dd, 1 H; 7.31, d, 1 H; 6.48, s, 1 H; 4.41, t, 2 H; 4.24, d, 2 H; 4.14, td, 2 H; 4.03-4.08, dd+m, 3 H; 3.92, dd, 1 H; 3.73-3.84, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 3.00, t, 2 H; 2.90, s, 6 H; 2.35, s, 3 H.
149	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.64, d, 1 H; 7.29-7.31, dd+d, 2 H; 6.11, s, 1 H; 4.35, t, 2 H; 3.96-4.13, m, 10 H; 3.74-3.90, m, 6 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.95, t, 2 H; 2.31, s, 3 H; 1.17, d, 3 H; 1.12, d, 3 H.
150	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.61, d, 1 H; 6.74, dd, 1 H; 6.71, d, 1 H; 4.96-5.01, m, 1 H; 4.41, dd, 1 H; 4.39, dd, 1 H; 4.22-4.28, m, 2 H; 4.13-4.19, m, 2 H; 4.03-4.09, m, 3 H; 3.91, dd, 1 H; 3.73-3.85, m, 3 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.53, dd, 1 H; 2.98, t, 2 H; 2.88, s, 6 H; 2.34, s, 3 H.
151	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 6.68-6.72, m, 2 H; 6.20, s, 1 H; 5.53, br s, 1 H; 4.96-5.01, m, 1 H; 4.35, d, 1 H; 4.33, d, 1 H; 4.08-4.15, m, 2 H; 3.97-4.07, m, 5 H; 3.73-3.98, m, 5 H; 3.63, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.92, t, 2 H; 2.29, s, 3 H; 1.14, d, 6 H.
152	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.58, d, 1 H; 7.38-7.45, m, 4 H; 7.32-7.36, m, 1 H; 6.93, dd, 1 H; 6.86, d, 1 H; 5.86, 1 H, s; 5.11, s, 2 H; 4.95, ddd, 1 H; 4.18, dd, 1 H; 4.11, dd, 1 H; 4.07, td, 1 H; 3.99, td, 1 H; 2.85, t, 2 H; 2.49, 1 H, dd; 2.31, dd, 1 H; 2.28, s, 3 H; 1.52, s, 3 H; 1.44, s, 3 H.
153	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.57, d, 1 H; 7.38-7.44, m, 4 H; 7.31-7.35, m, 1 H; 6.92, dd, 1 H; 6.86, d, 1 H; 5.83, s, 1 H; 5.11, s, 2 H; 4.01-4.06, m, 1 H; 3.96-4.00, m, 1 H; 3.90-3.95, m, 1 H; 3.88, br s, 2 H; 3.82-3.86, m, 1 H; 2.86, t, 2 H; 2.27, s, 3 H; 1.89-2.02, m, 3 H; 1.75-1.81, m, 1 H; 1.32, s, 3 H.
154	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.56, d, 1 H; 7.37-7.44, m, 4 H; 7.33-7.35, m, 1 H; 6.92, dd, 1 H; 6.85, d, 1 H; 5.84, s, 1 H; 5.10, s, 2 H; 4.34-4.36, m, 1 H; 3.98-4.05, m, 4 H; 2.85, t, 2 H; 2.27, s, 3 H; 2.10-2.14, m, 1 H; 1.77-1.86, m, 3 H; 1.27, s, 3 H; 1.26, s, 3 H.
155	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.62, d, 1 H; 6.90, dd, 1 H; 6.86, d, 1 H; 5.84, s, 1 H; 4.48, dt, 2 H; 3.98-4.07, m, 5 H; 3.74-3.89, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.90, t, 2 H; 2.27, s, 3 H.
156	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.63-7.65, m, 1 H; 7.32-7.37, m, 2 H; 7.25-7.27, m, 1 H; 5.81, s, 1 H; 3.98-4.09, m, 5 H; 3.73-3.89, m, 4 H; 3.64, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.91, t, 2 H; 2.29, s, 3 H.
157	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.85, d, 1 H; 7.65, d, 1 H; 7.39, dd, 1 H; 5.88, s, 1 H; 3.99-4.07, m, 5 H; 3.91, t, 2 H; 3.74-3.88, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.93, t, 2 H; 2.65, t, 2 H; 2.29, s, 3 H, 2.20, tt, 2 H.
158	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.59, d, 1 H; 6.89, dd, 1 H; 6.83, d, 1 H; 3.98-4.07, m, 5 H; 3.75-3.89, m, 4 H; 3.66, ddd, 1 H; 3.52, dd, 1 H; 2.89, t, 2 H; 2.28, s, 3 H.
159	¹ H NMR (CDCl ₃): 7.59, d, 1 H; 6.88, dd, 1 H; 6.83, d, 1 H; 5.91, s, 1 H; 4.84-4.86, m, 1 H; 4.72-4.74, m, 1 H; 4.30-4.32, m, 1 H; 4.23-4.25, m, 1 H; 3.99-4.09, m, 5 H; 3.74-3.88, m, 4 H; 3.65, ddd, 1 H; 3.51, dd, 1 H; 2.89, br t, 2 H; 2.28, s, 3 H.

【手続補正 8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 4 2 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 4 2 1】

試験化合物の1.67mMストック溶液をメタノール中に調製し、50mMリン酸カリウムバッファ、pH 7.4に1:3で段階希釈し、ヒト肝臓ミクロソーム(BD Gentest)及びプローブ基質に添加する。7つの異なる試験化合物濃度(0.045~33.3 μM)、2%メタノール、0.1mg/mLミクロソーム、10 μMアトルバスタチン、又は5 μMニフェジピンを反応させるために得る。37°Cで5分間、予め温めた後、補因子混合物(7.65mg/mLグルコース-6-リン酸、1.7mg/mL NADP、6U/mLのグルコース-6-リン酸脱水素酵素)を添加することにより、反応を開始させる。

。