公告本

發明專利說明書

（填寫本書件時請先行詳閱申請書後之申請須知，作※記號部分請勿填寫）

※ 申請案號：92100460 ※IPC分類：A61K31/34 (2006.01)
A61K31/28 (2006.01)

※ 申請日期：92.1.10

壹、發明名稱

（中文）胺醇衍生物或磺酸衍生物及含有這些之醫藥組成物

（英文）AN AMINOALCOHOL DERIVATIVE OR A PHOSPHONIC ACID DERIVATIVE AND THE PHARMACEUTICAL COMPOSITION CONTAINING THEREOF

貳、發明人（共 4 人）

發明人 1 （如發明人超過一人，請填**說明書發明人續頁**）

姓名：（中文）西剛秀

（英文）NISHI, Takahide

住居所地址：（中文）東京都品川區廣町 1 丁目 2 番 58 號 三共株式会社內

（英文）c/o SANKYO COMPANY, LIMITED

2-58, Hiromachi 1-chome, Shinagawa-ku, Tokyo, JAPAN

國籍：（中文） 日本 （英文） Japan

參、申請人（共 1 人）

申請人 1 （如發明人超過一人，請填**說明書申請人續頁**）

姓名：（中文）三共股份有限公司(三共株式会社)

（英文）SANKYO COMPANY, LIMITED

住居所地址：（中文）東京都中央區日本橋本町 3 丁目 5 番 1 號

（英文）

國籍：（中文） 日本 （英文） Japan

代表人：（中文）高藤鐵雄(高藤鉄雄)

（英文）Tetsuo TAKATO

發明人 2

姓名：（中文）下里隆一

（英文）SHIMOZATO, Takaichi

住居所地址：（中文）東京都品川區廣町 1 丁目 2 番 58 號 三共株式会社內

（英文）c/o SANKYO COMPANY, LIMITED

2-58, Hiromachi 1-chome, Shinagawa-ku, Tokyo, JAPAN

國籍：（中文） 日本 （英文） Japan

發明人 3

姓名：（中文）奈良太

（英文）NARA, Futoshi

住居所地址：（中文）東京都品川區廣町 1 丁目 2 番 58 號 三共株式会社內

（英文）c/o SANKYO COMPANY, LIMITED

2-58, Hiromachi 1-chome, Shinagawa-ku, Tokyo, JAPAN

國籍：（中文） 日本 （英文） Japan

發明人 4

姓名：（中文）宮崎正二郎

（英文）MIYAZAKI, Shojiro

住居所地址：（中文）東京都品川區廣町 1 丁目 2 番 58 號 三共株式会社內

（英文）c/o SANKYO COMPANY, LIMITED

2-58, Hiromachi 1-chome, Shinagawa-ku, Tokyo, JAPAN

國籍：（中文） 日本 （英文） Japan

捌、聲明事項

☐ 本案係符合專利法第二十條第一項□第一款但書或□第二款但書規定之期間，其日期爲：＿＿＿＿＿＿＿＿

☑ 本案已向下列國家（地區）申請專利，申請日期及案號資料如下：

【格式請依：申請國家（地區）；申請日期；申請案號　順序註記】

1.日本　2002.01.11　特願 2002-004456

2.日本　2002.01.11　特願 2002-004484

3.＿＿＿＿＿＿＿＿

☑ 主張專利法第二十四條第一項優先權：

【格式請依：受理國家（地區）；日期；案號　順序註記】

1.日本　2002.01.11　特願 2002-004456

2.日本　2002.01.11　特願 2002-004484

3.＿＿＿＿＿＿＿＿

☐ 主張專利法第二十五條之一第一項優先權：

【格式請依：申請日；申請案號　順序註記】

1.＿＿＿＿＿＿＿＿

2.＿＿＿＿＿＿＿＿

3.＿＿＿＿＿＿＿＿

☐ 主張專利法第二十六條微生物：

☐國內微生物　【格式請依：寄存機構；日期；號碼　順序註記】

1.＿＿＿＿＿＿＿＿

2.＿＿＿＿＿＿＿＿

3.＿＿＿＿＿＿＿＿

☐國外微生物　【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼　順序註記】

1.＿＿＿＿＿＿＿＿

2.＿＿＿＿＿＿＿＿

3.＿＿＿＿＿＿＿＿

☐熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

玖、發明說明

（發明說明應敘明：發明所屬之技術領域、先前技術、內容、實施方式及圖式簡單說明）

[技術領域]

本發明爲有關具優異免疫抑制作用之胺醇衍生物或膦酸衍生物，胺醇衍生物或膦酸衍生物之藥理容許鹽，胺醇衍生物或膦酸衍生物之藥理容許酯，或含有這些爲有效成份之醫藥組成物，或使用這些製造之醫藥組成物。

進言之，本發明爲有關免疫抑制劑，含選自具優異免疫抑制作用之胺醇化合物或膦酸衍生物，其藥理容許鹽及其酯之化合物爲有效成份，對器官及細胞移植之排斥反應、風溼病及其他自體免疫疾病等之與免疫作用有關疾病之優異預防或治療藥之醫藥組成物。

[先前技術]

以往、於風溼及其他自體免疫疾病等之與免疫作用有關疾病之治療時、僅能施以針對異常免疫反應所產生炎症反應之類固醇等消炎藥。故而無針對該疾病之治本治療法。

並且、有報告指出糖尿病及腎炎之產生與免疫系統異常有關，而至今尙未研發改善此類異常之藥劑。

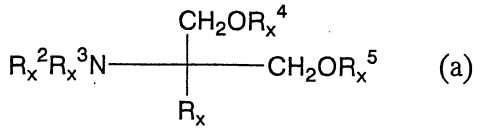
他方面，抑制免疫反應方法的開發，不僅於預防器官及細胞移植之排斥反應，以及各種自體免疫疾病的預防及治療上皆極爲重要。但環孢素 A(CsA)及大環內酯(Tacrolimus)(TRL)等已知之免疫抑制劑對腎臟及肝臟都顯示毒性，爲減輕其已知之副作用而與類固醇合併治療廣泛使用，但未能全無副作用而完全發揮免疫抑制效

果。

因此，嘗試找尋低毒性、優異免疫抑制作用之化合物。

已知之免疫抑制劑有如下化合物。

(1) 通式(a)



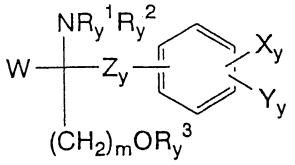
(a)

{上述化合物(a)中、

Rx為可有取代基之直或分岐碳鏈[該鏈中可含雙鍵、三鍵、氧、硫、-N(Rx⁶)-(式中、Rx⁶為氫)、可有取代基之伸芳基、可有取代基之雜芳基、該鏈端可含可有取代基之芳基、可有取代基之環烷基、可有取代基之雜芳基]、Rx²、Rx³、Rx⁴、Rx⁵為相同或不同、各為氫、烷基}已知該化合物可作為免疫抑制劑。

於該已知技術之上述化合物(a)之必須取代基中，於同一碳原子上有取代以2個氧甲基(-CH₂ORx⁴及-CH₂ORx⁵)；而本發明化合物相對應之基，則於同一碳原子上有取代以-CH₂OR³基及低烷基為與上述化合物(a)不同之處。

(2) 通式(b)化合物



(b)

[上述化合物(b)中

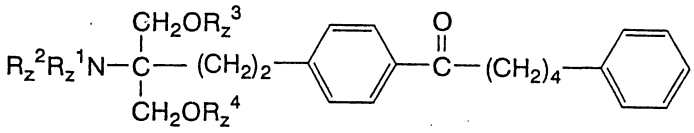
Ry¹、Ry²及Ry³為氫原子等、W為氫原子、烷基等、Zy

爲單鍵或伸烷基、Xy爲氫原子或烷氧基、Yy爲氫原子、烷基、烷氧基、醯基、醯氧基、胺基、醯胺基等。」已知該化合物可作爲免疫抑制劑。

上述化合物(b)之基本結構中必須具有苯基；而本發明化合物(I)相對應之基爲具雜環之呋喃基及吡咯基或氮原子中有取代基之吡咯基爲與上述化合物(b)不同之處。

並且，與本公報中本發明化合物(I)之構造類似之化合物並無具體的揭示。

(3) 通式(c)化合物



(c)

[上述化合物(c)、

Rz^1、Rz^2、Rz^3、Rz^4爲相同或不同、各爲氫或醯基]已知該化合物可作爲免疫抑制劑。

上述化合物(c)之必須取代基中，同一碳原子上有取代以2個氧甲基(一CH_2ORz^3及-CH_2ORz^4)；而本發明化合物相對應之基，則於同一碳原子上有取代以-CH_2OR^3基與低烷基爲與上述化合物(c)不同之處。並且，上述化合物(c)之基本結構中-$(CH_2)_2$-基與-CO-$(CH_2)_4$-基間之苯基爲必須之基；而本發明化合物(I)中，相對應之基爲具雜環之呋喃基及吡咯基或氮原子中有取代基之吡咯基爲與上述化合物(c)不同之處。

另，上述通式(II)化合物中，X爲硫原子之本發明化

合物，爲 O02/06268 號公報中揭示之含羥基化合物之保護基爲磷酸酯鹽残基之化合物。

並且，免疫抑制劑之併用中、免疫抑制劑 FTY-720 與環孢素 A 或大環內酯(Tacrolimus)併用之發明已揭示於特開平 11－80026 號公報。

因此，期望能發現低毒性、含優異免疫抑制作用之醫藥組成物。

[發明內容]

本發明爲有關低毒性之含優異免疫抑制作用之新穎化合物，經由長久特意研討之結果，發現新穎化合物可有效用於各種器官移植或皮膚移植時的排斥反應、全身性紅斑性狼瘡症、慢性関節風濕、多發性肌炎、結合組織炎、骨骼肌炎、骨関節炎、變形性関節症、皮膚肌炎、鞏皮症、bechet 病、Chron 病、潰瘍性大腸炎、自體免疫性肝炎、再生不良性貧血症、特發性血小板減少性紫斑病、自體免疫性溶血性貧血症、多發性硬化症、自體免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症候群、Wegener 肉芽腫、葡萄膜炎、Sjoegren 症候群、特發性間質性肺炎、Goodpasture 症候群、類肉瘤病、過敏性肉芽腫性血管炎、支氣管氣喘、心肌炎、心肌症、主動脈炎症候群、心肌梗塞後症候群、原發性肺高血壓症、微小變化型腎病、膜性腎症、膜性增殖性腎炎、巢狀球體硬化症、半月體形成性腎炎、重肌無力症、炎症性神經症、異位性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、褥瘡、Sydenham 舞踏病、硬化症、成人發症糖尿病、胰島素依

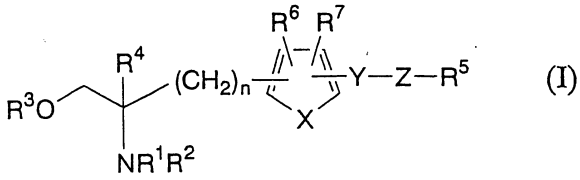
存性糖尿病、若年性糖尿病、粥樣性動脈硬化症、腎小球腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原發性膽汁性肝硬化、原發性硬化性膽管炎、劇症肝炎、病毒性肝炎、GVHD、接觸皮膚炎、敗血症等自體免疫疾病或其他免疫有關疾病、以及真菌、枝原體mycoplasma、病毒、原虫等感染症、心衰竭、心室肥大、心律不整、狹心症、心缺血、動脈塞栓、動脈痛、靜脈癌、血液循環障礙等循環系統疾病、阿茲海默症、痴呆、帕金森氏症、中風、腦梗塞、腦缺血、鬱病、燥鬱症、綜合失調症、杭廷頓氏舞蹈氏、器官痛、痙攣、過動症、腦炎、髓膜炎、食慾不振和飲食過量等中樞系統疾病、淋巴腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等各種疾病(特指各種器官移植或皮膚移植之排斥反應、全身性紅斑性狼瘡症、慢性関節風濕、多發性硬化症、異位性皮膚炎等自體免疫疾病),終於完成本發明。

並且,本發明者特別進行具免疫抑制作用之醫藥組成物之研究結果,發現本發明醫藥組成物乃低毒性、具有優異免疫抑制作用;該組成物中含有之免疫抑制劑皆可加強發揮藥理效果,並且降低該免疫抑制劑單獨存在之副作用而可有效用於各種器官移植或皮膚移植時的排斥反應、全身性紅斑性狼瘡症、慢性関節風濕、多發性肌炎、結合組織炎、骨骼肌炎、骨関節炎、變形性関節症、皮膚肌炎、鞏皮症、bechet病、Chron病、潰瘍性大腸炎、自體免疫性肝炎、再生不良性貧血症、特發性血小板減少性紫斑病、自體免疫性溶血性貧血症、多發性硬

化症、自體免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症候群、Wegener肉芽腫、葡萄膜炎、Sjoegren症候群、特發性間質性肺炎、Goodpasture症候群、肉瘤、過敏性肉芽腫性血管炎、支氣管氣喘、心肌炎、心肌症、主動脈炎症候群、心肌梗塞後症候群、原發性肺高血壓症、微小變化型腎病、膜性腎症、膜性增殖性腎炎、巢狀球體硬化症、半月體形成性腎炎、重肌無力症、炎症性神經症、異位性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、褥瘡、Sydenham舞踏病、硬化症、成人發症糖尿病、胰島素依存性糖尿病、若年性糖尿病、粥樣性動脈硬化症、腎小球腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原發性膽汁性肝硬化、原發性硬化性膽管炎、劇症肝炎、病毒性肝炎、GVHD、接觸皮膚炎、敗血症等自體免疫疾病或其他免疫有關疾病、以及真菌、枝原體(mycoplasma)、病毒、原虫等感染症、心衰竭、心室肥大、心律不整、狹心症、心缺血、動脈塞栓、動脈痛、靜脈癌、血液循環障礙等循環系統疾病、阿茲海默症、痴呆、帕金森氏症、中風、腦梗塞、腦缺血、鬱病、燥鬱症、綜合失調症、杭廷頓氏舞蹈氏、器官痛、痙攣、過動症、腦炎、髓膜炎、食慾不振和飲食過量等中樞系統疾病、淋巴腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等各種疾病(特指各種器官移植或皮膚移植之排斥反應、全身性紅斑性狼瘡症、慢性関節風濕、多發性硬化症、異位性皮膚炎等自體免疫疾病)，終於完成本發明。

本發明具體說明如下。

(1) 本發明胺醇衍生物爲有下述通式(I)化合物



(I)

上述式中、

R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、低烷基或胺基保護基、

R^3爲氫原子、低烷基或羥基保護基、

R^4爲低烷基、

n爲1～6整數、

X爲氧原子或式N-D之基(式中、D爲選自氫原子、C6-10芳基、低烷磺醯基、C6-10芳磺醯基或取代基群a之基)、

Y爲伸乙基、伸乙烯基、伸乙炔基、式-E-CH_2-之基(式中、E爲羰基或式-CH(OH)-之基)、C6-10伸芳基或有選自取代基群a之1～3個取代之C6-10伸芳基、

Z爲單鍵、C1-10伸烷基、有選自取代基群a及b之1～3個取代之C1-10伸烷基、碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之C1-10伸烷基、或有選自取代基群a及b之1～3個取代、且碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之C1-10伸烷基、

R^5爲氫原子、C3-10環烷基、C6-10芳基、含1～3個硫原子、氧原子及/或氮原子之5～7員雜環基、有選自取代基群a及b之1～3個取代之C3-10環烷基、有選自

取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代之 C6-10 芳基、或有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 取代，且含 1～3 個硫原子、氧原子及/或氮原子之 5～7 員雜環基、

R^6 及 R^7 爲相同或不同、各爲選自氫原子或取代基群 a 之基、

取代基群 a 爲鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基、低烷硫基、羧基、低烷氧羰基、羥基、低脂族醯基、胺基、單低烷胺基、二-低烷胺基、低脂族醯胺基、氰基及硝基、

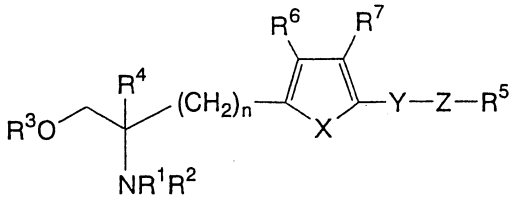
取代基群 b 爲 C3-10 環烷基、C6-10 芳基、含 1～3 個硫原子、氧原子及/或氮原子之 5～7 員雜環基、有選自取代基群 a 之 1～3 取代之 C3-10 環烷基、有選自取代基群 a 之 1～3 取代之 C6-10 芳基、及有選自取代基群 a 之 1～3 取代、含 1～3 個硫原子、氧原子及/或氮原子之 5～7 員雜環基，

當 R^5 爲氫原子時，Z 爲分岐鏈 C1-10 伸烷基、有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 取代之 C1-10 伸烷基、碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基、或有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代、且碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基。

本發明提供式(I)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯。

其中宜爲

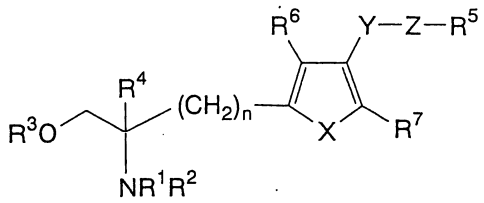
(2) 如(1)中式(I)化合物、其爲式(Ia)：



(Ia)

(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、X、Y、Z及n之定義如上)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯、

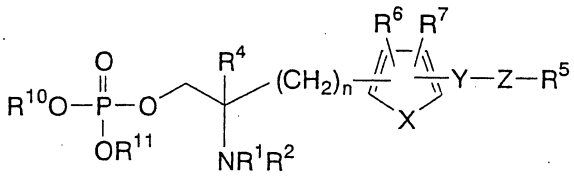
(3)如(1)中式(I)化合物、其爲式(Ib)：



(Ib)

(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、X、Y、Z及n之定義如上)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯、

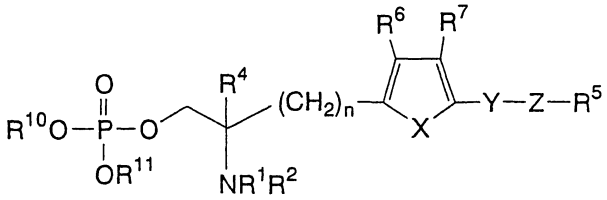
(3) 如(1)中式(I)化合物藥理容許酯、其爲式(II)



(II)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、X、Y、Z及n之定義如上、R^{10}及R^{11}爲相同或不同、各爲氫原子或磷酸基保護基。)化合物或其藥理容許鹽、

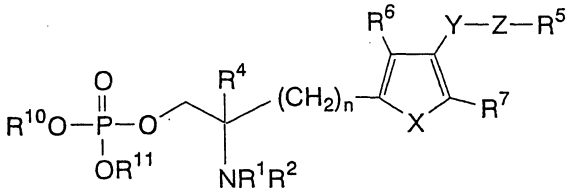
(4) 如(4)中含式(II)之酯、其爲式(IIa)



(IIa)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及n之定義如上)化合物或其藥理容許鹽及

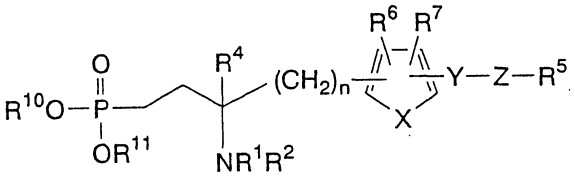
(5) 如(4)中含式(II)之酯、其爲式(IIb)



(IIb)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及之定義如上)化合物或其藥理容許鹽。

(6) 本發明之膦酸衍生物爲含下述一般式(III)：

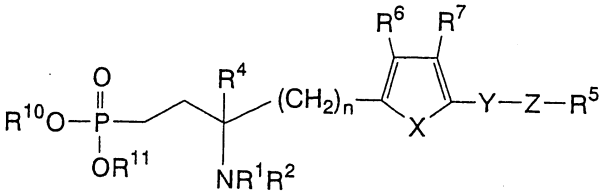


(III)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及之定義如上)。

本發明提供式(III)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯。其中宜爲

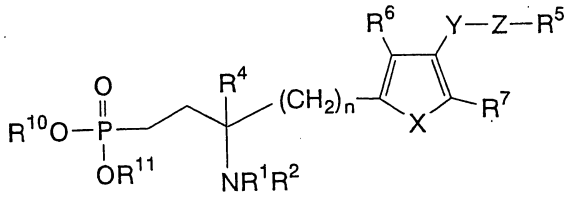
(7) 如(7)中式(III)化合物、其爲式(IIIa)



(IIIa)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及之定義如上)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯及

(9)如(7)中式(III)化合物、其爲式(IIIb)



(IIIb)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及n之定義如上)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯。

其中較佳化合物爲、

(10)如(1)～(9)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、低脂族醯基、低烷氧羰基、芳烷氧羰基類或選自取代基群a之1～3取代芳烷氧羰基、

(11)如(1)～(9)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、低脂族醯基或低烷氧羰基化合物或其藥理容許鹽、

(12)如(1)～(9)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-4脂族醯基或C1-4烷氧羰基、

(13)如(1)～(9)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中

R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-2脂族醯基或C1-2烷氧羰基、

(14)如(1)～(9)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、乙醯基或甲氧羰基、

(15)如(1)～(9)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^1及R^2爲氫原子、

(16)如(1)～(3)及(10)～(15)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^3爲氫原子、低烷基、低脂族醯基、芳香族醯基、選自取代基群a之1～3取代之芳香族醯基或矽烷基、

(17)如(1)～(3)及(10)～(15)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^3爲氫原子或低烷基、

(18)如(1)～(3)及(10)～(15)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^3爲氫原子或C1-4烷基、

(19)如(1)～(3)及(10)～(15)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^3爲氫原子、甲基或乙基、

(20)如(1)～(3)及(10)～(15)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^3爲氫原子、

(21)如(1)～(20)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^4爲C1-4烷基、

(22)如(1)～(20)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^4爲C1-2烷基、

(23)如(1)～(20)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中R^4爲甲基、

(24)如(1)～(23)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中n爲2或3、

(25)如(1)～(23)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中n爲2、

(26)如(1)～(25)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中X爲氧原子、

(27)如(1)～(25)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中X爲式N-D之基(式中、D爲氫原子、C1-4烷基或苯基)。

(28)如(1)～(25)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中X爲式-NCH_3之基、

(29)如(1)～(28)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中Y爲可有選自一群如伸乙基、伸乙炔基、式-CO-CH_2-之基、式-CH(OH)-CH_2-之基、伸苯基、或有選自鹵素及低烷基之1～3個取代之伸苯基、

(30)如(1)～(28)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中Y爲伸乙基、伸乙炔基、式-CO-CH_2-之基或伸苯基、

(31)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中Z爲有選自一群如C1-10伸烷基或有選自取代基群a及b之1～3個取代之C1-10伸烷基、

(32)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中Z爲C1-6伸烷基或取代1～3個羥基之C1-6伸烷基、

(33)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中Z爲C1-5伸烷基或取代以1～3個羥基之C1-5伸烷基、

(34)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其

中 Z 爲伸乙基、三亞甲基、四亞甲基、或取代以 1 個羥基之伸乙基、三亞甲基或四亞甲基、

(35)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 Z 爲伸乙基、三亞甲基或四亞甲基、

(36)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 Z 爲伸乙基或三亞甲基、

(37)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基、或取代以 1 個羥基且碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基(該取代基爲選自低烷基及羥基)、

(38)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基、

(39)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子之 C1-10 伸烷基、

(40)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子之 C1-6 伸烷基、

(41)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 Z 爲 $-O-CH_2-$、$-O-(CH_2)_2-$、$-O-(CH_2)_3-$、$-CH_2-O-$、$-(CH_2)_2-O-$或$-(CH_2)_3-O-$之基、

(42)如(1)～(30)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 Z 爲 $-CH_2-O-$或$-(CH_2)_2-O-$之基、

(43)如(1)～(42)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^5 爲氫原子、

(44)如(1)～(42)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其

中 R^5 爲 C3-10 環烷基、C6-10 芳基、或有選自鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基及低烷硫基之 1～3 個取代之 C3-10 環烷基或 C6-10 芳基、

(45)如(1)～(42)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^5 爲 C3-10 環烷基、C6-10 芳基、或有選自鹵原子、低烷基、鹵低烷基及低烷氧基之 1～3 個取代之 C3-10 環烷基或 C6-10 芳基、

(46)如(1)～(42)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^5 爲 C5-C6 環烷基、苯基或萘基、

(47)如(1)～(42)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^5 爲環己基或苯基、

(48)如(1)～(47)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^6 及 R^7 爲相同或不同、各爲氫原子、鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基或低烷硫基、

(49)如(1)～(47)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^6 及 R^7 爲氫原子、

(50)如(4)～(15)及(21)～(49)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^{10} 及 R^{11} 爲相同或不同、各爲氫原子或低烷基、

(51)如(4)～(15)及(21)～(49)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^{10} 及 R^{11} 爲相同或不同、各爲氫原子或 C1-4 烷基、

(52)如(4)～(15)及(21)～(49)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^{10} 及 R^{11} 爲相同或不同、各爲氫原子、甲基或乙基，

(53)如(4)～(15)及(21)～(49)中任一項之化合物或其藥理容許鹽、其中 R^{10} 及 R^{11} 爲氫原子。

上述(1)化合物中、宜選自(2)～(3)；(10)～(15)；(16)～(20)；(21)～(23)；(24)～(25)；(26)～(28)；(29)～(30)；(31)～(42)；(43)～(47)；及(48)～(49)中任一項任意組合之化合物。

上述(4)化合物中、宜選自(5)～(6)；(10)～(15)；(21)～(23)；(24)～(25)；(26)～(28)；(29)～(30)；(31)～(42)；(43)～(47)；(48)～(49)；及(50)～(53)中任一項任意組合之化合物。

上述(7)化合物中、宜選自(8)～(9)；(10)～(15)；(21)～(23)；(24)～(25)；(26)～(28)；(29)～(30)；(31)～(42)；(43)～(47)；(48)～(49)；及(50)～(53)中任一項任意組合之化合物。

其、特宜爲如下化合物、

(54)選自下列1個化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯：

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己氧戊醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇、及

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲基苯氧基)丙-1-炔基]

呋喃-2-基}丁-1-醇。

(55)選自下列1個化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯：

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇及

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]

丁-1-醇。

(56)如(54)中化合物之藥理容許酯、其爲如下任1個化合物或其藥理容許鹽：

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]-1-丁酯及

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯。

(57)如(56)中化合物之藥理容許酯、其爲如下任1個化合物或其藥理容許鹽：

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基戊-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯及

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯。

(58)選自下列1個化合物或其藥理容許鹽：

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5二環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦

酸及

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸。

(59)選自下列1個化合物或其藥理容許鹽：

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己氧基戊-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]戊

基膦酸及

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸。

本發明亦提供其醫藥組成物。

(60) 選自對T細胞中細胞素表現有關之細胞內訊號傳達有阻礙作用之藥劑、

對免疫細胞中核苷合成有阻礙作用之藥劑、

對免疫細胞中細胞素有阻礙作用之具抗風溼作用藥劑、

因DNA鏈破壞或DNA合成障礙所致細胞死亡之烷化劑、

抑制葉酸產生以阻礙核酸代謝之代謝拮抗劑、

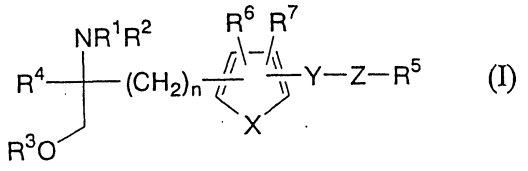
有TNF-α抑制作用之蛋白質製劑、

在細胞內類固醇受體結合形成複合體、在染色體上反應部位結合而合成之蛋白質而具免疫抑制作用之類固醇

荷爾蒙劑及

可抑制前列腺素產生之物質及/或對前列腺素作用有拮抗之非類固醇系抗炎症劑

之至少一種免疫抑制劑，與下式(I)化合物：



(I)

[式中、

R_1及R_2爲相同或不同、各爲氫原子、低烷基或胺基保護基、

R_3爲氫原子、低烷基或羥基保護基、

R_4 爲低烷基、

n 爲 1～6 整數、

X 爲硫原子、氧原子或式 N-D 之基(式中、D 爲選自氫原子、芳基、低烷磺醯基、芳磺醯基或取代基群 a 之基。)、

Y 爲伸乙基、伸乙烯基、伸乙炔基、式 $-E-CH_2-$ 之基(式中、E 爲羰基或式 -CH(OH)- 之基)、C6-10 伸芳基或有選自取代基群 a 之 1～3 個取代之 C6-10 伸芳基、

Z 爲單鍵、C1-10 伸烷基、有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代之 C1-10 伸烷基、碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基、或有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代、且碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基、

R^5 爲氫原子、C3-10 環烷基、C1-6 芳基、含 1～3 個硫原子、氧原子及/或氮原子之 5～7 員雜環基、有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代之 C3-10 環烷基、有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代之 C1-6 芳基、或有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 取代，且含 1～3 個硫原子、氧原子及/或氮原子之 5～7 員雜環基、

R^6 及 R^7 爲相同或不同、各爲選自氫原子或取代基群 a 之基、

取代基群 a 爲鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基、低烷硫基、羧基、低烷氧羰基、羥基、低脂族醯基、胺基、單低烷胺基、二-低烷胺基、低脂族醯胺基、氰基及硝基、

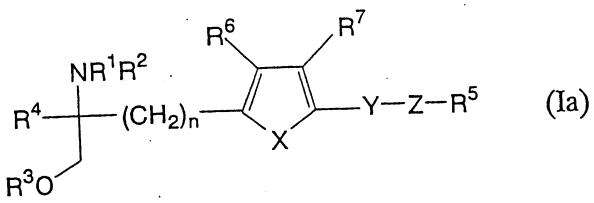
取代基群 b 爲 C1-6 環烷基、C1-6 芳基、含 1～3 個硫原子、氧原子及/或氮原子之 5～7 員雜環基、有選自取代基群 a 之 1～3 取代之 C1-6 環烷基、有選自取代基群 a 之 1～3 取代之 C1-6 芳基、及有選自取代基群 a 之 1～3 取代、且含 1～3 個硫原子、氧原子及/或氮原子之 5～7 員雜環基、

當 R^5 爲氫原子時，Y 爲分岐鏈 C1-10 伸烷基、有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 取代之 C1-10 伸烷基、碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基、或有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代、且碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基]、

及其藥理容許鹽及其酯之一以上化合物之醫藥組成物。

其中宜爲

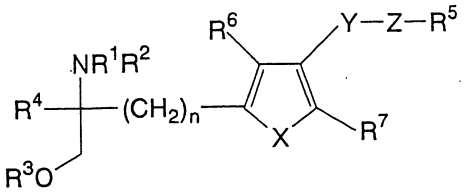
(61)如(60)中一般式(I)化合物、其爲下述一般式(Ia)化合物之醫藥組成物：



(Ia)

(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、X、Y、Z 及 n 之定義如上)、

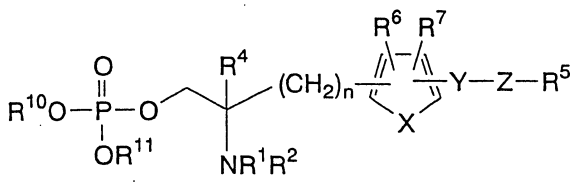
(62)如(60)中一般式(I)化合物、其爲下述一般式(Ib)化合物之醫藥組成物：



(Ib)

(式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、X、Y、Z及n之定義如上)、

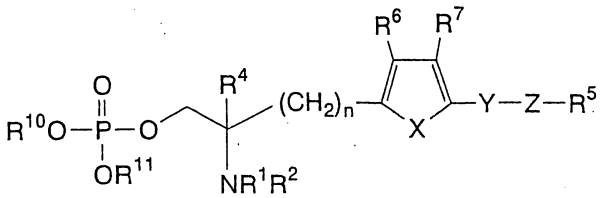
(63)如(60)中式(I)化合物之藥理容許酯、其爲式(II)化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物：



(II)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、X、Y、Z及n之定義如上、R^{10}及R^{11}爲相同或不同、各爲氫原子或磷酸基保護基)、

(64)如(63)中式(II)酯、其爲式(IIa)化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物：

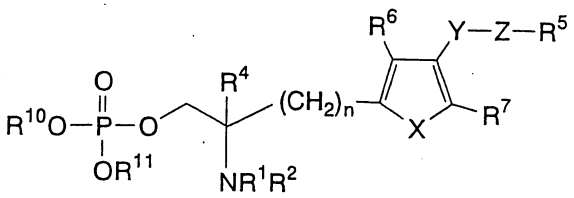


(IIa)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及n之定義如上)及

(65)如(63)中式(II)之酯、其爲式(IIb)化合物或其藥理容

許鹽之醫藥組成物：



(IIb)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及n之定義如上)。

本發明亦提供醫藥組成物。

(66) 選自對T細胞中細胞素表現有關之細胞內訊號傳達有阻礙作用之藥劑、

對免疫細胞中核苷合成有阻礙作用之藥劑、

對免疫細胞中細胞素有阻礙作用之具抗風溼作用藥劑、

因DNA鏈破壞或DNA合成障礙所致細胞死亡之烷化劑、

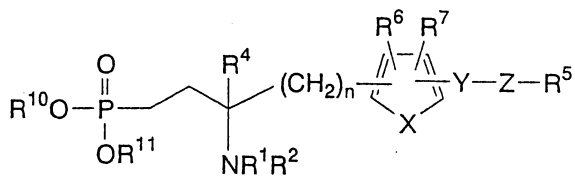
抑制葉酸產生以阻礙核酸代謝之代謝拮抗劑、

有TNF-α抑制作用之蛋白質製劑、

在細胞內類固醇受體結合形成複合體、在染色體上反應部位結合而合成之蛋白質而具免疫抑制作用之類固醇荷爾蒙劑及

可抑制前列腺素產生之物質及/或對前列腺素作用有拮抗之非類固醇系抗炎症劑

之至少一種免疫抑制劑，與式(III)化合物：



(III)

[式中、

R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、低烷基或胺基保護基、

R^4爲低烷基、

n爲1～6整數、

X爲硫原子、氧原子或式N-D之基(式中、D爲選自氫原子、芳基、低烷磺醯基、芳磺醯基或取代基群a之基。)、

Y爲伸乙基、伸乙烯基、伸乙炔基、式-E-CH_2-之基(式中、E爲羰基或式-CH(OH)-之基)、C6-10伸芳基或有選自取代基群a之1～3個取代之C6-10伸芳基、

Z爲單鍵、C1-10伸烷基、有選自取代基群a及b之1～3個取代之C1-10伸烷基、碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之C1-10伸烷基、或有選自取代基群a及之1～3個取代、且碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之C1-10伸烷基、

R^5爲氫原子、C3-10環烷基、C6-10芳基、含1～3個硫原子、氧原子及/或氮原子之5～7員雜環基、有選自取代基群a及b之1～3個取代之C3-10環烷基、有選自取代基群a及b之1～3個取代之C6-10芳基、或有選自取代基群a及b之1～3取代，且含1～3個硫原子、氧原子及/或氮原子之5～7員雜環基、

R^6及R^7爲相同或不同、各爲選自氫原子或取代基群a之基

R^{10}及R^{11}爲相同或不同、各爲氫原子或磷酸基保護基、

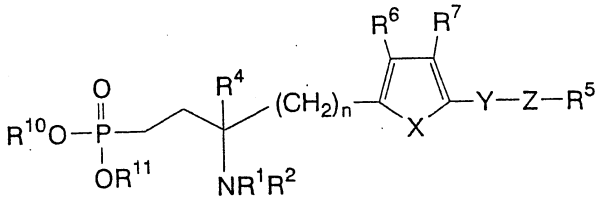
取代基群a爲鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基、低烷硫基、羧基、低烷氧羰基、羥基、低脂族醯基、胺基、單低烷胺基、二-低烷胺基、低脂族醯胺基、氰基及硝基、

取代基群b爲C3-10環烷基、C6-10芳基、含1～3個硫原子、氧原子及/或氮原子之5～7員雜環基、有選自取代基群a之1～3取代之C3-10環烷基、有選自取代基群a之1～3取代之C6-10芳基、及有選自取代基群a之1～3取代、且含1～3個硫原子、氧原子及/或氮原子之5～7員雜環基，

當R^5爲氫原子時，Z爲分岐鏈C1-10伸烷基、有選自取代基群a及b之1～3取代之C1-10伸烷基、碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之C1-10伸烷基、或有選自取代基群a及b之1～3個取代、且碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之C1-10伸烷基]化合物或其藥理容許鹽及其酯之一以上化合物之醫藥組成物。

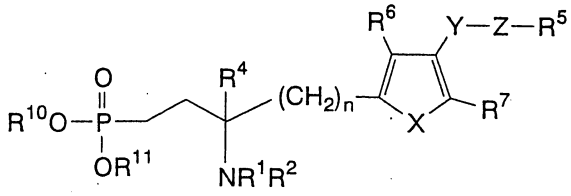
其中宜爲

(67)如(66)中式(III)化合物、其爲有式(IIIa)化合物或之醫藥組成物：



(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及n之定義如上)及

(68)如(66))中式(III)化合物、其爲有式(IIIb)化合物或之醫藥組成物：



(IIIb)

(式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及n之定義如上)。

上述醫藥組成物宜爲

(69)如(60)～(68)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、低脂族醯基、低烷氧羰基、芳烷氧羰基類或選自取代基群a之1～3取代芳烷氧羰基、

(70)如(60)～(68)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、低脂族醯基或低烷氧羰基、

(71)如(60)～(68)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-4脂族醯基或C1-4烷氧羰基、

(72)如(60)～(68)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-2脂族醯基或C1-2烷氧羰基、

(73)如(60)～(68)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫

藥組成物、其中 R^1 及 R^2 爲相同或不同、各爲氫原子、乙醯基或甲氧羰基、

(74)如(60)～(68)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^1 及 R^2 爲氫原子、

(75)如(60)～(62)及(69)～(74)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^3 爲氫原子、低烷基、低脂族醯基、芳族醯基、有選自取代基群 a 之 1～3 取代之芳香族醯基或矽烷基、

(76)如(60)～(62)及(69)～(74)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^3 爲氫原子或低烷基、

(77)如(60)～(62)及(69)～(74)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^3 爲氫原子或 C1-4 烷基、

(78)如(60)～(62)及(69)～(74)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^3 爲氫原子、甲基或乙基、

(79)如(60)～(62)及(69)～(74)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^3 爲氫原子、

(80)如(60)～(79)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^4 爲 C1-4 烷基、

(81)如(60)～(79)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^4 爲 C1-2 烷基、

(82)如(60)～(79)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^4 爲甲基、

(83)如(60)～(82)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 n 爲 2 或 3、

(84)如(60)～(82)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫

藥組成物、其中 n 爲 2、

(85)如(60)～(84)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 X 爲硫原子、

(86)如(60)～(84)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 X 爲氧原子、

(87)如(60)～(84)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 X 爲式 N-D 之基(式中、D 爲氫原子、C1-4 烷基或苯基。)、

(88)如(60)～(84)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 X 爲式 N-CH3 之基、

(89)如(60)～(88)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Y 爲伸乙基、伸乙炔基、式 -CO-CH_2-之基、式 -CH(OH)-CH_2-之基、伸苯基、或有選自鹵素及低烷基之 1～3 個取代之伸苯基、

(90)如(60)～(88)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Y 爲伸乙基、伸乙炔基、式 -CO－CH_2-之基或伸苯基、

(91)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲 C1-10 伸烷基或有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代之 C1-10 伸烷基、

(92)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲 C1-6 伸烷基或取代 1～3 個羥基之 C1-6 伸烷基、

(93)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲 C1-5 伸烷基或取代 1～3 個羥基之

C1-5 伸烷基、

(94)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲伸乙基、三亞甲基、四亞甲基、或取代以 1 個羥基之伸乙基、三亞甲基或四亞甲基、

(95)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲伸乙基、三亞甲基或四亞甲基、

(96)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲伸乙基或三亞甲基、

(97)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基、或取代以 1 個羥基且碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基(該取代基爲選自低烷基及羥基。)、

(98)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基、

(99)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子之 C1-10 伸烷基、

(100)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子之 C1-6 伸烷基、

(101)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 Z 爲 $-O-CH_2-$、$-O-(CH_2)_2-$、$-O-(CH_2)_3-$、$-CH_2-O-$、$-(CH_2)_2-O-$ 或 $-(CH_2)_3-O-$ 之基、

(102)如(60)～(90)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中Z爲-CH_2-O-或-$(CH_2)_2$-O-之基、

(103)如(60)～(102)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^5爲氫原子、

(104)如(60)～(102)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^5爲C3-10環烷基、C6-10芳基、或有選自鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基及低烷硫基之1～3個取代之C3-10環烷基或C6-10芳基、

(105)如(60)～(102)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^5爲C3-10環烷基、C6-10芳基、或有選自鹵原子、低烷基、鹵低烷基及低烷氧基之1～3個取代之3-C10環烷基或C6-10芳基、

(106)如(60)～(102)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^5爲C5-C6環烷基、苯基或萘基、

(107)如(60)～(102)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^5爲環己基或苯基、

(108)如(60)～(107)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^6及R^7爲相同或不同、各爲氫原子、鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基或低烷硫基、

(109)如(60)～(107)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^6及R^7爲氫原子、

(110)如(63)～(74)及(80)～(109)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中R^{10}及R^{11}爲相同或不同、各爲氫原子或低烷基、

(111)如(63)～(74)及(80)～(109)中任一項化合物或其藥

理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^{10} 及 R^{11} 爲相同或不同、各爲氫原子或 C1-4 烷基、

(112)如(63)～(74)及(80)～(109)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^{10} 及 R^{11} 爲相同或不同、各爲氫原子、甲基或乙基。

(113)如(63)～(74)及(80)～(109)中任一項化合物或其藥理容許鹽之醫藥組成物、其中 R^{10} 及 R^{11} 爲氫原子。

其中、特宜爲

(114)(60)中一般式(I)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁基)嘧吩-2-基] 丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊基)嘧吩-2-基] 丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基) 嘧吩-2-基] 丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁基)嘧吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基] 嘧吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]嘧吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁基)嘧吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)嘧吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯丁-1-炔基)嘧吩-2-基] 丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)嘧吩-2-基] 丁

-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基] 噻吩-2-基}丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁-1-炔基) 噻吩-2-基] 丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇 、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯丁醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩--2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩--2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇及

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇。

(115) (60)中一般式(I)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基] 丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基) 呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇及

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇。

(116) (60)中一般式(I)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇及

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇。

(117)(63)中一般式(II)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基] 噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基) 噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]

噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3r(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁醯基) 噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯丁醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊醯基) 噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基) 戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊醯基) 噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-乙醯苯氧基) 丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯及

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯。

(118)(63)中一般式(II)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基) 呋喃-2-基]-1-丁酯及

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯。

(119)(63)中一般式(II)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊卜-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯及

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

(120)(66)中一般式(III)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊基) 噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲氧苯氧基) 丁基]噻吩-2-基}

戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苯丁-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-

基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(3-環己基甲氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苄氧丁-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苯丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基] 戊基膦酸、

3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸。

(121) (66)中一般式(III)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-.5-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸及

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸。

(122) (66)中一般式(III)化合物、其藥理容許鹽及其藥理

容許酯、宜選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯之醫藥組成物：

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5~(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基] 戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸及

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]

(130)一種預防或治療慢性関節風溼病之方法,將有效量選自如(60)～(125)中任一項之醫藥組成物投予至哺乳動物。

(131)一種預防或治療器官移植之排斥反應之方法,將有效量選自如(60)～(125)中任一項之醫藥組成物投予至哺乳動物。

上述式(I)、(II)及(III)中、D、R^5及取代基群b定義中「C6-10芳基」、「選自取代基群a之1～3個取代之C6-10芳基」及「選自取代基群a及b之1～3個取代之C6-10芳基」之芳基部分爲如、苯基、茚基、萘基、宜爲苯基或萘基、最宜爲苯基。

Y及E定義中「C6-10伸芳基」、「有選自取代基群a之1～3個取代之C6-10伸芳基」及「有選自取代基群a及b之1～3個取代之C6-10伸芳基」之伸芳基部分爲如、伸苯基、伸茚基、伸萘基、宜爲伸苯基或伸萘基、最宜爲伸苯基。

Z定義中「C1-10伸烷基」及「有選自取代基群a及b之1～3個取代之C1-10伸烷基」之C1-10伸烷基部分爲亞甲基、甲基亞甲基、伸乙基、伸丙基、三亞甲基、1-甲基伸乙基、四亞甲基、1-甲基三亞甲基、2-甲基三亞甲基、3-甲基三亞甲基、1-甲基伸丙基、1,1-二甲基伸乙基、五亞甲基、1-甲基四亞甲基、2-甲基四亞甲基、3-甲基四亞甲基、4-甲基四亞甲基、1,1-二甲基三亞甲基、2,2-二甲基三亞甲基、3,3-二甲基三亞甲基、六亞甲基、1-甲基七亞甲基、2-甲基七亞甲基、3-甲基五亞甲

基、4-甲基五亞甲基、5-甲基七亞甲基、1,1-二甲基四亞甲基、2,2-二甲基四亞甲基、3,3-二甲基四亞甲基、4,4-二甲基四亞甲基、七亞甲基、1-甲基六亞甲基、2-甲基六亞甲基、5-甲基六亞甲基、3-乙基五亞甲基、八亞甲基、2-甲基七亞甲基、5-甲基七亞甲基、2-乙基六亞甲基、2-乙基-3-甲基五亞甲基、3-乙基-2-甲基五亞甲基、九亞甲基、2-甲基八亞甲基、7-甲基八亞甲基、4-乙基七亞甲基、3-乙基-2-甲基六亞甲基、2-乙基-1-甲基六亞甲基、十亞甲基等 C1～10 直鏈或分歧鏈伸烷基、宜爲 C1-6 伸烷基。更宜爲 C1-5 伸烷基、又宜爲伸乙基、三亞甲基或四亞甲基、最宜爲伸乙基或三亞甲基。

Z 定義中「碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基」及「有選自取代基群 a 及 b 之 1～3 個取代、且碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基」中「碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基」部分爲上述「C1-10 伸烷基」其碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之基、例如、$-O-CH_2-$、$-O-(CH_2)_2-$、$-O-(CH_2)_3-$、$-O-(CH_2)_4-$、$-O-(CH_2)_5-$、$-O-(CH_2)_6-$、$-O-(CH_2)_7-$、$-O-(CH_2)_8-$、$-O-(CH_2)_9-$、$-O-(CH_2)_{10}-$、$-CH_2-O-CH_2-$、$-CH_2-O(CH_2)_2-$、$-CH_2-O-(CH_2)_3-$、$-CH_2-O-(CH_2)_4-$、$-(CH_2)_2-O-CH_2-$、$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$、$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_3-$、$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_4-$、$-(CH_2)_3-O-CH_2-$、$-(CH_2)_3-O-(CH_2)_2-$、$-(CH_2)_3-O-(CH_2)_3-$、$-(CH_2)_4-O-CH_2-$、$-(CH_2)_4-O-(CH_2)_2-$、$-(CH_2)_5-O-CH_2-$、$-CH_2-O-$、$-(CH_2)_2-O-$、$-(CH_2)_3-O-$、$-(CH_2)_4-O-$、$-(CH_2)_5-O-$、$-(CH_2)_6-O-$、$-(CH_2)_7-O-$、

-$(CH_2)_8$-O-、-$(CH_2)_9$-O-、-$(CH_2)_{10}$-O-、-S-CH_2-、-S-$(CH_2)_2$-、-S-$(CH_2)_3$-、-S-$(CH_2)_4$-、-S-$(CH_2)_5$-、-S-$(CH_2)_6$-、-S-$(CH_2)_7$-、-S-$(CH_2)_8$-、-S-$(CH_2)_9$-、-S-$(CH_2)_{10}$-、-CH_2-S-CH_2-、-CH_2-S-$(CH_2)_2$-、-CH_2-S-$(CH_2)_3$-、-CH_2-S-$(CH_2)_4$-、-$(CH_2)_2$-S-CH_2-、-$(CH_2)_2$-S-(CH_2),-、-$(CH_2)_2$-S-$(CH_2)_3$-、-$(CH_2)_2$-S-$(CH_2)_4$-、-$(CH_2)_3$-S-CH_2-、-$(CH_2)_3$-S-$(CH_2)_2$-、-$(CH_2)_3$-S-$(CH_2)_3$-,-$(CH_2)_4$-S-CH_2-、-$(CH_2)_4$-S-$(CH_2)_2$-、-$(CH_2)_5$-S-CH_2-、-CH_2-S-、-$(CH_2)_2$-S-、-$(CH_2)_5$-S-、-$(CH_2)_4$-S-、-$(CH_2)_5$-S-、-$(CH_2)_6$-S-、-$(CH_2)_7$-S-、-$(CH_2)_8$-S-、-$(CH_2)_9$-S-、-$(CH_2)_{10}$-S-、宜爲碳鏈中或鏈端含氧原子之C1-6伸烷基、更宜爲-O-CH_2-、-O-$(CH_2)_2$-、-O-$(CH_2)_3$-、-CH_2-O-、-$(CH_2)_2$-O-或-$(CH_2)_3$-O、最宜爲-CH_2-O-或-$(CH_2)_2$-O-。

R5及取代基群b定義中「C3-10環烷基」、「有選自取代基群a之1～3個取代之C3-10環烷基」及「有選自取代基群a及b之1～3個取代之C3-10環烷基」之C3-10環烷基部分也可與苯環等與其他環基稠合、例如、環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、降莰基、金剛烷基或茚烷基、宜爲C5～C6環烷基、最宜爲環己基。

R5及取代基群b定義中「含1～3個硫原子、氧原子或/及氮原子之5～7員雜環基」、「有選自取代基群a之1～3個取代、且含1～3個硫原子、氧原子或/及氮原子之5～7員雜環基」及「有選自取代基群a及b之1～3個取代、且含1～3個硫原子、氧原子或/及氮原子之5～7員雜環基」中含1～3個硫原子、氧原子或/及氮原

子之5～7員雜環基部分爲例如、含1～3個硫原子、氧原子或/及氮原子之5～7員芳香族、或部分或完全還原型之飽和雜環基、例如、呋喃基、噻吩基、吡咯基、吖庚因基、吡唑基、咪唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、1,2,3-噁二唑基、三唑基、四唑基、噻二唑基、吡喃基、吡啶基、嗒咔基、嘧啶基、吡咔基、四氫吡喃基、嗎啉基、硫嗎啉基、吡咯啶基、吡咯啉基、咪唑啶基、吡唑啶基、哌啶基、哌咔基、噁唑啶基、異噁唑啶基、四氫吡喃基、嗎啉基、硫嗎啉基、吡咯啶基、吡咯啉基、咪唑啶基、吡唑啶基、哌啶基、哌咔基、噁唑啶基或異噁唑啶基、宜爲5～6員芳香族雜環基、更宜爲呋喃基、噻吩基或吡咯基、更宜爲呋喃基或噻吩基、更宜爲噻吩基。

上述「芳香族雜環基」也可與其他環基縮合、例如、苯并噻吩基、異苯并呋喃基、色烯基、吙基、啡噁咔基、吲咔基、異吲哚基、吲哚基、吲唑基、嘌呤基、喹咔基、異喹啉基、喹啉基、呔咔基、萘啶基、喹喏啉基、喹唑啉基、咔唑基、咔啉基、吖丁啶基或異吲哚啉基、宜爲苯并噻吩基。

取代基群a定義中「鹵素」爲氟、氯、溴、碘原子、宜爲氟原子或氯原子。

R^1、R^2、R^3、R^4及取代基群a定義中「低烷基」爲、例如、甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、戊基、異戊基、2-甲基丁基、新戊基、1-乙基丙基、己基、異己基、4-甲基戊基、3-甲基

戊基、2-甲基戊基、1-甲基戊基、3,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基等C1～6之直鏈或分歧鏈烷基、宜爲C1-4烷基、更宜爲C1-2烷基、最宜爲甲基。

取代基群a定義中「鹵低烷基」爲上述「低烷基」有鹵原子取代之基、例如、三氟甲基、三氯甲基、二氟甲基、二氯甲基、二溴甲基、氟甲基、2,2,2-三氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-溴乙基、2-氯乙基、2-氟乙基、2-碘乙基、3-氯丙基、4-氟丁基、6-碘己基、2,2-二溴乙基等鹵C1-6烷基、宜爲鹵C1-4烷基、更宜爲三氟甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基或2,2,2-三氯乙基、最宜爲三氟甲基。

取代基群a定義中「低烷氧基」爲上述「低級烷基」與氧原子結合之基、例如、甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基、戊氧基、異戊氧基、2-甲基丁氧基、1-乙基丙氧基、2-乙基丙氧基、新戊氧基、己氧基、4-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基等C1～6之直鏈或分歧鏈烷氧基、宜爲、C1～C4烷氧基、更宜爲C1～C烷氧基、最宜爲甲氧基。

取代基群a定義中「低烷硫基」爲上述「低烷基」與硫原子結合之基、例如、甲硫基、乙硫基、丙硫基、異

丙硫基、丁硫基、異丁硫基、第二丁硫基、第三丁硫基、戊硫基、異戊硫基、2-甲基丁硫基、新戊硫基、己硫基、4-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2、3-二甲基丁硫基等C1～6之直鏈或分歧鏈烷硫基、宜爲C1-4烷硫基、更宜爲C1-2烷硫基、最宜爲甲硫基。

取代基群a定義中「低烷氧羰基」爲上述「低烷氧基」與羰基結合之基、例如、甲氧羰基、乙氧羰基、丙氧羰基、異丙氧羰基、丁氧羰基、異丁氧羰基、第二丁氧羰基、第三丁氧羰基、戊氧羰基、異戊氧羰基、2-甲基丁氧羰基、新戊氧羰基、己氧羰基、4-甲基戊氧羰基、3-甲基戊氧羰基、2-甲基戊氧羰基、3,3-二甲基丁氧羰基、2,2-二甲基丁氧羰基、1,1-二甲基丁氧羰基、1,2-二甲基丁氧羰基、1,3-二甲基丁氧羰基、2,3-二甲基丁氧羰基等C1～6之直鏈或分歧鏈烷氧羰基、宜爲、C1～C4烷氧羰基、更宜爲C1～C烷氧羰基、最宜爲甲氧羰基。

取代基群a定義中「低脂族醯基」爲氫原子或飽和或不飽和鏈狀烴與羰基結合之基、例如、甲醯基、乙醯基、丙醯基、丁醯基、異丁醯基、戊醯基、異戊醯基、特戊醯基、己醯基、丙烯醯基、甲基丙烯醯基、丁烯醯基等C1～8直鏈或分歧鏈低脂族醯基、宜爲C1～C4低脂族醯基、更宜爲乙醯基或丙醯基、最宜爲乙醯基。

取代基群a定義中「單-低烷胺基」爲上述「低烷基」與1個胺基結合之基、例如、甲胺基、乙胺基、丙胺基、

異丙胺基、丁胺基、異丁胺基、第二丁胺基、第三丁胺基、戊胺基、異戊胺基、2-甲基丁胺基、新戊胺基、1-乙基丙胺基、己胺基、異己胺基、4-甲基戊胺基、3-甲基戊胺基、2-甲基戊胺基、1-甲基戊胺基、3,3-二甲基丁胺基、2,2-二甲基丁胺基、1,1-二甲基丁胺基、1,2-二甲基丁胺基、1,3-二甲基丁胺基、2,3-二甲基丁胺基、2-乙基丁胺基等單 C1～C6 烷胺基、宜爲單-C1～C4 烷胺基、更宜爲單-C1～C2 烷胺基、最宜爲甲胺基。

取代基群 a 定義中「二低烷胺基」爲上述「低烷基」與 2 個胺基結合之基、例如、二甲胺基、二乙胺基、N-乙基-N-甲胺基、二丙胺基、二丁胺基、二戊胺基、二己胺基等二-C1-6 烷胺基、宜爲二-C1～C4 烷胺基、更宜爲二-C1～C2 烷胺基、最宜爲二甲胺基。

取代基群 a 定義中「低級脂族醯胺基」爲上述「低級脂族醯基」與胺基結合之基、例如、甲醯胺基、乙醯胺基、丙醯胺基、丁醯胺基、異丁醯胺基、戊醯胺基、異戊醯胺基、特戊醯胺基、己醯胺基、丙烯醯胺基、甲基丙烯醯胺基、丁烯醯胺基等 C 1～7 直鏈或分岐鏈低脂族醯胺基、宜爲 C1-4 脂族醯胺基、更宜爲乙醯胺基或丙醯胺基、最宜乙醯胺基。

D 定義中「低烷磺醯基」爲上述「低烷基」與磺醯基結合之基、例如、甲磺醯基、乙磺醯基、丙磺醯基、異丙磺醯基、丁磺醯基、異丁磺醯基、第二丁磺醯基、第三丁磺醯基、戊磺醯基、異戊磺醯基、2-甲基丁磺醯基、新戊磺醯基、己磺醯基、4-甲基戊磺醯基、3-甲基戊磺

醯基、2-甲基戊磺醯基、3,3-二甲基丁磺醯基、2、2-二甲基丁磺醯基、1,1-二甲基丁磺醯基、1,2-二甲基丁磺醯基、1,3-二甲基丁磺醯基、2,3-二甲基丁磺醯基等C1～6直鏈或分岐鏈烷磺醯基、宜爲C1-4烷磺醯基、更宜爲C1-C烷磺醯基、最宜爲甲磺醯基。

D定義中「芳磺醯基」爲上述「芳基」與磺醯基結合之基、例如、苯磺醯基、對-甲苯磺醯基、間-二甲苯-4-磺醯基、鄰-二甲苯-4-磺醯基、對-二甲苯-4-磺醯基、萘磺醯基等C6～10個芳磺醯基、最宜爲苯磺醯基。

R^1及R^2定義中「胺基保護基」爲有機合成化學領域習用之胺基保護基、例如：

上述「低脂族醯基」：氯乙醯基、二氯乙醯基、三氯乙醯基、三氟乙醯基等鹵低脂族醯基、甲氧乙醯基等低烷氧基取代低脂族醯基之「脂族醯類」；

苄醯基、1－茚烷羰基、2－茚烷羰基、1-或2-萘甲醯基等芳族醯基4－氯苄醯基、4-氟苄醯基、2,4,6－三甲基苄醯基、4-甲苄醯基、4-甲氧苄醯基、4-硝苄醯基、2－硝苄醯基、2-(甲氧羰基)苄醯基、4－苯基苄醯基等有選自上述取代基群a之1～3個取代之芳香族醯基等「芳族醯類」；

上述「低烷氧羰基」、2,2,2-三氯乙氧羰基、2-三甲基矽烷基乙氧羰基等鹵素或三低烷基矽烷基取代之低烷氧羰基等「烷氧羰基類」；

乙烯氧羰基、烯丙氧羰基等「烯氧羰基類」；

苄氧羰基等芳烷氧羰基、4－甲氧苄氧羰基、3，4

－二甲氧苄氧羰基、2－硝苄氧羰基、4－硝苄氧羰基等有選自上述取代基群a之1～3個取代之芳烷氧羰基類等「芳烷氧羰基類」；

三甲基矽烷基、三乙基矽烷基、異丙基二甲基矽烷基、第三丁基二甲基矽烷基、甲基二異丙基矽烷基、甲基二第三丁基矽烷基、三異丙基矽烷基等三低烷基矽烷基、二苯基甲基矽烷基、二苯基丁基矽烷基、二苯基異丙基矽烷基、苯基二異丙基矽烷基等被芳基或芳基及低烷基來三取代矽烷基等「矽烷基類」；

苄基、苯乙基、3－苯丙基、α－萘甲基、β－萘甲基、二苯甲基、三苯甲基、α－萘基二苯甲基、9－蒽甲基等1～3個芳基取代之低烷基、4－甲苄基、2，4，6－三甲苄基、3，4，5－三甲苄基、4－甲氧苄基、4－甲氧苯基二苯甲基、2－硝苄基、4－硝苄基、4－氯苄基、4－溴苄基、4－氰苄基、4－氰苄基二苯甲基、雙（2－硝苯基）甲基、向日葵基等低烷基、低烷氧基、硝基、鹵或氰基將芳環取代1～3個之芳基取代之低烷基等之「芳烷基類」；及

N,N-二甲胺亞甲基亞苄基、4－甲氧基亞苄基、4－硝基亞苄基、亞柳基、5－氯亞柳基、二苯基亞甲基、（5－氯－2－羥苯基）苯基亞甲基等「形成許夫鹼之取代亞甲基」宜爲低脂族醯基、低烷氧羰基、芳烷氧羰基類或有選自取代基群a之1～3個取代之芳烷氧羰基類。

上述「胺基保護基」特宜爲乙醯基或第三丁氧羰基。

R3定義中「羥基保護基」可用如氫解、水解、電解、光分解等化學的方法裂解之「反應中一般保護基」及「活體內水解等生物學方法裂解之保護基」。

此等「反應中一般的保護基」可爲如：

上述「脂族醯類」；

上述「芳族醯類」；

四氫吡喃－2－基、3－溴四氫吡喃－2－基、4－甲氧四氫吡喃－4－基、四氫硫吡喃－2－基、4－甲氧四氫硫吡喃－4－基等「四氫吡喃基或四氫硫吡喃基類」；

四氫呋喃－2－基、四氫硫呋喃－2－基等「四氫呋喃基或四氫呋喃基或四氫硫呋喃基類」；

上述「醯基類」；

甲氧甲基、1,1-二甲基-1-甲氧甲基、乙氧甲基、丙氧甲基、異丙氧甲基、丁氧甲基、第三丁氧甲基等低烷氧甲基、2-甲氧乙氧甲基等低烷氧化低烷氧甲基、2,2,2-三氯乙氧甲基、雙(2-氯乙氧基)甲基等鹵低烷氧甲基等「烷氧甲基」；

1-乙氧乙基、1-(異丙氧基)乙基等低烷氧化乙基、2,2,2-三氯乙基等鹵化乙基等「已取代乙基類」；

上述「芳烷基類」；

上述「烷氧羰基類」；

上述「烯氧羰基類」；

上述「芳烷氧羰基類」。

「活體內可由水解等生物學方法裂解之保護基」可爲

如乙羰氧甲基、特戊醯基氧甲基、二甲胺基乙醯氧甲基、1－乙醯氧乙基等醯氧烷基類；

1-(甲氧羰氧基)乙基、1-(乙氧羰氧基)乙基、乙氧羰氧甲基、1-(異丙氧羰氧基)乙基、1-(第三丁氧羰氧基)乙基、1-(乙氧羰氧基)丙基、1-(環己氧羰氧基)乙基等1-(烷氧羰氧基)烷基類；

酞基；

4-甲基-氧二噁茂甲基、4－苯基－氧二噁茂甲基、氧二噁茂甲基等氧二噁茂甲基等之「羰氧烷基類」；

上述「脂族醯類」；

上述「芳族醯類」；

「丁二酸之半酯鹽殘基」；

「磷酸酯鹽殘基」；

「胺酸等酯形成殘基」；

胺甲醯基；

亞苄基等亞芳烷基；甲氧亞乙基、乙氧亞乙基等烷氧亞乙基；氧亞甲基；硫亞甲基等「2個羥基之保護基」；

及特戊醯氧甲氧羰基等「羰氧烷氧羰基」，是否爲這種衍生物，先在鼠及小白鼠等實驗動物靜脈注射後，調查動物體液、能否能檢測出原化合物或其藥理容許鹽。此等羥基之保護基宜爲低脂族醯基、芳香族醯基、有選自取代基群a之1～3個取代之芳香族醯基或矽烷基。

上述「羥基保護基」特宜爲乙醯基或第三丁二甲基矽烷基。

R^{10}及R^{11}定義中「磷酸基之保護基」爲如、

甲基、乙基、異丙基、丁基等低烷基、

2-氰乙基、2-氰基-1,1-二甲基乙基等被氰基取代之低烷基、

2-(甲基二苯矽烷基)乙基、2-三甲基矽烷乙基等低烷基或低烷基及芳基來三取代矽烷基之低烷基、

2-(2'-吡啶基)乙基、2-(4'-吡啶基)乙基等取代以雜環基之低烷基、

2-苯硫乙基、2-(4-硝苯硫基)乙基、2-(4-三苯甲苯硫基)乙基等被芳硫基取代之低烷基

2-(第三丁磺醯基)乙基、2-(苯磺醯基)乙基、2-(苄磺醯基)乙基等被烷磺醯基、芳磺醯基或芳烷磺醯基取代之低烷基、

2,2,2-三氯乙基、2,2,2-三氯乙基-1,1-二甲乙基、2,2,2-三溴乙基、2,3-二溴丙基、2,2,2-三氟乙基等鹵低烷基；

苄基、苯乙基、3－苯丙基、α－萘甲基、β－萘甲基、二苯甲基、三苯甲基、α－萘基二苯甲基、9－蒽甲基等１～３個芳基取代之低烷基、o－硝苄基、４－硝苄基、2,4-二硝苄基、4-氯苄基、4-氯-2-硝苄基、4-醯氧苄基等有硝基、鹵素或低脂族醯基取代芳環之芳基取代之低烷基、有2-硝苯乙基等取代基之芳基取代之低烷基、9-茀甲基等有茀基取代之低烷基等芳烷基類；

烯丙基、丙烯基等低烯基；

4-氰基-2-丁烯基等取代以氰基之低烯基；

苯基等芳基：

2-甲苯基、2,6-二甲苯基、2-氯苯基、4-氯苯基、2,4-二氯苯基、2,5-二氯苯基、2,6-二氯苯基、2-溴苯基、4硝苯基、3,5-二硝苯基、4-氯-2硝苯基、2-甲氧基-5-硝苯基等低烷基、芳基之三取代低烷基、低烷氧基、取代以硝基或鹵素之芳基；及

苯胺酸酯、4-三苯甲基苯胺酸酯、[N-(2-三苯甲氧基)乙基]苯胺酸酯、對-(N,N-二甲胺基)苯胺酸酯、3-(N,N-二乙胺甲基)苯胺酸酯等醯胺類。

「磷酸基之保護基」宜爲低烷基、低烯基或取代以1～3個苯基或萘基之甲基、更宜爲、甲基、乙基、芳基或苄基、最宜爲甲基或乙基。

上述R^5定義中「有選自取代基群a及b之1～3個取代之C3-10環烷基」之具體例、例如、2-氟環丙基、2-氯環丙基、2-或3-氟環戊基、2-或3-氯環戊基、2-, 3-或4-氟環己基、2-, 3-或4-氯環己基、2-, 3-或4-溴環己基、2-, 3-或4-碘環己基、2-甲基環丙基、2-乙基環丙基、2-或3-甲基環戊基、2-或3-乙基環戊基、2-, 3-或4-甲基環己基、2-, 3-或4-乙基環己基、2-三氟甲基環丙基、2-或3-三氟甲基環丁基、2-或3-三氟甲基環戊基、2-, 3-或4-三氟甲基環己基、2-甲氧基環丙基、2-或3-甲氧基環丁基、2-或3-甲氧基環戊基、2-, 3-或4-甲氧基環己基、2-, 3-或4-乙氧基環己基、2-, 3-或4-丙氧基環己基、2-, 3-或4-異丙氧基環己基、2-, 3-或4-(1-乙基丙氧基)環己基、2-, 3-或4-(2-乙基丙氧基)環己基、2-羧環丙基、2-或3-羧環戊基、2-, 3-或4-羧環己基、2-甲氧羰環

丙基、2-或3-甲氧羰環戊基、2-, 3-或4-甲氧羰環己基、2-羥環丙基、2-或3-羥環戊基、2-, 3-或4-羥環己基、2-甲醯環丙基、2-或3-甲醯環戊基、2-, 3-或4-甲醯環己基、2-乙醯環丙基、2-或3-乙醯環戊基、2-, 3-或4-乙醯環己基、2-胺環丙基、2-或3-胺環戊基、2-, 3-或4-胺環己基、2-甲胺環丙基、2-或3-甲胺環丁基、2-或3-甲胺環戊基、2-, 3-或4-甲胺環己基、2-二甲胺環丙基、2-或3-二甲胺環丁基、2-或3-二甲胺環戊基、2-, 3-或4-二甲胺環己基、2-氰環丙基、2-或3-氰環戊基、2-, 3-或4-氰環己基、2-或3-環己基環戊基、2-, 3-或4-環己基環己基、2-苯環丙基、2-或3苯環戊基、2-, 3-或4-苯環己基、3,4-二氟環己基、3,4-二氯環己基、2,3-二甲氧環己基、3、4-二甲氧環己基、3,5-二甲氧環己基、3,4,5-三甲氧環己基、宜爲有1～3個取代之C3-10環烷基(該取代基爲選自鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基、低烷硫基及低脂族醯基。)、更宜爲有1～3個取代之C3-10環烷基(該取代基爲選自鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基及低脂族醯基)、更宜爲有1～3個取代之C3-10環己基(該取代基爲選自鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基及低脂族醯基)、最宜爲有1個取代基之環己基(該取代基爲氟原子、氯原子、甲基、三氟甲基、甲氧基及乙醯基)。

R^5定義中「有選自取代基群a及b之1～3個取代之C6－C10芳基」具體例爲如、2-, 3-或4-氟苯基、2-, 3-或4-氯苯基、2-, 3-或4-溴苯基、2-, 3-或4-碘苯基、2-,

3-或4-甲苯基、2-,3-或4-乙苯基、2-,3-或4-丙苯基、2-,3-或4-丁苯基、2-,3-或4-戊苯基、2-,3-或4-三氟甲苯基、2-,3-或4-甲氧苯基、2-,3-或4-乙氧苯基、2-,3-或4-丙氧苯基、2-,3-或4-異丙氧苯基、2-,3-或4-丁氧苯基、2-,3-或4-(1-乙基丙氧基)苯基、2-,3-或4-(2-乙基丙氧基)苯基、2-,3-或4-甲硫苯基、2-,3-或4-乙硫苯基、2-,3-或4-羧苯基、2-,3-或4-甲氧羰苯基、2-,3-或4-乙氧羰苯基、2-,3-或4-羥苯基、2-,3-或4-甲醯苯基、2-,3-或4-乙醯苯基、2-,3-或4-胺苯基、2-,3-或4-甲胺苯基、2-,3-或4-二甲胺苯基、2-,3-或4-氰苯基、2-,3-或4-環戊苯基、2-,3-或4-環己基苯基、2-,3-或4-ピ苯基、2,4-二氟苯基、3,4-二氟苯基、3,5-二氟苯基、2,4-二氯苯基、3,4-二氯苯基、3,5-二氯苯基、3,4-二溴苯基、2,3-二甲苯基、3,4-二甲苯基、3,5-二甲苯基、2,3-二甲氧苯基、3、4-二甲氧苯基、3,5-二甲氧苯基、3,4,5-三甲氧苯基、3-氟-4-甲氧苯基、4-甲基-2-甲氧苯基、6-氟-4-甲基-2-甲氧苯基、5-氟茚-3-基、5-氟茚-3-基、5-甲茚-3-基、5-甲氧茚-3-基、5-氟茚-2-基、5-氯茚-2-基、5-甲茚-2-基、5-甲氧茚-2-基、5-羥茚-3-基、5-硝茚-3-基、5-環己基茚-3-基、5-苯茚-3-基、5-苯氧茚-3-基、5-苄氧茚-3-基、5-苯硫茚-3-基、5-羥茚-2-基、5-硝茚-2-基、5-環己基茚-2-基、5-苯茚-2-基、5-氟萘-2-基、5-氟萘-2-基、5-甲萘-2-基、5-甲氧萘-2-基、5-氟萘-1-基、5-氟萘-1-基、5-甲萘-1-基、5-甲氧萘-1-基、5-羥萘-2-基、5-硝萘-2-基、5-環己基萘-2-基、5-苯萘-2-

基、5-苯氧萘-2-基、5-苄氧萘-2-基、5-苯硫萘-2-基、5-羥萘-1-基、5-硝萘-1-基、5-環己基萘-1-基、5-苯萘-1-基、宜爲1～3個取代之C6-10芳基(該取代基爲鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基、低烷硫基及低脂族醯基)、更宜爲1～3個取代之C6-C10芳基(該取代基爲鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基及低脂族醯基)、更宜爲1～3個取代之苯基(該取代基爲鹵原子、低烷基、鹵低烷基、低烷氧基及低脂族醯基)、更宜爲1～2個取代之苯基(該取代基爲氟原子、氯原子、甲基、三氟甲基、甲氧基及乙醯基。但甲氧基中宜爲1～3個取代之苯基)、最宜爲3-氟苯基、4-氟苯基、3、4-二氟苯基、3.5-二氟苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3,4-二氯苯基、3,5-二氯苯基、3-甲苯基、4-甲苯基、3,4-二甲苯基、3,5-二甲苯基、3-三氟甲苯基、4-三氟甲苯基、3,4-二(三氟甲苯基)、3,5-二(三氟甲苯基)、3-甲氧苯基、4-甲氧苯基、3,4-二甲氧苯基、3,5-二甲氧苯基、3,4,5-三甲氧苯基、3-乙醯苯基或4-乙醯苯基。

R^5定義中「有選自取代基群a及b之1～3個取代、且含1～3個硫原子、氧原子及/或氮原子之5～7員雜環基」具體例爲、例如、3-, 4-或5-甲呋喃-2-基、2-, 4-或5-甲呋喃-3-基、3-, 4-或5-氟噻吩-2-基、2-, 4-或5-氟呋喃-3-基、3-, 4-或5-溴噻吩-2-基、2-, 4-或5-溴呋喃-3-基、3-, 4-或5-甲噻吩-2-基、2-, 4-或5-甲噻吩-3-基、3, 4-或5-乙噻吩-2-基、2-, 4-或5-乙噻吩-3-基、3-, 4-或5-甲氧噻吩-2-基、2-, 4-或5-甲氧噻吩-3-基、3-或

4-甲噻唑-5-基、3-,4-或5-氟苯并噻吩-2-基、3-,4-或5-溴苯并噻吩-2-基、3-,4-或5-甲苯并噻吩-2-基、3-,4-或5-甲氧苯并噻吩-2-基、2-,4-或5-氟苯并噻吩-3-基、2-,4-或5-溴苯并噻吩-3-基、2-,4-或5-甲苯并噻吩-3-基、2-,4-或5-甲氧苯并噻吩-3-基、4-,5-,6-或7-甲苯并噻吩-2-基、3-,4-或5-羥呋喃--2-基、2-,4-或5-羥呋喃-3-基、3-,4-或5-羥噻吩-2-基、3-,4-或5-硝噻吩-2-基、3-,4-或5-苯噻吩-2-基、2-,4-或5-羥噻吩-3-基、2-,4-或5-氰噻吩-3-基、1-,2-或3-羥吡啶-4-基、1-,2-或3-氰吡啶-4-基、1-,2-或3-苯吡啶-4-基、宜爲3-,4-或5-氟噻吩-2-基或2-,4-或5-氟呋喃-3-基。

「其藥理容許鹽」乃指本發明一般式(I)、(II)或(III)化合物有胺基等鹼性基時與酸反應,若有羧基或磷酸基等酸性基時與鹼反應來作成之鹽。

鹼性基之鹽宜爲如氫氟酸鹽、鹽酸鹽、氫溴鹽、氫碘酸鹽等氫鹵酸鹽、硝酸鹽、過氯酸鹽、硫酸鹽、磷酸鹽等無機酸鹽;甲磺酸鹽、三氟甲磺酸鹽、乙磺酸鹽等低烷磺酸鹽、苯磺酸鹽、對甲苯甲酸鹽等芳磺酸鹽、乙酸鹽、蘋果酸鹽、富馬酸鹽、丁二酸鹽、檸檬酸鹽、抗壞血酸鹽、酒石酸鹽、草酸鹽、順丁烯二酸鹽等有機酸鹽;或甘胺酸鹽、精胺酸鹽、離胺酸鹽、鳥胺酸鹽、麩胺酸鹽、天冬胺酸鹽、麩胺酸鹽等胺基酸鹽、宜爲有機酸鹽(特爲富馬酸鹽、草酸鹽或順丁烯二酸鹽)或氫鹵酸鹽(特爲鹽酸鹽)。

酸性基之鹽可如、鈉鹽、鉀鹽、鋰鹽等鹼金屬鹽、鈣

鹽、鎂鹽等鹼土金屬鹽、鋁鹽、鐵鹽等金屬鹽；銨鹽等無機鹽、第三辛胺鹽、二苄胺鹽、嗎啉鹽、葡萄糖胺鹽、苯甘胺酸烷酯鹽、乙二胺鹽、N-甲基葡萄胺鹽、胍鹽、二乙胺鹽、三乙胺鹽、二環己胺鹽、N,N'-二苄基乙二胺鹽、氯普羅卡因鹽、普羅卡因鹽、二乙醇胺鹽、N-苄基苯乙胺鹽、哌啡鹽、四甲銨鹽、參（羥甲基）胺基甲烷鹽等有機鹽等胺鹽；或甘胺酸鹽、精胺酸鹽、離胺酸鹽、鳥胺酸鹽、麩胺酸鹽、天冬胺酸鹽、麩胺酸鹽等胺基酸鹽、宜爲鹼金屬鹽(特爲、鈉鹽)。

本發明一般式(I)、(II)或(III)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯在大氣中放置或再結晶,則有吸收水分、吸附水、成水合物之情形,此等水合物也包括在本發明之鹽。

本發明一般式(I)、(II)或(III)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯在其分子內有不對稱碳原子,故有光學異構物存在。本發明化合物之光學異構物及光學異構物之混合物均以單一式、即一般式(I)、(II)或(III)表示。故本發明也包括光學異構物及光學異構物之任意比例之混合物。

本發明一般式(I)、(II)或(III)化合物、$-NR^1R^2$基在不對稱碳原子取代，但宜具有R之絕對組態之化合物。

上述「酯」因本發明化合物(I)、(II)或(III)可作成酯，故指其酯、此等酯可爲「羥基之酯」及「羧基之酯」、各酯殘基爲「反應中一般保護基」或「活體內可由水解等生物學方法裂解之保護基」之酯。

「反應中一般保護基」乃指可由氫解、水解、電解、光分解等化學方法裂解之保護基。

「羥基之酯」之「反應中一般保護基」及「活體內可由水解等生物學方法裂解之保護基」同前述「羥基之保護基」。

「羧基之酯」中「反應之一般保護基」、宜爲上述「低烷基」；乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基；2-乙基-2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、1-甲基-1-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基等低烯基；乙炔基、2-丙炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-2-丙炔基、2-乙基-2-丙炔基、2-丁炔基、1-甲基-2-丁炔基、2-甲基-2-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-戊炔基、1-甲基-2-戊炔基、2-甲基-2-戊炔基、3-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基等低炔基；上述「鹵低烷」；2-羥乙基、2,3-二羥丙基、3-羥丙基、3,4-二羥丁基、4-羥丁基等羥「低烷基」；乙醯甲基等「低脂族醯基」-「低烷基」；

上述「芳烷基」；或上述「矽烷基」。

「羧基之酯」之「活體內可由水解等生物學方法裂解之保護基」可宜爲甲氧乙基、1-乙氧乙基、1-甲基-1-甲氧乙基、1-(異丙氧基)乙基、2-甲氧乙基、2-乙氧乙基、1、1-二甲基-1-甲氧乙基、乙氧甲基、正丙氧甲基、異丙氧甲基、正丁氧甲基、第三丁氧甲基等低烷氧低烷基、2-甲氧乙氧甲基等低烷氧低烷氧低烷基、苯氧甲基等「芳基」氧「低烷基」、2,2,2-三氯乙氧甲基、雙(2-氯乙氧基)甲基等鹵低烷氧低烷基等「烷氧烷基」；甲氧羰甲基等「「低級烷氧基」羰基「低烷基」」；氰甲基、2-氰乙基等「氰「低烷基」」；甲硫甲基、乙硫甲基等「「低烷基」硫甲基」；苯硫甲基、萘硫甲基等「「芳基」硫甲基」；2-甲磺醯乙基、2-三氟甲磺醯乙基等「可有鹵素取代之「低烷基」磺醯基「低烷基」」；2-苯磺醯乙基、2－甲苯磺醯乙基等「「芳基」磺醯基「低烷基」」；前述「1-(醯氧基)「低烷基」」；前述「酞基」；前述「芳基」；前述「低烷基」；羧甲基等「羧烷基」；或苯基丙胺酸基等「胺基酸之醯胺形成殘基」。

上述「羧基之酯」之「反應中一般保護基」及「活體內可由水解等生物學方法裂解之保護基」宜爲低烷基或芳烷基。

含本發明醫藥組成物爲有效成份之「免疫抑制劑」爲可防止或阻礙免疫反應進行之藥劑、免疫抑制作用之化合物依反應機制可分爲如下：

(1)對T細胞中細胞素表現有關之細胞內訊號傳達有

阻礙作用之藥劑、因細胞內訊號傳達有阻礙、而阻礙細胞素產生及阻礙免疫細胞作用。此等T細胞中細胞素表現有關之細胞內訊號傳達有阻礙作用之藥劑爲如：

US4117118號公報中S7481/F-1等所記載化合物或其藥理容許鹽[宜爲環孢素A(cyclosporinA)、其化學名爲環[3-羥基-4-甲基-2-(甲胺基)-6-辛醯基]-2-胺丁醯基-甲甘胺醯基-甲基-白胺醯-纈胺醯-甲基-白胺醯-丙胺醯-丙胺醯-甲基-白胺醯-甲基-白胺醯-甲基-纈胺醯]、

EP184,162號公報中記載一般式(I)化合物或其藥理容許鹽[宜爲大環內酯(tacrolimus)、其化學名爲17-烯丙基-1,14-二羥基-12-[2-(4-羥基-3-甲氧環己基)-1-甲基乙烯基]-23,25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,28-二噁-4-吖三環[22.3.1.$0^{4,9}$]二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮]、

US3,929,992號公報中記載雷帕黴素(Rapamycin)之化合物{其化學名爲
9,10,12,13,14,21,22,23,24,25,26,27,32,33,34,34a-十六氫-9,27-二羥基-3-[2-(4-羥基-3-甲氧環己基)-1-甲基乙基]-10,21-二甲氧基-6,8,12,14,20,26-六甲基-23,27-環氧基-3H-吡啶并[2,1-c][1,4]噁吖環三十五碳炔-1,5,11,28,29(4H,6H,31H)-五酮}、

EP94,632號公報(特開昭58-62152號公報)中記載一般式(II)化合物或其藥理容許鹽[宜爲加士帕力母士(gusperimus)、其化學名爲N-[4-(3-胺丙基)胺丁基]胺甲醯羥甲基-7-胍庚醯胺、本發明之加士帕力母士(gusperimus)爲含其藥理容許鹽(鹽酸鹽)]、

US5,912,253號公報中記載式(I)化合物或其藥理容許鹽{宜爲艾布羅力母士(everolimus)、其化學名爲9,10,12,13,14,21,22,23,24,25,26,27,32,33, 34,34a-十六氫-9,27-二羥基-3-[2-[4-羥乙氧基-3-甲氧環己基]-1-甲基乙基]-10,21-二甲氧基-6,8,12,14,20,26-六甲基-23,27-環氧基-3H-吡啶并[2,1-c][1,4] 吖環三十五碳炔-1,5,11,28,29(4H,6H,31H)-五酮}、

EP600,762號公報中記載式(I)化合物或其藥理容許鹽{宜爲得列士帕力母士(tresperimus)、其化學名爲2-[4-(3-胺丙胺基)丁基]胺羰氧基-N-[6-(胺亞胺甲胺己基)乙醯胺、本發明之得列士帕力母士(tresperimus)爲含其藥理容許鹽。]、

Int. J. Immunopharmacol., vol.21(5), 349-358(1999)中LF15-0195記載之化合物{安尼士帕力母士(anisperimus)、其化學名爲(6-胍己基)胺甲醯基}甲基[4-(3-胺丁基)胺丁基]羧醯胺。}、

EP626,385號公報(特許3076724號公報或米国特許第5,493,019號公報)中記載一般式(I)化合物或其藥理容許鹽{宜爲SDZ-281-240、其化學名爲17-乙基-1,14-二羥基-12-[2-(4-羥基-3-甲氧環己基)-1-甲基乙烯基]-23,25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,28-二噁-4-吖三環[22.3.1.$0^{4,9}$]二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮、本發明SDZ-281-240爲含其藥理容許鹽}、

WO93/04680號公報(EP642,516號公報)中記載一般式(VII)化合物或其藥理容許鹽{宜爲ABT-281、其化學名

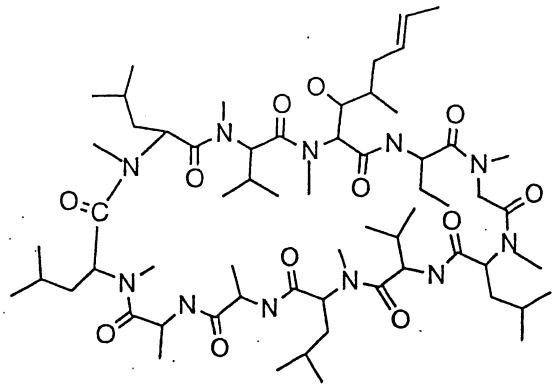
爲 17-乙基-1,14-二羥基-12-[2-(4-四唑基-3-甲氧環己基)-1-甲基乙烯基]-23,25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,28-二噁-4-吖三環[22.3.1.$0^{4,9}$]二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮}、

EP414,632號公報中記載一般式(A)化合物或其藥理容許鹽{宜爲奇苦得力母士、其化學名爲環[[3-羥基-4-甲基-2-(甲胺基)-6-辛醯基]-L-2-胺丁基-N-甲甘胺醯莖-N-甲基-L-白胺醯-L-纈胺醯-N-甲基-L-白胺醯-L-丙胺醯基-[3-O-(2-羥乙基)-D-絲胺醯基]-N-甲基-L-白胺醯-N-甲基-L-白胺醯-N-甲基-L-纈胺醯]}、

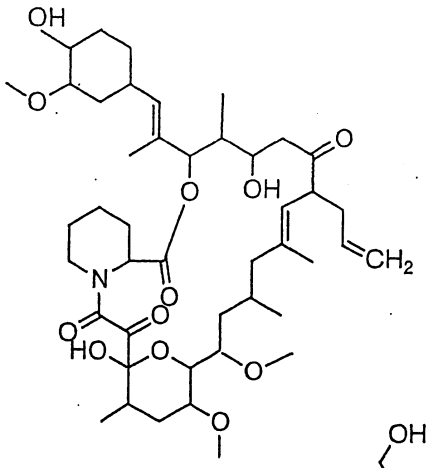
WO 97/11080號公報中記載一般式(I)化合物或其藥理容許鹽{宜爲 A-119435、其化學名爲 17-乙基-1,14-二羥基-12-[2-[4-(乙醯胺乙醯硫基)-3-甲氧環己基]-1-甲基乙烯基]-23,25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,28-二噁-4-吖三環[22.3.1.$0^{4,9}$]二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮}、或

Bioorg. Med. Chem. Lett, 01.9(2)、227-232(1999)中記載 17-乙基-1,14-二羥基-12-[2-[4-(2-苯肼羰氧基)-3-甲氧環己基]-1-甲基乙烯基]-23,25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,28-二噁-4-吖三環[22.3.1.$0^{4,9}$]二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮。

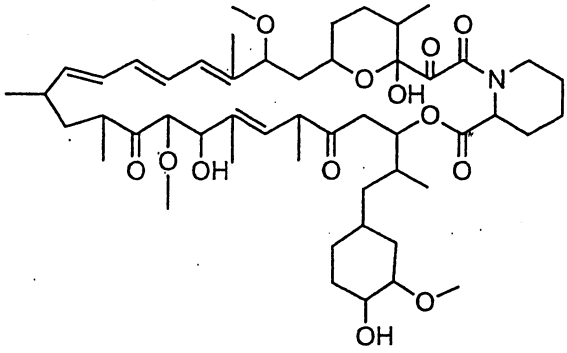
代表的化合物之結構如下。



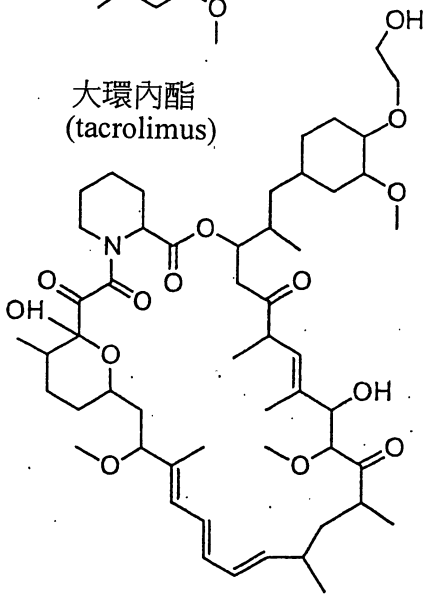
環孢素 A
(cyclosporin A)



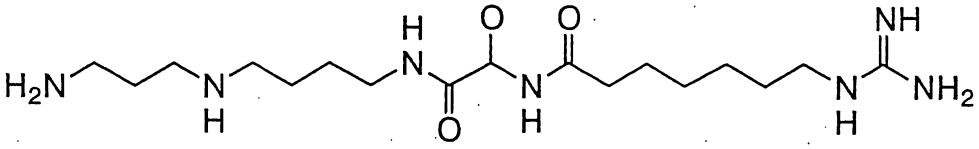
大環內酯
(tacrolimus)



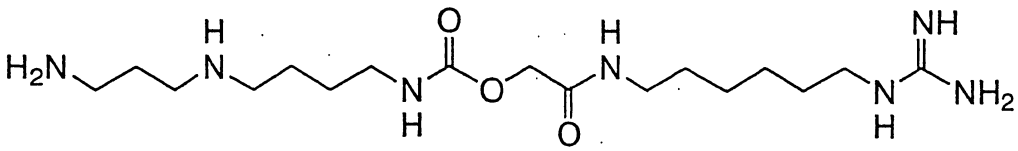
雷帕黴素
(Rapamycin)



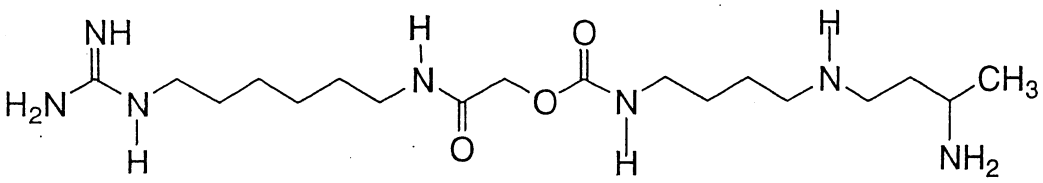
艾布羅力母士
(everolimus)



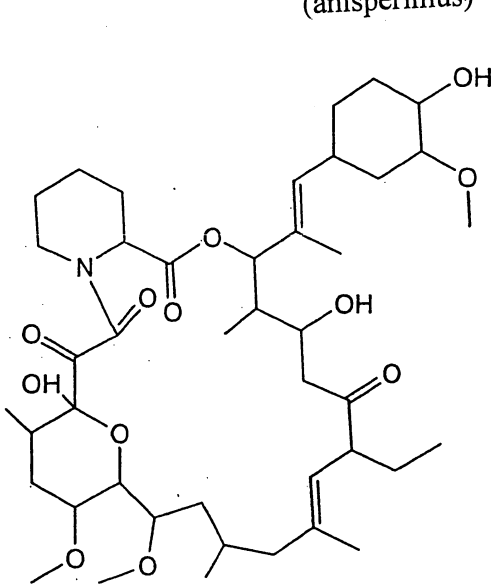
加士帕力母士
(gusperimus)



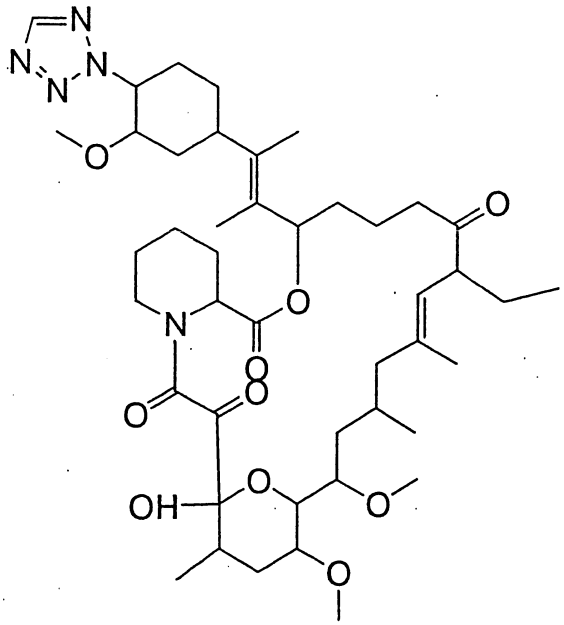
得列帕力母士
(tresperimus)



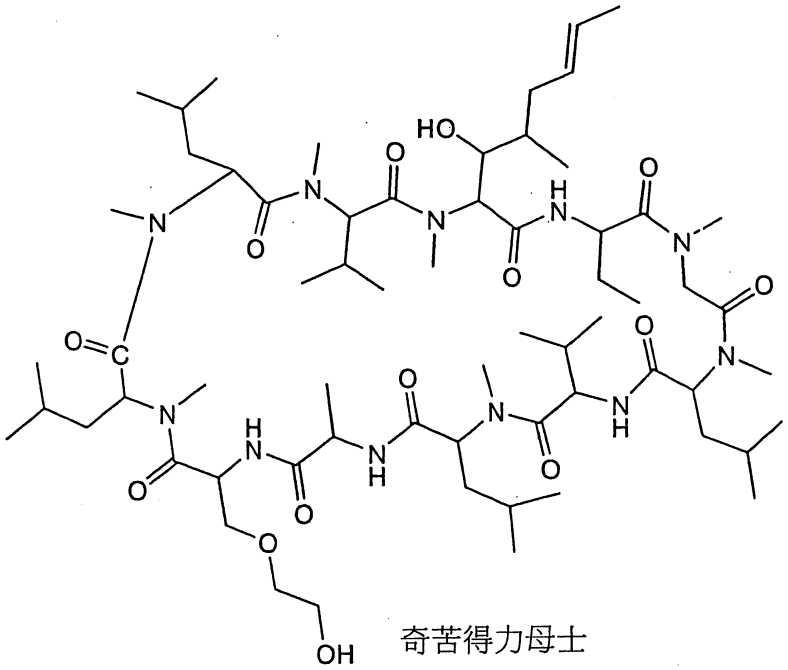
安尼士帕力母士
(anisperimus)



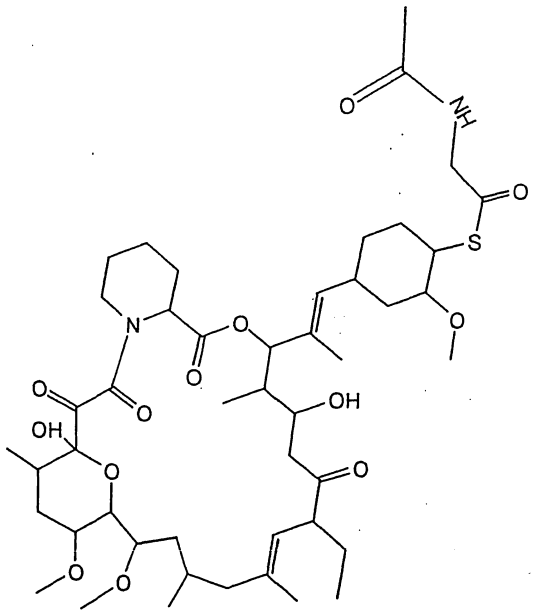
SDZ－281-240



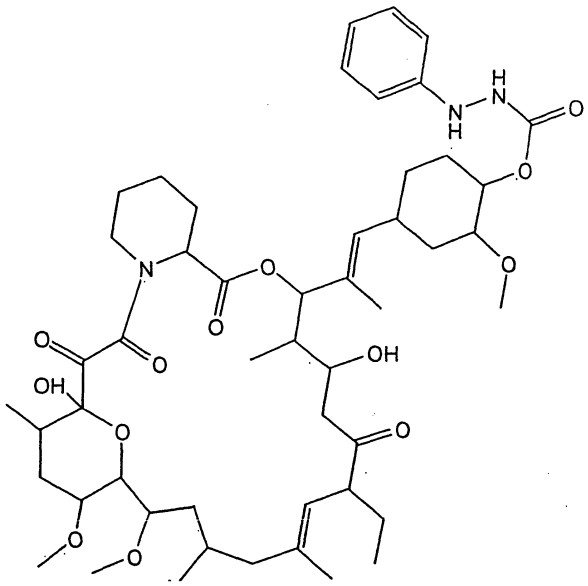
ABT-281



奇苦得力母士



A－119435



17-乙基-1,14-二羥基-12-〔2-〔4-(2-苯肼羰氧基-3-甲氧環己基)-1-甲基乙烯基〕-23,25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,23-二噁-4-吖三環〔22.3.1.$0^{4,9}$〕二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮

(2)對免疫細胞中核苷合成有阻礙作用之藥劑、因阻礙免疫細胞中核苷合成而可抑制淋巴球之增殖、而有非專一性免疫抑制作用。此等對免疫細胞中核苷合成有阻礙作用之藥劑可例如：

具有US3,888,843號公報請求項1中記載化學構造式之化合物咪唑力平 (mizoribine)、其化學名爲5-羥基-1-β-D-呋喃核糖-1H-咪唑基-4-羧醯胺)、

具有US3,056,785號公報請求項7中記載一般式化合物或其藥理容許鹽[宜爲吖硫嘌呤(azathioprine)、其化學名爲6-[(1-甲基-4-硝基-1H-咪唑-5-基)硫基]-1H-嘌呤、本發明之吖硫嘌呤(azathioprine)中含其藥理容許鹽(鹽酸鹽)]、

具有EP281,713號公報(US4,753,935號公報)中記載

之一般式(A)化合物或其藥理容許鹽[宜爲菌酚酸、其化學名爲6-(1,3-二氫-4-羥基-6-甲氧基-7-甲基-3-氧-5-異苯并呋喃基)-4-甲基-(4E)-己酸2-(4-嗎啉基)乙酯]、

具有EP13376號公報(特開昭62-72614號公報或US4,284,786號公報)中記載之式(I)化合物或其藥理容許鹽[宜爲列氟諾邁德、其化學名爲5-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]-4-異噁唑羧醯胺]、

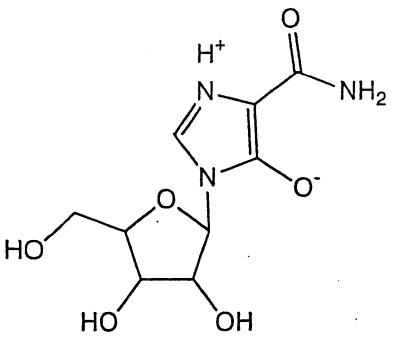
WO97/40028號公報中記載一般式(I)化合物或其藥理容許鹽{宜爲美力面伯地布(merimempodib)、其化學名爲[[3-[[[[3-甲氧基-4-(5-噁唑基)苯基]胺基]羰基]胺基]苯基]甲基]胺甲酸(3s)-四氫-3-呋喃酯}、

FR2,727,628號公報中記載一般式(I)化合物或其藥理容許鹽[宜爲HMR-1279、其化學名爲α-氰基-N-(4-氰苯基)-β-氧-環丙烷丙醯胺]、

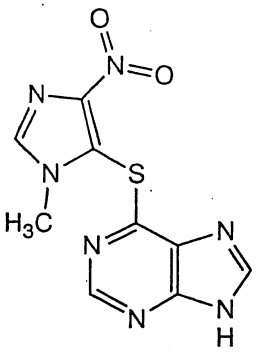
WO93/22286號公報(日本特許2928385號公報、EP601191號公報或US5,371,225號公報)中記載一般式(I)化合物或其藥理容許鹽{宜爲TSK-204、其化學名爲6,7-二氫-10-氟-3-(2-氟苯基)-5H-苯并[6,7]環庚[1,2-b]喹啉-8-羧酸}、或

EP569,912號(公報特開平6-32784號公報)中記載一般式(I)化合物或其藥理容許鹽{宜爲SP-100030、其化學名爲2-氯-N-[3,5-二(三氟甲基)苯基]-4-(三氟甲基)嘧啶-5-羧醯胺}等。

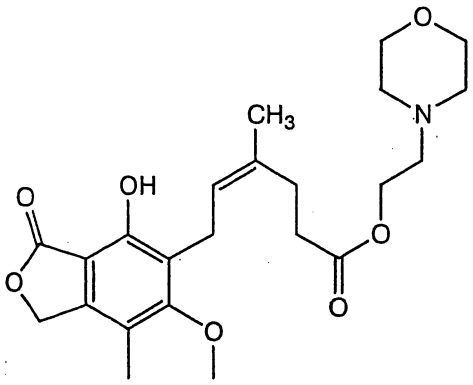
又、代表化合物之結構如下:



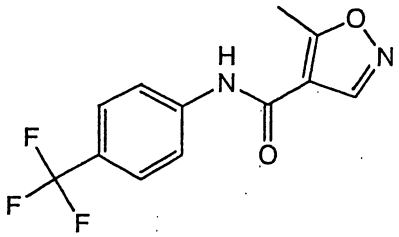
咪唑力平
(mizoribine)



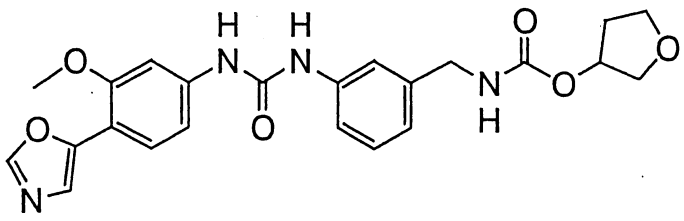
吖硫嘌呤
(azathioprine)



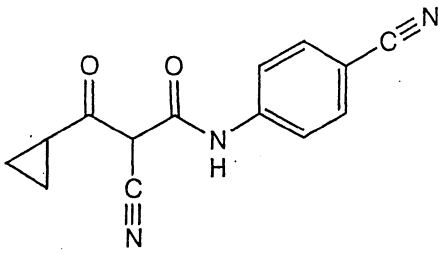
菌酚酸
(mycophenolic acid)



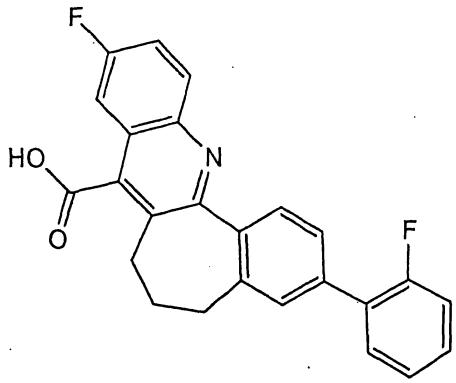
列氟諾邁德



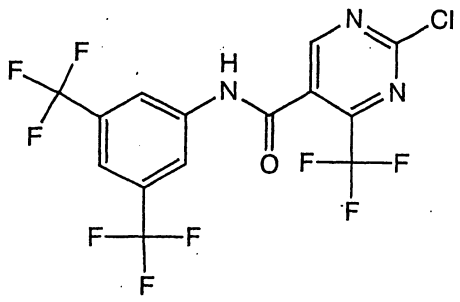
美力面伯地布
(merimempodib)



HMR－1279



TSK－204



SP－100030

(3)對免疫細胞阻礙細胞素之作用而具抗風溼作用之藥劑，除具有抑制細胞素產生之外，兼具抑制淋巴球增殖及免疫球蛋白產生抑制作用、該藥劑中也包括對T細胞增殖有抑制作用、抑制NK細胞活性、TNF受體有拮抗作用等之化合物。此等對免疫細胞有阻礙細胞素作用之具抗風溼作用之藥劑爲例如：

特開平2-49778號公報之特許請求範圍第(1)項中記載一般式化合物或其藥理容許鹽(宜爲T-614、其化學名爲N-[3-甲醯胺基-4-氧-6-苯氧基-4H-1-苯并吡喃-7-基]甲磺醯胺)、

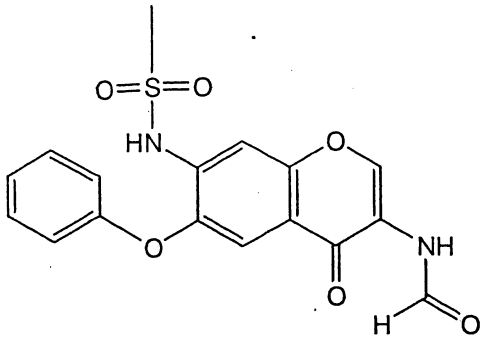
US4,720,506號公報中記載一般式(I)化合物或其藥理

容許鹽[宜爲 actarit、其化學名爲 4-(乙醯胺基)苯乙酸]、

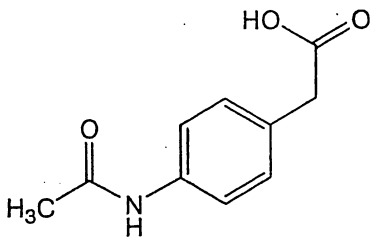
US2,396,145 號公報之特許請求範圍第 1 項中記載一般式化合物或其藥理容許鹽{宜爲沙唑硫吡啶(salazosulfapyridine)、其化學名爲 5-[[對-(2-吡啶胺亞磺醯基)-苯基]偶氮]水楊酸}、或

WO97/23457 號公報中記載一般式(I)化合物[宜爲 CDC-801、其化學名爲 3-丁亞醯胺基-3-(3-環戊氧基-4-甲氧苯基)丙醯胺]等。

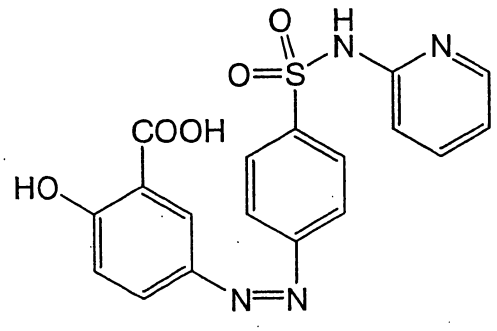
代表化合物之結構如下。



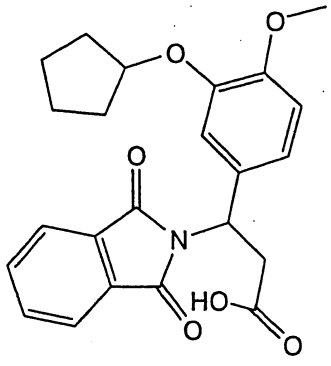
T－614



(actarit)



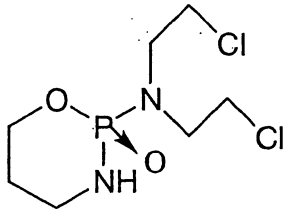
沙唑硫吡啶
(salazosulfapyridine)



CDC－801

(4)因 DNA 鏈破壞或 DNA 合成障礙所致細胞死亡之烷化劑、此等藥劑可爲例如、

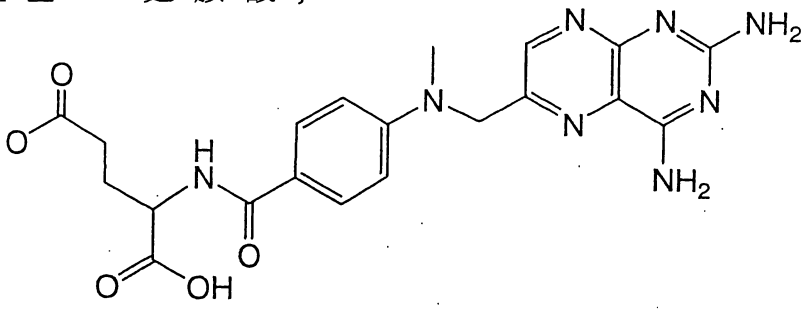
US3,018,302 號公報中記載一般式(IIIa)化合物或其藥理容許鹽[宜爲環磷醯胺、其化學名爲 N,N'-雙(2-氯乙基)四氫-2H-1,3,2-噁吖磷英-2-胺 2-氧化物]等。



環磷醯胺

(5)抑制葉酸產生以阻礙核酸代謝之代謝拮抗劑、可與二氫葉酸還原酶結合、抑制核酸成份合成中必要之四氫葉酸產生、具阻礙核酸代謝作用。此等抑制葉酸產生以阻礙核酸代謝之代謝拮抗劑爲例如:

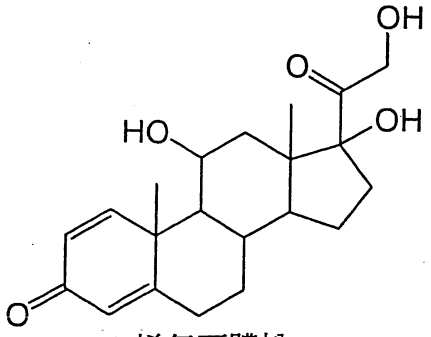
US2,512,572 號公報請求項 1 中記載一般式化合物或其藥理容許鹽{宜爲美索多列奇雪德(methotrexate)、其化學名爲 N-[4-[[2,4-二胺基-6-喋啶基]甲基]甲胺基]苄醯基-L-麩胺酸}。



美索例奇雪德
(methorexate)

(6)有 TNF-α 抑制作用之蛋白質製劑、此蛋白質製劑群中、血中 TNF-α 中和作用及阻礙其受體與細胞內 TNF-α 間訊號、抑制 TNF-α 作用之化合物及 IL-1 受體-拮抗劑、包括可溶性 IL-1 受體-及抗 IL-6 受體-抗體。此等有 TNF-α 抑制作用之蛋白質製劑爲、例如:

(7)在細胞內類固醇受體結合形成複合體、在染色體上反應部位結合而形成蛋白質具免疫抑制作用之類固醇荷爾蒙劑、此等藥劑爲例如、1-烯氫可體松(其化學名爲1,4-孕二烯-3,20-二酮-11β,17α-21-三醇)等。



1-烯氫可體松

(8)可抑制前列腺素產生之物質及/或對前列腺素作用有拮抗之非類固醇系抗炎症劑、此等藥劑爲例如:

特公昭58-4699號公報特許請求範圍第1項中記載一般式化合物或其藥理容許鹽{宜爲羅奇索普羅芬鈉(loxoprofen-Na)、其化學名爲2-[4-(2-氧環戊-1-基甲基)苯基]丙酸鈉。

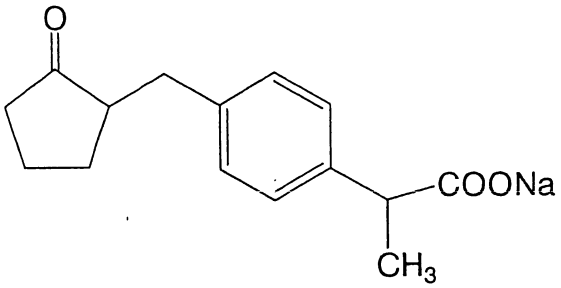
US3,558,690號公報中記載之一般式I(A)化合物或其藥理容許鹽{宜爲地克羅芬那克鈉(diclofenac-Na)、其化學名爲[0-(2,6-二氯苯胺)苯基]乙酸鈉}、

US4,233,299號公報(EP0,002,482號公報或特開昭58-92976號公報)中記載之一般式(I)化合物或其藥理容許鹽[宜爲美羅奇西茨、其化學名爲4-羥基-2-甲基-N-(5-甲基-2-噻唑基)-2H-1,2-苯并噻唑-3-羧醯胺-1,1-二氧化物]、

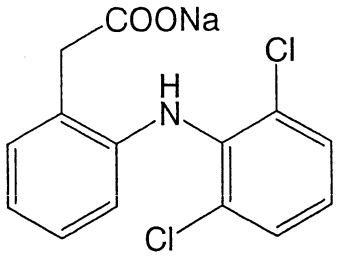
WO 95/15316號公報(US5,521,207號公報或特開2000-109466號公報)中記載之一般式(II)化合物或其藥

理容許鹽{宜爲西列可奇西布}、其化學名爲 4-[5-(4-甲苯基)-3-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯磺醯胺}或

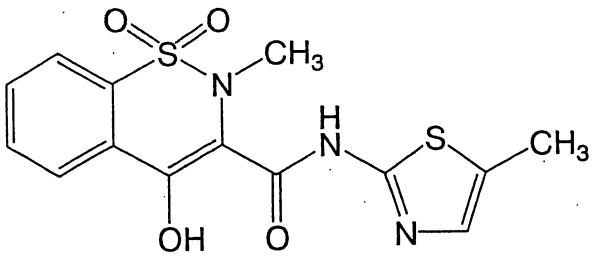
WO95/00501 號公報(US5,474,995 號公報)中記載一般式(I)化合物或其藥理容許鹽{宜爲羅非可奇西布、其化學名爲 4-[4-(甲磺醯基)苯基]-3-苯基-2(5H)-呋喃酮。}



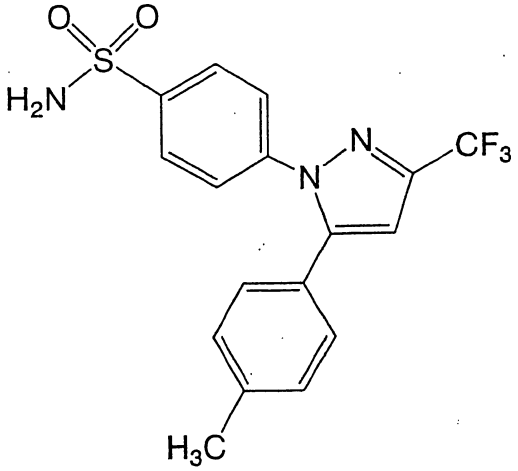
羅奇索普羅芬鈉
(loxoprofen-Na)



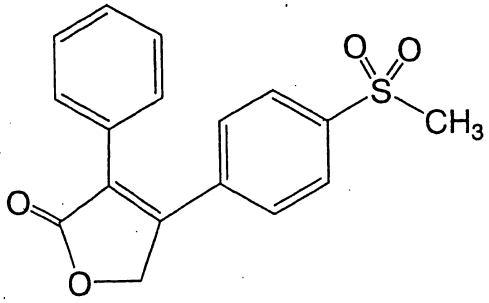
地克羅芬那克鈉
(diclofenac-Na)



美羅奇西茨



西列可奇西布



羅非可奇西布

上述免疫抑制劑中宜爲環孢素 A、大環內酯

(tacrolimus)、雷帕黴素(Rapamycin)、列氟諾邁德、美索多列奇雪德(methotrexate)、列米克德、緣布列路等。

上述「藥理容許鹽」乃指上述免疫抑制劑有胺基等鹼性基時與酸反應,若有羧基等酸性基時與鹼反應來作成之鹽、包含以下鹽。

鹼性基之鹽宜爲如氫氟酸鹽、鹽酸鹽、氫溴鹽、氫碘酸鹽等氫鹵酸鹽、硝酸鹽、過氯酸鹽、硫酸鹽、磷酸鹽等無機酸鹽;甲磺酸鹽、三氟甲磺酸鹽、乙磺酸鹽等低烷磺酸鹽、苯磺酸鹽、對甲苯甲酸鹽等芳磺酸鹽、乙酸鹽、蘋果酸鹽、富馬酸鹽、丁二酸鹽、檸檬酸鹽、抗壞血酸鹽、酒石酸鹽、草酸鹽、順丁烯二酸鹽等有機酸鹽;或甘胺酸鹽、精胺酸鹽、離胺酸鹽、鳥胺酸鹽、麩胺酸鹽、天冬胺酸鹽、麩胺酸鹽等胺基酸鹽、更宜爲鹽酸鹽、乙酸鹽、富馬酸鹽、丁二酸鹽或順丁烯二酸鹽。

酸性基之鹽宜爲鈉鹽、鉀鹽、鋰鹽等鹼金屬鹽、鈣鹽、鎂鹽等鹼土金屬鹽、鋁鹽、鐵鹽等金屬鹽;銨鹽等無機鹽、第三辛胺鹽、二苄胺鹽、嗎啉鹽、葡萄糖胺鹽、苯甘胺酸烷酯鹽、乙二胺鹽、N-甲基葡萄胺鹽、胍鹽、二乙胺鹽、三乙胺鹽、二環己胺鹽、N,N'-二苄基乙二胺鹽、氯普羅卡因鹽、普羅卡因鹽、二乙醇胺鹽、N-苄基苯乙胺鹽、哌啡鹽、四甲銨鹽、參(羥甲基)胺基甲烷鹽等有機鹽等胺鹽;或甘胺酸鹽、精胺酸鹽、離胺酸鹽、鳥胺酸鹽、麩胺酸鹽、天冬胺酸鹽、麩胺酸鹽等胺基酸鹽、更宜爲鈉鹽、鉀鹽、鈣鹽、鎂鹽或鋁鹽。

本發明醫藥組成物之有效成份爲免疫抑制劑、在大氣

中放置或再結晶,則有吸收水分、吸附水、成水合物之情形,此等水合物也包括在本發明之鹽。

本發明醫藥組成物之有效成份爲免疫抑制劑、其分子內有不對稱碳原子時可有異構物。本發明化合物中異構物及異構物混合物均以單一式表示。故本發明也包括異構物及異構物之任意比例之混合物。

本發明一般式(I)、(II)或(III)化合物之具體例爲如下述表1、表2、表3、表4、表5及表6中記載之化合物、但本發明不限於此化合物。表1及表2中同一化合物號碼之化合物中、X爲S、O或N-CH_3之3個化合物、表5及表中同一化合物號碼之化合物中、X爲S、O或N-CH_3、磷酸基結合在O或CH_2之6個化合物。

表中縮寫如下。

Bu : 丁基

iBu : 異丁基

Bz : 苄基

Et : 乙基

cHx : 環己基

Me : 甲基

Np(1) : 萘－1－基

Np(2) : 萘－2－基

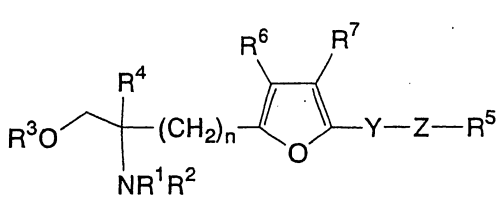
Ph : 苯基

cPn : 環戊基

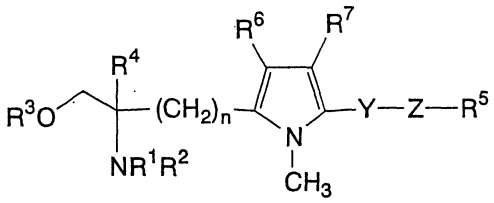
Pr : 丙基

iPr : 異丙基

表 1

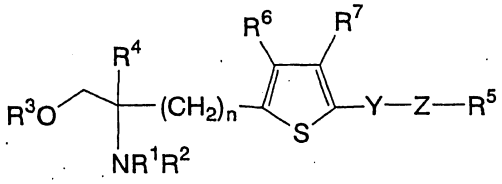


(Ia-1)



(Ia-2)

或



(Ia-3)

化合物	R^1	R^2	R^3	R^4	n	-Y-Z-R^5	R^6	R^7
1- 1	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-cHx	H	H
1- 2	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-F-cHx)	H	H
1- 3	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-Me-cHx)	H	H
1- 4	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-Et-cHx)	H	H
1- 5	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1- 6	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-MeO-cHx)	H	H
1- 7	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-EtO-cHx)	H	H
1- 8	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-MeS-cHx)	H	H
1- 9	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-10	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-11	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-Ph	H	H
1-12	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H

1-13	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-Me-Ph)	H	H
1-14	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-Et-Ph)	H	H
1-15	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-16	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-17	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-18	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-19	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-20	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-21	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$cHx	H	H
1-22	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-F-cHx)	H	H
1-23	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Me-cHx)	H	H
1-24	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Et-cHx)	H	H
1-25	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-26	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-27	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-28	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-MeS-cHx)	H	H
1-29	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-cHx-cHx)	H	H
1-30	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Ph-cHx)	H	H
1-31	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$Ph	H	H
1-32	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-F-Ph)	H	H
1-33	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Me-Ph)	H	H
1-34	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Et-Ph)	H	H
1-35	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-36	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-37	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-38	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-39	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-40	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-41	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cPn	H	H

1-42	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H
1-43	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	Me	H
1-44	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	Me
1-45	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	F	H
1-46	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	F
1-47	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-F-cHx)	H	H
1-48	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H
1-49	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-Cl-cHx)	H	H
1-50	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-Br-cHx)	H	H
1-51	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-Me-cHx)	H	H
1-52	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H
1-53	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-Et-cHx)	H	H
1-54	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H
1-55	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-Pr-cHx)	H	H
1-56	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-Pr-cHx)	H	H
1-57	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-iPr-cHx)	H	H
1-58	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-Bu-cHx)	H	H
1-59	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-Bu-cHx)	H	H
1-60	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-CF_3-cHx)	H	H
1-61	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-62	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-MeO-cHx)	H	H
1-63	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-64	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-EtO-cHx)	H	H
1-65	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-66	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-PrO-cHx)	H	H
1-67	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-PrO-cHx)	H	H
1-68	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-69	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-70	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H

1-71	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-72	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-73	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-74	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-MeS-cHx)	H	H
1-75	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-76	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-EtS-cHx)	H	H
1-77	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-EtS-cHx)	H	H
1-78	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-PrS-cHx)	H	H
1-79	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-PrS-cHx)	H	H
1-80	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-81	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-82	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-83	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-84	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-85	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-86	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-cHx-cHx)	H	H
1-87	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-88	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-Ph-cHx)	H	H
1-89	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-90	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-91	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-92	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-93	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-94	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-Ph	Me	H
1-95	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-Ph	H	Me
1-96	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-Ph	F	H
1-97	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-Ph	H	F
1-98	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3-F-Ph)	H	H
1-99	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H

1-100	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Cl-Ph)	H	H
1-101	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Br-Ph)	H	H
1-102	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Me-Ph)	H	H
1-103	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Me-Ph)	H	H
1-104	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Et-Ph)	H	H
1-105	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Et-Ph)	H	H
1-106	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Pr-Ph)	H	H
1-107	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Pr-Ph)	H	H
1-108	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iPr-Ph)	H	H
1-109	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPr-Ph)	H	H
1-110	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Bu-Ph)	H	H
1-111	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Bu-Ph)	H	H
1-112	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-CF_3-Ph)	H	H
1-113	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-114	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeO-Ph)	H	H
1-115	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-116	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-EtO-Ph)	H	H
1-117	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-118	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-PrO-Ph)	H	H
1-119	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrO-Ph)	H	H
1-120	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iPrO-Ph)	H	H
1-121	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrO-Ph)	H	H
1-122	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-123	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-124	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iBuO-Ph)	H	H
1-125	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iBuO-Ph)	H	H
1-126	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeS-Ph)	H	H
1-127	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-128	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-EtS-Ph)	H	H

1-129	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtS-Ph)	H	H
1-130	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-PrS-Ph)	H	H
1-131	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrS-Ph)	H	H
1-132	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iPrS-Ph)	H	H
1-133	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrS-Ph)	H	H
1-134	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-135	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-136	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iBuS-Ph)	H	H
1-137	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iBuS-Ph)	H	H
1-138	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-cHx-Ph)	H	H
1-139	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-140	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Ph-Ph)	H	H
1-141	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-142	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-143	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-144	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-145	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Np(1)	H	H
1-146	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Np(2)	H	H
1-147	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cPn	H	H
1-148	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H
1-149	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	Me	H
1-150	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	Me
1-151	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	F	H
1-152	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	F
1-153	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-F-cHx)	H	H
1-154	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-cHx)	H	H
1-155	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-cHx)	H	H
1-156	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-cHx)	H	H
1-157	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Me-cHx)	H	H

1-158	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-cHx)	H	H
1-159	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Et-cHx)	H	H
1-160	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-cHx)	H	H
1-161	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Pr-cHx)	H	H
1-162	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-cHx)	H	H
1-163	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-cHx)	H	H
1-164	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Bu-cHx)	H	H
1-165	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-cHx)	H	H
1-166	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-CF_3-cHx)	H	H
1-167	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-168	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeO-cHx)	H	H
1-169	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-170	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-EtO-cHx)	H	H
1-171	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-172	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-PrO-cHx)	H	H
1-173	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-cHx)	H	H
1-174	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPrO-cHx)	H	H
1-175	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-cHx)	H	H
1-176	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-177	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-178	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iBuO-cHx)	H	H
1-179	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iBuO-cHx)	H	H
1-180	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-cHx)	H	H
1-181	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-cHx)	H	H
1-182	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-EtS-cHx)	H	H
1-183	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtS-cHx)	H	H
1-184	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-PrS-cHx)	H	H
1-185	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrS-cHx)	H	H
1-186	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPrS-cHx)	H	H

1-187	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-188	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-189	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-190	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-191	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-192	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3-cHx-cHx)	H	H
1-193	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-194	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3-Ph-cHx)	H	H
1-195	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-196	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-197	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-198	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-199	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-Ph	H	H
1-200	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-Ph	Me	H
1-201	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-Ph	H	Me
1-202	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-Ph	F	H
1-203	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-Ph	H	F
1-204	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3-F-Ph)	H	H
1-205	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-F-Ph)	H	H
1-206	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-207	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-Br-Ph)	H	H
1-208	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3-Me-Ph)	H	H
1-209	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-Me-Ph)	H	H
1-210	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3-Et-Ph)	H	H
1-211	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-Et-Ph)	H	H
1-212	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3-Pr-Ph)	H	H
1-213	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-Pr-Ph)	H	H
1-214	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(3-iPr-Ph)	H	H
1-215	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_6$-(4-iPr-Ph)	H	H

1-216	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Bu-Ph)	H	H
1-217	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-Ph)	H	H
1-218	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-CF_3-Ph)	H	H
1-219	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-220	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeO-Ph)	H	H
1-221	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-222	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-EtO-Ph)	H	H
1-223	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-224	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-PrO-Ph)	H	H
1-225	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-Ph)	H	H
1-226	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPrO-Ph)	H	H
1-227	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-Ph)	H	H
1-228	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-229	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-230	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iBuO-Ph)	H	H
1-231	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iBuO-Ph)	H	H
1-232	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-Ph)	H	H
1-233	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-234	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-EtS-Ph)	H	H
1-235	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtS-Ph)	H	H
1-236	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-PrS-Ph)	H	H
1-237	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrS-Ph)	H	H
1-238	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPrS-Ph)	H	H
1-239	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrS-Ph)	H	H
1-240	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-241	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-242	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iBuS-Ph)	H	H
1-243	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iBuS-Ph)	H	H
1-244	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-cHx-Ph)	H	H

1-245	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-246	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Ph-Ph)	H	H
1-247	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-248	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-249	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-250	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-251	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Np(1)	H	H
1-252	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Np(2)	H	H
1-253	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$cHx	H	H
1-254	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-F-cHx)	H	H
1-255	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-Me-cHx)	H	H
1-256	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-Et-cHx)	H	H
1-257	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-258	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-259	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-260	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-MeS-cHx)	H	H
1-261	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-cHx-cHx)	H	H
1-262	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-Ph-cHx)	H	H
1-263	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$Ph	H	H
1-264	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-F-Ph)	H	H
1-265	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-Me-Ph)	H	H
1-266	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-Et-Ph)	H	H
1-267	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-268	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-269	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-270	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-271	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-272	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-273	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$O-cHx	H	H

1-274	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-F-cHx)	H	H
1-275	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Me-cHx)	H	H
1-276	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Et-cHx)	H	H
1-277	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-278	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-279	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-280	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-MeS-cHx)	H	H
1-281	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-cHx-cHx)	H	H
1-282	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Ph-cHx)	H	H
1-283	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$Ph	H	H
1-284	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-F-Ph)	H	H
1-285	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Me-Ph)	H	H
1-286	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Et-Ph)	H	H
1-287	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-288	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-289	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-290	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-291	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-292	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-293	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cPn	H	H
1-294	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	H
1-295	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	Me	H
1-296	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	Me
1-297	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	F	H
1-298	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	F
1-299	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-F-cHx)	H	H
1-300	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-F-cHx)	H	H
1-301	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Cl-cHx)	H	H
1-302	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Br-cHx)	H	H

1-303	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Me-cHx)	H	H
1-304	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Me-cHx)	H	H
1-305	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Et-cHx)	H	H
1-306	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Et-cHx)	H	H
1-307	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Pr-cHx)	H	H
1-308	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Pr-cHx)	H	H
1-309	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPr-cHx)	H	H
1-310	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Bu-cHx)	H	H
1-311	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Bu-cHx)	H	H
1-312	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-CF_3-cHx)	H	H
1-313	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-314	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-MeO-cHx)	H	H
1-315	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-316	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-EtO-cHx)	H	H
1-317	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-318	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-PrO-cHx)	H	H
1-319	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-PrO-cHx)	H	H
1-320	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPrO-cHx)	H	H
1-321	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPrO-cHx)	H	H
1-322	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-323	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-324	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iBuO-cHx)	H	H
1-325	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iBuO-cHx)	H	H
1-326	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-MeS-cHx)	H	H
1-327	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-MeS-cHx)	H	H
1-328	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-EtS-cHx)	H	H
1-329	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-EtS-cHx)	H	H
1-330	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-PrS-cHx)	H	H
1-331	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-PrS-cHx)	H	H

1-332	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPrS-cHx)	H	H
1-333	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPrS-cHx)	H	H
1-334	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-335	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-336	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iBuS-cHx)	H	H
1-337	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iBuS-cHx)	H	H
1-338	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-cHx-cHx)	H	H
1-339	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-cHx-cHx)	H	H
1-340	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Ph-cHx)	H	H
1-341	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Ph-cHx)	H	H
1-342	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-343	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-344	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-345	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	H
1-346	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	Me	H
1-347	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	Me
1-348	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	F	H
1-349	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	F
1-350	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-F-Ph)	H	H
1-351	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-F-Ph)	H	H
1-352	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Cl-Ph)	H	H
1-353	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Br-Ph)	H	H
1-354	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Me-Ph)	H	H
1-355	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Me-Ph)	H	H
1-356	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Et-Ph)	H	H
1-357	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Et-Ph)	H	H
1-358	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Pr-Ph)	H	H
1-359	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Pr-Ph)	H	H
1-360	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPr-Ph)	H	H

1-361	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPr-Ph)	H	H
1-362	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Bu-Ph)	H	H
1-363	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Bu-Ph)	H	H
1-364	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-CF_3-Ph)	H	H
1-365	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-366	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-MeO-Ph)	H	H
1-367	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-368	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-EtO-Ph)	H	H
1-369	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-370	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-PrO-Ph)	H	H
1-371	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-PrO-Ph)	H	H
1-372	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPrO-Ph)	H	H
1-373	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPrO-Ph)	H	H
1-374	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-375	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-376	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iBuO-Ph)	H	H
1-377	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iBuO-Ph)	H	H
1-378	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-MeS-Ph)	H	H
1-379	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-380	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-EtS-Ph)	H	H
1-381	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-EtS-Ph)	H	H
1-382	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-PrS-Ph)	H	H
1-383	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-PrS-Ph)	H	H
1-384	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPrS-Ph)	H	H
1-385	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPrS-Ph)	H	H
1-386	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-387	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-388	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iBuS-Ph)	H	H
1-389	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iBuS-Ph)	H	H

1-390	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-cHx-Ph)	H	H
1-391	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-392	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Ph-Ph)	H	H
1-393	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-394	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-395	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-396	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-397	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-O-$cHx	H	H
1-398	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-O-$Ph	H	H
1-399	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-O-$cHx	H	H
1-400	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-O-$Ph	H	H
1-401	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$cHx	H	H
1-402	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-F-cHx)	H	H
1-403	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Me-cHx)	H	H
1-404	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Et-cHx)	H	H
1-405	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-406	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-407	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-408	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-MeS-cHx)	H	H
1-409	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-cHx-cHx)	H	H
1-410	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Ph-cHx)	H	H
1-411	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$Ph	H	H
1-412	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-F-Ph)	H	H
1-413	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Me-Ph)	H	H
1-414	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Et-Ph)	H	H
1-415	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-416	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-417	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-418	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-MeS-Ph)	H	H

1-419	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-420	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-421	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cPn	H	H
1-422	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	H
1-423	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	Me	H
1-424	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	Me
1-425	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	F	H
1-426	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	F
1-427	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-F-cHx)	H	H
1-428	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-F-cHx)	H	H
1-429	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Cl-cHx)	H	H
1-430	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Br-cHx)	H	H
1-431	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Me-cHx)	H	H
1-432	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Me-cHx)	H	H
1-433	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Et-cHx)	H	H
1-434	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Et-cHx)	H	H
1-435	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Pr-cHx)	H	H
1-436	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Pr-cHx)	H	H
1-437	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPr-cHx)	H	H
1-438	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Bu-cHx)	H	H
1-439	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Bu-cHx)	H	H
1-440	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-CF_3-cHx)	H	H
1-441	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-442	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-MeO-cHx)	H	H
1-443	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-444	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-EtO-cHx)	H	H
1-445	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-446	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-PrO-cHx)	H	H
1-447	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-PrO-cHx)	H	H

1-448	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPrO-cHx)	H	H
1-449	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPrO-cHx)	H	H
1-450	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-451	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-452	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iBuO-cHx)	H	H
1-453	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iBuO-cHx)	H	H
1-454	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-MeS-cHx)	H	H
1-455	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-MeS-cHx)	H	H
1-456	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-EtS-cHx)	H	H
1-457	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-EtS-cHx)	H	H
1-458	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-PrS-cHx)	H	H
1-459	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-PrS-cHx)	H	H
1-460	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPrS-cHx)	H	H
1-461	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPrS-cHx)	H	H
1-462	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-463	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-464	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iBuS-cHx)	H	H
1-465	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iBuS-cHx)	H	H
1-466	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-cHx-cHx)	H	H
1-467	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-cHx-cHx)	H	H
1-468	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Ph-cHx)	H	H
1-469	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Ph-cHx)	H	H
1-470	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-471	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-472	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-473	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	H	H
1-474	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	Me	H
1-475	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	H	Me
1-476	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	F	H

1-477	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-Ph$	H	F
1-478	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-F-Ph)	H	H
1-479	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-F-Ph)	H	H
1-480	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Cl-Ph)	H	H
1-481	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Br-Ph)	H	H
1-482	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Me-Ph)	H	H
1-483	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Me-Ph)	H	H
1-484	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Et-Ph)	H	H
1-485	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Et-Ph)	H	H
1-486	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Pr-Ph)	H	H
1-487	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Pr-Ph)	H	H
1-488	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPr-Ph)	H	H
1-489	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPr-Ph)	H	H
1-490	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Bu-Ph)	H	H
1-491	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Bu-Ph)	H	H
1-492	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-CF_3-Ph)	H	H
1-493	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-494	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-MeO-Ph)	H	H
1-495	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-496	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-EtO-Ph)	H	H
1-497	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-498	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-PrO-Ph)	H	H
1-499	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-PrO-Ph)	H	H
1-500	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPrO-Ph)	H	H
1-501	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPrO-Ph)	H	H
1-502	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-503	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-504	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iBuO-Ph)	H	H
1-505	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iBuO-Ph)	H	H

1-506	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-MeS-Ph)	H	H
1-507	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-508	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-EtS-Ph)	H	H
1-509	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-EtS-Ph)	H	H
1-510	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-PrS-Ph)	H	H
1-511	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-PrS-Ph)	H	H
1-512	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPrS-Ph)	H	H
1-513	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPrS-Ph)	H	H
1-514	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-515	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-516	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iBuS-Ph)	H	H
1-517	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iBuS-Ph)	H	H
1-518	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-cHx-Ph)	H	H
1-519	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-cHx-Ph)	H	H
1-520	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Ph-Ph)	H	H
1-521	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Ph-Ph)	H	H
1-522	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-523	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-524	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-525	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-OCH_2-$cHx	H	H
1-526	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-OCH_2-$Ph	H	H
1-527	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-OCH_2-$cHx	H	H
1-528	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-OCH_2-$Ph	H	H
1-529	H	H	H	Me	2	-C≡C-cHx	H	H
1-530	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-F-cHx)	H	H
1-531	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Me-cHx)	H	H
1-532	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Et-cHx)	H	H
1-533	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(4-CF_3-cHx)$	H	H
1-534	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeO-cHx)	H	H

1-535	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-cHx)	H	H
1-536	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeS-cHx)	H	H
1-537	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-cHx)	H	H
1-538	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-cHx)	H	H
1-539	H	H	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H
1-540	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-F-Ph)	H	H
1-541	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Me-Ph)	H	H
1-542	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Pr-Ph)	H	H
1-543	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Bu-Ph)	H	H
1-544	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeO-Ph)	H	H
1-545	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-Ph)	H	H
1-546	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-PrO-Ph)	H	H
1-547	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-Ph)	H	H
1-548	H	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-Ph)	H	H
1-549	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H
1-550	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-F-cHx)	H	H
1-551	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Me-cHx)	H	H
1-552	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Et-cHx)	H	H
1-553	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-554	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-555	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-556	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-557	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-558	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-559	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H
1-560	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-F-Ph)	H	H
1-561	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Me-Ph)	H	H
1-562	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Et-Ph)	H	H
1-563	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-CF_3-Ph)	H	H

1-564	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-565	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-566	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-567	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-568	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-569	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cPn	H	H
1-570	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H
1-571	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	Me	H
1-572	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	Me
1-573	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	F	H
1-574	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	F
1-575	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-F-cHx)	H	H
1-576	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-F-cHx)	H	H
1-577	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Cl-cHx)	H	H
1-578	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-cHx)	H	H
1-579	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Me-cHx)	H	H
1-580	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-cHx)	H	H
1-581	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Et-cHx)	H	H
1-582	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-cHx)	H	H
1-583	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Pr-cHx)	H	H
1-584	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-cHx)	H	H
1-585	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-cHx)	H	H
1-586	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Bu-cHx)	H	H
1-587	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-cHx)	H	H
1-588	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-CF_3-cHx)	H	H
1-589	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-590	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeO-cHx)	H	H
1-591	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-592	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-EtO-cHx)	H	H

1-593	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-594	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-PrO-cHx)	H	H
1-595	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-cHx)	H	H
1-596	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-597	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-598	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-599	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-600	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-601	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-602	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-cHx)	H	H
1-603	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-604	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-EtS-cHx)	H	H
1-605	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtS-cHx)	H	H
1-606	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-PrS-cHx)	H	H
1-607	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrS-cHx)	H	H
1-608	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-609	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-610	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-611	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-612	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-613	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-614	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-cHx-cHx)	H	H
1-615	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-616	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Ph-cHx)	H	H
1-617	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-618	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-619	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-620	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-621	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H

1-622	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	Me	H
1-623	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	Me
1-624	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	F	H
1-625	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	F
1-626	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-F-Ph)	H	H
1-627	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H
1-628	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-629	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-Ph)	H	H
1-630	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Me-Ph)	H	H
1-631	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H
1-632	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Et-Ph)	H	H
1-633	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H
1-634	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Pr-Ph)	H	H
1-635	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-Ph)	H	H
1-636	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPr-Ph)	H	H
1-637	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-Ph)	H	H
1-638	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Bu-Ph)	H	H
1-639	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-Ph)	H	H
1-640	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-641	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-642	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeO-Ph)	H	H
1-643	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-644	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-EtO-Ph)	H	H
1-645	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-646	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-PrO-Ph)	H	H
1-647	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-Ph)	H	H
1-648	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-649	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-650	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H

1-651	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-652	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iBuO-Ph)	H	H
1-653	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-654	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-Ph)	H	H
1-655	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-656	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-EtS-Ph)	H	H
1-657	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtS-Ph)	H	H
1-658	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-PrS-Ph)	H	H
1-659	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrS-Ph)	H	H
1-660	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPrS-Ph)	H	H
1-661	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrS-Ph)	H	H
1-662	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-663	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-664	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iBuS-Ph)	H	H
1-665	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iBuS-Ph)	H	H
1-666	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-cHx-Ph)	H	H
1-667	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-668	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Ph-Ph)	H	H
1-669	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-670	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-671	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-672	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-673	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Np(1)	H	H
1-674	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Np(2)	H	H
1-675	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cPn	H	H
1-676	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
1-677	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	Me	H
1-678	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	Me
1-679	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	F	H

1-680	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	F
1-681	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-F-cHx)	H	H
1-682	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H
1-683	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-cHx)	H	H
1-684	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-cHx)	H	H
1-685	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Me-cHx)	H	H
1-686	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H
1-687	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Et-cHx)	H	H
1-688	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H
1-689	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Pr-cHx)	H	H
1-690	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-cHx)	H	H
1-691	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-cHx)	H	H
1-692	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Bu-cHx)	H	H
1-693	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-cHx)	H	H
1-694	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-cHx)	H	H
1-695	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-696	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeO-cHx)	H	H
1-697	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-698	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-EtO-cHx)	H	H
1-699	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-700	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-PrO-cHx)	H	H
1-701	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-cHx)	H	H
1-702	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-703	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-704	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-705	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-706	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-707	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-708	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeS-cHx)	H	H

1-709	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-710	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-EtS-cHx)	H	H
1-711	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtS-cHx)	H	H
1-712	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-PrS-cHx)	H	H
1-713	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrS-cHx)	H	H
1-714	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-715	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-716	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-717	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-718	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-719	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-720	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-cHx-cHx)	H	H
1-721	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-722	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Ph-cHx)	H	H
1-723	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-724	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-725	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-726	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-727	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
1-728	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	Me	H
1-729	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	Me
1-730	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	F	H
1-731	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	F
1-732	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-F-Ph)	H	H
1-733	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H
1-734	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-735	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-Ph)	H	H
1-736	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Me-Ph)	H	H
1-737	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H

1-738	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Et-Ph)	H	H
1-739	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H
1-740	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Pr-Ph)	H	H
1-741	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-Ph)	H	H
1-742	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPr-Ph)	H	H
1-743	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-Ph)	H	H
1-744	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Bu-Ph)	H	H
1-745	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-Ph)	H	H
1-746	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-747	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-748	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeO-Ph)	H	H
1-749	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-750	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-EtO-Ph)	H	H
1-751	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-752	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-PrO-Ph)	H	H
1-753	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-Ph)	H	H
1-754	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-755	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-756	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-757	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-758	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iBuO-Ph)	H	H
1-759	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-760	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeS-Ph)	H	H
1-761	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-762	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-EtS-Ph)	H	H
1-763	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtS-Ph)	H	H
1-764	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-PrS-Ph)	H	H
1-765	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrS-Ph)	H	H
1-766	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPrS-Ph)	H	H

1-767	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrS-Ph)	H	H
1-768	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-769	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-770	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iBuS-Ph)	H	H
1-771	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iBuS-Ph)	H	H
1-772	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-cHx-Ph)	H	H
1-773	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-774	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Ph-Ph)	H	H
1-775	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-776	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-777	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-778	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-779	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Np(1)	H	H
1-780	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Np(2)	H	H
1-781	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
1-782	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H
1-783	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H
1-784	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H
1-785	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-786	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-787	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-788	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-789	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-790	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-791	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-792	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H
1-793	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Me-Ph)	H	H
1-794	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Et-Ph)	H	H
1-795	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-Ph)	H	H

1-796	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-797	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-798	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-799	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-800	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-801	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H
1-802	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-F-cHx)	H	H
1-803	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Me-cHx)	H	H
1-804	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Et-cHx)	H	H
1-805	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-806	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-807	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-808	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-809	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-810	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-811	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H
1-812	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-F-Ph)	H	H
1-813	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Me-Ph)	H	H
1-814	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Et-Ph)	H	H
1-815	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-816	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-817	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-818	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-819	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-820	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-821	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-cHx	H	H
1-822	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-F-cHx)	H	H
1-823	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Me-cHx)	H	H
1-824	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Et-cHx)	H	H

1-825	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-826	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-827	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-EtO-cHx)	H	H
1-828	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-829	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-830	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-831	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-Ph	H	H
1-832	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-F-Ph)	H	H
1-833	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Me-Ph)	H	H
1-834	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Et-Ph)	H	H
1-835	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-836	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-837	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-838	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-839	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-cHx-Ph)	H	H
1-840	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Ph-Ph)	H	H
1-841	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cPn	H	H
1-842	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	H
1-843	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	Me	H
1-844	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	Me
1-845	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	F	H
1-846	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	F
1-847	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-F-cHx)	H	H
1-848	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-F-cHx)	H	H
1-849	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-cHx)	H	H
1-850	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-cHx)	H	H
1-851	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Me-cHx)	H	H
1-852	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-cHx)	H	H
1-853	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Et-cHx)	H	H

1-854	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-cHx)	H	H
1-855	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Pr-cHx)	H	H
1-856	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-cHx)	H	H
1-857	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-cHx)	H	H
1-858	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Bu-cHx)	H	H
1-859	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-cHx)	H	H
1-860	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-CF_3-cHx)	H	H
1-861	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-862	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeO-cHx)	H	H
1-863	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-864	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-EtO-cHx)	H	H
1-865	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-cHx)	H	H
1-866	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-PrO-cHx)	H	H
1-867	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-cHx)	H	H
1-868	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-869	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-870	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-871	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H
1-872	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-873	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-874	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeS-cHx)	H	H
1-875	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-876	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-EtS-cHx)	H	H
1-877	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtS-cHx)	H	H
1-878	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-PrS-cHx)	H	H
1-879	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrS-cHx)	H	H
1-880	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-881	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-882	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H

1-883	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H
1-884	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-885	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-886	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-cHx-cHx)	H	H
1-887	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-888	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Ph-cHx)	H	H
1-889	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-890	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-891	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-892	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-893	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H
1-894	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	Me	H
1-895	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	Me
1-896	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	F	H
1-897	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	F
1-898	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-F-Ph)	H	H
1-899	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-F-Ph)	H	H
1-900	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-901	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-Ph)	H	H
1-902	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Me-Ph)	H	H
1-903	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-Ph)	H	H
1-904	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Et-Ph)	H	H
1-905	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-Ph)	H	H
1-906	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Pr-Ph)	H	H
1-907	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-Ph)	H	H
1-908	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPr-Ph)	H	H
1-909	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-Ph)	H	H
1-910	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Bu-Ph)	H	H
1-911	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-Ph)	H	H

1-912	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-913	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-914	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-915	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-916	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-EtO-Ph)	H	H
1-917	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-918	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-PrO-Ph)	H	H
1-919	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-Ph)	H	H
1-920	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-921	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-922	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-923	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-924	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iBuO-Ph)	H	H
1-925	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-926	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeS-Ph)	H	H
1-927	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-928	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-EtS-Ph)	H	H
1-929	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtS-Ph)	H	H
1-930	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-PrS-Ph)	H	H
1-931	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrS-Ph)	H	H
1-932	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPrS-Ph)	H	H
1-933	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrS-Ph)	H	H
1-934	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-935	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-936	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iBuS-Ph)	H	H
1-937	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iBuS-Ph)	H	H
1-938	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-cHx-Ph)	H	H
1-939	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-cHx-Ph)	H	H
1-940	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Ph-Ph)	H	H

1-941	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Ph-Ph)	H	H
1-942	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-943	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-944	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-945	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$O-cHx	H	H
1-946	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$O-Ph	H	H
1-947	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$O-cHx	H	H
1-948	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$O-Ph	H	H
1-949	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-cHx	H	H
1-950	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-F-cHx)	H	H
1-951	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Me-cHx)	H	H
1-952	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Et-cHx)	H	H
1-953	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-954	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-MeO-cHx)	H	H
1-955	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-EtO-cHx)	H	H
1-956	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-MeS-cHx)	H	H
1-957	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-cHx-cHx)	H	H
1-958	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Ph-cHx)	H	H
1-959	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-Ph	H	H
1-960	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-F-Ph)	H	H
1-961	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Me-Ph)	H	H
1-962	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Et-Ph)	H	H
1-963	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-964	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-MeO-Ph)	H	H
1-965	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-EtO-Ph)	H	H
1-966	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-MeS-Ph)	H	H
1-967	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-cHx-Ph)	H	H
1-968	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Ph-Ph)	H	H
1-969	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cPn	H	H

1-970	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H
1-971	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	Me	H
1-972	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	Me
1-973	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	F	H
1-974	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	F
1-975	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-F-cHx)	H	H
1-976	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-F-cHx)	H	H
1-977	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Cl-cHx)	H	H
1-978	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Br-cHx)	H	H
1-979	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Me-cHx)	H	H
1-980	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Me-cHx)	H	H
1-981	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Et-cHx)	H	H
1-982	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Et-cHx)	H	H
1-983	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Pr-cHx)	H	H
1-984	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Pr-cHx)	H	H
1-985	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPr-cHx)	H	H
1-986	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Bu-cHx)	H	H
1-987	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Bu-cHx)	H	H
1-988	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-CF_3-cHx)	H	H
1-989	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-990	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-MeO-cHx)	H	H
1-991	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeO-cHx)	H	H
1-992	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-EtO-cHx)	H	H
1-993	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtO-cHx)	H	H
1-994	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-PrO-cHx)	H	H
1-995	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-PrO-cHx)	H	H
1-996	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-997	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-998	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H

1-999	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1000	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-1001	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-1002	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-MeS-cHx)	H	H
1-1003	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1004	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-EtS-cHx)	H	H
1-1005	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtS-cHx)	H	H
1-1006	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-PrS-cHx)	H	H
1-1007	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-PrS-cHx)	H	H
1-1008	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-1009	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-1010	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1011	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1012	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-1013	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1014	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-cHx-cHx)	H	H
1-1015	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1016	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Ph-cHx)	H	H
1-1017	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1018	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1019	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1020	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1021	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H
1-1022	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	Me	H
1-1023	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	Me
1-1024	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	F	H
1-1025	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	F
1-1026	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-F-Ph)	H	H
1-1027	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-F-Ph)	H	H

1-1028	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1029	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Br-Ph)	H	H
1-1030	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Me-Ph)	H	H
1-1031	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Me-Ph)	H	H
1-1032	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Et-Ph)	H	H
1-1033	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Et-Ph)	H	H
1-1034	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Pr-Ph)	H	H
1-1035	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1036	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPr-Ph)	H	H
1-1037	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPr-Ph)	H	H
1-1038	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Bu-Ph)	H	H
1-1039	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1040	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-1041	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1042	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1043	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1044	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-EtO-Ph)	H	H
1-1045	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1046	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-PrO-Ph)	H	H
1-1047	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1048	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-1049	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1050	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[3-(2-Et-PrO)Ph]	H	H
1-1051	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[4-(2-Et-PrO)Ph]	H	H
1-1052	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iBuO-Ph)	H	H
1-1053	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-1054	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-MeS-Ph)	H	H
1-1055	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1056	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-EtS-Ph)	H	H

1-1057	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtS-Ph)	H	H
1-1058	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-PrS-Ph)	H	H
1-1059	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-PrS-Ph)	H	H
1-1060	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPrS-Ph)	H	H
1-1061	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPrS-Ph)	H	H
1-1062	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)Ph]	H	H
1-1063	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)Ph]	H	H
1-1064	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iBuS-Ph)	H	H
1-1065	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iBuS-Ph)	H	H
1-1066	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-cHx-Ph)	H	H
1-1067	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1068	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Ph-Ph)	H	H
1-1069	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1070	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1071	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1072	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1073	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	H
1-1074	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	H
1-1075	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-OCH_2-cHx	H	H
1-1076	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-OCH_2-Ph	H	H
1-1077	H	H	H	Me	2	-CO-CH_2-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1078	H	H	H	Me	2	-CO-CH_2-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1079	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-cHx	H	H
1-1080	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-Ph	H	H
1-1081	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H
1-1082	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H
1-1083	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
1-1084	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H
1-1085	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H

1-1086	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H
1-1087	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1088	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1089	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1090	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1091	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1092	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1093	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
1-1094	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H
1-1095	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H
1-1096	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H
1-1097	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1098	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1099	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1100	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1101	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1102	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1103	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
1-1104	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H
1-1105	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H
1-1106	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H
1-1107	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1108	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1109	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1110	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1111	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1112	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1113	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-1114	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H

1-1115	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Me-Ph)	H	H
1-1116	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Et-Ph)	H	H
1-1117	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1118	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1119	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1120	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1121	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1122	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1123	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_6$-cHx	H	H
1-1124	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_6$-Ph	H	H
1-1125	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_7$-cHx	H	H
1-1126	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_7$-Ph	H	H
1-1127	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-cHx	H	H
1-1128	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-F-cHx)	H	H
1-1129	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Me-cHx)	H	H
1-1130	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Et-cHx)	H	H
1-1131	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1132	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1133	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1134	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1135	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1136	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1137	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-Ph	H	H
1-1138	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-F-Ph)	H	H
1-1139	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Me-Ph)	H	H
1-1140	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Et-Ph)	H	H
1-1141	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1142	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1143	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-EtO-Ph)	H	H

1-1144	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1145	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1146	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1147	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cPn	H	H
1-1148	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	H
1-1149	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	Me	H
1-1150	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	Me
1-1151	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	F	H
1-1152	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	F
1-1153	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-F-cHx)	H	H
1-1154	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-F-cHx)	H	H
1-1155	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Cl-cHx)	H	H
1-1156	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Br-cHx)	H	H
1-1157	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Me-cHx)	H	H
1-1158	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Me-cHx)	H	H
1-1159	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Et-cHx)	H	H
1-1160	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Et-cHx)	H	H
1-1161	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Pr-cHx)	H	H
1-1162	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Pr-cHx)	H	H
1-1163	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPr-cHx)	H	H
1-1164	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Bu-cHx)	H	H
1-1165	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Bu-cHx)	H	H
1-1166	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-CF_3-cHx)	H	H
1-1167	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1168	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-MeO-cHx)	H	H
1-1169	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1170	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-EtO-cHx)	H	H
1-1171	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1172	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-PrO-cHx)	H	H

1-1173	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-PrO-cHx)	H	H
1-1174	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-1175	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1176	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1177	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1178	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-1179	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-1180	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-MeS-cHx)	H	H
1-1181	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1182	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-EtS-cHx)	H	H
1-1183	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-EtS-cHx)	H	H
1-1184	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-PrS-cHx)	H	H
1-1185	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-PrS-cHx)	H	H
1-1186	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-1187	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-1188	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1189	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1190	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-1191	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1192	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-cHx-cHx)	H	H
1-1193	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1194	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Ph-cHx)	H	H
1-1195	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1196	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1197	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1198	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1199	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	H
1-1200	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	Me	H
1-1201	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	Me

1-1202	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	F	H
1-1203	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	F
1-1204	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-F-Ph)	H	H
1-1205	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-F-Ph)	H	H
1-1206	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1207	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Br-Ph)	H	H
1-1208	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Me-Ph)	H	H
1-1209	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Me-Ph)	H	H
1-1210	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Et-Ph)	H	H
1-1211	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Et-Ph)	H	H
1-1212	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Pr-Ph)	H	H
1-1213	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1214	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPr-Ph)	H	H
1-1215	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPr-Ph)	H	H
1-1216	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Bu-Ph)	H	H
1-1217	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1218	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-1219	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1220	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1221	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1222	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-EtO-Ph)	H	H
1-1223	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1224	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-PrO-Ph)	H	H
1-1225	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1226	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-1227	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1228	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-1229	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H
1-1230	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iBuO-Ph)	H	H

1-1231	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-1232	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-MeS-Ph)	H	H
1-1233	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1234	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-EtS-Ph)	H	H
1-1235	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-EtS-Ph)	H	H
1-1236	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-PrS-Ph)	H	H
1-1237	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-PrS-Ph)	H	H
1-1238	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPrS-Ph)	H	H
1-1239	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPrS-Ph)	H	H
1-1240	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-1241	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H
1-1242	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iBuS-Ph)	H	H
1-1243	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iBuS-Ph)	H	H
1-1244	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-cHx-Ph)	H	H
1-1245	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1246	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Ph-Ph)	H	H
1-1247	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1248	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1249	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1250	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1251	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-O-cHx	H	H
1-1252	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-O-Ph	H	H
1-1253	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-O-cHx	H	H
1-1254	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-O-Ph	H	H
1-1255	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H
1-1256	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-F-cHx)	H	H
1-1257	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Me-cHx)	H	H
1-1258	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Et-cHx)	H	H
1-1259	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-CF_3-cHx)	H	H

1-1260	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1261	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1262	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1263	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1264	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1265	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H
1-1266	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-F-Ph)	H	H
1-1267	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Me-Ph)	H	H
1-1268	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Et-Ph)	H	H
1-1269	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1270	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1271	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1272	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1273	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1274	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1275	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-CH_2-cPn	H	H
1-1276	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	H
1-1277	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	Me	H
1-1278	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	Me
1-1279	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	F	H
1-1280	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	F
1-1281	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-F-cHx)	H	H
1-1282	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-F-cHx)	H	H
1-1283	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Cl-cHx)	H	H
1-1284	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Br-cHx)	H	H
1-1285	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Me-cHx)	H	H
1-1286	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Me-cHx)	H	H
1-1287	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Et-cHx)	H	H
1-1288	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Et-cHx)	H	H

1-1289	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Pr-cHx)	H	H
1-1290	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Pr-cHx)	H	H
1-1291	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPr-cHx)	H	H
1-1292	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Bu-cHx)	H	H
1-1293	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Bu-cHx)	H	H
1-1294	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-CF_3-cHx)	H	H
1-1295	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1296	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-MeO-cHx)	H	H
1-1297	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1298	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-EtO-cHx)	H	H
1-1299	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1300	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-PrO-cHx)	H	H
1-1301	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-PrO-cHx)	H	H
1-1302	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPrO-cHx)	H	H
1-1303	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1304	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1305	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H
1-1306	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iBuO-cHx)	H	H
1-1307	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iBuO-cHx)	H	H
1-1308	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-MeS-cHx)	H	H
1-1309	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1310	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-EtS-cHx)	H	H
1-1311	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-EtS-cHx)	H	H
1-1312	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-PrS-cHx)	H	H
1-1313	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-PrS-cHx)	H	H
1-1314	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPrS-cHx)	H	H
1-1315	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPrS-cHx)	H	H
1-1316	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H
1-1317	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H

1-1318	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iBuS-cHx)	H	H
1-1319	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iBuS-cHx)	H	H
1-1320	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-cHx-cHx)	H	H
1-1321	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1322	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Ph-cHx)	H	H
1-1323	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1324	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1325	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1326	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1327	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	H
1-1328	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	Me	H
1-1329	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	Me
1-1330	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	F	H
1-1331	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	F
1-1332	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-F-Ph)	H	H
1-1333	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-F-Ph)	H	H
1-1334	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1335	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Br-Ph)	H	H
1-1336	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Me-Ph)	H	H
1-1337	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Me-Ph)	H	H
1-1338	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Et-Ph)	H	H
1-1339	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Et-Ph)	H	H
1-1340	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Pr-Ph)	H	H
1-1341	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1342	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPr-Ph)	H	H
1-1343	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPr-Ph)	H	H
1-1344	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Bu-Ph)	H	H
1-1345	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1346	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-CF_3-Ph)	H	H

1-1347	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1348	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1349	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1350	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-EtO-Ph)	H	H
1-1351	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1352	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-PrO-Ph)	H	H
1-1353	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1354	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPrO-Ph)	H	H
1-1355	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1356	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[3-(2-Et-PrO)Ph]	H	H
1-1357	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[4-(2-Et-PrO)Ph]	H	H
1-1358	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iBuO-Ph)	H	H
1-1359	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iBuO-Ph)	H	H
1-1360	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-MeS-Ph)	H	H
1-1361	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1362	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-EtS-Ph)	H	H
1-1363	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-EtS-Ph)	H	H
1-1364	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-PrS-Ph)	H	H
1-1365	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-PrS-Ph)	H	H
1-1366	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPrS-Ph)	H	H
1-1367	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPrS-Ph)	H	H
1-1368	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)Ph]	H	H
1-1369	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)Ph]	H	H
1-1370	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iBuS-Ph)	H	H
1-1371	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iBuS-Ph)	H	H
1-1372	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-cHx-Ph)	H	H
1-1373	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1374	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Ph-Ph)	H	H
1-1375	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Ph-Ph)	H	H

1-1376	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1377	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1378	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1379	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-OCH_2-cHx	H	H
1-1380	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-OCH_2-Ph	H	H
1-1381	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-OCH_2-cHx	H	H
1-1382	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-OCH_2-Ph	H	H
1-1383	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH_2-cHx	H	H
1-1384	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH_2-Ph	H	H
1-1385	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_2$-cHx	H	H
1-1386	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_2$-Ph	H	H
1-1387	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-cHx	H	H
1-1388	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-Ph	H	H
1-1389	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
1-1390	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H
1-1391	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H
1-1392	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H
1-1393	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1394	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1395	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1396	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1397	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1398	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1399	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
1-1400	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H
1-1401	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H
1-1402	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H
1-1403	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1404	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H

1-1405	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1406	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1407	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1408	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1409	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
1-1410	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H
1-1411	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H
1-1412	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H
1-1413	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1414	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1415	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1416	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1417	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-cHx-cHx)	H	H
1-1418	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Ph-cHx)	H	H
1-1419	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-1420	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H
1-1421	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Me-Ph)	H	H
1-1422	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Et-Ph)	H	H
1-1423	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1424	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1425	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1426	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1427	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-cHx-Ph)	H	H
1-1428	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Ph-Ph)	H	H
1-1429	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_6$-cHx	H	H
1-1430	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_6$-Ph	H	H
1-1431	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_7$-cHx	H	H
1-1432	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_7$-Ph	H	H
1-1433	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H

1-1434	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2-F-Ph	H	H
1-1435	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-3-F-Ph	H	H
1-1436	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2,3-diF-Ph	H	H
1-1437	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2-Cl-Ph	H	H
1-1438	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-3-Cl-Ph	H	H
1-1439	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2,3-diCl-Ph	H	H
1-1440	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2-Me-Ph	H	H
1-1441	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-3-Me-Ph	H	H
1-1442	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2,3-diMe-Ph	H	H
1-1443	H	H	H	Me	2	-4-[cHx-$(CH_2)_2O$]Ph	H	H
1-1444	H	H	H	Me	2	-3-[cHx-$(CH_2)_2O$]Ph	H	H
1-1445	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-1446	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H
1-1447	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H
1-1448	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H
1-1449	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H
1-1450	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H
1-1451	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H
1-1452	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H
1-1453	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H
1-1454	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H
1-1455	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-$(CH_2)_2O$]-Ph	H	H
1-1456	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-$(CH_2)_3O$]-Ph	H	H
1-1457	H	H	H	Et	2	-$(CH_2)_3$-cHx	H	H
1-1458	H	H	H	Et	2	-$(CH_2)_3$-Ph	H	H
1-1459	H	H	H	Et	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
1-1460	H	H	H	Et	2	-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
1-1461	H	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cPn	H	H
1-1462	H	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H

1-1463	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-cHx	Me	H
1-1464	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	Me
1-1465	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-cHx	F	H
1-1466	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	F
1-1467	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H
1-1468	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Cl-cHx)	H	H
1-1469	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Br-cHx)	H	H
1-1470	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H
1-1471	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H
1-1472	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Pr-cHx)	H	H
1-1473	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-iPr-cHx)	H	H
1-1474	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1475	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1476	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1477	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-PrO-cHx)	H	H
1-1478	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1479	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(3-MeS-cHx)	H	H
1-1480	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1481	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1482	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1483	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1484	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-1485	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	Me	H
1-1486	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	Me
1-1487	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	F	H
1-1488	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	F
1-1489	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H
1-1490	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1491	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Br-Ph)	H	H

1-1492	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-Me-Ph)	H	H
1-1493	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-Et-Ph)	H	H
1-1494	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-Pr-Ph)	H	H
1-1495	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPr-Ph)	H	H
1-1496	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-Bu-Ph)	H	H
1-1497	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1498	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-1499	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-1500	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrO-Ph)	H	H
1-1501	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1502	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeS-Ph)	H	H
1-1503	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-1504	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1505	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1506	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1507	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cPn	H	H
1-1508	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H
1-1509	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	Me	H
1-1510	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	Me
1-1511	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	F	H
1-1512	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	F
1-1513	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-cHx)	H	H
1-1514	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-cHx)	H	H
1-1515	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-cHx)	H	H
1-1516	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-cHx)	H	H
1-1517	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-cHx)	H	H
1-1518	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-cHx)	H	H
1-1519	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-cHx)	H	H
1-1520	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-cHx)	H	H

1-1521	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1522	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-1523	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-1524	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-cHx)	H	H
1-1525	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1526	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-cHx)	H	H
1-1527	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-cHx)	H	H
1-1528	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1529	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1530	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1531	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	H
1-1532	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	Me	H
1-1533	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	Me
1-1534	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	F	H
1-1535	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	F
1-1536	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-Ph)	H	H
1-1537	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-Ph)	H	H
1-1538	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-Ph)	H	H
1-1539	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-Ph)	H	H
1-1540	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-Ph)	H	H
1-1541	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-Ph)	H	H
1-1542	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-Ph)	H	H
1-1543	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-Ph)	H	H
1-1544	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1545	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-Ph)	H	H
1-1546	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-Ph)	H	H
1-1547	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-Ph)	H	H
1-1548	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1549	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-Ph)	H	H

1-1550	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-Ph)	H	H
1-1551	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1552	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1553	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1554	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_7-$cHx	H	H
1-1555	H	H	H	Et	2	$-(CH_2)_7-$Ph	H	H
1-1556	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-$cHx	H	H
1-1557	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-$Ph	H	H
1-1558	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$cHx	H	H
1-1559	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$Ph	H	H
1-1560	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$cPn	H	H
1-1561	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$cHx	H	H
1-1562	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$cHx	Me	H
1-1563	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$cHx	H	Me
1-1564	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$cHx	F	H
1-1565	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$cHx	H	F
1-1566	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-F-cHx)	H	H
1-1567	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-Cl-cHx)	H	H
1-1568	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-Br-cHx)	H	H
1-1569	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-Me-cHx)	H	H
1-1570	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-Et-cHx)	H	H
1-1571	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-Pr-cHx)	H	H
1-1572	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-iPr-cHx)	H	H
1-1573	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-Bu-cHx)	H	H
1-1574	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1575	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-MeO-cHx)	H	H
1-1576	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-EtO-cHx)	H	H
1-1577	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-PrO-cHx)	H	H
1-1578	H	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(4-iPrO-cHx)	H	H

1-1579	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-cHx)	H	H
1-1580	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1581	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1582	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1583	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1584	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H
1-1585	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	Me	H
1-1586	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	Me
1-1587	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	F	H
1-1588	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	F
1-1589	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H
1-1590	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1591	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-Ph)	H	H
1-1592	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H
1-1593	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H
1-1594	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1595	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-Ph)	H	H
1-1596	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1597	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1598	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1599	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1600	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1601	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1602	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-Ph)	H	H
1-1603	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1604	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1605	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1606	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1607	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cPn	H	H

1-1608	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
1-1609	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	Me	H
1-1610	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	Me
1-1611	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	F	H
1-1612	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	F
1-1613	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H
1-1614	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-cHx)	H	H
1-1615	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-cHx)	H	H
1-1616	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H
1-1617	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H
1-1618	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-cHx)	H	H
1-1619	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-cHx)	H	H
1-1620	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-cHx)	H	H
1-1621	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1622	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1623	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1624	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-cHx)	H	H
1-1625	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1626	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1627	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1628	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1629	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1630	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
1-1631	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	Me	H
1-1632	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	Me
1-1633	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	F	H
1-1634	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	F
1-1635	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H
1-1636	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H

1-1637	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-Ph)	H	H
1-1638	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H
1-1639	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H
1-1640	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1641	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-Ph)	H	H
1-1642	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1643	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1644	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1645	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1646	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1647	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1648	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeS-Ph)	H	H
1-1649	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1650	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1651	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1652	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1653	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
1-1654	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-1655	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H
1-1656	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H
1-1657	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH_2O-cHx	H	H
1-1658	H	H	H	Et	2	-C≡C-CH_2O-Ph	H	H
1-1659	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cPn	H	H
1-1660	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H
1-1661	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	Me	H
1-1662	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	Me
1-1663	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	F	H
1-1664	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	F
1-1665	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-(4-F-cHx)	H	H

1-1666	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-cHx)	H	H
1-1667	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-cHx)	H	H
1-1668	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-cHx)	H	H
1-1669	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-cHx)	H	H
1-1670	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-cHx)	H	H
1-1671	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-cHx)	H	H
1-1672	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-cHx)	H	H
1-1673	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-cHx)	H	H
1-1674	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-cHx)	H	H
1-1675	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-cHx)	H	H
1-1676	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-cHx)	H	H
1-1677	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-cHx)	H	H
1-1678	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeS-cHx)	H	H
1-1679	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-cHx)	H	H
1-1680	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-cHx)	H	H
1-1681	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-cHx)	H	H
1-1682	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-cHx)	H	H
1-1683	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H
1-1684	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	Me	H
1-1685	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	Me
1-1686	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	F	H
1-1687	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	F
1-1688	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-F-Ph)	H	H
1-1689	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1690	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-Ph)	H	H
1-1691	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-Ph)	H	H
1-1692	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-Ph)	H	H
1-1693	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-Ph)	H	H
1-1694	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-Ph)	H	H

1-1695	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-Ph)	H	H
1-1696	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1697	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1698	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-Ph)	H	H
1-1699	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-Ph)	H	H
1-1700	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-Ph)	H	H
1-1701	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1702	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1703	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1704	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1705	H	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H
1-1706	H	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H
1-1707	H	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
1-1708	H	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
1-1709	H	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
1-1710	H	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-1711	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
1-1712	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
1-1713	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
1-1714	H	H	H	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-1715	H	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H
1-1716	H	H	H	Et	2	-4-[cHx-$(CH_2)_2$O]Ph	H	H
1-1717	H	H	H	Et	2	-4-[cHx-$(CH_2)_3$O]Ph	H	H
1-1718	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-1719	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H
1-1720	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H
1-1721	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H
1-1722	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H
1-1723	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H

1-1724	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H
1-1725	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H
1-1726	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H
1-1727	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H
1-1728	H	H	H	Et	2	-4-[Ph-$(CH_2)_2$O]-Ph	H	H
1-1729	H	H	H	Et	2	-4-[Ph-$(CH_2)_3$O]-Ph	H	H
1-1730	H	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
1-1731	H	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
1-1732	H	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_6$-cHx	H	H
1-1733	H	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_6$-Ph	H	H
1-1734	H	H	H	Pr	2	-C≡C-CH_2-cHx	H	H
1-1735	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H
1-1736	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H
1-1737	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
1-1738	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
1-1739	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	H
1-1740	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H
1-1741	H	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H
1-1742	H	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
1-1743	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-F-Ph)	H	H
1-1744	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1745	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1746	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-Cl-Ph)	H	H
1-1747	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1748	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1749	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1750	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-Me-Ph)	H	H
1-1751	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1752	H	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H

1-1753	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(3-CF_3-Ph)$	H	H
1-1754	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(3,4-diCF_3-Ph)$	H	H
1-1755	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(3,5-diCF_3-Ph)$	H	H
1-1756	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(3-MeO-Ph)$	H	H
1-1757	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(3,4-diMeO-Ph)$	H	H
1-1758	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(3,5-diMeO-Ph)$	H	H
1-1759	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(3,4,5-triMeO-Ph)$	H	H
1-1760	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(3-Ac-Ph)$	H	H
1-1761	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-(4-Ac-Ph)$	H	H
1-1762	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diF-Ph)$	H	H
1-1763	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diF-Ph)$	H	H
1-1764	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Cl-Ph)$	H	H
1-1765	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diCl-Ph)$	H	H
1-1766	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diCl-Ph)$	H	H
1-1767	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diCF_3-Ph)$	H	H
1-1768	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diCF_3-Ph)$	H	H
1-1769	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diMeO-Ph)$	H	H
1-1770	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diMeO-Ph)$	H	H
1-1771	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4,5-triMeO-Ph)$	H	H
1-1772	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-Ac-Ph)$	H	H
1-1773	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Ac-Ph)$	H	H
1-1774	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3-F-Ph)$	H	H
1-1775	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,4-diF-Ph)$	H	H
1-1776	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,5-diF-Ph)$	H	H
1-1777	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3-Me-Ph)$	H	H
1-1778	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,4-diMe-Ph)$	H	H
1-1779	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,5-diMe-Ph)$	H	H
1-1780	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3-CF_3-Ph)$	H	H
1-1781	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,4-diCF_3-Ph)$	H	H

1-1782	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,5-diCF_3-Ph)$	H	H
1-1783	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3-MeO-Ph)$	H	H
1-1784	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,4-diMeO-Ph)$	H	H
1-1785	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,5-diMeO-Ph)$	H	H
1-1786	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3,4,5-triMeO-Ph)$	H	H
1-1787	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(3-Ac-Ph)$	H	H
1-1788	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-(4-Ac-Ph)$	H	H
1-1789	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-(3,4-diF-Ph)$	H	H
1-1790	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-(3,5-diF-Ph)$	H	H
1-1791	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-(3,4-diMeO-Ph)$	H	H
1-1792	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-(3,5-diMeO-Ph)$	H	H
1-1793	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-(3,4,5-triMeO-Ph)$	H	H
1-1794	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-(3-Ac-Ph)$	H	H
1-1795	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-(4-Ac-Ph)$	H	H
1-1796	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3-F-Ph)$	H	H
1-1797	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,4-diF-Ph)$	H	H
1-1798	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,5-diF-Ph)$	H	H
1-1799	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3-Cl-Ph)$	H	H
1-1800	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(4-Cl-Ph)$	H	H
1-1801	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,4-diCl-Ph)$	H	H
1-1802	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,5-diCl-Ph)$	H	H
1-1803	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3-Me-Ph)$	H	H
1-1804	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,4-diMe-Ph)$	H	H
1-1805	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,5-diMe-Ph)$	H	H
1-1806	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3-CF_3-Ph)$	H	H
1-1807	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,4-diCF_3-Ph)$	H	H
1-1808	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,5-diCF_3-Ph)$	H	H
1-1809	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3-MeO-Ph)$	H	H
1-1810	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-(3,4-diMeO-Ph)$	H	H

1-1811	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1812	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1813	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(3-Ac-Ph)	H	H
1-1814	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Ac-Ph)	H	H
1-1815	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1816	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1817	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Cl-Ph)	H	H
1-1818	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1819	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1820	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H
1-1821	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H
1-1822	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1823	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1824	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1825	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Ac-Ph)	H	H
1-1826	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Ac-Ph)	H	H
1-1827	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-F-Ph)	H	H
1-1828	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1829	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1830	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-Cl-Ph)	H	H
1-1831	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1832	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1833	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1834	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-Me-Ph)	H	H
1-1835	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
1-1836	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1837	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1838	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-1839	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H

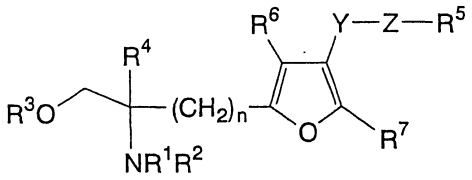
1-1840	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H
1-1841	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1842	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1843	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1844	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1845	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-Ac-Ph)	H	H
1-1846	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Ac-Ph)	H	H
1-1847	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-CO_2H-Ph)	H	H
1-1848	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1849	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1850	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3-Cl-Ph)	H	H
1-1851	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1852	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1853	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H
1-1854	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H
1-1855	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1856	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1857	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1858	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3-Ac-Ph)	H	H
1-1859	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(4-Ac-Ph)	H	H
1-1860	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-F-Ph)	H	H
1-1861	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H
1-1862	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1863	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1864	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-Cl-Ph)	H	H
1-1865	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1866	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1867	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1868	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-Me-Ph)	H	H

1-1869	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H
1-1870	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1871	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1872	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-Et-Ph)	H	H
1-1873	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H
1-1874	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-1875	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1876	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H
1-1877	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H
1-1878	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1879	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1880	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1881	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1882	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1883	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1884	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-Ac-Ph)	H	H
1-1885	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-Ac-Ph)	H	H
1-1886	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-F-Ph)	H	H
1-1887	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1888	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1889	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-Cl-Ph)	H	H
1-1890	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1891	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1892	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1893	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-Me-Ph)	H	H
1-1894	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1895	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1896	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-1897	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H

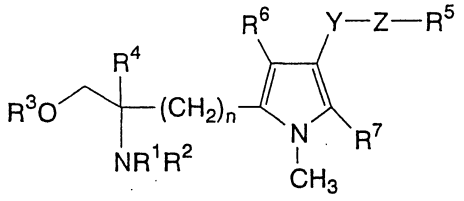
1-1898	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H
1-1899	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1900	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1901	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1902	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1903	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-Ac-Ph)	H	H
1-1904	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Ac-Ph)	H	H
1-1905	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-F-Ph)	H	H
1-1906	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H
1-1907	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1908	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1909	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-Cl-Ph)	H	H
1-1910	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1911	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1912	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1913	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-Me-Ph)	H	H
1-1914	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H
1-1915	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1916	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1917	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-Et-Ph)	H	H
1-1918	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H
1-1919	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-1920	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H
1-1921	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H
1-1922	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H
1-1923	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1924	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H
1-1925	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1926	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H

1-1927	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1928	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H
1-1929	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-Ac-Ph)	H	H
1-1930	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-Ac-Ph)	H	H
1-1931	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-F-Ph)	H	H
1-1932	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diF-Ph)	H	H
1-1933	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diF-Ph)	H	H
1-1934	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-Cl-Ph)	H	H
1-1935	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H
1-1936	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diCl-Ph)	H	H
1-1937	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diCl-Ph)	H	H
1-1938	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-Me-Ph)	H	H
1-1939	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
1-1940	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
1-1941	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-Ph)	H	H
1-1942	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H
1-1943	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H
1-1944	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-MeO-Ph)	H	H
1-1945	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H
1-1946	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H
1-1947	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H
1-1948	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-Ac-Ph)	H	H
1-1949	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Ac-Ph)	H	H

表 2

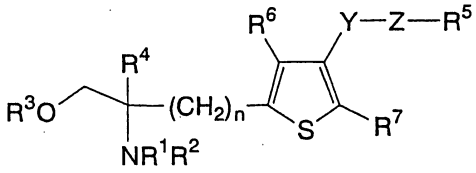


(Ib-1)



(Ib-2)

或



(Ib-3)

化合物	R^1	R^2	R^3	R^4	n	-Y-Z-R^5	R^6	R^7
2- 1	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-cHx	H	H
2- 2	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-Ph	H	H
2- 3	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H
2- 4	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H
2- 5	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cPn	H	H
2- 6	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H
2- 7	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	Me	H
2- 8	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	Me
2- 9	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	F	H
2-10	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	F
2-11	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H

2-12	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Cl-cHx)	H	H
2-13	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Br-cHx)	H	H
2-14	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Me-cHx)	H	H
2-15	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Et-cHx)	H	H
2-16	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Pr-cHx)	H	H
2-17	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPr-cHx)	H	H
2-18	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-CF_3-cHx)	H	H
2-19	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeO-cHx)	H	H
2-20	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtO-cHx)	H	H
2-21	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrO-cHx)	H	H
2-22	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrO-cHx)	H	H
2-23	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeS-cHx)	H	H
2-24	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeS-cHx)	H	H
2-25	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(2,4-diMe-cHx)	H	H
2-26	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-27	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-28	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	H
2-29	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	Me	H
2-30	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	Me
2-31	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	F	H
2-32	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	F
2-33	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-F-Ph)	H	H
2-34	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Cl-Ph)	H	H
2-35	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Br-Ph)	H	H
2-36	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Me-Ph)	H	H
2-37	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Et-Ph)	H	H
2-38	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Pr-Ph)	H	H
2-39	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPr-Ph)	H	H
2-40	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Bu-Ph)	H	H

2-41	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-CF_3-Ph)$	H	H
2-42	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-MeO-Ph)$	H	H
2-43	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-EtO-Ph)$	H	H
2-44	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-PrO-Ph)$	H	H
2-45	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iPrO-Ph)$	H	H
2-46	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3-MeS-Ph)$	H	H
2-47	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-MeS-Ph)$	H	H
2-48	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(2,4-diMe-Ph)$	H	H
2-49	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,4-diMe-Ph)$	H	H
2-50	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(3,5-diMe-Ph)$	H	H
2-51	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cPn$	H	H
2-52	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	H
2-53	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	Me	H
2-54	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	Me
2-55	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	F	H
2-56	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-cHx$	H	F
2-57	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-F-cHx)$	H	H
2-58	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Cl-cHx)$	H	H
2-59	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Br-cHx)$	H	H
2-60	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Me-cHx)$	H	H
2-61	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Et-cHx)$	H	H
2-62	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Pr-cHx)$	H	H
2-63	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-iPr-cHx)$	H	H
2-64	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-Bu-cHx)$	H	H
2-65	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-CF_3-cHx)$	H	H
2-66	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-MeO-cHx)$	H	H
2-67	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-EtO-cHx)$	H	H
2-68	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-PrO-cHx)$	H	H
2-69	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-(4-iPrO-cHx)$	H	H

2-70	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-cHx)	H	H
2-71	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-cHx)	H	H
2-72	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(2,4-diMe-cHx)	H	H
2-73	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-74	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-75	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H
2-76	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	Me	H
2-77	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	Me
2-78	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	F	H
2-79	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	F
2-80	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-Ph)	H	H
2-81	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-Ph)	H	H
2-82	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-Ph)	H	H
2-83	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-Ph)	H	H
2-84	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-Ph)	H	H
2-85	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-Ph)	H	H
2-86	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-Ph)	H	H
2-87	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-Ph)	H	H
2-88	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-Ph)	H	H
2-89	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-Ph)	H	H
2-90	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-Ph)	H	H
2-91	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-Ph)	H	H
2-92	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-Ph)	H	H
2-93	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-Ph)	H	H
2-94	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-Ph)	H	H
2-95	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-96	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-97	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-98	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-$cHx	H	H

2-99	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7-Ph$	H	H
2-100	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8-cHx$	H	H
2-101	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8-Ph$	H	H
2-102	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-CH_2-cHx$	H	H
2-103	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-CH_2-Ph$	H	H
2-104	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H
2-105	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H
2-106	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cPn$	H	H
2-107	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H
2-108	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	Me	H
2-109	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	Me
2-110	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	F	H
2-111	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	F
2-112	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-F-cHx)$	H	H
2-113	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Cl-cHx)$	H	H
2-114	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Br-cHx)$	H	H
2-115	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Me-cHx)$	H	H
2-116	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Et-cHx)$	H	H
2-117	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Pr-cHx)$	H	H
2-118	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-iPr-cHx)$	H	H
2-119	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Bu-cHx)$	H	H
2-120	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-CF_3-cHx)$	H	H
2-121	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-MeO-cHx)$	H	H
2-122	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-EtO-cHx)$	H	H
2-123	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-PrO-cHx)$	H	H
2-124	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-iPrO-cHx)$	H	H
2-125	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-MeS-cHx)$	H	H
2-126	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-MeS-cHx)$	H	H
2-127	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(2,4-diMe-cHx)$	H	H

2-128	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-129	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-130	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H
2-131	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	Me	H
2-132	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	Me
2-133	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	F	H
2-134	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	F
2-135	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H
2-136	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H
2-137	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-Ph)	H	H
2-138	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H
2-139	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H
2-140	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-Ph)	H	H
2-141	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-Ph)	H	H
2-142	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-Ph)	H	H
2-143	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H
2-144	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H
2-145	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-Ph)	H	H
2-146	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-Ph)	H	H
2-147	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-Ph)	H	H
2-148	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-Ph)	H	H
2-149	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H
2-150	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-151	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-152	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-153	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cPn	H	H
2-154	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
2-155	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	Me	H
2-156	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	Me

2-157	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	F	H
2-158	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	F
2-159	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H
2-160	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-cHx)	H	H
2-161	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-cHx)	H	H
2-162	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H
2-163	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H
2-164	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-cHx)	H	H
2-165	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-cHx)	H	H
2-166	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-cHx)	H	H
2-167	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H
2-168	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H
2-169	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H
2-170	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-cHx)	H	H
2-171	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-cHx)	H	H
2-172	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H
2-173	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-cHx)	H	H
2-174	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-175	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-176	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
2-177	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	Me	H
2-178	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	Me
2-179	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	F	H
2-180	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	F
2-181	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H
2-182	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H
2-183	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-Ph)	H	H
2-184	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H
2-185	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H

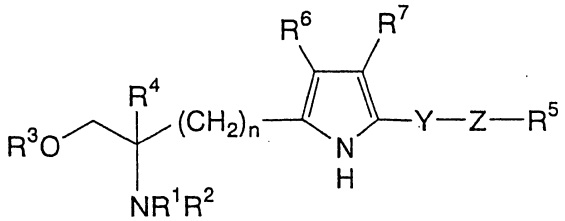
2-186	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-Ph)	H	H
2-187	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-Ph)	H	H
2-188	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-Ph)	H	H
2-189	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H
2-190	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H
2-191	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H
2-192	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-Ph)	H	H
2-193	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-Ph)	H	H
2-194	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeS-Ph)	H	H
2-195	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H
2-196	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-197	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-198	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-199	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
2-200	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
2-201	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H
2-202	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H
2-203	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2O-cHx	H	H
2-204	H	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2O-Ph	H	H
2-205	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cPn	H	H
2-206	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H
2-207	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	Me	H
2-208	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	Me
2-209	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	F	H
2-210	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	F
2-211	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-(4-F-cHx)	H	H
2-212	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-(4-Cl-cHx)	H	H
2-213	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-(4-Br-cHx)	H	H
2-214	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-(4-Me-cHx)	H	H

2-215	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-cHx)	H	H
2-216	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-cHx)	H	H
2-217	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-cHx)	H	H
2-218	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-cHx)	H	H
2-219	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-cHx)	H	H
2-220	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-cHx)	H	H
2-221	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-cHx)	H	H
2-222	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-cHx)	H	H
2-223	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-cHx)	H	H
2-224	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeS-cHx)	H	H
2-225	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-cHx)	H	H
2-226	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-cHx)	H	H
2-227	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-cHx)	H	H
2-228	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-cHx)	H	H
2-229	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H
2-230	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	Me	H
2-231	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	Me
2-232	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	F	H
2-233	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	F
2-234	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-F-Ph)	H	H
2-235	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-Ph)	H	H
2-236	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-Ph)	H	H
2-237	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-Ph)	H	H
2-238	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-Ph)	H	H
2-239	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-Ph)	H	H
2-240	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-Ph)	H	H
2-241	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-Ph)	H	H
2-242	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-Ph)	H	H
2-243	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-Ph)	H	H

2-244	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-Ph)	H	H
2-245	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-Ph)	H	H
2-246	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-Ph)	H	H
2-247	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-Ph)	H	H
2-248	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-Ph)	H	H
2-249	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-Ph)	H	H
2-250	H	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-Ph)	H	H
2-251	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
2-252	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
2-253	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
2-254	H	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
2-255	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
2-256	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H
2-257	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
2-258	H	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-Ph	H	H
2-259	H	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H
2-260	H	H	H	Me	2	-4-[cHx-$(CH_2)_2$O]Ph	H	H
2-261	H	H	H	Me	2	-4-[cHx-$(CH_2)_3$O]Ph	H	H
2-262	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
2-263	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H
2-264	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H
2-265	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H
2-266	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H
2-267	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H
2-268	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H
2-269	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H
2-270	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H
2-271	H	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H
2-272	H	H	H	Me	2	-4-[Ph-$(CH_2)_2$O]-Ph	H	H

2-273	H	H	H	Me	2	-3-[cHx-$(CH_2)_2O$]-Ph	H	H
2-274	H	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
2-275	H	H	H	Et	2	-$(CH_2)_6$-cHx	H	H
2-276	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H
2-277	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
2-278	H	H	H	Et	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H
2-279	H	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
2-280	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H
2-281	H	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-Ph	H	H
2-282	H	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H
2-283	H	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_6$-cHx	H	H
2-284	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H
2-285	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H
2-286	H	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H
2-287	H	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H
2-288	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H
2-289	H	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-Ph	H	H

表 3

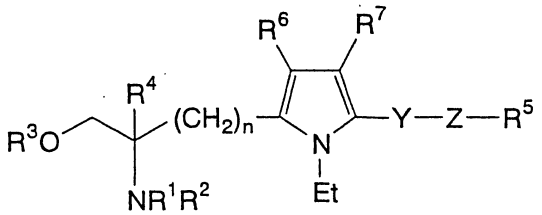


(Ia-4)

化合物	R^1	R^2	R^3	R^4	n	-Y-Z-R^5	R^6	R^7

3-1	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-cHx$	H	H
3-2	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H
3-3	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H
3-4	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H
3-5	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H
3-6	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H
3-7	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H
3-8	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H
3-9	H	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3-cHx$	H	H
3-10	H	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3-Ph$	H	H
3-11	H	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H
3-12	H	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H

表 4

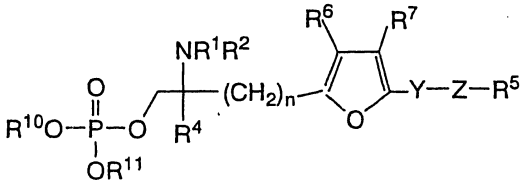


(Ia-5)

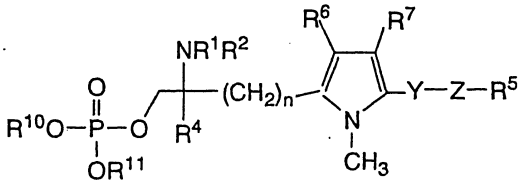
化合物	R^1	R^2	R^3	R^4	n	$-Y-Z-R^5$	R^6	R^7
4-1	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-cHx$	H	H
4-2	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H
4-3	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H
4-4	H	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H
4-5	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H

4-6	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H
4-7	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H
4-8	H	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H
4-9	H	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3-cHx$	H	H
4-10	H	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3-Ph$	H	H
4-11	H	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H
4-12	H	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H

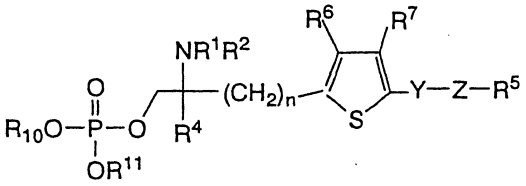
表 5



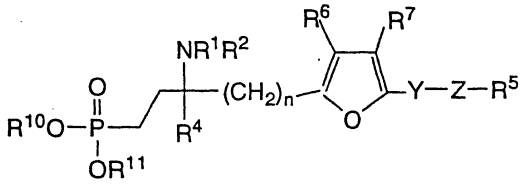
(IIa-1)



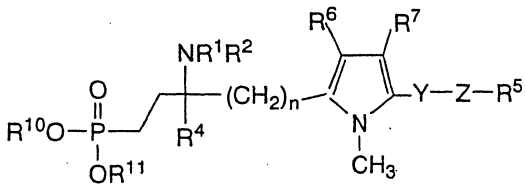
(IIa-2)



(IIa-3)

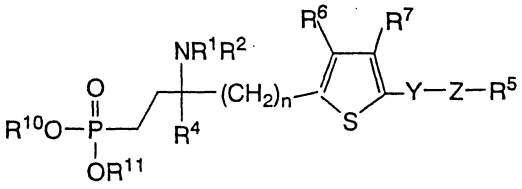


(IIIa-1)



(IIIa-2)

或



(IIIa-3)

化合物	R^1	R^2	R^4	n	$-Y-Z-R^5$	R^6	R^7	R^{10}	R^{11}
5-1	H	H	Me	1	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H

5-2	H	H	Me	1	$-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
5-3	H	H	Me	1	$-CH=CH-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-4	H	H	Me	1	$-CH=CH-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-5	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-6	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-7	H	H	Me	1	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-8	H	H	Me	1	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-9	H	H	Me	1	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-10	H	H	Me	1	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-11	H	H	Me	1	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H	H	H
5-12	H	H	Me	1	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-13	H	H	Me	1	$-C\equiv C-CH_2O-cPn$	H	H	H	H
5-14	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cPn$	H	H	H	H
5-15	H	H	Me	1	$-C\equiv C-CH_2O-cHx$	H	H	H	H
5-16	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
5-17	H	H	Me	1	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
5-18	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-Ph$	H	H	H	H
5-19	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-20	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-21	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-22	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-23	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-24	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-25	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-26	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-27	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-28	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-29	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-30	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H

5-31	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-32	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$Ph	H	H	H	H
5-33	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_2-$Ph	H	H	H	H
5-34	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$Ph	H	H	H	H
5-35	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$Ph	H	H	H	H
5-36	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-37	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-38	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-39	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-40	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-41	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-42	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-43	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-44	H	H	Me	2	$-(CH_2)_2-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-45	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$cHx	H	H	H	H
5-46	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_3-$cHx	H	H	H	H
5-47	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$cHx	H	H	H	H
5-48	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$cHx	H	H	H	H
5-49	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-50	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-51	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-52	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-53	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-54	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-55	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-56	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-57	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-58	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-$Ph	H	H	H	H
5-59	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_3-$Ph	H	H	H	H

5-60	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-61	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-62	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-63	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-64	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-65	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-66	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-67	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-68	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-69	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-70	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-71	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-72	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-73	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-74	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-75	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-76	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-77	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-78	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-79	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-80	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-81	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-82	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-83	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-84	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-85	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-86	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-87	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-88	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H	H	H

5-89	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-90	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-91	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-92	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-93	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-94	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-95	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-96	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-97	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cPn	H	H	H	H
5-98	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cHx	H	H	H	H
5-99	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cHx	Me	H	H	H
5-100	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cHx	H	Me	H	H
5-101	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cHx	F	H	H	H
5-102	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cHx	H	F	H	H
5-103	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_5-$cHx	H	H	H	H
5-104	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cHx	H	H	H	H
5-105	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$cHx	H	H	H	H
5-106	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-107	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-108	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-109	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-110	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-111	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-112	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-113	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-114	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-115	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-116	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-117	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Bu-cHx)	H	H	H	H

5-118	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-119	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-120	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-121	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-122	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-123	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-124	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-125	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-126	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-127	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-128	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-129	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-130	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-131	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-132	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-133	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-134	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-135	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-136	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-137	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-138	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-139	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-140	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-141	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-142	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-143	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-144	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-145	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-146	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H

5-147	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-148	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-149	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-150	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-151	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-152	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-153	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-Ph	Me	H	H	H
5-154	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	Me	H	H
5-155	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-Ph	F	H	H	H
5-156	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	F	H	H
5-157	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-158	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-159	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-160	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-161	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-162	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-163	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-164	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-165	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-166	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-167	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-168	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-169	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-170	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-171	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-172	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-173	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-174	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-175	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H

5-176	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-177	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-178	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-179	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-180	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-181	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-182	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-183	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-184	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-185	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-186	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-187	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-188	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-189	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-190	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-191	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-192	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-193	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-194	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-195	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-196	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-197	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-198	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-199	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-200	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-201	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-202	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-203	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-204	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H

5-205	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-206	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-207	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Np(1)	H	H	H	H
5-208	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Np(2)	H	H	H	H
5-209	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cPn	H	H	H	H
5-210	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
5-211	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	Me	H	H	H
5-212	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	Me	H	H
5-213	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	F	H	H	H
5-214	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	F	H	H
5-215	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
5-216	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
5-217	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
5-218	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-219	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-220	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-221	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-222	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-223	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-224	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-225	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-226	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-227	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-228	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-229	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-230	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-231	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-232	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-233	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeO-cHx)	H	H	H	H

5-234	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-235	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-236	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-237	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-238	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-239	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-240	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-241	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-242	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-243	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-244	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-245	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-246	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-247	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-248	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-249	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-250	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-251	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-252	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-253	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-254	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-255	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-256	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-257	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-258	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-259	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-260	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-261	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-262	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H

5-263	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-264	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H	H	H
5-265	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	Me	H	H	H
5-266	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	Me	H	H
5-267	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	F	H	H	H
5-268	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	F	H	H
5-269	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H	H	H
5-270	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H	H	H
5-271	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H	H	H
5-272	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-273	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-274	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-275	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-276	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-277	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-278	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-279	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-280	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-281	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-282	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-283	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-284	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-285	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-286	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-287	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-288	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-289	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-290	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-291	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H

5-292	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-293	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-294	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-295	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-296	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-297	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-298	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-299	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-300	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-301	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-302	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-303	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-304	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-305	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-306	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-307	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-308	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-309	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-310	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-311	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-312	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-313	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-314	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-315	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-316	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-317	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-318	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-319	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Np(1)	H	H	H	H
5-320	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Np(2)	H	H	H	H

5-321	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-cHx	H	H	H	H
5-322	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-cHx	H	H	H	H
5-323	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-cHx	H	H	H	H
5-324	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-cHx	H	H	H	H
5-325	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-326	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-327	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-328	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-329	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-330	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-331	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-332	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-333	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-334	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-Ph	H	H	H	H
5-335	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_7$-Ph	H	H	H	H
5-336	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-Ph	H	H	H	H
5-337	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-Ph	H	H	H	H
5-338	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-339	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-340	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-341	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-342	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-343	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-344	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-345	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-346	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-347	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-cHx	H	H	H	H
5-348	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_8$-cHx	H	H	H	H
5-349	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-cHx	H	H	H	H

5-350	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-cHx	H	H	H	H
5-351	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-352	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-353	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-354	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-355	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-356	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-357	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-358	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-359	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-360	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-Ph	H	H	H	H
5-361	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_8$-Ph	H	H	H	H
5-362	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-Ph	H	H	H	H
5-363	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-Ph	H	H	H	H
5-364	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-365	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-366	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-367	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-368	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-369	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-370	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-371	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-372	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-373	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-O-cHx	H	H	H	H
5-374	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_3$-O-cHx	H	H	H	H
5-375	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-O-cHx	H	H	H	H
5-376	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-O-cHx	H	H	H	H
5-377	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-378	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3$-O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H

5-379	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-380	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-381	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-382	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-383	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-384	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-385	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-386	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$Ph	H	H	H	H
5-387	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$Ph	H	H	H	H
5-388	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$Ph	H	H	H	H
5-389	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$Ph	H	H	H	H
5-390	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-391	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-392	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-393	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-394	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-395	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-396	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-397	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-398	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-399	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cPn	H	H	H	H
5-400	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	H	H	H
5-401	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	Me	H	H	H
5-402	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	Me	H	H
5-403	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	F	H	H	H
5-404	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	F	H	H
5-405	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	H	H	H
5-406	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	H	H	H
5-407	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$cHx	H	H	H	H

5-408	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-409	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-410	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-411	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-412	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-413	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-414	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-415	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-416	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-417	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-418	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-419	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-420	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-421	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-422	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-423	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-424	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-425	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-426	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-427	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-428	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-429	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-430	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-431	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-432	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-433	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-434	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-435	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-436	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H

5-437	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-438	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-439	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-440	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-441	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-442	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-443	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-444	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-445	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-446	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-447	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-448	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-449	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-450	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-451	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-452	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-453	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-454	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	H	H	H
5-455	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	Me	H	H	H
5-456	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	Me	H	H
5-457	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	F	H	H	H
5-458	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	F	H	H
5-459	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	H	H	H
5-460	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	H	H	H
5-461	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$Ph	H	H	H	H
5-462	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-463	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-464	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-465	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Br-Ph)	H	H	H	H

5-466	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-467	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-468	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-469	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-470	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-471	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-472	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-473	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-474	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-475	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-476	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-477	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-478	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-479	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-480	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-481	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-482	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-483	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-484	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-485	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-486	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-487	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-488	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-489	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-490	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-491	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-492	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-493	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-494	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-PrS-Ph)	H	H	H	H

5-495	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-496	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-497	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-498	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-499	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-500	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-501	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-502	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-503	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-504	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-505	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-506	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-507	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-508	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-509	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-O-$cHx	H	H	H	H
5-510	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-O-$Ph	H	H	H	H
5-511	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-O-$cHx	H	H	H	H
5-512	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-O-$Ph	H	H	H	H
5-513	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-514	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-515	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-516	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-517	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-518	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-519	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-520	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-521	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-522	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-523	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H

5-524	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-525	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-526	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-527	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-528	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-529	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-530	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-531	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-532	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-533	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-534	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-535	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-536	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-537	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-538	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-OCH_2-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-539	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cPn	H	H	H	H
5-540	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-541	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	Me	H	H	H
5-542	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	Me	H	H
5-543	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	F	H	H	H
5-544	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	F	H	H
5-545	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-546	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-547	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-548	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-549	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-550	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-551	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-552	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Me-cHx)	H	H	H	H

5-553	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-554	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-555	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-556	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-557	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-558	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-559	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-560	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-561	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-562	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-563	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-564	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-565	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-566	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-567	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-568	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-569	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-570	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-571	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-572	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-573	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-574	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-575	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-576	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-577	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-578	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-579	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-580	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-581	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H

5-582	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-583	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-584	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-585	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-586	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-587	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-588	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-589	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-590	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-591	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-592	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-593	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-594	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-595	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	Me	H	H	H
5-596	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	H	Me	H	H
5-597	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	F	H	H	H
5-598	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	H	F	H	H
5-599	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-600	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-601	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-602	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-603	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-604	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-605	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-606	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-607	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-608	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-609	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-610	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Pr-Ph)	H	H	H	H

5-611	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-612	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-613	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-614	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-615	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-616	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-617	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-618	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-619	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-620	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-621	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-622	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-623	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-624	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-625	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-626	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-627	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-628	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-629	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-630	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-631	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-632	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-633	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-634	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-635	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-636	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-637	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-638	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-639	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H

5-640	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-641	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-642	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-643	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-644	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-645	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-646	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-647	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-648	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-OCH_2-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-649	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-650	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-651	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-OCH_2-$cHx	H	H	H	H
5-652	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-OCH_2-$Ph	H	H	H	H
5-653	H	H	Me	2	-CH=CH-cHx	H	H	H	H
5-654	H	H	Me	2	-CH=CH-Ph	H	H	H	H
5-655	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_2-$cHx	H	H	H	H
5-656	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_2-$Ph	H	H	H	H
5-657	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$cHx	H	H	H	H
5-658	H	Me	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$cHx	H	H	H	H
5-659	CO_2Me	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$cHx	H	H	H	H
5-660	CO_2Et	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$cHx	H	H	H	H
5-661	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-662	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-663	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-664	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-665	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-666	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-667	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-668	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-$(4-cHx-cHx)	H	H	H	H

5-669	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-670	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-671	H	Me	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-672	CO_2Me	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-673	CO_2Et	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-674	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-675	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-676	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-677	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-678	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-679	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-680	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-681	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-682	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-683	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-684	H	Me	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-685	CO_2Me	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-686	CO_2Et	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-687	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-688	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-689	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-690	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-691	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-692	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-693	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-694	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-695	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-696	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-697	H	Me	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H

5-698	CO_2Me	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-699	CO_2Et	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-700	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-701	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-702	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-703	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-704	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-705	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-706	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-707	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-708	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-$(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-709	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-710	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-711	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
5-712	H	H	Me	2	$-CH=CH-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
5-713	H	H	Me	2	$-C=C-CH_2O-cHx$	H	H	H	H
5-714	H	H	Me	2	$-C=C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
5-715	H	H	Me	2	$-C=C-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
5-716	H	H	Me	2	$-C=C-(CH_2)_2O-Ph$	H	H	H	H
5-717	H	H	Me	2	$-C\equiv C-cHx$	H	H	H	H
5-718	H	Me	Me	2	$-C\equiv C-cHx$	H	H	H	H
5-719	CO_2Me	H	Me	2	$-C\equiv C-cHx$	H	H	H	H
5-720	CO_2Et	H	Me	2	$-C\equiv C-cHx$	H	H	H	H
5-721	H	H	Me	2	$-C\equiv C-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-722	H	H	Me	2	$-C\equiv C-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-723	H	H	Me	2	$-C\equiv C-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-724	H	H	Me	2	$-C\equiv C-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-725	H	H	Me	2	$-C\equiv C-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-726	H	H	Me	2	$-C\equiv C-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H

5-727	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-728	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-729	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-730	H	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H	H	H
5-731	H	Me	Me	2	-C≡C-Ph	H	H	H	H
5-732	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H	H	H
5-733	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-Ph	H	H	H	H
5-734	H	H	Me	2	-C≡C-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-735	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-736	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-737	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-738	H	H	Me	2	-C≡C-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-739	H	H	Me	2	-C≡C-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-740	H	H	Me	2	-C≡C-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-741	H	H	Me	2	-C≡C-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-742	H	H	Me	2	-C≡C-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-743	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
5-744	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
5-745	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
5-746	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
5-747	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-748	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-749	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-750	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-751	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-752	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-753	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-754	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-755	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H

5-756	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
5-757	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
5-758	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
5-759	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
5-760	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-761	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-762	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-763	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-764	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-765	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-766	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-767	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-768	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-769	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cPn	H	H	H	H
5-770	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-771	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	Me	H	H	H
5-772	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	Me	H	H
5-773	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	F	H	H	H
5-774	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	F	H	H
5-775	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-776	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-777	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-778	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-779	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-780	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-781	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-782	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-783	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-784	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Et-cHx)	H	H	H	H

5-785	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-786	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-787	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-788	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-789	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-790	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-791	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-792	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-793	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-794	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-795	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-796	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-797	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-798	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-799	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-800	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-801	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-802	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-803	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-804	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-805	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-806	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-807	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-808	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-809	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-810	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-811	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-812	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-813	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H

5-814	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-815	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-816	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-817	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-818	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-819	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-820	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-821	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-822	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-823	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-824	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-825	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	Me	H	H	H
5-826	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	Me	H	H
5-827	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	F	H	H	H
5-828	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	F	H	H
5-829	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-830	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-831	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-832	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-833	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-834	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-835	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-836	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-837	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-838	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-839	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-840	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-841	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-842	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPr-Ph)	H	H	H	H

5-843	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-844	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-845	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-846	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-847	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-848	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-849	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-850	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-851	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-852	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-853	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-854	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-855	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-856	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-857	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-858	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-859	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-860	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-861	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-862	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-863	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-864	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-865	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-866	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-867	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
-868	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
869	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
'0	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H

5-872	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-873	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-874	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-875	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-876	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-877	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-878	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-879	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Np(1)	H	H	H	H
5-880	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Np(2)	H	H	H	H
5-881	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cPn	H	H	H	H
5-882	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-883	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	Me	H	H	H
5-884	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	Me	H	H
5-885	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	F	H	H	H
5-886	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	F	H	H
5-887	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-888	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-889	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-890	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-891	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-892	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-893	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-894	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-895	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-896	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-897	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-898	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-899	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-900	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H

5-901	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-902	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-903	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-904	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-905	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-906	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-907	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-908	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-909	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-910	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-911	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-912	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-913	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-914	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-915	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-916	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-917	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-918	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-919	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-920	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-921	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-922	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-923	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-924	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-925	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-926	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-927	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-928	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-929	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-cHx-cHx)	H	H	H	H

5-930	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-931	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-932	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-933	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-934	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-935	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-936	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-937	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	Me	H	H	H
5-938	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	Me	H	H
5-939	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	F	H	H	H
5-940	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	F	H	H
5-941	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-942	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-943	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-944	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-945	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-946	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-947	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-948	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-949	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-950	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-951	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-952	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-953	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-954	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-955	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-956	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-957	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-958	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H

5-959	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-960	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-961	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-962	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-963	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-964	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-965	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-966	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-967	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-968	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-969	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-970	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-971	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-972	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-973	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-974	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-975	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-976	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-977	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-978	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-979	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-980	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-981	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-982	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-983	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-984	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-985	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-986	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-987	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H

5-988	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-989	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-990	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-991	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Np(1)	H	H	H	H
5-992	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Np(2)	H	H	H	H
5-993	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-994	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-995	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-996	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-997	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-998	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-999	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1000	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1001	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1002	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1003	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1004	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1005	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1006	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1007	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1008	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1009	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1010	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1011	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1012	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1013	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1014	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1015	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1016	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H

5-1017	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1018	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1019	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-1020	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-1021	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-1022	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-1023	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1024	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1025	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1026	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1027	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1028	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1029	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1030	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1031	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1032	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1033	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1034	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1035	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1036	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1037	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1038	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1039	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1040	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1041	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1042	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1043	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1044	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1045	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-cHx	H	H	H	H

5-1046	H	Me	Me	2	-C≡C-CH_2-O-cHx	H	H	H	H
5-1047	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-cHx	H	H	H	H
5-1048	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-cHx	H	H	H	H
5-1049	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1050	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1051	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1052	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1053	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1054	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1055	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1056	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1057	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1058	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-Ph	H	H	H	H
5-1059	H	Me	Me	2	-C≡C-CH_2-O-Ph	H	H	H	H
5-1060	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-Ph	H	H	H	H
5-1061	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-Ph	H	H	H	H
5-1062	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1063	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1064	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1065	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1066	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1067	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1068	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1069	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1070	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1071	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cPn	H	H	H	H
5-1072	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	H	H	H
5-1073	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	Me	H	H	H
5-1074	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	Me	H	H

5-1075	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	F	H	H	H
5-1076	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	F	H	H
5-1077	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	H	H	H
5-1078	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	H	H	H
5-1079	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	H	H	H
5-1080	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-1081	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1082	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1083	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1084	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1085	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1086	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1087	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1088	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1089	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1090	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1091	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1092	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1093	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1094	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1095	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1096	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1097	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1098	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1099	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1100	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1101	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1102	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1103	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[3-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H

5-1104	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[4-(2-Et-PrO)-cHx]	H	H	H	H
5-1105	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1106	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1107	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1108	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1109	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1110	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1111	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1112	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1113	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1114	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1115	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[3-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-1116	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[4-(2-Et-PrS)-cHx]	H	H	H	H
5-1117	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1118	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1119	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1120	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1121	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1122	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1123	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1124	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1125	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1126	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H
5-1127	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	Me	H	H	H
5-1128	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	Me	H	H
5-1129	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	F	H	H	H
5-1130	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	F	H	H
5-1131	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H
5-1132	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H

5-1133	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H
5-1134	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1135	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1136	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1137	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1138	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1139	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1140	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1141	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1142	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1143	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1144	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1145	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1146	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1147	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1148	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1149	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1150	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1151	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1152	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1153	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1154	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1155	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1156	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1157	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1158	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-1159	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-1160	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1161	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H

5-1162	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1163	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1164	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1165	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1166	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1167	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1168	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1169	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1170	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-1171	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-1172	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1173	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1174	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1175	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1176	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1177	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1178	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1179	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1180	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1181	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$O-cHx	H	H	H	H
5-1182	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$O-Ph	H	H	H	H
5-1183	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$O-cHx	H	H	H	H
5-1184	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$O-Ph	H	H	H	H
5-1185	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1186	H	Me	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1187	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1188	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1189	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1190	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Me-cHx)	H	H	H	H

5-1191	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1192	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1193	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1194	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1195	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1196	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1197	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1198	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1199	H	Me	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1200	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1201	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1202	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1203	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1204	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1205	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1206	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1207	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1208	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1209	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1210	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-OCH_2-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1211	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cPn	H	H	H	H
5-1212	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1213	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	Me	H	H	H
5-1214	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	Me	H	H
5-1215	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	F	H	H	H
5-1216	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	F	H	H
5-1217	H	Me	Me	2	--C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-CH_2-cHx	H	H	H	H
5-1218	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1219	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H	H	H

5-1220	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-1221	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1222	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1223	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1224	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1225	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1226	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1227	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1228	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1229	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1230	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1231	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1232	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1233	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1234	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1235	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1236	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1237	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1238	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1239	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1240	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1241	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1242	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1243	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1244	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1245	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1246	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1247	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1248	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H

5-1249	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1250	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1251	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1252	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1253	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1254	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1255	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H	H	H
5-1256	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H	H	H
5-1257	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1258	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1259	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1260	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1261	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1262	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1263	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1264	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1265	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1266	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1267	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	Me	H	H	H
5-1268	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	Me	H	H
5-1269	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	F	H	H	H
5-1270	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	F	H	H
5-1271	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-CH_2-Ph	H	H	H	H
5-1272	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1273	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1274	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1275	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1276	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1277	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Br-Ph)	H	H	H	H

5-1278	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1279	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1280	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1281	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1282	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1283	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1284	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1285	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1286	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1287	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1288	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1289	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1290	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1291	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1292	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1293	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1294	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1295	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1296	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1297	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1298	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[3-(2-Et-PrO)Ph]	H	H	H	H
5-1299	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[4-(2-Et-PrO)Ph]	H	H	H	H
5-1300	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1301	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1302	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1303	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1304	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1305	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1306	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-PrS-Ph)	H	H	H	H

5-1307	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1308	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1309	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1310	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)Ph]	H	H	H	H
5-1311	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)Ph]	H	H	H	H
5-1312	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1313	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1314	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1315	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1316	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1317	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1318	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1319	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1320	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1321	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1322	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1323	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1324	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1325	H	H	Me	2	-CO-CH_2-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1326	H	H	Me	2	-CO-CH_2-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1327	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
5-1328	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
5-1329	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-1330	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-1331	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1332	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1333	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1334	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1335	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H	H	H

5-1336	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1337	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1338	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1339	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1340	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1341	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1342	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1343	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1344	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1345	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1346	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1347	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1348	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1349	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1350	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1351	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1352	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1353	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1354	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1355	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1356	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1357	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1358	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1359	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1360	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1361	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1362	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1363	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1364	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H

5-1365	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1366	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1367	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1368	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1369	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1370	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1371	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1372	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1373	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1374	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1375	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1376	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1377	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1378	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1379	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1380	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1381	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1382	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1383	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-1384	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1385	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_7$-cHx	H	H	H	H
5-1386	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_7$-Ph	H	H	H	H
5-1387	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-cHx	H	H	H	H
5-1388	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-cHx	H	H	H	H
5-1389	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-cHx	H	H	H	H
5-1390	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-cHx	H	H	H	H
5-1391	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1392	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1393	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Et-cHx)	H	H	H	H

5-1394	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1395	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1396	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1397	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1398	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1399	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1400	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-Ph	H	H	H	H
5-1401	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-Ph	H	H	H	H
5-1402	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-Ph	H	H	H	H
5-1403	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-Ph	H	H	H	H
5-1404	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1405	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1406	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1407	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1408	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1409	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1410	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1411	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1412	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-O-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1413	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cPn	H	H	H	H
5-1414	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	H	H	H
5-1415	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	Me	H	H	H
5-1416	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	Me	H	H
5-1417	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	F	H	H	H
5-1418	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	F	H	H
5-1419	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	H	H	H
5-1420	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	H	H	H
5-1421	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-cHx	H	H	H	H
5-1422	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-F-cHx)	H	H	H	H

5-1423	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1424	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1425	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1426	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1427	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1428	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1429	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1430	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1431	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1432	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1433	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1434	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1435	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1436	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1437	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1438	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1439	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1440	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1441	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1442	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1443	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1444	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1445	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1446	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1447	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1448	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1449	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1450	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1451	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-EtS-cHx)	H	H	H	H

5-1452	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1453	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1454	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1455	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1456	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1457	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H	H	H
5-1458	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H	H	H
5-1459	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1460	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1461	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1462	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1463	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1464	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1465	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1466	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1467	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1468	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	H	H	H
5-1469	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	Me	H	H	H
5-1470	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	Me	H	H
5-1471	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	F	H	H	H
5-1472	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	F	H	H
5-1473	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	H	H	H
5-1474	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	H	H	H
5-1475	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-Ph	H	H	H	H
5-1476	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1477	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1478	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1479	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1480	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Me-Ph)	H	H	H	H

5-1481	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1482	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1483	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1484	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1485	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1486	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1487	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1488	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1489	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1490	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1491	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1492	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1493	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1494	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1495	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1496	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1497	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1498	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1499	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1500	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[3-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-1501	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[4-(2-Et-PrO)-Ph]	H	H	H	H
5-1502	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1503	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1504	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1505	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1506	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1507	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1508	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1509	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-PrS-Ph)	H	H	H	H

5-1510	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1511	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1512	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[3-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-1513	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-[4-(2-Et-PrS)-Ph]	H	H	H	H
5-1514	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1515	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1516	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1517	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1518	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1519	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1520	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1521	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1522	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-O-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1523	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-O-cHx	H	H	H	H
5-1524	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-O-Ph	H	H	H	H
5-1525	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-O-cHx	H	H	H	H
5-1526	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-O-Ph	H	H	H	H
5-1527	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1528	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1529	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1530	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1531	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1532	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1533	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1534	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1535	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1536	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1537	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1538	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H

5-1539	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1540	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1541	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1542	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1543	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1544	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1545	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1546	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1547	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1548	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1549	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1550	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1551	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1552	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_2$-OCH_2-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1553	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-CH_2-cPn	H	H	H	H
5-1554	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1555	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	Me	H	H	H
5-1556	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	Me	H	H
5-1557	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	F	H	H	H
5-1558	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	F	H	H
5-1559	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1560	COMe	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1561	CO_2Et	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1562	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-F-cHx)	H	H	H	H
5-1563	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1564	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1565	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1566	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1567	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Me-cHx)	H	H	H	H

5-1568	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1569	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1570	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1571	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1572	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1573	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1574	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1575	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1576	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1577	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1578	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1579	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1580	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1581	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1582	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1583	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1584	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1585	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[3-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1586	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[4-(2-Et-PrO)cHx]	H	H	H	H
5-1587	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1588	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iBuO-cHx)	H	H	H	H
5-1589	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1590	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1591	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1592	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-EtS-cHx)	H	H	H	H
5-1593	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1594	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-PrS-cHx)	H	H	H	H
5-1595	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPrS-cHx)	H	H	H	H
5-1596	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPrS-cHx)	H	H	H	H

5-1597	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)cHx]	H	H		
5-1598	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)cHx]	H	H		
5-1599	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1600	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iBuS-cHx)	H	H	H	H
5-1601	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1602	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1603	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1604	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1605	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1606	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1607	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1608	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1609	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	Me	H	H	H
5-1610	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	Me	H	H
5-1611	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	F	H	H	H
5-1612	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	F	H	H
5-1613	H	Me	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1614	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1615	CO_2Me	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1616	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1617	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1618	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1619	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1620	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1621	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1622	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1623	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1624	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1625	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H

5-1626	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1627	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1628	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1629	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1630	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1631	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1632	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1633	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1634	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1635	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1636	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1637	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1638	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1639	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1640	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[3-(2-Et-PrO)Ph]	H	H	H	H
5-1641	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[4-(2-Et-PrO)Ph]	H	H	H	H
5-1642	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1643	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iBuO-Ph)	H	H	H	H
5-1644	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1645	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1646	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1647	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-EtS-Ph)	H	H	H	H
5-1648	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1649	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-PrS-Ph)	H	H	H	H
5-1650	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1651	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iPrS-Ph)	H	H	H	H
5-1652	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[3-(2-Et-PrS)Ph]	H	H	H	H
5-1653	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-[4-(2-Et-PrS)Ph]	H	H	H	H
5-1654	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-iBuS-Ph)	H	H	H	H

5-1655	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-iBuS-Ph)	H	H	H	H
5-1656	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1657	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1658	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1659	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1660	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1661	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1662	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-OCH_2-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1663	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1664	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1665	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
5-1666	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_5$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-1667	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH_2-cHx	H	H	H	H
5-1668	H	H	Me	2	-CH(OH)-CH_2-Ph	H	H	H	H
5-1669	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
5-1670	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
5-1671	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-1672	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-1673	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1674	H	Me	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1675	CO_2Me	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1676	CO_2Et	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1677	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1678	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1679	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1680	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1681	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1682	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1683	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H

5-1684	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1685	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1686	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1687	H	Me	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1688	CO_2Me	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1689	CO_2Et	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1690	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1691	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1692	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1693	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1694	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1695	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1696	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1697	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1698	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1699	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1700	H	Me	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1701	CO_2Me	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1702	CO_2Et	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1703	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1704	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1705	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1706	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1707	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1708	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1709	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1710	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-cHx-cHx)	H	H	H	H
5-1711	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Ph-cHx)	H	H	H	H
5-1712	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H

5-1713	H	Me	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1714	CO_2Me	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1715	CO_2Et	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1716	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1717	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1718	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1719	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1720	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1721	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1722	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1723	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-cHx-Ph)	H	H	H	H
5-1724	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-(4-Ph-Ph)	H	H	H	H
5-1725	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-1726	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1727	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_7$-cHx	H	H	H	H
5-1728	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_7$-Ph	H	H	H	H
5-1729	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H	H	H
5-1730	H	Me	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H	H	H
5-1731	CO_2Me	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H	H	H
5-1732	CO_2Et	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H	H	H
5-1733	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2-F-Ph	H	H	H	H
5-1734	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-3-F-Ph	H	H	H	H
5-1735	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2,3-diF-Ph	H	H	H	H
5-1736	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2-Cl-Ph	H	H	H	H
5-1737	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-3-Cl-Ph	H	H	H	H
5-1738	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2,3-diCl-Ph	H	H	H	H
5-1739	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2-Me-Ph	H	H	H	H
5-1740	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-3-Me-Ph	H	H	H	H
5-1741	H	H	Me	2	-4-(cHx-CH_2O)-2,3-diMe-Ph	H	H	H	H

5-1742	H	H	Me	2	-4-[cHx-$(CH_2)_2O$]Ph	H	H	H	H
5-1743	H	H	Me	2	-4-[cHx-$(CH_2)_3O$]Ph	H	H	H	H
5-1744	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-1745	H	Me	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-1746	CO_2Me	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-1747	CO_2Et	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-1748	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H	H	H
5-1749	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H	H	H
5-1750	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H	H	H
5-1751	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1752	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1753	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-1754	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1755	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1756	H	H	Me	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1757	H	H	Me	2	-4-[Ph-$(CH_2)_2O$]-Ph	H	H	H	H
5-1758	H	H	Me	2	-4-[Ph-$(CH_2)_3O$]-Ph	H	H	H	H
5-1759	H	H	Et	2	-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-1760	H	H	Et	2	-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-1761	H	H	Et	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1762	H	H	Et	2	-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1763	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cPn	H	H	H	H
5-1764	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1765	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	Me	H	H	H
5-1766	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	Me	H	H
5-1767	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	F	H	H	H
5-1768	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	F	H	H
5-1769	H	Me	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1770	CO_2Me	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H

5-1771	CO_2Et	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-1772	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1773	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1774	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1775	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1776	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1777	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1778	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1779	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1780	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1781	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1782	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1783	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1784	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1785	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1786	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1787	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1788	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1789	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1790	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	Me	H	H	H
5-1791	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	Me	H	H
5-1792	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	F	H	H	H
5-1793	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	F	H	H
5-1794	H	Me	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1795	CO_2Me	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1796	CO_2Et	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-1797	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1798	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1799	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5$-(4-Br-Ph)	H	H	H	H

5-1800	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1801	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1802	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1803	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1804	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1805	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1806	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1807	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1808	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1809	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1810	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1811	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1812	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1813	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1814	H	H	Et	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1815	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cPn	H	H	H	H
5-1816	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
5-1817	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	Me	H	H	H
5-1818	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	Me	H	H
5-1819	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	F	H	H	H
5-1820	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	F	H	H
5-1821	H	Me	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
5-1822	CO_2Me	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
5-1823	CO_2Et	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
5-1824	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1825	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1826	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1827	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
5-1828	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H

5-1829	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1830	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1831	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1832	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1833	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1834	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1835	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1836	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1837	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1838	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1839	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1840	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1841	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1842	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1843	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	Me	H	H	H
5-1844	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	Me	H	H
5-1845	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	F	H	H	H
5-1846	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	F	H	H
5-1847	H	Me	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1848	CO_2Me	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1849	CO_2Et	H	Et	2	$-(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-1850	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1851	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1852	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1853	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1854	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1855	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1856	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1857	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-Ph)	H	H	H	H

5-1858	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-CF_3-Ph)$	H	H	H	H
5-1859	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-MeO-Ph)$	H	H	H	H
5-1860	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-EtO-Ph)$	H	H	H	H
5-1861	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-PrO-Ph)$	H	H	H	H
5-1862	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-iPrO-Ph)$	H	H	H	H
5-1863	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(3-MeS-Ph)$	H	H	H	H
5-1864	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(4-MeS-Ph)$	H	H	H	H
5-1865	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(2,4-diMe-Ph)$	H	H	H	H
5-1866	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(3,4-diMe-Ph)$	H	H	H	H
5-1867	H	H	Et	2	$-(CH_2)_6-(3,5-diMe-Ph)$	H	H	H	H
5-1868	H	H	Et	2	$-(CH_2)_7-cHx$	H	H	H	H
5-1869	H	H	Et	2	$-(CH_2)_7-Ph$	H	H	H	H
5-1870	H	H	Et	2	-CH=CH-cHx	H	H	H	H
5-1871	H	H	Et	2	-CH=CH-Ph	H	H	H	H
5-1872	H	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-1873	H	Me	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-1874	CO_2Me	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-1875	CO_2Et	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-1876	H	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-1877	H	Me	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-1878	CO_2Me	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-1879	CO_2Et	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-1880	H	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-1881	H	Me	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-1882	CO_2Me	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-1883	CO_2Et	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-1884	H	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-1885	H	Me	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-1886	CO_2Me	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H

5-1887	CO_2Et	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-1888	H	H	Et	2	$-CH=CH-CH_2O-cHx$	H	H	H	H
5-1889	H	H	Et	2	$-CH=CH-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
5-1890	H	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
5-1891	H	H	Et	2	$-CH=CH-(CH_2)_2O-Ph$	H	H	H	H
5-1892	H	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-cHx$	H	H	H	H
5-1893	H	Me	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-cHx$	H	H	H	H
5-1894	CO_2Me	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-cHx$	H	H	H	H
5-1895	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-cHx$	H	H	H	H
5-1896	H	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-Ph$	H	H	H	H
5-1897	H	Me	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-Ph$	H	H	H	H
5-1898	CO_2Me	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-Ph$	H	H	H	H
5-1899	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2-Ph$	H	H	H	H
5-1900	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-1901	H	Me	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-1902	CO_2Me	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-1903	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-1904	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-1905	H	Me	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-1906	CO_2Me	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-1907	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-1908	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cPn$	H	H	H	H
5-1909	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-1910	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	Me	H	H	H
5-1911	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	Me	H	H
5-1912	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	F	H	H	H
5-1913	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	F	H	H
5-1914	H	Me	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-1915	CO_2Me	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H

5-1916	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-1917	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-F-cHx)$	H	H	H	H
5-1918	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Cl-cHx)$	H	H	H	H
5-1919	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Br-cHx)$	H	H	H	H
5-1920	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Me-cHx)$	H	H	H	H
5-1921	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Et-cHx)$	H	H	H	H
5-1922	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Pr-cHx)$	H	H	H	H
5-1923	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-iPr-cHx)$	H	H	H	H
5-1924	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Bu-cHx)$	H	H	H	H
5-1925	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-CF_3-cHx)$	H	H	H	H
5-1926	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-MeO-cHx)$	H	H	H	H
5-1927	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-EtO-cHx)$	H	H	H	H
5-1928	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-PrO-cHx)$	H	H	H	H
5-1929	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-iPrO-cHx)$	H	H	H	H
5-1930	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3-MeS-cHx)$	H	H	H	H
5-1931	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-MeS-cHx)$	H	H	H	H
5-1932	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(2,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-1933	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3,4-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-1934	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(3,5-diMe-cHx)$	H	H	H	H
5-1935	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-1936	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	Me	H	H	H
5-1937	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	Me	H	H
5-1938	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	F	H	H	H
5-1939	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	F	H	H
5-1940	H	Me	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-1941	CO_2Me	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-1942	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-1943	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
5-1944	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-(4-Cl-Ph)$	H	H	H	H

5-1945	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1946	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1947	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-1948	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-1949	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-1950	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-1951	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-1952	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-1953	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-1954	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-1955	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-1956	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1957	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-1958	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1959	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1960	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-1961	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cPn	H	H	H	H
5-1962	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1963	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	Me	H	H	H
5-1964	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	Me	H	H
5-1965	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	F	H	H	H
5-1966	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	F	H	H
5-1967	H	Me	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1968	CO_2Me	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1969	CO_2Et	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-1970	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
5-1971	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
5-1972	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
5-1973	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H

5-1974	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
5-1975	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
5-1976	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
5-1977	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
5-1978	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
5-1979	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
5-1980	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
5-1981	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
5-1982	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
5-1983	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
5-1984	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1985	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1986	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-1987	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1988	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	Me	H	H	H
5-1989	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	Me	H	H
5-1990	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	F	H	H	H
5-1991	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	F	H	H
5-1992	H	Me	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1993	CO_2Me	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1994	CO_2Et	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-1995	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-1996	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-1997	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-1998	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-1999	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-2000	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-2001	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-2002	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H

5-2003	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2004	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2005	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-2006	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-2007	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-2008	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-2009	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-2010	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2011	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2012	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2013	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2014	H	Me	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2015	CO_2Me	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2016	CO_2Et	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2017	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2018	H	Me	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2019	CO_2Me	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2020	CO_2Et	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2021	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-2022	H	Me	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-2023	CO_2Me	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-2024	CO_2Et	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-2025	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-2026	H	Me	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-2027	CO_2Me	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-2028	CO_2Et	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-2029	H	H	Et	2	-C≡C-CH_2O-cHx	H	H	H	H
5-2030	H	Me	Et	2	-C≡C-CH_2O-cHx	H	H	H	H
5-2031	CO_2Me	H	Et	2	-C≡C-CH_2O-cHx	H	H	H	H

5-2032	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2O-cHx$	H	H	H	H
5-2033	H	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
5-2034	H	Me	Et	2	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
5-2035	CO_2Me	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
5-2036	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
5-2037	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cPn$	H	H	H	H
5-2038	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
5-2039	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	Me	H	H	H
5-2040	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	Me	H	H
5-2041	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	F	H	H	H
5-2042	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	F	H	H
5-2043	H	Me	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
5-2044	CO_2Me	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
5-2045	CO_2Et	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
5-2046	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-F-cHx)$	H	H	H	H
5-2047	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Cl-cHx)$	H	H	H	H
5-2048	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Br-cHx)$	H	H	H	H
5-2049	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Me-cHx)$	H	H	H	H
5-2050	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Et-cHx)$	H	H	H	H
5-2051	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Pr-cHx)$	H	H	H	H
5-2052	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-iPr-cHx)$	H	H	H	H
5-2053	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Bu-cHx)$	H	H	H	H
5-2054	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-CF_3-cHx)$	H	H	H	H
5-2055	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-MeO-cHx)$	H	H	H	H
5-2056	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-EtO-cHx)$	H	H	H	H
5-2057	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-PrO-cHx)$	H	H	H	H
5-2058	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-iPrO-cHx)$	H	H	H	H
5-2059	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(3-MeS-cHx)$	H	H	H	H
5-2060	H	H	Et	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-MeS-cHx)$	H	H	H	H

5-2061	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-2062	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-2063	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
5-2064	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H
5-2065	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	Me	H	H	H
5-2066	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	Me	H	H
5-2067	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	F	H	H	H
5-2068	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	F	H	H
5-2069	H	Me	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
5-2070	CO_2Me	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H
5-2071	CO_2Et	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H
5-2072	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-2073	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2074	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
5-2075	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2076	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-2077	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
5-2078	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
5-2079	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
5-2080	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2081	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2082	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
5-2083	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
5-2084	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
5-2085	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-2086	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2087	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2088	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2089	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H

5-2090	H	Me	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2091	CO_2Me	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2092	CO_2Et	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2093	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2094	H	Me	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2095	CO_2Me	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2096	CO_2Et	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2097	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2098	H	Me	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2099	CO_2Me	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2100	CO_2Et	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2101	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2102	H	Me	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2103	CO_2Me	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2104	CO_2Et	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2105	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2106	H	Me	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2107	CO_2Me	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2108	CO_2Et	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2109	H	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2110	H	Me	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2111	CO_2Me	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2112	CO_2Et	H	Et	2	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2113	H	H	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2114	H	Me	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2115	CO_2Me	H	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2116	CO_2Et	H	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2117	H	H	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2118	H	Me	Et	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H

5-2119	CO_2Me	H	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2120	CO_2Et	H	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2121	H	H	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2122	H	Me	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2123	CO_2Me	H	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2124	CO_2Et	H	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2125	H	H	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2126	H	Me	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2127	CO_2Me	H	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2128	CO_2Et	H	Et	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2129	H	H	Et	2	$-4-(cHx-CH_2O)Ph$	H	H	H	H
5-2130	H	Me	Et	2	$-4-(cHx-CH_2O)Ph$	H	H	H	H
5-2131	CO_2Me	H	Et	2	$-4-(cHx-CH_2O)Ph$	H	H	H	H
5-2132	CO_2Et	H	Et	2	$-4-(cHx-CH_2O)Ph$	H	H	H	H
5-2133	H	H	Et	2	$-4-[cHx-(CH_2)_2O]Ph$	H	H	H	H
5-2134	H	H	Et	2	$-4-[cHx-(CH_2)_3O]Ph$	H	H	H	H
5-2135	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2136	H	Me	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2137	CO_2Me	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2138	CO_2Et	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2139	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H	H	H
5-2140	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2141	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2142	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2143	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2144	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2145	H	H	Et	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2146	H	H	Et	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2147	H	H	Et	2	-(4-BzO-2,3-diMe-Ph)	H	H	H	H

5-2148	H	H	Et	2	-4-[Ph-$(CH_2)_2O$]-Ph	H	H	H	H
5-2149	H	H	Et	2	-4-[Ph-$(CH_2)_3O$]-Ph	H	H	H	H
5-2150	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2151	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2152	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-2153	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_6$-Ph	H	H	H	H
5-2154	H	H	Pr	2	-C≡C-CH_2-cHx	H	H	H	H
5-2155	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2156	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2157	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2158	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2159	CO_2Me	H	Pr	2	-C≡C-CH_2O-Ph	H	H	H	H
5-2160	CO_2Et	H	Pr	2	-C≡C-CH_2O-Ph	H	H	H	H
5-2161	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2162	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2163	H	H	Pr	2	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H	H	H
5-2164	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2165	H	H	Me	3	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2166	H	H	Me	3	-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
5-2167	H	H	Me	3	-CH=CH-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2168	H	H	Me	3	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2169	H	H	Me	3	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2170	H	H	Me	3	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2171	H	H	Me	3	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2172	H	H	Me	3	-CO-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2173	H	H	Me	3	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2174	H	H	Me	3	-CO-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2175	H	H	Me	3	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2176	H	H	Me	3	-CH(OH)-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H

5-2177	H	H	Me	3	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H	H	H
5-2178	H	H	Me	3	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
5-2179	H	H	Me	3	-C≡C-CH_2O-cPn	H	H	H	H
5-2180	H	H	Me	3	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cPn	H	H	H	H
5-2181	H	H	Me	3	-C≡C-CH_2O-cHx	H	H	H	H
5-2182	H	H	Me	3	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2183	H	H	Me	3	-C≡C-CH_2O-Ph	H	H	H	H
5-2184	H	H	Me	3	-C≡C-$(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2185	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2186	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2187	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2188	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2189	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2190	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2191	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2192	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2193	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2194	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2195	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2196	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2197	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2198	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2199	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2200	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2201	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2202	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2203	H	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2204	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2205	H	H	Me	2	-$(CH_2)_5$-(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H

5-2206	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2207	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2208	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2209	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2210	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2211	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2212	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2213	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2214	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2215	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2216	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2217	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2218	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2219	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2220	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2221	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2222	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2223	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2224	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2225	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2226	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2227	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2228	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2229	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2230	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-O-$(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2231	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2232	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2233	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2234	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H

5-2235	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2236	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2237	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-O-$(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2238	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2239	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2240	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2241	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2242	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2243	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2244	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2245	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2246	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2247	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2248	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2249	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2250	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2251	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2252	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2253	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2254	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2255	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2256	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-$(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2257	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2258	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2259	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2260	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2261	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2262	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2263	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-$(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H

5-2264	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2265	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2266	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2267	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2268	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2269	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2270	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2271	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2272	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2273	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2274	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2275	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2276	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2277	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(2,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2278	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2279	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2280	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2281	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2282	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2283	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2284	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2285	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2286	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2287	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2288	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2289	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-O-(4-CO_2H-Ph)	H	H	H	H
5-2290	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2291	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2292	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3-Cl-Ph)	H	H	H	H

5-2293	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2294	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2295	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2296	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2297	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2298	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2299	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2300	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2301	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-O-(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2302	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2303	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-2304	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2305	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2306	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2307	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2308	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2309	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2310	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2311	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2312	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2313	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2314	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-2315	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-2316	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2317	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2318	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2319	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2320	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2321	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H

5-2322	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2323	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2324	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2325	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-2326	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2327	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2328	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2329	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2330	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2331	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2332	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2333	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2334	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2335	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2336	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2337	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2338	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2339	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2340	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2341	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2342	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2343	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2344	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2345	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2346	H	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2347	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2348	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
5-2349	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2350	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H

5-2351	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2352	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2353	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2354	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2355	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2356	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2357	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2358	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2359	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-Et-Ph)	H	H	H	H
5-2360	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
5-2361	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2362	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2363	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2364	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2365	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2366	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2367	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2368	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2369	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2370	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
5-2371	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2372	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_3$-(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2373	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-F-Ph)	H	H	H	H
5-2374	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2375	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diF-Ph)	H	H	H	H
5-2376	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2377	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
5-2378	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diCl-Ph)	H	H	H	H
5-2379	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diCl-Ph)	H	H	H	H

5-2380	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-Me-Ph)	H	H	H	H
5-2381	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2382	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
5-2383	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-CF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2384	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2385	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diCF_3-Ph)	H	H	H	H
5-2386	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-MeO-Ph)	H	H	H	H
5-2387	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2388	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,5-diMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2389	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3,4,5-triMeO-Ph)	H	H	H	H
5-2390	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(3-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2391	H	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-(4-Ac-Ph)	H	H	H	H
5-2392	H	H	Me	2	-O-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2393	H	H	Me	2	-O-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2394	H	H	Me	2	-O-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
5-2395	H	H	Me	2	-O-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2396	H	H	Me	2	-O-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2397	H	H	Me	2	-O-$(CH_2)_5$-Ph	H	H	H	H
5-2398	$COCH_3$	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2399	COC_2H_5	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2400	COC_3H_7	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2401	COC_4H_9	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2402	COC_5H_{11}	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2403	COC_6H_{13}	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2404	COC_7H_{15}	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2405	COC_8H_{17}	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2406	$COCH_3$	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2407	COC_2H_5	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2408	COC_3H_7	H	Me	2	-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H

5-2409	COC_4H_9	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2410	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2411	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2412	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2413	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2414	$COCH_3$	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2415	COC_2H_5	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2416	COC_3H_7	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2417	COC_4H_9	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2418	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2419	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2420	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2421	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2422	$COCH_3$	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2423	COC_2H_5	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2424	COC_3H_7	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2425	COC_4H_9	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2426	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2427	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2428	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2429	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2430	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-2431	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-2432	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-2433	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-2434	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-2435	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-2436	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
5-2437	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H

5-2438	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-2439	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-2440	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-2441	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-2442	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-2443	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-2444	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-2445	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
5-2446	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-2447	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-2448	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-2449	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-2450	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-2451	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-2452	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-2453	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
5-2454	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-2455	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-2456	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-2457	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-2458	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-2459	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-2460	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-2461	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
5-2462	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2463	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2464	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2465	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2466	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H

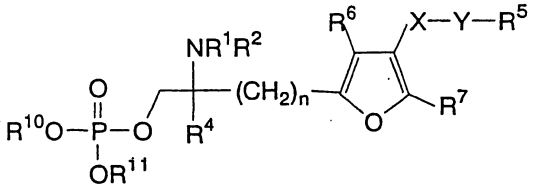
5-2467	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2468	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2469	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2470	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2471	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2472	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2473	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2474	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2475	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2476	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2477	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2478	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2479	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2480	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2481	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2482	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2483	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2484	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2485	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
5-2486	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2487	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2488	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2489	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2490	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2491	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2492	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2493	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
5-2494	$COCH_3$	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2495	COC_2H_5	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H

5-2496	COC_3H_7	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2497	COC_4H_9	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2498	COC_5H_{11}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2499	COC_6H_{13}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2500	COC_7H_{15}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2501	COC_8H_{17}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
5-2502	$COCH_3$	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2503	COC_2H_5	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2504	COC_3H_7	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2505	COC_4H_9	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2506	COC_5H_{11}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2507	COC_6H_{13}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2508	COC_7H_{15}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2509	COC_8H_{17}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
5-2510	$COCH_3$	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2511	COC_2H_5	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2512	COC_3H_7	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2513	COC_4H_9	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2514	COC_5H_{11}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2515	COC_6H_{13}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2516	COC_7H_{15}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2517	COC_8H_{17}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
5-2518	$COCH_3$	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2519	COC_2H_5	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2520	COC_3H_7	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2521	COC_4H_9	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2522	COC_5H_{11}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2523	COC_6H_{13}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2524	COC_7H_{15}	H	Me	2	-CO-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H

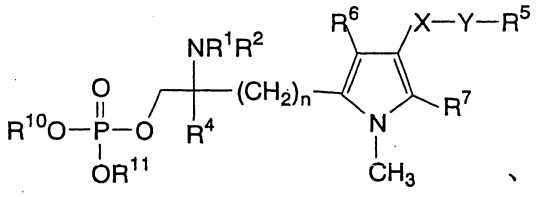
5-2525	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2526	$COCH_3$	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2527	COC_2H_5	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2528	COC_3H_7	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2529	COC_4H_9	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2530	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2531	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2532	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2533	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
5-2534	$COCH_3$	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2535	COC_2H_5	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2536	COC_3H_7	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2537	COC_4H_9	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2538	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2539	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2540	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2541	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
5-2542	$COCH_3$	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2543	COC_2H_5	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2544	COC_3H_7	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2545	COC_4H_9	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2546	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2547	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2548	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2549	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
5-2550	$COCH_3$	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2551	COC_2H_5	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2552	COC_3H_7	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
5-2553	COC_4H_9	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H

5-2554	COC_5H_{11}	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2555	COC_6H_{13}	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2556	COC_7H_{15}	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
5-2557	COC_8H_{17}	H	Me	2	-CH(OH)-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H

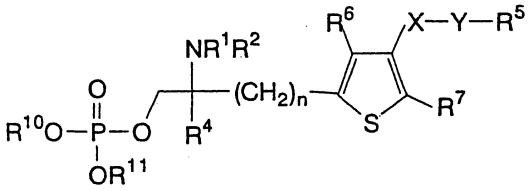
表 6



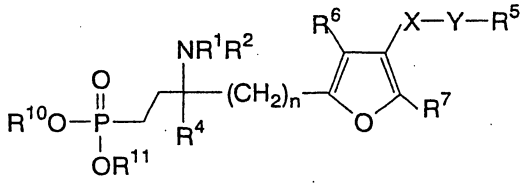
(IIb-1)



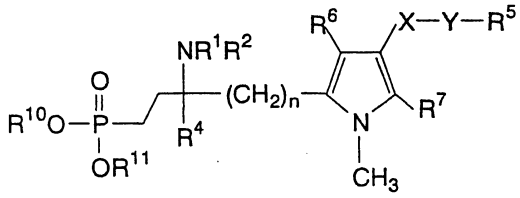
(IIb-2)



(IIb-3)

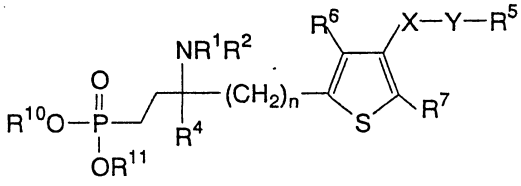


(IIIb-1)



(IIIb-2)

或



(IIIb-3)

化合物	R^1	R^2	R^4	n	-Y-Z-R^5	R^6	R^7	R^{10}	R^{11}
6-1	H	H	Me	1	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H

6-2	H	H	Me	1	$-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
6-3	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-4	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-5	H	H	Me	1	$-4-(cHx-CH_2O)Ph$	H	H	H	H
6-6	H	H	Me	1	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-7	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
6-8	H	H	Me	1	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-Ph$	H	H	H	H
6-9	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-10	H	H	Me	2	$-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-11	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-12	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-13	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cPn$	H	H	H	H
6-14	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-15	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	Me	H	H	H
6-16	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	Me	H	H
6-17	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	F	H	H	H
6-18	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	F	H	H
6-19	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-20	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-21	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-22	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-F-cHx)$	H	H	H	H
6-23	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Cl-cHx)$	H	H	H	H
6-24	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Br-cHx)$	H	H	H	H
6-25	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Me-cHx)$	H	H	H	H
6-26	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Et-cHx)$	H	H	H	H
6-27	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-Pr-cHx)$	H	H	H	H
6-28	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-iPr-cHx)$	H	H	H	H
6-29	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-CF_3-cHx)$	H	H	H	H
6-30	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-(4-MeO-cHx)$	H	H	H	H

6-31	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
6-32	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
6-33	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
6-34	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
6-35	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
6-36	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(6-4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-37	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-38	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-39	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	H	H	H
6-40	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	Me	H	H	H
6-41	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	Me	H	H
6-42	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	F	H	H	H
6-43	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	F	H	H
6-44	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	H	H	H
6-45	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	H	H	H
6-46	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$Ph	H	H	H	H
6-47	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
6-48	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-49	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Br-Ph)	H	H	H	H
6-50	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
6-51	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
6-52	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
6-53	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
6-54	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
6-55	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
6-56	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
6-57	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
6-58	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
6-59	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H

6-60	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-61	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-62	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(6-4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-63	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-64	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-65	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cPn	H	H	H	H
6-66	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
6-67	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	Me	H	H	H
6-68	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	Me	H	H
6-69	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	F	H	H	H
6-70	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	F	H	H
6-71	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
6-72	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
6-73	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$cHx	H	H	H	H
6-74	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-cHx)	H	H	H	H
6-75	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
6-76	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-cHx)	H	H	H	H
6-77	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-cHx)	H	H	H	H
6-78	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-cHx)	H	H	H	H
6-79	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
6-80	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
6-81	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
6-82	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
6-83	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
6-84	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
6-85	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
6-86	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
6-87	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
6-88	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-cHx)	H	H	H	H

6-89	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(6-4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-90	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-91	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-92	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H	H	H
6-93	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	Me	H	H	H
6-94	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	Me	H	H
6-95	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	F	H	H	H
6-96	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	F	H	H
6-97	H	Me	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H	H	H
6-98	CO_2Me	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H	H	H
6-99	CO_2Et	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$Ph	H	H	H	H
6-100	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-F-Ph)	H	H	H	H
6-101	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-102	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Br-Ph)	H	H	H	H
6-103	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Me-Ph)	H	H	H	H
6-104	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Et-Ph)	H	H	H	H
6-105	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
6-106	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
6-107	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
6-108	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
6-109	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
6-110	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
6-111	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
6-112	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
6-113	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-114	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-115	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(6-4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-116	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-117	H	H	Me	2	$-(CH_2)_6-$(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H

6-118	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-cHx	H	H	H	H
6-119	H	H	Me	2	$-(CH_2)_7$-Ph	H	H	H	H
6-120	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-cHx	H	H	H	H
6-121	H	H	Me	2	$-(CH_2)_8$-Ph	H	H	H	H
6-122	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-123	H	Me	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-124	CO_2Me	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-125	CO_2Et	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-126	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
6-127	H	Me	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
6-128	CO_2Me	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
6-129	CO_2Et	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
6-130	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-131	H	Me	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-132	CO_2Me	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-133	CO_2Et	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-134	H	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-135	H	Me	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-136	CO_2Me	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-137	CO_2Et	H	Me	2	-CH=CH-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-138	H	H	Me	2	-C=C-CH_2O-cHx	H	H	H	H
6-139	H	H	Me	2	-C=C-CH_2O-Ph	H	H	H	H
6-140	H	H	Me	2	-C=C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-141	H	H	Me	2	-C=C-$(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-142	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-cHx	H	H	H	H
6-143	H	Me	Me	2	-C≡C-CH_2-cHx	H	H	H	H
6-144	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-CH_2-cHx	H	H	H	H
6-145	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-CH_2-cHx	H	H	H	H
6-146	H	H	Me	2	-C≡C-CH_2-Ph	H	H	H	H

6-147	H	Me	Me	2	-C≡C-CH_2-Ph	H	H	H	H
6-148	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-CH_2-Ph	H	H	H	H
6-149	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-CH_2-Ph	H	H	H	H
6-150	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
6-151	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
6-152	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
6-153	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-cHx	H	H	H	H
6-154	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
6-155	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
6-156	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
6-157	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-Ph	H	H	H	H
6-158	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cPn	H	H	H	H
6-159	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-160	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	Me	H	H	H
6-161	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	Me	H	H
6-162	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	F	H	H	H
6-163	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	F	H	H
6-164	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-165	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-166	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-167	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
6-168	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
6-169	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
6-170	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
6-171	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
6-172	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
6-173	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
6-174	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
6-175	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H

6-176	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
6-177	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
6-178	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
6-179	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
6-180	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
6-181	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
6-182	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(6-4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-183	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-184	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-185	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
6-186	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	Me	H	H	H
6-187	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	Me	H	H
6-188	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	F	H	H	H
6-189	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	F	H	H
6-190	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
6-191	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
6-192	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-Ph	H	H	H	H
6-193	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
6-194	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-195	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
6-196	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
6-197	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
6-198	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
6-199	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
6-200	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
6-201	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
6-202	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
6-203	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
6-204	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H

6-205	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
6-206	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-207	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-208	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(6-4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-209	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-210	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-211	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cPn	H	H	H	H
6-212	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-213	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	Me	H	H	H
6-214	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	Me	H	H
6-215	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	F	H	H	H
6-216	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	F	H	H
6-217	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-218	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-219	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-220	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-cHx)	H	H	H	H
6-221	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
6-222	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
6-223	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
6-224	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
6-225	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
6-226	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
6-227	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
6-228	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
6-229	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
6-230	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
6-231	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
6-232	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
6-233	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H

6-234	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(6-4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-235	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-236	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-237	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-238	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	Me	H	H	H
6-239	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	Me	H	H
6-240	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	F	H	H	H
6-241	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	F	H	H
6-242	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-243	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-244	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-245	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-F-Ph)	H	H	H	H
6-246	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-247	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Br-Ph)	H	H	H	H
6-248	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Me-Ph)	H	H	H	H
6-249	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Et-Ph)	H	H	H	H
6-250	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Pr-Ph)	H	H	H	H
6-251	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPr-Ph)	H	H	H	H
6-252	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-Bu-Ph)	H	H	H	H
6-253	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-CF_3-Ph)	H	H	H	H
6-254	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeO-Ph)	H	H	H	H
6-255	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-EtO-Ph)	H	H	H	H
6-256	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-PrO-Ph)	H	H	H	H
6-257	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-iPrO-Ph)	H	H	H	H
6-258	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-259	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(4-MeS-Ph)	H	H	H	H
6-260	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(6-4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-261	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,4-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-262	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-(3,5-diMe-Ph)	H	H	H	H

6-263	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-264	H	Me	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-265	CO_2Me	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-266	CO_2Et	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-267	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-268	H	Me	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-269	CO_2Me	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-270	CO_2Et	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-271	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
6-272	H	Me	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
6-273	CO_2Me	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
6-274	CO_2Et	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_6-cHx$	H	H	H	H
6-275	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
6-276	H	Me	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
6-277	CO_2Me	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
6-278	CO_2Et	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_6-Ph$	H	H	H	H
6-279	H	H	Me	2	$-C\equiv C-CH_2O-cHx$	H	H	H	H
6-280	H	Me	Me	2	$-C\equiv C-CH_2O-cHx$	H	H	H	H
6-281	CO_2Me	H	Me	2	$-C\equiv C-CH_2O-cHx$	H	H	H	H
6-282	CO_2Et	H	Me	2	$-C\equiv C-CH_2O-cHx$	H	H	H	H
6-283	H	H	Me	2	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
6-284	H	Me	Me	2	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
6-285	CO_2Me	H	Me	2	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
6-286	CO_2Et	H	Me	2	$-C\equiv C-CH_2O-Ph$	H	H	H	H
6-287	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cPn$	H	H	H	H
6-288	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	H	H	H
6-289	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	Me	H	H	H
6-290	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	H	Me	H	H
6-291	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-cHx$	F	H	H	H

6-292	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	F	H	H
6-293	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-cHx	H	H	H	H
6-294	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	H	H	H
6-295	CO_2Et	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-cHx	H	H	H	H
6-296	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-F-cHx)	H	H	H	H
6-297	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Cl-cHx)	H	H	H	H
6-298	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Br-cHx)	H	H	H	H
6-299	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Me-cHx)	H	H	H	H
6-300	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Et-cHx)	H	H	H	H
6-301	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Pr-cHx)	H	H	H	H
6-302	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPr-cHx)	H	H	H	H
6-303	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-Bu-cHx)	H	H	H	H
6-304	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-CF_3-cHx)	H	H	H	H
6-305	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeO-cHx)	H	H	H	H
6-306	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-EtO-cHx)	H	H	H	H
6-307	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-PrO-cHx)	H	H	H	H
6-308	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-iPrO-cHx)	H	H	H	H
6-309	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3-MeS-cHx)	H	H	H	H
6-310	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(4-MeS-cHx)	H	H	H	H
6-311	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(6-4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-312	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,4-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-313	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-(3,5-diMe-cHx)	H	H	H	H
6-314	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H
6-315	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	Me	H	H	H
6-316	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	Me	H	H
6-317	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	F	H	H	H
6-318	H	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	F	H	H
6-319	H	Me	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$-OCH_2-Ph	H	H	H	H
6-320	CO_2Me	H	Me	2	-C≡C-$(CH_2)_2$O-Ph	H	H	H	H

6-321	CO_2Et	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-Ph$	H	H	H	H
6-322	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-F-Ph)$	H	H	H	H
6-323	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Cl-Ph)$	H	H	H	H
6-324	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Br-Ph)$	H	H	H	H
6-325	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Me-Ph)$	H	H	H	H
6-326	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Et-Ph)$	H	H	H	H
6-327	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Pr-Ph)$	H	H	H	H
6-328	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-iPr-Ph)$	H	H	H	H
6-329	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-Bu-Ph)$	H	H	H	H
6-330	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-CF_3-Ph)$	H	H	H	H
6-331	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-MeO-Ph)$	H	H	H	H
6-332	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-EtO-Ph)$	H	H	H	H
6-333	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-PrO-Ph)$	H	H	H	H
6-334	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-iPrO-Ph)$	H	H	H	H
6-335	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(4-MeS-Ph)$	H	H	H	H
6-336	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(6-4-diMe-Ph)$	H	H	H	H
6-337	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(3,4-diMe-Ph)$	H	H	H	H
6-338	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-(3,5-diMe-Ph)$	H	H	H	H
6-339	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-340	H	Me	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-341	CO_2Me	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-342	CO_2Et	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-343	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-344	H	Me	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-345	CO_2Me	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-346	CO_2Et	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-347	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-348	H	Me	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-349	CO_2Me	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H

6-350	CO_2Et	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-351	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-352	H	Me	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-353	CO_2Me	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-354	CO_2Et	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-355	H	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-356	H	Me	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-357	CO_2Me	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-358	CO_2Et	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-359	H	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-360	H	Me	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-361	CO_2Me	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-362	CO_2Et	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-363	H	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-364	H	Me	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-365	CO_2Me	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-366	CO_2Et	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-367	H	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-368	H	Me	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-369	CO_2Me	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-370	CO_2Et	H	Me	2	$-CH(OH)-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-371	H	H	Me	6-4-(cHx-CH_2O)Ph		H	H	H	H
6-372	H	Me	Me	6-4-(cHx-CH_2O)Ph		H	H	H	H
6-373	CO_2Me	H	Me	6-4-(cHx-CH_2O)Ph		H	H	H	H
6-374	CO_2Et	H	Me	6-4-(cHx-CH_2O)Ph		H	H	H	H
6-375	H	H	Me	6-4-[cHx-$(CH_2)_2O$]Ph		H	H	H	H
6-376	H	H	Me	6-4-[cHx-$(CH_2)_3O$]Ph		H	H	H	H
6-377	H	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-378	H	Me	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H

6-379	CO_2Me	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-380	CO_2Et	H	Me	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-381	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-F-Ph)	H	H	H	H
6-382	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-F-Ph)	H	H	H	H
6-383	H	H	Me	2	-(4-BzO-6-3-diF-Ph)	H	H	H	H
6-384	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-385	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Cl-Ph)	H	H	H	H
6-386	H	H	Me	2	-(4-BzO-6-3-diCl-Ph)	H	H	H	H
6-387	H	H	Me	2	-(4-BzO-2-Me-Ph)	H	H	H	H
6-388	H	H	Me	2	-(4-BzO-3-Me-Ph)	H	H	H	H
6-389	H	H	Me	2	-(4-BzO-6-3-diMe-Ph)	H	H	H	H
6-390	H	H	Me	6-4-[Ph-$(CH_2)_2O$]-Ph		H	H	H	H
6-391	H	H	Me	6-4-[Ph-$(CH_2)_3O$]-Ph		H	H	H	H
6-392	H	H	Et	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
6-393	H	H	Et	2	-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
6-394	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-395	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-396	H	H	Et	6-4-(cHx-CH_2O)Ph		H	H	H	H
6-397	H	H	Et	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-398	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-399	H	H	Et	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-400	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
6-401	H	H	Pr	2	-$(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
6-402	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-403	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-404	H	H	Pr	6-4-(cHx-CH_2O)Ph		H	H	H	H
6-405	H	H	Pr	2	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-406	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-407	H	H	Pr	2	-C≡C-$(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H

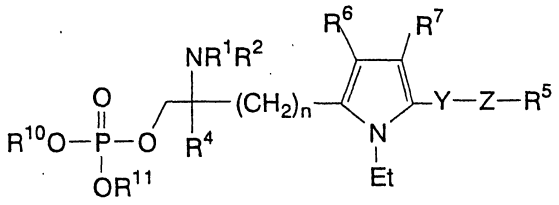
6-408	H	H	Me	3	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
6-409	H	H	Me	3	$-(CH_2)_6$-cHx	H	H	H	H
6-410	H	H	Me	3	$-C\equiv C-(CH_2)_3$-cHx	H	H	H	H
6-411	H	H	Me	3	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-412	H	H	Me	3	-4-(cHx-CH_2O)Ph	H	H	H	H
6-413	H	H	Me	3	-(4-BzO-Ph)	H	H	H	H
6-414	H	H	Me	3	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-415	H	H	Me	3	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-416	$COCH_3$	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-417	COC_2H_5	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-418	COC_3H_7	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-419	COC_4H_9	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-420	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-421	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-422	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-423	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-424	$COCH_3$	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-425	COC_2H_5	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-426	COC_3H_7	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-427	COC_4H_9	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-428	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-429	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-430	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-431	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-432	$COCH_3$	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
6-433	COC_2H_5	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
6-434	COC_3H_7	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
6-435	COC_4H_9	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H
6-436	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-(CH_2)_5$-cHx	H	H	H	H

6-437	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-438	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-439	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
6-440	$COCH_3$	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-441	COC_2H_5	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-442	COC_3H_7	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-443	COC_4H_9	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-444	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-445	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-446	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-447	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
6-448	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-449	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-450	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-451	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-452	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-453	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-454	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-455	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
6-456	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-457	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-458	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-459	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-460	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-461	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-462	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-463	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
6-464	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-465	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H

6-466	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-467	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-468	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-469	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-470	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-471	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-cHx	H	H	H	H
6-472	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-473	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-474	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-475	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-476	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-477	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-478	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-479	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_4$-Ph	H	H	H	H
6-480	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-481	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-482	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-483	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-484	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-485	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-486	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-487	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-cHx	H	H	H	H
6-488	$COCH_3$	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-489	COC_2H_5	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-490	COC_3H_7	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-491	COC_4H_9	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-492	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-493	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H
6-494	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O$-Ph	H	H	H	H

6-495	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2O-Ph$	H	H	H	H
6-496	$COCH_3$	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-497	COC_2H_5	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-498	COC_3H_7	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-499	COC_4H_9	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-500	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-501	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-502	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-503	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
6-504	$COCH_3$	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-505	COC_2H_5	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-506	COC_3H_7	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-507	COC_4H_9	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-508	COC_5H_{11}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-509	COC_6H_{13}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-510	COC_7H_{15}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
6-511	COC_8H_{17}	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H

表 7

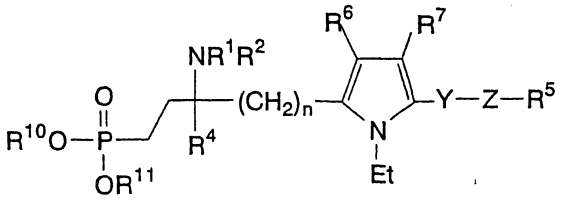


(IIa-4)

化合物	R^1	R^2	R^4	n	$-Y-Z-R^5$	R^6	R^7	R^{10}	R^{11}

7-1	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
7-2	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
7-3	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
7-4	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H
7-5	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
7-6	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
7-7	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
7-8	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
7-9	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
7-10	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
7-11	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
7-12	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H

表 8



(IIIa-4)

化合物	R^1	R^2	R^4	n	$-Y-Z-R^5$	R^6	R^7	R^{10}	R^{11}
8-1	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
8-2	H	H	Me	2	$-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H
8-3	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-cHx$	H	H	H	H
8-4	H	H	Me	2	$-(CH_2)_5-Ph$	H	H	H	H

8-5	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-cHx$	H	H	H	H
8-6	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_2-Ph$	H	H	H	H
8-7	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
8-8	H	H	Me	2	$-C\equiv C-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
8-9	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3-cHx$	H	H	H	H
8-10	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_3-Ph$	H	H	H	H
8-11	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-cHx$	H	H	H	H
8-12	H	H	Me	2	$-CO-(CH_2)_4-Ph$	H	H	H	H

上述表１[式（Ｉａ-1)、（Ｉａ-2）及　（１ａ－３）]、表２[（Ｉｂ-1)、（Ｉｂ-2）及　（１ｂ－３）]、表３[(１ａ－４)]及表４[(１ａ－５)]中　　、

本發明化合物（Ｉ）宜

例示化合物編號：1-21, 1-30～1-46, 1-93～1-152, 1-199～1-253, 1-263～1-272, 1-283～1-298, 1-345～1-401, 1-411～1-426, 1-473～1-528, 1-548～1-549, 1-559～1-574, 1-621～1-680, 1-727～1-781, 1-791～1-801, 1-831～1-836, 1-896～1-949, 1-959～1-974, 1-1021～1-1078, 1-1081～1-1083, 1-1093～1-1103, 1-1113～1-1127, 1-1137～1-1152, 1-1199～1-1255, 1-1265～1-1280, 1-1327～1-1389, 1-1399～1-1409, 1-1419～1-1430, 1-1433, 1-1433～1-1445, 1-1457～1-1466, 1-1484～1-1512, 1-1531～1-1555, 1-1558～1-1565, 1-1584～1-1612, 1-1630～1-1654, 1-1657～1-1664, 1-1683～1-1729, 1-1743～1-1949,

2-1～2-10, 2-28～2-56, 2-75～2-99, 2-104～2-111, 2-130～2-158, 2-176～2-200, 2-203～2-210, 2-229～2-281,

4-9～4-12

尤宜

1-21, 1-31～1-38, 1-41～1-46, 1-93～1-105, 1-112～1-117, 1-142～1-144, 1-147～1-152, 1-199～1-211, 1-248～1-250, 1-253, 1-263～1-269, 1-284～1-289, 1-293～1-298, 1-345～1-357, 1-364～1-369, 1-394～1-401, 1-411～1-417, 1-421～1-426, 1-474～1-485, 1-492～1-497, 1-522～1-528, 1-549, 1-559～1-565, 1-568～1-574, 1-621～1-633, 1-640, 1-643, 1-670～1-672, 1-676～1-680, 1-727～1-739, 1-776～1-778, 1-781, 1-831～1-838, 1-842～1-846, 1-893～1-905, 1-912～1-917, 1-942～1-946, 1-949, 1-959～1-965, 1-970～1-974, 1-1021～1-1033, 1-1040～1-1045, 1-1070～1-1073, 1-1081～1-1083, 1-1093～1-1099, 1-1103, 1-1113～1-1119, 1-1148～1-1152, 1-1199～1-1211, 1-1248～1-1252, 1-1265～1-1271, 1-1276～1-1280, 1-1327～1-1339, 1-1376～1-1380, 1-1433, 1-1443～1-1445, 1-1459～1-1466,

1-1484～1-1499, 1-1504～1-1512, 1-1558～1-1565, 1-1584～1-1599, 1-1604～1-1612, 1-1630～1-1639, 1-1657～1-1658, 1-1660～1-1664, 1-1683～1-1692, 1-1702～1-1710, 1-1743～1-1773, 1-1796～1-1846, 1-1848～1-1876, 1-1886～1-1904,

2-3～2-10, 2-28～2-37, 2-52～2-56, 2-75～2-84, 2-88～2-90, 2-95～2-99, 2-104～2-111, 2-130～2-139, 2-143～2-146, 2-150～2-158, 2-176～2-185, 2-189～2-191, 2-196～2-200, 2-203～2-210, 2-229～2-238, 2-242～2-244, 2-248～2-252,

4-9～4-12

尤宜

1-21, 1-42, 1-93～1-105, 1-112～1-117, 1-142～1-144, 1-147～1-152, 1-199～1-211, 1-248～1-250, 1-294～1-298, 1-351, 1-367, 1-411, 1-549, 1-559～1-565, 1-569～1-574, 1-621～1-633, 1-643, 1-670～1-672, 1-676～1-680, 1-831～1-838, 1-842～1-846, 1-893～1-905, 1-912～1-917, 1-942～1-944, 1-949, 1-1021, 1-1081～1-1083, 1-1093～1-1099, 1-1462, 1-1558～1-1565, 1-1584～1-1599, 1-1604～1-1612, 1-1660～1-1664, 1-1707～1-1710, 1-1762～1-1773, 1-1816～1-1846, 1-1848～1-1859, 1-1886～1-1904,

4-9～4-12

更好之化合物可爲如：

例 示化合物編號 在Ia-1中1-93：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例 示化合物編號 在Ia-1中1-570：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例 示化合物編號 在Ia-1中1-621：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例 示化合物編號 在Ia-1中1-833：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例 示化合物編號在Ia-1中1-842:2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-

環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-1中1-1083：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-1中1-1836：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-1中1-628：2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氯苯基)戊-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-1中1-640：2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-三氟甲苯基)戊-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-1中1-835：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-1中1-1831：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-1中1-1838：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-1中1-1842：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-621：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-833：2-胺基-2-甲基-4-[1-

甲基-5-[3-(4-甲基)苯氧基丙-1-炔基]吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-842：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-1836：2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-93：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-1093：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-1890：2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[5-(4-氯苯基)戊醯基]吡咯-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-1896：2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[5-(3-三氟甲苯基)戊醯基]吡咯-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-1083：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-1082：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-2中1-1081：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-5中4-12：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-5中4-11：2-胺基-2-甲基-4-[1-

乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-5中4-10：2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-5中4-9：2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-21：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-42：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-93：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-294：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-351：2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-367：2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-473：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-549：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-559：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-570：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-621：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-627：2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-643：2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-833：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-834：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-838：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-842：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-899：2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-903：2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-949：2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基丙-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1021：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1082：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁醯基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1083：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1093：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1094：2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1462：2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1561：2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊-1-基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1707：2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1831：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1834：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1836：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1841：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1842：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-1843：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在Ia-3中1-1845：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇及

例示化合物編號 在Ia-3中1-1846：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇

特宜爲

例示化合物編號在Ia-1中1-93：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-1中1-570：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-1中1-621：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-1中1-842：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-1中1-1083：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-1中1-1836：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-2中1-621：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-2 中 1-833：2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲基)苯氧基丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-2 中 1-842：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號 在 Ia-2 中 1-1093：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-2 中 1-1836：2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲基)苯氧基丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-2 中 1-1083：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-2 中 1-1082：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-2 中 1-1081：2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-5 中 4-12：2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-5 中 4-11：2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-5 中 4-10：2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-5 中 4-9：2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在 Ia-3 中 1-21：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-

環己基丁基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-42：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-93：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-294：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-351：2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-367：2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-473：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-549：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-559：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-570：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號在Ia-3中1-621：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-627：2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-643：2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-833：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-834：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-838：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-842：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-899：2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-903：2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-949：2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基丙-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1021：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1082：2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁醯基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1083：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1093：2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1094：2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1462：2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊基)嘧啶-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1561：2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊-炔基)嘧啶-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1707：2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊醯基)嘧啶-2-基]丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1831：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]嘧啶-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1834：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]嘧啶-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1836：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]嘧啶-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1841：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]嘧啶-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1842：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]嘧啶-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1843：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]嘧啶-2-基}丁烷-1-醇、

例示化合物編號　在Ia-3中1-1845：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]嘧啶-2-基}丁烷-1-醇及

例示化合物編號 在Ia-3中1-1846：2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁烷-1-醇。

上述表5[式(IIa-1)、(IIa-2)及(IIa-3)]、表6[(IIb-1)、(IIb-2)及(IIb-3)]及表7[(IIa-4)]中，

本發明之化合物(II)尤宜爲，

例示化合物編號：5-19, 5-23～5-32, 5-36～5-45, 5-49～5-58, 5-62～5-71, 5-75～5-84, 5-88～5-102, 5-106～5-156, 5-160～5-214, 5-218～5-268, 5-272～5-321, 5-325～5-334, 5-338～5-347, 5-351～5-360, 5-364～5-373, 5-377～5-386, 5-390～5-404, 5-408～5-458, 5-462～5-513, 5-517～5-526, 5-530～5-544, 5-548～5-598, 5-602～5-657, 5-670, 5-674～5-683, 5-696, 5-700～5-717, 5-721～5-730, 5-734～5-743, 5-747～5-756, 5-760～5-774, 5-778～5-828, 5-832～5-886, 5-890～5-940, 5-944～5-993, 5-997～5-1006, 5-1010～5-1019, 5-1045, 5-1049～5-1058, 5-1062～5-1076, 5-1080～5-1130, 5-1134～5-1185, 5-1189～5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212～5-1216, 5-1220～5-1270, 5-1274～5-1331, 5-1335～5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1361～5-1370, 5-1374～5-1387, 5-1391～5-1400, 5-1404～5-1418, 5-1422～5-1472, 5-1476～5-1527, 5-1531～5-1540, 5-1544～5-1558, 5-1562～5-1612, 5-1616～5-1673, 5-1677～5-1686, 5-1690～5-1699, 5-1703～5-1712, 5-1716～5-1729, 5-1733～5-1744, 5-1748～5-1768, 5-1772～5-1793, 5-1797～5-1820, 5-1824～5-1846, 5-1850～5-1869, 5-1872, 5-1876, 5-1880, 5-1884, 5-1888～5-1892, 5-1896, 5-1900, 5-1908～5-1913, 5-1917～5-1939, 5-1943～5-1966, 5-1970～5-1991, 5-1995～5-2013, 5-2017, 5- 2021, 5-2025, 5-2029, 5-2033, 5-2037～5-2042, 5-2046～5-2068, 5-2072～5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2101, 5-2105, 5-2109, 5-2113, 5-2117, 5-2121, 5-2125, 5-2129, 5-2133, 5-2135, 5-2139～5-2158, 5-2161～5-2164, 5-2185～5-2346, 5-2398～5-2557,

6-9～6-18, 6-22～6-43, 6-47～6-70, 6-74～6-96, 6-100～6-119, 6-142, 6-146, 6-150, 6-154, 6-158～6-163, 6-167～6-183, 6-185～6-189, 6-193

～6-216, 6-220～6-241, 6-245～6-263, 6-267, 6-271, 6-275, 6-279, 6-283, 6-287～6-292, 6-296～6-318, 6-322～6-338, 6-343, 6-347, 6-351, 6-371, 6-375～6-377, 6-381～6-407, 6-416～6-511,

7-9～7-12

尤 宜、

5-19, 5-32, 5-36～5-45, 5-57, 5-62～5-71, 5-84, 5-88, 5-97～5-100, 5-152～5-154, 5-160～5-214, 5-218～5-227, 5-264～5-268, 5-272～5-321, 5-334, 5-347, 5-360, 5-373, 5-386, 5-390～5-402, 5-454～5-458, 5-462～5-513, 5-526, 5-530～5-542, 5-594～5-598, 5-602～5-653, 5-743, 5-756, 5-760～5-768, 5-770～5-774, 5-778～5-828, 5-832～5-886, 5-890～5-940, 5-944～5-993, 5-1045, 5-1058, 5-1062～5-1074, 5-1126～5-1130, 5-1134～5-1185, 5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212～5-1214, 5-1266～5-1270, 5-1274～5-1331, 5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1370, 5-1374～5-1387, 5-1400, 5-1404～5-1416, 5-1468～5-1472, 5-1476～5-1527, 5-1540, 5-1544～5-1556, 5-1608～5-1612, 5-1616～5-1666, 5-1729, 5-1742, 5-1744, 5-1759～5-1767, 5-1789～5-1793, 5-1797～5-1818, 5-1842～5-1846, 5-1900, 5-1908～5-1913, 5-1935～5-1939, 5-1943～5-1966, 5-1987～5-1991, 5-2013, 5-2017, 5-2029, 5-2033, 5-2037～5-2042, 5-2064～5-2068, 5-2072～5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2101, 5-2105, 5-2109, 5-2129, 5-2133, 5-2135, 5-2185～5-2346, 5-2398～5-2557,

6-11～6-18, 6-39～6-43, 6-47～6-70, 6-185～6-189, 6-193～6-216, 6-287～6-292, 6-338, 6-343, 6-347, 6-351, 6-416～6-511,

7-9～7-12

尤 其

5-45, 5-71, 5-84, 5-88, 5-97～5-100, 5-152～5-154, 5-160～5-206, 5-209～5-212, 5-264～5-266, 5-334, 5-373, 5-386, 5-390～5-402, 5-454～5-458, 5-462～5-485, 5-509, 5-510, 5-513, 5-526, 5-530～5-542, 5-594～5-598, 5-602～5-613, 5-649, 5-650, 5-743, 5-756, 5-760～5-768, 5-770～5-772,

5-824～5-828, 5-832～5-884, 5-936, 5-1045, 5-1058, 5-1062～5-1074, 5-1126～5-1130, 5-1134～5-1145, 5-1148～5-1151, 5-1162, 5-1163, 5-1179～5-1182, 5-1185, 5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212, 5-1213, 5-1214, 5-1266～5-1270, 5-1274～5-1285, 5-1288～5-1291, 5-1319～5-1322, 5-1329～5-1331, 5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1370, 5-1387, 5-1400, 5-1404～5-1416, 5-1468～5-1472, 5-1476～5-1487, 5-1490～5-1493, 5-1504, 5-1505, 5-1521～5-1524, 5-1527, 5-1540, 5-1544～5-1556, 5-1608～5-1612, 5-1616～5-1627, 5-1663, 5-1664, 5-1729, 5-1742, 5-1744, 5-1761～5-1766, 5-1789～5-1791, 5-1815～5-1818, 5-1900, 5-1909, 5-1962, 5-2064～5-2066, 5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2101, 5-2105, 5-2133, 5-2216～5-2288, 5-2290～5-2346, 5-2398～5-2557,

7-9～7-12

更宜爲

例示化合物編號 在IIa-1中5-84：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-770：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-824：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-1063：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-1072：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-1331：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-2278：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲基苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-834：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氯苯基)戊-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-846：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-三氟甲苯基)戊-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-1065：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-2273：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-2280：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-1中5-2284：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-824：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1063：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-[3-(4-甲基)苯氧基丙-1-炔基]吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1072：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-2278：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-84：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1344：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-2332：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[5-(4-氯苯基)戊醯基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-2338：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[5-(3-三氟甲苯基)戊醯基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1331：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1330：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1329：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-4中7-12：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-4中7-11：磷酸單2-胺基-2-甲

基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-4中7-10：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-4中7-9：磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-71：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-84：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-98：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-152：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-210：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(6-環己基己基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-264：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(6-苯己基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-373：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己氧丙基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-386：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-苯氧丙基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-400：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-454：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯氧丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-509：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己氧戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-510：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯氧戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-513：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧丙基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-743：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-756：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-770：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-824：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-882：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(6-環己基己-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-936：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(6-苯基己-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1045：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己氧基丙-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1058：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-苯氧基丙-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1072：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1126：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-[5-(4-苯氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1181：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己氧基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1182：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯氧基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1185：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基丙-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1329：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1330：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1331：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1344：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1357：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(6-環己基己醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1370：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(6-苯基己醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1387：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己氧基丙醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1400：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-苯氧基丙醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1414：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-[5-(4-環己氧基丁醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1468：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯氧基丁醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1523：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己氧基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1524：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯氧基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1527：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基丙醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1729：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基甲氧苯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1742：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基乙氧苯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1744：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧苯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1761：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1764：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1816：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(6-環己基己基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1900：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1909：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1962：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(6-環己基己-1-炔基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2089：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(4-環己基丁醯基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2097：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊醯基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2105：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(6-環己基己醯基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、及

例示化合物編號 在IIa-3中5-463：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-479：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-594：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-760：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯基)丁-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-761：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯基)丁-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-762：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-乙苯基)丁-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-763：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-三氟甲苯基)丁-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-764：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯基)丁-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁

酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-765：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-乙氧苯基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-766：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲硫苯基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-832：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-833：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-834：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氯苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-836：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-甲苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-837：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-846：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-三氟甲苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-847：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-三氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-848：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁

酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-849：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-860：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-甲硫苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-861：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲硫苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-877：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二甲苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-878：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二甲苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1050：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲環己氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1062：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氟苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1063：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1064：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1065：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1066：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1067：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1068：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1134：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1135：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1136：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氯苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1138：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[4-(3-甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1139：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1148：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-三氟甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1149：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-三氟甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1150：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-甲氧苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1151：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1162：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-甲硫苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1163：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲硫苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1179：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,4-二甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-

丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1180：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,5-二甲苯氧基)丁-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1198：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-苄氧基丙-1-炔基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1202：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氟苯基)甲氧基丙-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1203：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯基)甲氧基丙-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1204：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯基)甲氧基丙-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1205：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-三氟甲苯基)甲氧基丙-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1206：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲氧苯基)甲氧基丙-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1207：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙氧苯基)甲氧基丙-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1208：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯基)甲氧基丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1212：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基甲氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1266：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1274：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-氟苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1275：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1276：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氯苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1278：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-甲苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1279：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1288：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-三氟甲苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1289：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-三氟甲苯基)甲氧基丁-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1290：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-甲氧苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1291：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1319：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,4-二甲苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1320：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,5-二甲苯基)甲氧基丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1348：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1349：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1350：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-乙苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1351：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-三氟甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1352：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1353：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-乙氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1354：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲硫苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1476：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-氟苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1477：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1478：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氯苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1480：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1481：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1490：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-三氟甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1491：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-三氟甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1492：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-甲氧苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1493：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1504：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-甲硫苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1505：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲硫苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1521：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,4-二甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1522：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,5-二甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2093：磷酸單2-胺基-乙基-4-[5-(4-苯基丁醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2101：磷酸單2-胺基-乙基-4-[5-(5-苯基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2109：磷酸單2-胺基-乙基-4-[5-(6-苯基己醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2257：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2258：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁

酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2259：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-氯苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2260：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二氯苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2261：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二氯苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2262：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二三氟甲苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2263：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二三氟甲苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2264：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2265：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2266：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4,5-三甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2267：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[5-(3-乙醯苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2268：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-乙醯苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2269：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-氟苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2270：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二氟苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2271：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二氟苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2272：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-氯苯基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2273：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2274：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2275：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2276：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2278：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2279：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2280：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2281：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2282：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2283：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2284：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-2285：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2286：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4,5-三甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2287：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2288：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2290：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,4-二氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2291：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,5-二氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2292：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-氯苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2293：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,4-二氯苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2294：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,5-二氯苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-

丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2295：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,4-二三氟甲苯氧基)丁-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2296：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,5-二三氟甲苯氧基)丁-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2297：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,4-二甲氧苯氧基)丁-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2298：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,5-二甲氧苯氧基)丁-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2299：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3,4,5-三甲氧苯氧基)丁-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2300：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(3-乙醯苯氧基)丁-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2301：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-乙醯苯氧基)丁-1-炔基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2328：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-氟苯基)戊醯基]嘧吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2329：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[5-(3,4-二氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2330：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2331：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-氯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2332：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2333：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二氯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2334：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二氯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2335：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2336：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2337：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2338：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-三氟甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁

酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2339：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二三氟甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2340：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二三氟甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2341：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2342：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4-二甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2343：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,5-二甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2344：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3,4,5-三甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2345：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-乙醯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯及

例示化合物編號 在IIa-3中5-2346：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-乙醯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

最好爲、

例示化合物編號 在IIa-1中5-84：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-1中5-770：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-1中5-824：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-1中5-1072：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-1中5-1331：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-1中5-2278：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲基苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-2中5-824：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-2中5-1063：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-[3-(4-甲基)苯氧基丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-2中5-1072：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-2中5-2278：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-2中5-1344：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1331：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1330：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-2中5-1329：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-4中7-12：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-4中7-11：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-4中7-10：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-4中7-9：磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-71：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-98：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-152：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-400：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-463：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-479：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-594：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-743：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-756：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-770：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-824：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-833：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-849：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1050：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲環己氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1063：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1064：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1068：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1072：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1135：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1139：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基]嘧啶-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1185：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基丙-1-炔基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1266：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧基丁-1-炔基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1329：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁醯基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1330：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁醯基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1331：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1344：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊醯基)嘧啶-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號　在IIa-3中5-1348：磷酸單2-胺基-2-

甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1764：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-1909：磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2097：磷酸單2-胺基-乙基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2273：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2276：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2278：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2283：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2284：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2285：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2287：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

例示化合物編號 在IIa-3中5-2288：磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯。

上述表5[式(IIIa-1)、(IIIa-2)及(IIIa-3)]、表6[(IIIb-1)、(IIIb-2)及(IIIb-3)]及表8[(IIIa-4)]中，本發明之化合物（III）尤宜爲、

例示化合物編號：5-19, 5-23～5-32, 5-36～5-45, 5-49～5-58, 5-62～5-71, 5-75～5-84, 5-88～5-102, 5-106～5-156, 5-160～5-214, 5-218～5-268, 5-272～5-321, 5-325～5-334, 5-338～5-347, 5-351～5-360, 5-364～5-373, 5-377～5-386, 5-390～5-404, 5-408～5-458, 5-462～5-513, 5-517～5-526, 5-530～5-544, 5-548～5-598, 5-602～5-657, 5-670, 5-674～5-683, 5-696, 5-700～5-717, 5-721～5-730, 5-734～5-743, 5-747～5-756, 5-760～5-774, 5-778～5-828, 5-832～5-886, 5-890～5-940, 5-944～5-993, 5-997～5-1006, 5-1010～5-1019, 5-1045, 5-1049～5-1058, 5-1062～5-1076, 5-1080～5-1130, 5-1134～5-1185, 5-1189～5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212～5-1216, 5-1220～5-1270, 5-1274～5-1331, 5-1335～5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1361～5-1370, 5-1374～5-1387, 5-1391～5-1400, 5-1404～5-1418, 5-1422～5-1472, 5-1476～5-1527, 5-1531～5-1540, 5-1544～5-1558, 5-1562～5-1612, 5-1616～5-1673, 5-1677～5-1686, 5-1690～5-1699, 5-1703～5-1712, 5-1716～5-1729, 5-1733～5-1744, 5-1748～5-1768, 5-1772～5-1793, 5-1797～5-1820, 5-1824～5-1846, 5-1850～5-1869, 5-1872, 5-1876, 5-1880, 5-1884, 5-1888～5-1892, 5-1896, 5-1900, 5-1908～5-1913, 5-1917～5-1939, 5-1943～5-1966, 5-1970～5-1991, 5-1995～5-2013, 5-2017, 5- 2021, 5-2025, 5-2029, 5-2033, 5-2037～5-2042, 5-2046～5-2068, 5-2072～5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2101, 5-2105, 5-2109, 5-2113, 5-2117,

5-2121, 5-2125, 5-2129, 5-2133, 5-2135, 5-2139～5-2158, 5-2161～5-2164, 5-2185～5-2346, 5-2398～5-2557,

6-9～6-18, 6-22～6-43, 6-47～6-70, 6-74～6-96, 6-100～6-119, 6-142, 6-146, 6-150, 6-154, 6-158～6-163, 6-167～6-183, 6-185～6-189, 6-193～6-216, 6-220～6-241, 6-245～6-263, 6-267, 6-271, 6-275, 6-279, 6-283, 6-287～6-292, 6-296～6-318, 6-322～6-338, 6-343, 6-347, 6-351, 6-371, 6-375～6-377, 6-381～6-407, 6-416～6-511,

8-9～8-12

更 宜

5-19, 5-32, 5-36～5-45, 5-57, 5-62～5-71, 5-84, 5-88, 5-97～5-100, 5-152～5-154, 5-160～5-214, 5-218～5-227, 5-264～5-268, 5-272～5-321, 5-334, 5-347, 5-360, 5-373, 5-386, 5-390～5-402, 5-454～5-458, 5-462～5-513, 5-526, 5-530～5-542, 5-594～5-598, 5-602～5-653, 5-743, 5-756, 5-760～5-768, 5-770～5-774, 5-778～5-828, 5-832～5-886, 5-890～5-940, 5-944～5-993, 5-1045, 5-1058, 5-1062～5-1074, 5-1126～5-1130, 5-1134～5-1185, 5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212～5-1214, 5-1266～5-1270, 5-1274～5-1331, 5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1370, 5-1374～5-1387, 5-1400, 5-1404～5-1416, 5-1468～5-1472, 5-1476～5-1527, 5-1540, 5-1544～5-1556, 5-1608～5-1612, 5-1616～5-1666, 5-1729, 5-1742, 5-1744, 5-1759～5-1767, 5-1789～5-1793, 5-1797～5-1818, 5-1842～5-1846, 5-1900, 5-1908～5-1913, 5-1935～5-1939, 5-1943～5-1966, 5-1987～5-1991, 5-2013, 5-2017, 5-2029, 5-2033, 5-2037～5-2042, 5-2064～5-2068, 5-2072～5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2101, 5-2105, 5-2109, 5-2129, 5-2133, 5-2135, 5-2185～5-2346, 5-2398～5-2557,

6-11～6-18, 6-39～6-43, 6-47～6-70, 6-185～6-189, 6-193～6-216, 6-287～6-292, 6-338, 6-343, 6-347, 6-351, 6-416～6-511,

8-9～8-12

尤 宜

5-45, 5-71, 5-84, 5-88, 5-97～5-100, 5-152～5-154, 5-160～5-206, 5-209～5-212, 5-264～5-266, 5-334, 5-373, 5-386, 5-390～5-402, 5-454～5-458,

5-462～5-485, 5-509, 5-510, 5-513, 5-526, 5-530～5-542, 5-594～5-598, 5-602～5-613, 5-649, 5-650, 5-743, 5-756, 5-760～5-768, 5-770～5-772, 5-824～5-828, 5-832～5-884, 5-936, 5-1045, 5-1058, 5-1062～5-1074, 5-1126～5-1130, 5-1134～5-1145, 5-1148～5-1151, 5-1162, 5-1163, 5-1179～5-1182, 5-1185, 5-1198, 5-1202～5-1208, 5-1212, 5-1213, 5-1214, 5-1266～5-1270, 5-1274～5-1285, 5-1288～5-1291, 5-1319～5-1322, 5-1329～5-1331, 5-1344, 5-1348～5-1357, 5-1370, 5-1387, 5-1400, 5-1404～5-1416, 5-1468～5-1472, 5-1476～5-1487, 5-1490～5-1493, 5-1504, 5-1505, 5-1521～5-1524, 5-1527, 5-1540, 5-1544～5-1556, 5-1608～5-1612, 5-1616～5-1627, 5-1663, 5-1664, 5-1729, 5-1742, 5-1744, 5-1761～5-1766, 5-1789～5-1791, 5-1815～5-1818, 5-1900, 5-1909, 5-1962, 5-2064～5-2066, 5-2089, 5-2093, 5-2097, 5-2105, 5-2133, 5-2216～5-2288, 5-2290～5-2346, 5-2398～5-2557,

8-9～8-12

更佳之化合物爲，

例示化合物編號 在 IIIa-1 中 5-84：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在 IIIa-1 中 5-770：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在 IIIa-1 中 5-824：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在 IIIa-1 中 5-1063：3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在 IIIa-1 中 5-1072：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在 IIIa-1 中 5-1331：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在 IIIa-1 中 5-2278：3-胺基-3-甲基

-5-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-834：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-氯苯基)戊-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-846：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3-三氟甲苯基)戊-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-1065：3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-2273：3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-2280：3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-2284：3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-824：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯基戊-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1063：3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(4-甲基)苯氧基丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1072：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦

酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-2278：3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲基苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-84：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1344：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-2332：3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[5-(4-氯苯基)戊醯基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-2338：3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[5-(3-三氟甲苯基)戊醯基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1331：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1330：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1329：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-4中8-12：3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-4中8-11：3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-4中8-10：3-胺基-3-甲基-5-[1-

乙基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-4中8-9：3-胺基-3-甲基-5-[1-

乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-71：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-84：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(4-苯基丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-98：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-152：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(5-苯基戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-210：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(6-環己基己基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-264：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(6-苯基己基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-373：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(3-環己氧丙基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-386：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(3-苯氧丙基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-400：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-454：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(4-苯氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-509：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(5-環己氧戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-510：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯氧戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-513：3-胺基-3-甲基-5-[5-(3-環己基甲氧丙基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1329：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1330：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苯基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1331：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1344：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1357：3-胺基-3-甲基-5-[5-(6-環己基己醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1370：3-胺基-3-甲基-5-[5-(6-苯基己醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1387：3-胺基-3-甲基-5-[5-(3-環己氧基丙醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1400：3-胺基-3-甲基-5-[5-(3-苯氧基丙醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1414：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1468：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苯氧基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在 IIIa-3 中 5-1523：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(5-環己氧基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1524：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯氧基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1527：3-胺基-3-甲基-5-[5-(3-環己基甲氧丙醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1729：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基甲氧苯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1742：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基乙氧苯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1744：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苄氧苯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1761：3-胺基-3-乙基-5-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1764：3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1816：3-胺基-3-乙基-5-[5-(6-環己基己基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2089：3-胺基-3-乙基-5-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2097：3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、及

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2105：3-胺基-3-乙基-5-[5-(6-環己基己醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

及

例示化合物編號 在IIIa-3中5-463：3-胺基-3-甲基

-5-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-479：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-594：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1348：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1349：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1350：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-乙苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1351：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-三氟甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1352：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1353：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-乙氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1354：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-甲硫苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1476：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(3-氟苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1477：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1478：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-氯苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1480：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(3-甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1481：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1490：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(3-三氟甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1491：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-三氟甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1492：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(3-甲氧苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1493：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1504：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(3-甲硫苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1505：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲硫苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1521：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(3,4-二甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1522：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(3,5-二甲苯氧基)丁醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2093：3-胺基-3-乙基-5-[5-(4-苯基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2101：3-胺基-3-乙基

-5-[5-(5-苯基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2109：3-胺基-3-乙基-5-[5-(6-苯基己醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2328：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2329：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,4-二氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2330：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,5-二氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2331：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3-氯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2332：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-氯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2333：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,4-二氯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2334：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,5-二氯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2335：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3-甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2336：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,4-二甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2337：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,5-二甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2338：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3-三氟甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-2339：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,5-二三氟甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-2340：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,5-二三氟甲苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-2341：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3-甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-2342：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,4-二甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-2343：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,5-二甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-2344：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3,4,5-三甲氧苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-2345：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(3-乙醯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸及、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-2346：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-乙醯苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸，

最好爲，

例示化合物編號　在IIIa-1中5-84：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯基戊基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-1中5-770：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-1中5-824：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(5-苯基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-1072：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-1331：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-1中5-2278：3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-824：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯基戊-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1063：3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(4-甲基)苯氧基丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1072：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-2278：3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1344：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1331：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-2中5-1330：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-2中5-1329：3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-4中8-12：3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-苯基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-4中8-11：3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-4中8-10：3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-苯基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-4中8-9：3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-71：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-98：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-152：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯基戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-400：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-463：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-479：3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-594：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號　在IIIa-3中5-1329：3-胺基-3-甲基

-5-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1330：3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苯基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1331：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1344：3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1348：3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

例示化合物編號 在IIIa-3中5-1764：3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸及

例示化合物編號 在IIIa-3中5-2097：3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸。

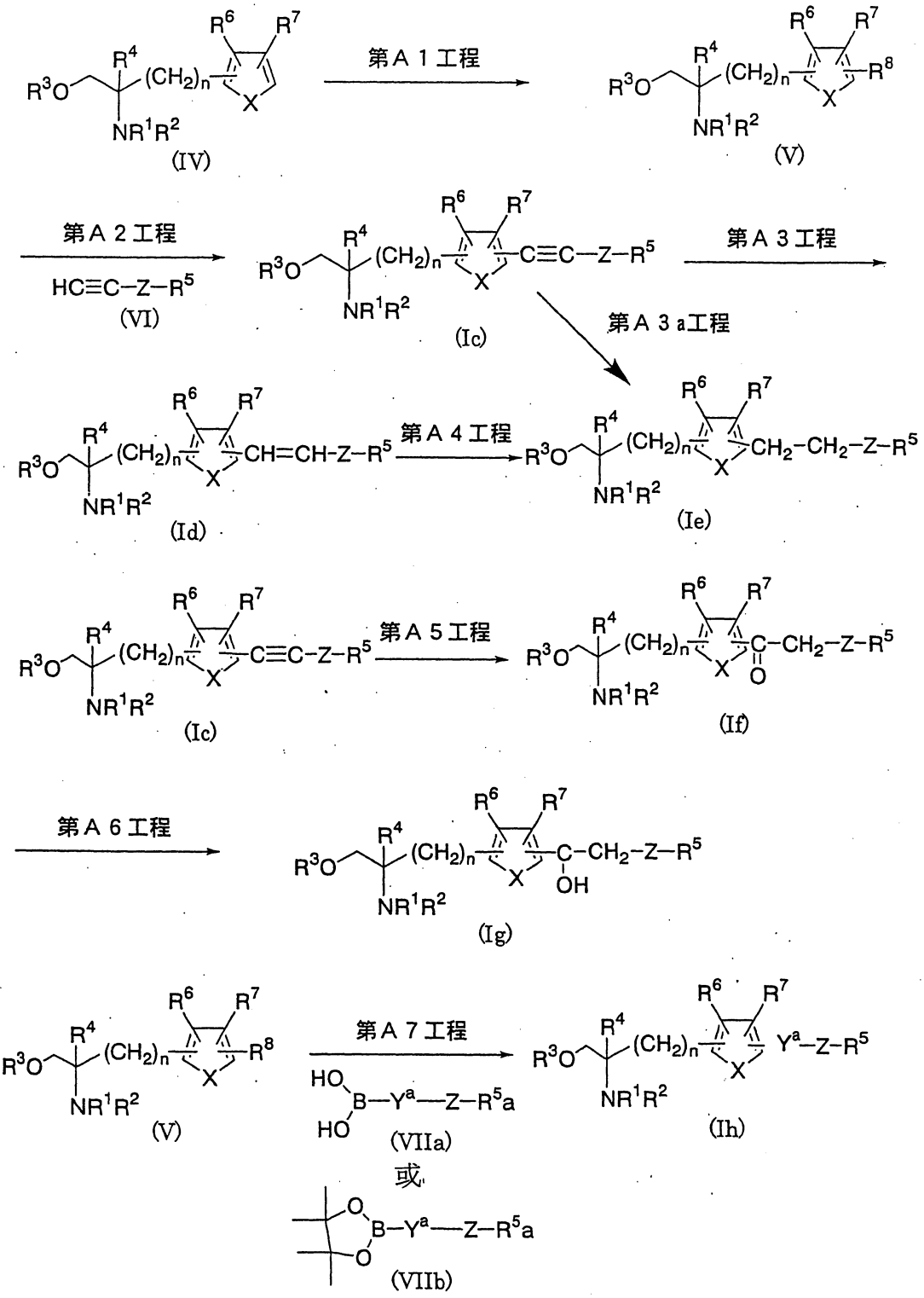
[發明之實施形態]

本發明化合物(I)、(II)及(III)可以下所記載之方法製造。

(A法)

A法爲製造化合物(I)中Y爲伸乙炔基之化合物(Ic)、Y爲伸乙烯基之化合物(Id)、Y爲伸乙基之化合物(Ie)、Y爲含-CO-CH_2基之化合物(If)、Y爲含-CH(OH)-基之化合物(Ig)及Y爲芳基或取代以1～3個取代基群a之芳基化合物(Ih)之方法。

A法


第A 1 工程
(IV)
(V)
第A 2 工程
HC≡C–Z–R5
(VI)
第A 3 工程
(Ic)
第A 3 a工程
第A 4 工程
(Id)
(Ie)
第A 5 工程
(Ic)
(If)
第A 6 工程
(Ig)
第A 7 工程
(V)
(VIIa)
或
(VIIb)
(Ih)

上述式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、X、Z及n之定義如上、R^8爲溴或碘、R^5a爲R^5中有取代基之胺基、羥基及/或羧基、可有保護基之胺基、羥基及/或羧基或其它如R^5定義之基、環Y^a爲芳基或取代以1～3個取代基群a之芳基。

R^5a定義中「可有保護基之胺基」之「保護基」爲有機合成化學領域使用之胺基保護基，並無特定、可如上述所例示者、宜爲低烷氧羰基、最宜爲第三丁氧羰基。

R^5a定義中「可有保護之羥基」之「保護基」爲有機合成化學領域使用之羥基保護基則無特定、例如、上述「羥基之酯反應中一般保護基」同意義、宜爲低脂族醯基、芳香族醯基、低烷氧羰基或(低烷氧基)甲基、更宜爲低脂族醯基或(低烷氧基)甲基、最宜爲乙醯基或甲氧甲基。

R^5a定義中「可被保護之羧基」之「保護基」爲有機合成化學領域所使用羧基保護基，並無特限、例如、可如上述「羧基之酯中反應之一般保護基」所例示者、宜爲低烷基、最宜爲甲基。

第A1工程

第A1工程爲製造一般式(V)化合物之工程、將一般式(IV)化合物、於惰性溶劑中、於存在或不存在鹼下、與溴化劑或碘化劑反應來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定,例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁

烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；或甲醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類、溴化時宜爲醯胺類(最宜爲 N,N-二甲基甲醯胺)、碘化時宜爲鹵化烴類(最宜爲二氯甲烷或氯仿)。

上述反應中使用之溴化劑並無特限、可如於“Comprehensive Organic Transformation”(Larlock、VCH、p316-317)中記載之溴化劑、宜爲 N-溴丁二醯亞胺。

上述反應中使用之碘化劑並無特限、可如於“Comprehensive Organic Transformation”(Larlock、VCH、p316-317)中記載之碘化劑、宜爲碘。

上述反應使用之鹼只要對化合物(IV)中鹵素取代位置以外部分不影響則無特定、例如、碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀等鹼金屬碳酸鹽類；碳酸氫鋰、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀等鹼金屬重碳酸鹽類；甲氧化鋰、甲氧化鈉、乙氧化鈉、第三丁氧化鉀等金屬烷氧類；三乙胺、三丁胺、二異丙基乙胺、N-甲嗎啉、吡啶、2,6-二甲吡啶、4-(N,N-二甲胺基)吡啶、N,N-二甲苯胺、N,N-二乙苯胺、1,5-二吖雙環[4.3.0]壬-5-烯、1,4-二吖雙環[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,8-二吖雙環[5.4.0]-7-十一碳烯(DBU)等有機胺類；丁基鋰、二異丙胺鋰(LDA)、雙(三甲基矽烷基)胺鋰等有機金屬鹼類；或上述鹼之組合。宜爲有機胺類(最宜爲吡啶)。

反應温度可視原料化合物、溴化劑或碘化劑、溶劑種類等而定、通常爲-78℃～150℃、宜爲-20℃～100℃(最宜爲 0℃～60℃)。

反應時間可視反應溫度、原料化合物、反應試劑或使用之溶劑種類等而定、通常爲 5 分～60 小時、宜爲 15 分～24 小時(最宜爲 30 分～4 小時)。

反應終了後、本反應及後述第 A2 工程～第 A7 工程之目的化合物可依常法從反應混合物回收。例如、將反應混合物適當中和、若有不溶物時，濾除後,加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑,分離含目的化合物之有機層,以水等洗淨後,以無水硫酸鎂、無水硫酸鈉、無水碳酸氫鈉等乾燥後,蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法,例如再結晶、再沈澱等通常有機化合物之分離精製慣用之方法、例如、矽膠、鋁氧化鋁、鎂-矽膠系之氟氯碳化物等載體之吸附柱層析法；Sephadex LH-20(Pharmacia 公司製造)、Amberlite XAD-11(Rhom & Haas 公司製造)、Daiyaion HP-20(三菱化學公司製造)等載體之分配柱層析等合成吸附劑之方法、用離子交換層析之方法、或將用矽膠或烷化矽膠之順相・逆相柱層析法(宜高速液體層析)適當組合,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

第 A2 工程

第 A2 工程爲製造一般式(Ic)化合物之工程、將化合物(V)於惰性溶劑中、於氮氣及存在鹼及鈀觸媒下、與化合物(VI)進行 Sonogashira 偶化反應、視需要可除去羥基、胺基及/或羧基保護基。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定,例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；甲苯、苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、

二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；甲酸乙酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸丁酯、碳酸二乙酯等酯類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁酮、異佛爾酮、環己酮等酮類；乙腈、異丁腈等腈類；甲醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類；二甲亞碸等亞碸類；或磺醯基等磺醯基類；、宜爲醚類、醯胺類或亞碸類(最宜爲醚類類或醯胺類)。反應溶劑可添加少量水以促進反應。

上述反應中使用之鹼爲一般 Sonogashira 偶化反應中使用之鹼，並無特限定、例如、碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀等鹼金屬碳酸鹽類；碳酸氫鋰、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀等鹼金屬重碳酸鹽類；氫化鋰、氫化鈉、氫化鉀等鹼金屬氫化物類；氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀等鹼金屬氫氧化物類；甲氧化鋰、甲氧化鈉、乙氧化鈉、第三丁氧化鉀等鹼金屬烷氧類；或三乙胺、三丁胺、二異丙基乙胺、N-甲嗎啉、吡啶、4-(N,N-二甲胺基)吡啶、N,N-二甲苯胺、N,N-二乙苯胺、1,5-二吖雙環[4.3.0]壬-5-烯、1,4-二吖雙環[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,8-二吖雙環[5.4.0]-7-十一碳烯(DBU)等有機胺類；宜爲有機胺類(最宜爲三乙胺)。

上述反應中使用之觸媒爲 Sonogashira 偶化反應中習用者使，並無特限定、例如、乙酸鈀、氯化鈀、碳酸鈀等鈀鹽類、於配基形成之複合物如二氯雙(三苯膦)鈀複合物等鈀鹽複合物類、鈀-碳素等。

可使用添加劑如碘化銅(I)、氯苄三乙銨以提升回產率。

反應溫度可視原料化合物、鹼、溶劑種類等而定、通常爲-20℃～200℃(宜爲0℃～120℃)。

反應時間可視原料化合物、鹼、溶劑、反應溫度等而定、通常爲5分～48小時(宜爲15分～24小時)。

R^1、R^2及R^3中除去羥基、胺基及/或羧基保護基之反應可依後述第A7工程中除去保護基之方法來施行。

本工程目的化合物(Ic)必要時可依常法、例如再結晶、再沈殿、或通常有機化合物之分離精製慣用之方法適當組合,應用層析,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

第A3工程

第A3工程爲製造一般式(Id)化合物之工程、於惰性溶劑中、將化合物(Ic)還原(宜於氫氣下以觸媒還原)、必要時可除去羥基、胺基及/或羧基保護基。除去該保護基可依後述第A7工程中除去保護基之方法來施行。

上述反應中觸媒還原所之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；甲苯、苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙酸甲酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸丁酯、碳酸二乙酯等酯類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油、辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；乙酸、鹽酸

等有機酸類；水；或上述溶劑與水之混合溶劑；宜爲醚類或醇類(最宜爲甲醇)。

觸媒還原中使用之觸媒只要爲一般三鍵及雙鍵中還原反應所使用者、並無特限、宜爲鈀一碳酸鈣、鈀一氧化鋁、鈀一碳素、鈀—硫酸鋇等鈀類或銠一氧化鋁等銠類、宜爲鈀一碳酸鈣。

本工程中、因將含在化合物(Ic)支鏈之伸乙炔基還原爲伸乙烯基、並不還原至伸乙基、故反應溶劑中可添加如吡啶、喹啉等鹼性芳香族化合物、銨、三乙胺等胺類(宜爲喹啉)等對觸媒隋性之物質。

壓力無特定,通常爲１～１０氣壓、宜爲１氣壓。

反應温度可視原料化合物、觸媒、溶劑種類等而定、通常爲-20℃～200℃(宜爲 0℃～100℃)。

反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑、反應温度等而定、通常爲 5 分～96 小時(宜爲 15 分～72 小時)。

本工程目的化合物(Id)視需要可依常法、例如、再結晶、再沈殿或通常有機化合物之分離精製慣用之方法適當組合,應用層析,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

第 A4 工程

第 A4 工程爲製造一般式(Ie)化合物之工程、於惰性溶劑中、將化合物(Id)還原(宜於氫氣下以觸媒還原)、必要時可除去羥基、胺基及/或羧基保護基。除去該保護基可依後述第 A7 工程中除去保護基之方法來施行。

上述反應中觸媒還原所用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如、可如上述第 A3 工程中使用者、宜

爲酯類、醚類或醇類(最宜爲乙酸乙酯或甲醇)。

上述反應中觸媒還原所用之觸媒爲觸媒還原反應中習用者、並無特限、例如鈀碳、鈀黑、氫氧化鈀、鈀-硫酸鋇等鈀類、氧化鉑、鉑黑等鉑類、銠一氧化鋁、三苯膦-氯化銠等銠類、阮來鎳等。

壓力並無限定,通常爲1～10氣壓、宜爲1氣壓。

反應溫度可視原料化合物、觸媒、溶劑種類等而定、通常、爲-20℃～200℃(宜爲0℃～100℃)。

反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑、反應溫度等而定、通常爲5分～96小時(宜爲15分～72小時)。

本工程目的化合物(Ie)視需要可依常法、例如、再結晶、再沈殿或通常有機化合物之分離精製慣用之方法適當組合,應用層析,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

第A3a工程

將一般式(Ie)化合物於惰性溶劑中以化合物(Ic)還原(宜爲氫氣下、觸媒還原)而得、必要時可除去其羥基、胺基及/或羧基保護基、可由2工程中一段製成、其中、觸媒還原中使用之惰性溶劑及觸媒還原之觸媒爲一般觸媒還原反應所使用者、並無特限定、可依上述第A4工程之方法來進行。

壓力無特定,通常爲1～10氣壓、宜爲1氣壓。

反應溫度可視原料化合物、觸媒、溶劑種類等而定、通常、-20℃～200℃(宜爲0℃～100℃)。

反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑、反應溫度等而定、通常爲5分～96小時(宜爲15分～72小時)。

第 A5 工程

第 A5 工程爲製造一般式(If)化合物之工程、將化合物(Ic)、於惰性溶劑中施行用酸觸媒之水合反應、必要時進行除去羥基、胺基及/或羧基保護基之反應。該保護基除去反應可依後述第 A7 工程中除去保護基之方法來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定，例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；甲酸乙酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸丁酯、碳酸二乙酯等酯類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁酮、異佛爾酮、環己酮等酮類；水；或上述溶劑之混合溶劑；宜爲醇類。

上述反應中使用之酸觸媒爲習用之酸觸媒，並無特定、例如、鹽酸、氫溴酸、硫酸、過氯酸、磷酸等無機酸或乙酸、甲酸、草酸、甲磺酸、對-甲苯磺酸、莰磺酸、三氟乙酸、三氟甲磺酸等有機酸等布連史脫酸或氯化鋅、四氯化錫、三氯化硼、三氟化硼、三溴化硼等路易士酸或、酸性離子交換樹脂、宜爲無機酸。

反應溫度可視原料化合物、觸媒、溶劑種類等而定、通常、爲-20℃～200℃(宜爲 0℃～100℃)。

反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑、反應溫度等而定、通常爲 5 分～96 小時(宜爲 15 分～72 小時)。

第 A6 工程

第 A6 工程爲製造一般式(Ig)化合物之工程、於惰性溶劑中、將化合物(If)中 CO 基以-CH(OH)-還原、必要時除去羥基、胺基及/或羧基保護基。除去該保護基可依後述第 A7 工程中除去保護基之方法來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、1,2-二氯乙烷、四氯化碳等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類或上述溶劑之混合溶劑、宜爲醚類或醇類(最宜爲甲醇或乙醇)。

上述反應中使用之還原劑爲可將 CO 基還原爲-CH(OH)-基之還原劑、並無特限、例如、硼氫化鈉、硼氫化鋰、氰硼氫化鈉等硼氫化鹼金屬類；或二異丁鋁氫化物、鋁氫化鋰、三乙氧鋁氫化鋰等鋁氫化物；宜爲硼氫化鹼金屬類(特爲硼氫化鈉)。

反應溫度可視原料化合物、還原劑、溶劑種類等而定、通常、爲-10℃～100℃(宜爲-20℃～20℃)。

反應時間可視原料化合物、還原劑、溶劑、反應溫度等而定、通常爲 10 分～48 小時(宜爲 30 分～12 小時)。

第 A7 工程

第 A7 工程爲製造一般式(Ih)化合物之工程；將化合物(V)與化合物(VIIa)或(VIIb)與 Suzukicoupling 反應後、必要時進行除去羥基、胺基及/或羧基保護之反應。該保護基除去反應可依後述第 A7 工程中除去保護基之方法來施行。

反應温度可視原料化合物、溶劑種類等而定、通常爲 0℃～150℃(宜爲 10℃～100℃)。

反應時間可視原料化合物、溶劑、反應温度等而定、通常爲 15 分～24 小時(宜爲 30 分～12 小時)。

上述反應中使用溶劑、鹼及鈀觸媒可依前述第 A2 工程中 Sonogashira 偶含反應所使用者。

本工程目的化合物(Ih)必要時可依常法、例如、再結晶、再沈殿等通常有機化合物之分離精製慣用之種種層析之適宜組合、以適當溶離劑溶離來分離、精製。

必要時除去羥基、胺基及/或羧基保護基之反應可視其種類而定、如依一般有機合成化學技術所周知之方法、例如 T.W. Green,(Protective Groups in Organic Synthesis), John Wiley & Sons： J. F. W. McOmis,(Protective Groups in Organic Chemistry), Plenum Press 中記載方法來施行、例如以下法來施行。

當胺基保護基爲矽烷基類時、通常以氟化四丁銨、氫氟酸、氫氟酸-吡啶、氟化鉀等形成氟陰離子之化合物處理來除去。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特

定、宜如、乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類等。

反應温度及反應時間無特定、通常於0℃～50℃下實施10分～18小時。

當胺基保護基爲脂族醯類、芳族醯類、烷氧羰基類或形成許夫鹼之取代亞甲基時,在水性溶劑之存在下用酸或鹼處理來除去。

上述反應中使用之酸爲習用酸,只要對反應無阻礙並無特限定、例如;氫溴酸、鹽酸、硫酸、過氯酸、磷酸、硝酸等無機酸、宜爲鹽酸。

上述反應中使用之鹼爲通常鹼習用者,只要對反應無阻礙並無特限定、宜爲碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀等鹼金屬碳酸鹽類;氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀等鹼金屬氫氧化物類;甲氧化鋰、甲氧化鈉、乙氧化鈉、第三丁氧化鉀等金屬烷氧類;氨水、濃氨-甲醇等氨類、宜爲鹼金屬氫氧化物。

上述反應中使用之惰性溶劑爲水解反應習用之溶劑,並無特限、例如、甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類;乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類;水;水與上述有機溶劑之混合溶劑;宜爲醚類或醇類與水之混合溶劑(最宜爲四氫呋喃、二噁烷、乙醇、甲醇與水之混合溶劑)。

反應温度及反應時間可視原料化合物、溶劑及使用酸

或鹼等而定、只要能抑制副反應並無特限、通常、於0℃～150℃下反應1小時～10小時。

當胺基保護基爲芳烷基類或芳烷氧羰基類時、通常、於惰性溶劑中、以還原劑接觸(宜爲觸媒下、以常温進行觸媒還原)來除去或用氧化劑來除去。

觸媒還原所使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如、己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；乙酸甲酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸丁酯、碳酸二乙酯等酯類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；乙酸等有機酸類；水；上述溶劑與水之混合溶劑；宜爲醇類、醚類、有機酸類或水(最宜爲醇類或有機酸類)。

觸媒還原除去使用之觸媒只要爲通常接觸還原反應使用者,則無特定,宜鈀－碳、阮來鎳、氧化鉑、鉑黑、銠-氧化鋁、三苯膦－氯化銠、鈀－硫酸鋇。

壓力無特定,通常爲1～10氣壓、宜爲1氣壓。

反應温度及反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑等而定、通常、於0℃～100℃下實施5分～24小時。

使用氧化劑之除去反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如、氯仿、二氯甲烷、1,2－二氯乙烷、四氯化碳等鹵化烴類；乙腈等腈類、乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚

等醚類；丙酮等酮類；甲醯胺、二甲基甲醯胺、二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類；及二甲亞碸等亞碸類；磺醯基；宜爲鹵化烴類、醚類或亞碸類(最宜爲鹵化烴類或亞碸類)。

使用之氧化劑只要爲一般氧化使用者、不影響反應者則無特限、宜爲過硫酸鉀、過硫酸鈉、硝酸銨鈰(CAN)、2,3-二氯－5，6－二氰－對昆(DDQ)。

反應溫度及反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑等而定、通常、於0℃～150℃下實施10分～24小時。

當胺基保護基爲芳烷基類時、於惰性溶劑中、使用酸以除去保護基。

上述反應中使用之酸爲習用之酸觸媒基，並無特限定、例如、鹽酸、氫溴酸、硫酸、過氯酸、磷酸等無機酸；乙酸、甲酸、草酸、甲磺酸、對甲苯磺酸、莰磺酸、三氟乙酸、三氟甲磺酸等有機酸等布連史脫酸或氯化鋅、四氯化錫、三氯化硼、三氟化硼、三溴化硼等路易士酸或、酸性離子交換樹脂、宜爲無機酸或有機酸(最宜爲鹽酸、乙酸或三氟乙酸)。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；氯仿、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氯化碳等鹵化烴類；乙酸甲酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸丁酯、碳酸二乙酯等酯類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁

醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油、辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；甲醯胺、二甲基甲醯胺、二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類；水；或水與上述溶劑之混合溶劑；宜爲醚類、醇類或水(最宜爲二噁烷、四氫呋喃、乙醇或水)。

反應温度可視原料化合物、使用酸、溶劑等而定、通常、爲-20℃～沸點温度(宜爲0℃～100℃)。

反應時間可視原料化合物、使用酸、溶劑、反應温度等而定、通常爲15分～48小時(宜爲30分～20小時)。

當胺基保護基爲烯氧羰基類、通常胺基保護基可依上述脂族醯類、芳族醯類、烷氧羰基類或形成許夫鹼之取代亞甲基場合時除去反應之條件來處理鹼。

當胺基保護基爲烯丙氧羰基時,尤其用鈀及三苯膦或四羰基鎳來除去之方法較簡便且副反應較少。

若羥基之保護基用矽烷基類時,通常以氟化四丁銨、氫氟酸、氫氟酸－吡啶、氟化鉀等形成氟陰離子之化合物處理來除去,或以如鹽酸、氫溴酸、硫酸、過氯酸、磷酸等無機酸或乙酸、甲酸、草酸、甲磺酸、對甲苯磺酸、莰磺酸、三氟乙酸、三氟甲磺酸等有機酸(宜爲鹽酸)處理來除去。

若由氟陰離子來除去保護基時所使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、宜爲乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚腈；乙腈、異丁腈等腈類；乙酸等有機酸；水；上述溶劑之混合溶劑、宜爲四氫呋喃。

若由氟陰離子來除去保護基時,加甲酸、乙酸、丙酸等有機酸有時可促進反應、防止反應生成物之分解並提升回產率。

由氟陰離子來除去保護基時,反應溫度及反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑等而定、通常、於0℃～100℃(宜爲10℃～50℃)、反應1小時～24小時。

由無機酸或有機酸來除去保護基時、可依胺基或亞胺基之保護基爲芳烷基類之場合相同反應條件來施行、可處理以無機酸或有機酸來完成。

當羥基保護基爲芳烷基類或芳烷氧羰基類時、通常在惰性溶劑中與還原劑接觸(宜觸媒下、常温接觸還原)來除去或用氧化劑來除去。

用接觸還原來除去所用之惰性溶劑只要不影響反應則無特限、例如、當胺基或亞胺基之保護基爲芳烷基類或芳烷氧羰基類時、由還原劑接觸而除去所使用之惰性溶劑爲相同、宜爲醇類(最宜爲甲醇)。

觸媒還原除去中使用之觸媒爲通常觸媒還原反應中使用者、並無特限、例如、當胺基或亞胺基之保護基爲芳烷基類或芳烷氧羰基類時、由還原劑接觸而除去所使用之隋性觸媒爲相同、宜爲鈀-碳素。

壓力無特定,通常爲1～10氣壓。

反應温度及反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑等而定、通常爲0℃～100℃(宜爲20℃～70℃)、5分～48小時(宜爲1小時～24小時)。

由氧化除去使用之溶劑只要不影響反應則無特限、例

如、當胺基保護基爲芳烷基類或芳烷氧羰基類時、與由氧化劑接觸而除去所使用之惰性溶劑相同。

所使用之氧化劑只要爲氧化使用之化合物則無特定、例如、當胺基保護基爲芳烷基類或芳烷氧羰基類時、與由氧化劑接觸而除去所使用之氧化劑相同。

反應温度及反應時間可視原料化合物、觸媒、溶劑等而定、通常爲 0℃ ～ 150℃、實施 10 分 ～ 24 小時。

於液體銨中或甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類中、在 -78℃ ～ 0℃、與金屬鋰、金屬鈉等鹼金屬類作用來除去。

若羥基之保護基爲芳烷基類或芳烷氧羰基類時、可在溶劑中使用氯化鋁-碘化鈉或碘化三甲矽烷等烷矽烷基鹵等以除去保護基。

當使用氯化鋁-碘化鈉、或烷矽烷基鹵類以除去保護基所用之惰性溶劑、只要不影響反應則無特限，宜爲二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等鹵化烴類；乙腈等腈類；上述溶劑之混合溶劑。

當使用氯化鋁-碘化鈉或烷矽烷基鹵以除去保護基時反應温度及反應時間可視原料化合物、溶劑等而定、通常於 0℃ ～ 50℃、反應 5 分 ～ 72 小時。

當反應基質含硫原子時，宜使用氯化鋁-碘化鈉。

當羥基保護基爲脂族醯類、芳族醯類或烷氧羰基類時、可於溶劑中處理以鹼而除去。

上述反應中使用之鹼爲習用鹼，只要對化合物其他部

分無影響則無特限、例如、碳酸鋰、碳酸鈉、碳酸鉀等鹼金屬碳酸鹽類；碳酸氫鋰、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀等鹼金屬重碳酸鹽類；氫氧化鋰、氫氧化鈉、氫氧化鉀等鹼金屬氫氧化物類；甲氧化鋰、甲氧化鈉、乙氧化鈉、第三丁氧化鉀等金屬烷氧類；氨水、濃氨一甲醇等氨類；宜爲鹼金屬氫氧化物類、金屬烷氧類或氨類(最宜爲鹼金屬氫氧化物類或金屬烷氧類)。

上述反應中使用之惰性溶劑爲水解反應中習用之溶劑，並無特限、宜如、乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；水；上述溶劑之混合溶劑。

反應温度及反應時間可視原料化合物、使用鹼、溶劑等而定、要能抑制副反應並無特限、通常、於-20℃～150℃下反應1小時～10小時。

當羥基保護基爲烷氧甲基類、四氫哌喃類、四氫硫哌喃類、四氫呋喃類、四氫噻吩類或已取代乙基類時、通常於惰性溶劑中處理以酸來除去。.

上述反應中使用之酸爲通常布連史脫酸或路易士酸反應中使用者、並無特限、宜爲氯化氫；鹽酸、硫酸、硝酸等無機酸；或乙酸、三氟乙酸、甲磺酸、對-甲苯磺酸等有機酸等布連史脫酸；三氟化硼等路易士酸、宜爲鹽酸或乙酸、亦可使用Dowex50W等強酸性陽離子交換樹脂。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；甲酸乙酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸丁酯、碳酸二乙酯等酯類；：乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁酮、異佛爾酮、環己酮等酮類；水；上述溶劑之混合溶劑；宜爲醚類(最宜爲四氫呋喃)或醇類(最宜爲甲醇)。

反應温度及反應時間可視原料化合物、使用酸、溶劑等而定、通常爲-10℃～200℃(宜爲0℃～150℃)、實施5分～48小時(宜爲30分～10小時)。

當羥基保護基爲烯氧羰基類時、通常、羥基保護基可依上述脂族醯類、芳族醯類或烷氧羰基類場合時除去反應之條件來處理鹼。

當於丙烯氧羰基時、使用鈀、及三苯膦、或雙(甲二苯膦)(1,5-環辛二烯)銥(I)・六氟磷酸酯之除去方法爲簡便且副反應較少。

當羰基保護基爲低烷基或可取代以低烷基、低烷氧基、硝基、鹵素或氰基之1～3個芳基取代之低烷基時、通常、可依羥基保護基爲上述脂族醯類、芳族醯類或烷氧羰基類時除去反應之相同條件而進行、處理以鹼來施

行。

胺基、羥基及/或羧基保護基之除去反應可依需求依次施行。

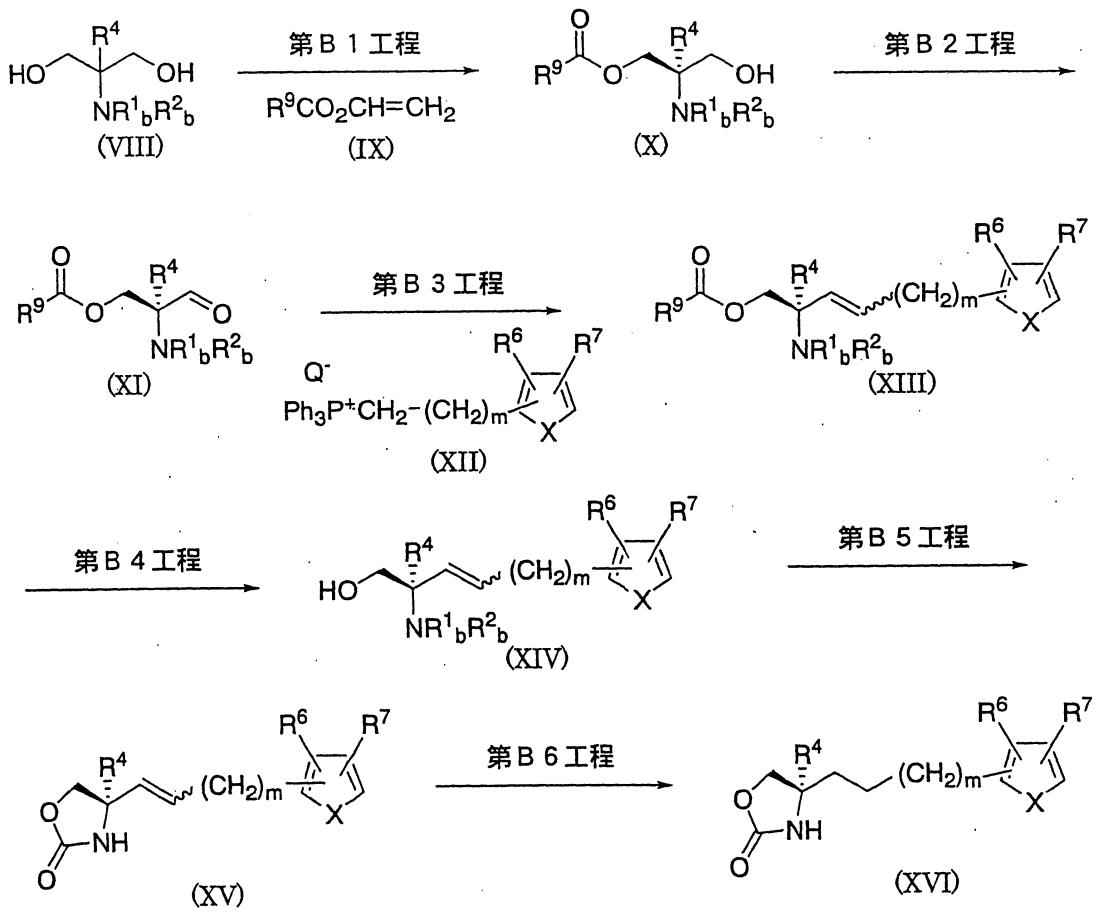
當需分離異構物時、於上述各工程反應終了後、或於所望工程終了後之適當階段依上述分離精製方法來施行。

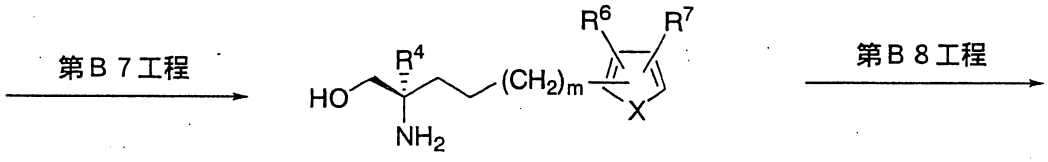
原料化合物(VI)及(VII)爲已知、可用已知方法或類似方法便於製造。

(B法)

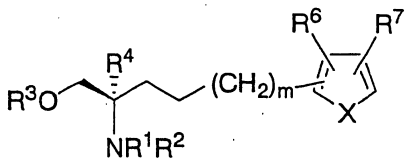
B法爲製造本發明化合物(I)中間體、即化合物(IV)之方法。

B法





(XVII)



(IV)

上述式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^6、R^7及X之定義如上、式$-NR^1bR^2b$之基爲有羰基保護基之已保護胺基、R^9爲C1-20烷基、有雜原子仲介之C2-C20烷基、取代以芳基或芳香族雜環基之C1～20烷基、C2-20炔基、有雜原子仲介之C3-C20炔基、取代以芳基或芳香族雜環基之C2-C20炔基、C2-C20烯基、有雜原子仲介之C3-20烯基、取代以芳基或芳香族雜環基之C2-20烯基、取代以芳基或芳香族雜環基之含鹵素之C2～20烷基、或爲C3-10環烷基、m爲0～4之整數、Ph爲苯基、Q爲鹵素(宜爲氯原子、溴原子或碘原子)。

上述R^9定義中「C1～C20烷基」爲如、上述「低烷基」、庚基、1-甲基己基、2-甲基己基、3-甲基己基、4-甲基己基、5-甲基己基、1-丙基丁基、4,4-二甲基戊基、辛基、1-甲基庚基、2-甲基庚基、3-甲基庚基、4-甲基庚基、5-甲基庚基、6-甲基庚基、1-丙基戊基、2-乙基己基、5,5-二甲基己基、壬基、3-甲基辛基、4-甲基辛基、5-甲基辛基、6-甲基辛基、1-丙基己基、2-乙基庚基、6,6-二甲基庚基、癸基、1-甲基辛基、3-甲基辛基、8-甲基辛基、3-乙基辛基、3,7-二甲基辛基、7,7-二甲基

辛基、十一基、4,8-二甲基辛基、十二基、十三基、十四基、十五基、3,7,11-三甲基十二基、十六基、4,8,12-三甲基十三基、1-甲基十五基、14-甲基十五基、13,13二甲基十四基、十七基、15-甲基十六基、十八基、1-甲基十七基、十九基、二十基、及、3,7,11,15-四甲基十六基等C1～20之直鏈或分歧鏈烷基、宜爲C1～C10烷基。

上述R^9定義中「含鹵素之C2～20烷基」爲上述「C1～20烷基」中「C2～20烷基」、含有相同或不同、1或2個硫原子、氧原子、或氮原子之基、例如、甲硫甲基、1-甲硫乙基、2-甲硫乙基、乙硫甲基、1-甲硫丙基、2-甲硫丙基、3-甲硫丙基、2-乙硫乙基、2-甲基-2-甲硫乙基、1-甲硫丁基、2-甲硫丁基、3-甲硫丁基、2-乙硫丙基、3-甲基-3-甲硫丙基、4-甲硫戊基、3-甲硫戊基、2-甲硫戊基、1-甲硫戊基、3,3-二甲硫丁基、2,2-二甲硫丁基、1,1-二甲硫丁基、1-甲基-2-甲硫丁基、1,3-二甲硫丁基、2,3-二甲硫丁基、2-乙硫丁基、1-甲硫己基、2-甲硫己基、3-甲硫己基、4-甲硫己基、5-甲硫己基、1-丙硫丁基、4-甲基-4-甲硫戊基、1-甲硫庚基、2-甲硫庚基、3-甲硫庚基、4-甲硫庚基、5-甲硫庚基、6-甲硫庚基、1-丙硫庚基、2-乙硫己基、5-甲基-5-甲硫己基、3-甲硫辛基、4-甲硫辛基、5-甲硫辛基、6-甲硫辛基、1-丙硫己基、2-乙硫庚基、6-甲基-6-甲硫庚基、1-甲硫辛基、3-甲硫辛基、8-甲硫辛基、3-乙硫辛基、3-甲基-7-甲硫辛基、7,7-二甲硫辛基、4-甲基-8-甲硫辛基、3,7-

二甲基-11-甲硫癸基、4,8-二甲基-12-甲硫十三基、1-甲硫十五基、14-甲硫十七基、13-甲基-13-甲硫十四基、15-甲硫十六基、1-甲硫十七基、及、3,7,11-三甲基-15-甲硫十六基等含1或2個硫原子之C2～20烷基；甲氧甲基、1-甲氧乙基、2-甲氧乙基、乙氧甲基、1-甲氧丙基、2-甲氧丙基、3-甲氧丙基、2-乙氧乙基、2-甲基-2-甲氧乙基、1-甲氧丁基、2-甲氧丁基、3-甲氧丁基、2-乙氧丙基、3-甲基-3-甲氧丙基、4-甲氧戊基、3-甲氧戊基、2-甲氧戊基、1-甲氧戊基、3,3-二甲氧丁基、2,2-二甲氧丁基、1,1-二甲氧丁基、1-甲基-2-甲氧丁基、1,3-二甲氧丁基、2,3-二甲氧丁基、2-乙氧丁基、1-甲氧己基、2-甲氧己基、3-甲氧己基、4-甲氧己基、5-甲氧己基、1-丙氧丁基、4-甲基-4-甲氧戊基、1-甲氧庚基、2-甲氧庚基、3-甲氧庚基、4-甲氧庚基、5-甲氧庚基、6-甲氧庚基、1-丙氧戊基、2-乙氧己基、5-甲基-5-甲氧己基、3-甲氧辛基、4-甲氧辛基、5-甲氧辛基、6-甲氧辛基、1-丙氧己基、2-乙氧庚基、6-甲基-6-甲氧庚基、1-甲氧壬基、3-甲氧壬基、8-甲氧壬基、3-乙氧辛基、3-甲基-7-甲氧辛基、7,7-二甲氧辛基、4-甲基-8-甲氧壬基、3,7-二甲基-11-甲氧十二基、4,8-二甲基-12-甲氧十三基、1-甲氧十五基、14-甲氧十七基、13-甲基-13-甲氧十四基、15-甲氧十六基、1-甲氧十七基、及3,7,11-三甲基-15-甲氧十六基等含1或2個氧原子之C2～20烷基；N-甲胺甲基、1-(N-甲胺基)乙基、2-(N-甲胺基)乙基、N-乙乙甲基、1-(N-甲胺基)丙基、2-(N-甲胺基)丙基、3-(N-甲

胺基)丙基、2-(N-乙胺基)乙基、2-(N,N-二甲胺基)乙基、1-(N-甲胺基)丁基、2-(N-甲胺基)丁基、3-(N-甲胺基)丁基、2-(N-乙胺基)丙基、3-(N,N-二甲胺基)丙基、4-(N-甲胺基)戊基、3-(N-甲胺基)戊基、2-(N-甲胺基)戊基、1-(N-甲胺基)戊基、3-(N,N-二甲胺基)丁基、2-(N,N-二甲胺基)丁基、1-(N,N-二甲胺基)丁基、1-甲基-2-(N-甲胺基)丁基、1,3-二(N-甲胺基)丁基、2,3-二(N-甲胺基)丁基、2-(N-乙胺基)丁基、1-(N-甲胺基)己基、2-(N-甲胺基)己基、3-(N-甲胺基)己基、4-(N-甲胺基)己基、5-(N-甲胺基)己基、1-(N-丙胺基)丁基、4-甲基-4-(N-甲胺基)戊基、1-(N-甲胺基)庚基、2-(N-甲胺基)庚基、3-(N-甲胺基)庚基、4-(N-甲胺基)庚基、5-(N-甲胺基)庚基、6-(N-甲胺基)庚基、1-(N-丙胺基)庚基、2-(N-乙胺基)己基、5-甲基-5-(N-甲胺基)己基、3-(N-甲胺基)辛基、4-(N-甲胺基)辛基、5-(N-甲胺基)辛基、6-(N-甲胺基)辛基、1-(N-丙胺基)己基、2-(N-乙胺基)庚基、6-甲基-6-(N-甲胺基)庚基、1-(N-甲胺基)壬基、3-(N-甲胺基)壬基、8-(N-甲胺基)壬基、3-(N-乙胺基)辛基、3-甲基-7-(N-甲胺基)辛基、7,7-二(N-甲胺基)辛基、4-甲基-8-(N-甲胺基)壬基、3,7-二甲基-11-(N-甲胺基)癸基、4,8-二甲基--12-(N-甲胺基)十三基、1-(N-甲胺基)十五基、14-(N-甲胺基)十七基、13-甲基-13-(N-甲胺基)十四基、15-(N-甲胺基)十六基、1-(N-甲胺基)十七基、及3,7,11-三甲基-15-(N-甲胺基)十六基等含1或2個氮原子之C2～20烷基、宜爲含雜原子仲介之C2-10烷基。

上述 R^9 定義中「有芳基或芳香族雜環基取代之 C1-20 烷基」爲上述「C1-20 烷基」取代以 1～3 個相同或不同之芳基或芳香族雜環基、該「芳基」及「芳香族雜環基」之定義如上。

上述 R^9 定義中「C2-20 炔基」爲如乙炔基、2-丙炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-2-丙炔基、2-乙基-2-丙炔基、2-丁炔基、1-甲基-2-丁炔基、2-甲基-2-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-庚炔基、1-甲基-2-庚炔基、2-甲基-2-庚炔基、3-戊炔基、1-甲基-3-庚炔基、2-甲基-3-庚炔基、4-庚炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、庚炔基、1-甲基己炔基、2-甲基己炔基、3-甲基己炔基、4-甲基己炔基、5-甲基己炔基、1-丙基丁炔基、4,4-二甲基庚炔基、辛炔基、1-甲基庚炔基、2-甲基庚炔基、3-甲基庚炔基、4-甲基庚炔基、5-甲基庚炔基、6-甲基庚炔基、1-丙基戊炔基、2-乙基己炔基、5,5-二甲基己炔基、壬炔基、3-甲基辛炔基、4-甲基辛炔基、5-甲基辛炔基、6-甲基辛炔基、1-丙基己炔基、2-乙基庚炔基、6,6-二甲基庚炔基、癸炔基、1-甲基壬炔基、3-甲基壬炔基、8-甲基壬炔基、3-乙基辛炔基、3,7-二甲基辛炔基、7,7-二甲基辛炔基、十一炔基、4,8-二甲基壬炔基、十二炔基、十三炔基、十四炔基、十五炔基、3,7,11-三甲基十二炔基、十六炔基、4,8,12-三甲基十三炔基、1-甲基十五炔基、14-甲基十五炔基、13,13-二甲基十四炔基、十

七炔基、15-甲基十六炔基、十八炔基、1-甲基十七炔基、十九炔基、二十炔基、及、3,7,11,15-四甲基十六炔基等C2～20之直鏈或分歧鏈炔基、宜爲C1～10炔基。

上述R9定義中「有雜原子仲介之C3-C20炔基」爲前述「C1-20炔基」中之「C3-20炔基」、有1或2個相同或不同之硫原子、氧原子、或氮原子仲介之基、例如、1-甲硫乙炔基、2-甲硫乙炔基、1-甲硫丙炔基、2-甲硫丙炔基、3-甲硫丙炔基、2-乙硫乙炔基、2-甲基-2-甲硫乙炔基、1-甲硫丁炔基、2-甲硫丁炔基、3-甲硫丁炔基、2-乙硫丙炔基、3-甲基-3-甲硫丙炔基、4-甲硫戊炔基、3-甲硫戊炔基、2-甲硫戊炔基、1-甲硫戊炔基；3,3-二甲硫丁炔基、2,2-二甲硫丁炔基、1,1-二甲硫丁炔基、1-甲基-2-甲硫丁炔基、1,3-二甲硫丁炔基、2,3-二甲硫丁炔基、2-乙硫丁炔基、1-甲硫己炔基、2-甲硫己炔基、3-甲硫己炔基、4-甲硫己炔基、5-甲硫己炔基、1-丙硫丁炔基、4-甲基-4-甲硫庚炔基、1-甲硫庚炔基、2-甲硫庚炔基、3-甲硫庚炔基、4-甲硫庚炔基、5-甲硫庚炔基、6-甲硫庚炔基、1-丙硫戊炔基、2-乙硫己炔基、5-甲基-5-甲硫己炔基、3-甲硫辛炔基、4-甲硫辛炔基、5-甲硫辛炔基、6-甲硫辛炔基、1-丙硫己炔基、2-乙硫庚炔基、6-甲基-6-甲硫庚炔基、1-甲硫壬炔基、3-甲硫壬炔基、8-甲硫壬炔基、3-乙硫辛炔基、3-甲基-7-甲硫辛炔基、7,7-二甲硫辛炔基、4-甲基-8-甲硫壬炔基、3,7-二甲基-11-甲硫十二炔基、4,8-二甲基-12-甲硫十三炔基、1-甲硫十五炔基、14-甲硫十五炔基、13-甲基-13-甲硫十四

炔基、15-甲硫十六炔基、1-甲硫十七炔基、及、3,7,11-三甲基-15-甲硫十六炔基等有1或2個硫原子仲介之C3～20炔基；1-甲氧乙炔基、2-甲氧乙炔基、1-甲氧丙炔基、2-甲氧丙炔基、3- 甲氧丙炔基、2-乙氧乙炔基、2-甲基-2-甲氧乙炔基、1-甲氧丁炔基、2-甲氧丁炔基、3-甲氧丁炔基、2-乙氧丙炔基、3-甲基-3-甲氧丙炔基、4-甲氧戊炔基、3-甲氧戊炔基、2-甲氧戊炔基、1-甲氧戊炔基、3,3-二甲氧丁炔基、2,2-二甲氧丁炔基、1,1-二甲氧丁炔基、1-甲基-2-甲氧丁炔基、1、3-二甲氧丁炔基、2,3-二甲氧丁炔基、2-乙氧丁炔基、1-甲氧己炔基、2-甲氧己炔基、3-甲氧己炔基、4-甲氧己炔基、5-甲氧己炔基、1-丙氧丁炔基、4-甲基-4-甲氧戊炔基、1-甲氧庚炔基、2-甲氧庚炔基、3-甲氧庚炔基、4-甲氧庚炔基、5-甲氧庚炔基、6-甲氧庚炔基、1-丙氧戊炔基、2-乙氧己炔基、5-甲基-5-甲氧己炔基、3-甲氧辛炔基、4-甲氧辛炔基、5-甲氧辛炔基、6-甲氧辛炔基、1-丙氧己炔基、2-乙氧庚炔基、6-甲基-6-甲氧庚炔基、1-甲氧壬炔基、3-甲氧壬炔基、8-甲氧壬炔基、3-乙氧辛炔基、3-甲基-7-甲氧辛炔基、7,7-二甲氧辛炔基、4-甲基-8-甲氧壬炔基、3,7-二甲基-11-甲氧十二炔基、4,8-二甲基-12-甲氧十三炔基、1-甲氧十五炔基、14-甲氧十五炔基、13-甲基-13-甲氧十四炔基、15-甲氧十六炔基、1-甲氧十七炔基、及、3,7,11-三甲基-15-甲氧十六炔基等有1或2個氧原子仲介之C3～20炔基；1-(N-甲胺基)乙炔基、2-(N-甲胺基)乙炔基、1-(N-甲胺基)丙炔基、2-(N-甲胺基)丙炔基、

3-(N-甲胺基)丙炔基、2-(N-乙胺基)乙炔基、2-(N,N-二甲胺基)乙炔基、1-(N-甲胺基)丁炔基、2-(N-甲胺基)丁炔基、3-(N-甲胺基)丁炔基、2-(N-乙胺基)丙炔基、3-(N,N-二甲胺基)丙炔基、4-(N-甲胺基)戊炔基、3-(N-甲胺基)戊炔基、2-(N-甲胺基)戊炔基、1-(N-甲胺基)戊炔基、3-(N,N-二甲胺基)丁炔基、2-(N,N-二甲胺基)丁炔基、1-(N,N-二甲胺基)丁炔基、1-甲基-2-(N-甲胺基)丁炔基、1,3-二(N-甲胺基)丁炔基、2,3-二(N-甲胺基)丁炔基、2-(N-乙胺基)丁炔基、1-(N-甲胺基)己炔基、2-(N-甲胺基)己炔基、3-(N-甲胺基)己炔基、4-〔N-甲胺基〕己炔基、5-(N-甲胺基)己炔基、1-(N-丙胺基)丁炔基、4-甲基-4-(N-甲胺基)戊炔基、1-(N-甲胺基)庚炔基、2-(N-甲胺基)庚炔基、3-(N-甲胺基)庚炔基、4-(N-甲胺基)庚炔基、5-(N-甲胺基)庚炔基、6-(N-甲胺基)庚炔基、1-(N-丙胺基)戊炔基、2-(N-乙胺基)己炔基、5-甲基-5-(N-甲胺基)己炔基、3-(N-甲胺基)辛炔基、4-(N-甲胺基)辛炔基、5-(N-甲胺基)辛炔基、6-(N-甲胺基)辛炔基、1-(N-丙胺基)己炔基、2-(N-乙胺基)庚炔基、6-甲基-6-(N-甲胺基)庚炔基、1-(N-甲胺基)壬炔基、3-(N-甲胺基)壬炔基、8-(N-甲胺基)壬炔基、3-(N-乙胺基)辛炔基、3-甲基-7-(N-甲胺基)辛炔基、7,7-二(N-甲胺基)辛炔基、4-甲基-8-(N-甲胺基)壬炔基、3,7-二甲基-11-(N-甲胺基)十二炔基、4,8-二甲基-12-(N-甲胺基)十三炔基、1-(N-甲胺基)十七炔基、14-(N-甲胺基)十七炔基、13-甲基-13-(N-甲胺基)十四炔基、15-(N-甲胺基)十六炔基、1-(N-甲胺基)

十七炔基、及3,7,11-三甲基-15-(N-甲胺基)十六炔基等有1或2個氮原子仲介之C3～20炔基、宜爲有雜原子仲介之C3-10炔基。

上述R^9定義中「取代以芳基或芳香族雜環基之C2-20炔基」爲前述「C2-C20炔基」取代以1或3個，相同或不同之前述「芳基」或前述「芳香族雜環基」。

上述R^9定義中「C2-20烯基」爲如乙烯基、2-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、2-乙基-2-丙烯基；2-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、庚烯基、1-甲基己烯基、2-甲基己烯基、3-甲基己烯基、4-甲基己烯基、5-甲基己烯基、1-丙基丁烯基、4,4-二甲基戊烯基、辛烯基、1-甲基戊烯基、2-甲基庚烯基、3-甲基庚烯基、4-甲基庚烯基、5-甲基庚烯基、6-甲基庚烯基、1-丙基戊烯基、2-乙基己烯基、5,5-二甲基己烯基、壬烯基、3-甲基辛烯基、4-甲基辛烯基、5-甲基辛烯基、6-甲基辛烯基、1-丙基己烯基、2-乙基戊烯基、6,6-二甲基庚烯基、癸烯基、1-甲基壬烯基、3-甲基壬烯基、8-甲基壬烯基、3-乙基辛烯基、3,7-二甲基辛烯基、7,7-三甲基辛烯基、十一烯基、4,8-二甲基壬烯基、十二烯基、十三烯基、十四烯基、十五烯基、3,7,11-三甲基十

二烯基、十六烯基、4,8,12-三甲基十三烯基、1-甲基十五烯基、14-甲基十五烯基、13,13-二甲基十四烯基；十七烯基、15-甲基十六烯基、十八烯基、1-甲基十七烯基、十九烯基、二十烯基、及3,7,11,15-四甲基十六烯基等C2～20直鏈或分岐鏈烯基、宜爲C2-10烯基。

上述R^9定義中「有雜原子仲介之C3-20烯基」爲上述「C2-20烯基」中「C3-20烯基」有1或2個相同或不同之硫原子、氧原子、或氮原子仲介之基、例如、1-甲硫乙烯基、2-甲硫乙烯基、1-甲硫丙烯基、2-甲硫丙烯基、3-甲硫丙烯基、2-乙硫乙烯基、2-甲基-2-甲硫乙烯基、1-甲硫丁烯基、2-甲硫丁烯基、3-甲硫丁烯基、2-乙硫丙烯基、3-甲基-3-甲硫丙烯基、4-甲硫庚烯基、3-甲硫庚烯基、2-甲硫庚烯基、1-甲硫庚烯基、3,3-二甲硫丁烯基、2,2-二甲硫丁烯基、1,1-二甲硫丁烯基、1-甲基-2-甲硫丁烯基、1,3-二甲硫丁烯基、2,3-二甲硫丁烯基、2-乙硫丁烯基、1-甲硫己烯基、2-甲硫己烯基、3-甲硫己烯基、4-甲硫己烯基、5-甲硫己烯基、1-丙硫丁烯基、4-甲基-4-甲硫庚烯基、1-甲硫庚烯基、2-甲硫庚烯基、3-甲硫庚烯基、4-甲硫庚烯基、5-甲硫庚烯基、6-甲硫庚烯基、1-丙硫庚烯基、2-乙硫己烯基、5-甲基-5-甲硫己烯基、3-甲硫辛烯基、4-甲硫辛烯基、5-甲硫辛烯基、6-甲硫辛烯基、1-丙硫己烯基、2-乙硫庚烯基、6-甲基-6-甲硫庚烯基、1-甲硫壬烯基、3-甲硫壬烯基、8-甲硫壬烯基、3-乙硫辛烯基、3-甲基-7-甲硫辛烯基、7,7-二甲硫辛烯基、4-甲基-8-甲硫壬烯基、3,7-二甲基

-11-甲硫十二烯基、4.8-二甲基-12-甲硫十三烯基、1-甲硫十五烯基、14-甲硫十五烯基、13-甲基-13-甲硫十四烯基、15-甲硫十六烯基、1-甲硫十七烯基、及3,7,11-三甲基-15-甲硫十六烯基等有1或2個硫原子仲介之C3～20個烯基；1-甲氧乙烯基、2-甲氧乙烯基、1-甲氧丙烯基、2-甲氧丙烯基、3-甲氧丙烯基、2-乙氧乙烯基、2-甲基-2-甲氧乙烯基、1-甲氧丁烯基、2-甲氧丁烯基、3-甲氧丁烯基、2-乙氧丙烯基、3-甲基-3-甲氧丙烯基、4-甲氧庚烯基、3-甲氧庚烯基、2-甲氧庚烯基、1-甲氧庚烯基、3,3-二甲氧丁烯基、2,2-二甲氧丁烯基、1,1-二甲氧丁烯基、1-甲基-2-甲氧丁烯基、1,3-二甲氧丁烯基、2,3-二甲氧丁烯基、2-乙氧丁烯基、1-甲氧己烯基、2-甲氧己烯基、3-甲氧己烯基、4-甲氧己烯基、5-甲氧己烯基、1-丙氧丁烯基、4-甲基-4-甲氧戊烯基、1-甲氧庚烯基、2-甲氧庚烯基、3-甲氧庚烯基、4-甲氧庚烯基、5-甲氧庚烯基、6-甲氧庚烯基、1-丙氧戊烯基、2-乙氧己烯基、5-甲基-5-甲氧己烯基、3-甲氧辛烯基、4-甲氧辛烯基、5-甲氧辛烯基、6-甲氧辛烯基、1-丙氧己烯基、2-乙氧庚烯基、6-甲基-6-甲氧庚烯基、1-甲氧壬烯基、3-甲氧壬烯基、8-甲氧壬烯基、3-乙氧辛烯基、3-甲基-7-甲氧辛烯基、7,7-二甲氧辛烯基、4-甲基-8-甲氧壬烯基、3,7-二甲基-11-甲氧十二烯基、4,8-二甲基-12-甲氧十三烯基、1-甲氧十五烯基、14-甲氧十五烯基、13-甲基-13-甲氧十四烯基、15-甲氧十六烯基、1-甲氧十七烯基、及、3,7,11-三甲基-15-甲氧十六烯基等有1或2個氧原子仲

介之C3～20個烯基；1-(N-甲胺基)乙烯基、2-(N-甲胺基)乙烯基、1-(N-甲胺基)丙烯基、2-(N-甲胺基)丙烯基、3-(N-甲胺基)丙烯基、2-(N-乙胺基)乙烯基、2-(N,N-二甲胺基)乙烯基、1-(N-甲胺基)丁烯基、2-(N-甲胺基)丁烯基、3-(N-甲胺基)丁烯基、2-(N-乙胺基)丙烯基、3-(N,N-二甲胺基)丙烯基、4-(N-甲胺基)戊烯基、3-(N-甲胺基)戊烯基、2-(N-甲胺基)戊烯基、1-(N-甲胺基)戊烯基、3-(N,N-二甲胺基)丁烯基、2-(N,N-二甲胺基)丁烯基、1-(N,N-二甲胺基)丁烯基、1-甲基-2-(N-甲胺基)丁烯基、1,3-二(N-甲胺基)丁烯基、2、3-二(N-甲胺基)丁烯基、2-(N-乙胺基)丁烯基、1-(N-甲胺基)己烯基、2-(N-甲胺基)己烯基、3-(N-甲胺基)己烯基、4-(N-甲胺基)己烯基、5-(N-甲胺基)己烯基、1-(N-丙胺基)丁烯基、4-甲基-4-(N-甲胺基)戊烯基、1-(N-甲胺基)庚烯基、2-(N-甲胺基)庚烯基、3-(N-甲胺基)庚烯基、4-(N-甲胺基)庚烯基、5-(N-甲胺基)庚烯基、6-(N-甲胺基)庚烯基、1-(N-丙胺基)戊烯基、2-(N-乙胺基)己烯基、5-甲基-5-(N-甲胺基)己烯基、3-(N-甲胺基)辛烯基、4-(N-甲胺基)辛烯基、5-(N-甲胺基)辛烯基、6-(N-甲胺基)辛烯基、1-(N-丙胺基)己烯基、2-(N-乙胺基)庚烯基、6-甲基-6-(N-甲胺基)庚烯基、1-(N-甲胺基)壬烯基、3-(N-甲胺基)壬烯基、8-(N-甲胺基)壬烯基、3-(N--乙胺基)辛烯基、3-甲基-7-(N-甲胺基)辛烯基、7,7-二(N-甲胺基)辛烯基、4-甲基-8-(N-甲胺基)壬烯基、3,7-二甲基-11-(N-甲胺基)十二烯基、4,8-二甲基-12-(N-甲胺基)十三烯基、1-(N-

甲胺基)十五烯基、14-(N-甲胺基)十五烯基、13-甲基-13-(N-甲胺基)十四烯基、15-(N-甲胺基)十六烯基、1-(N-甲胺基)十七烯基、及、3,7,11-三甲基-15-(N-甲胺基)十六烯基等有1或2個氮原子仲介之C3～20個烯基、宜爲有雜原子仲介之C3-10烯基。

上述R^9定義中「芳基或芳香族雜環基取代之C2-20烯基」爲上述「C2-20烯基」取代以1-3個相同或不同之上述「芳基」或上述「芳香族雜環基」之基。

上述R^9定義中「取代以芳基或芳香族雜環基且有雜原子仲介之C2-20烷基」爲上述「有雜原子仲介之C2-20烷基」取代以相同或不同、1-3個上述「芳基」或上述「芳香族雜環基」之基。

上述R^9定義中「C3-10環烷基」定義如上述「環烷基」。

第B1工程

第B1工程爲製造一般式(X)化合物之工程、令化合物(VIII)之羥基、於存在或不存在惰性溶劑下(宜爲存在下)、於存在脂肪酶下、使用化合物(IX)選擇地醯化。

上述反應所使用「脂肪酶」無限定,依原料化合物之種類而最適宜者不同、宜Pseudomonas sp.、Pseudomonas fluorescens、Pseudomonas cepacia、Chromobacterium viscosum、Aspergillus niger、Aspergillus oryzae、Candida antarctica、Candida cylindracea、Candida lipolytica、Candida rugosa、Candida utilis、Penicillium roqueforti、Rhizopus arrhizus、Rhizopus delemar、Rhizopus javanicus、Rhizomucor miehei、Rhizopus niveus、Humicola

lanuginosa、Mucor javanicus、Mucor miehei、Thermus aquaticus、Thermus flavus、Thermus thermophilus 等人、豬等之胰臟、小麥胚芽由来之脂肪酶。酵素不只可部分或完全精製來使用,也可固定化之形態使用。

最好爲將 Pseudomonas sp.固定化者（例如從 Pseudomonas sp.固定化之脂肪酶（TOYOBO 公司）。

上述反應中使用化合物(IX)之較佳化合物可視原料化合物種類而定、宜爲正己酸乙烯酯、正庚酸乙烯酯、正戊酸乙烯酯、乙酸乙烯酯等直鏈脂肪族羧酸乙烯酯、最宜爲正己酸乙烯酯。

上述反應中使用之惰性溶劑無特定、可依化合物(IX)、原料化合物之種類最適宜者而不同、可使用各種有機溶劑、含水有機溶劑、宜爲二異丙醚、第三丁基甲基醚、乙醚、四氫呋喃等醚類；正己烷、正庚烷等脂族烴類；苯、甲苯等芳香族烴；及二氯甲烷、1,2一二氯乙烷等鹵化烴類、更宜爲醚類、最宜爲二異丙醚或第三丁基甲基醚。

反應温度可視原料化合物、使用溶劑、使用脂肪酶種類等而定、通常、於-50℃～50℃、宜爲 0℃～40℃。

反應時間可視原料化合物、使用溶劑、使用脂肪酶、及反應温度等而定、通常、爲 15 分～150 小時、宜爲 30 分～24 小時。

第 B2 工程

第 B2 工程爲製造一般式(XI)化合物之工程、於惰性溶劑中及存在氧化劑在下、將化合物(X)醇部分以醛氧

化來施行。

上述反應使用之氧化反應只要能從一級醇生成醛之氧化反應則無特定,例如在二氯甲烷中用吡啶及鉻酸之Collins氧化;二氯甲烷中用氯化鉻酸吡錠(PCC)施行PCC氧化;二氯甲烷中用二鉻酸吡錠(PDC)施行之PDC氧化;二氯甲烷中用親電子劑(例如乙酐、三氟乙酐、磺醯氯、亞磺醯氯、草醯氯、二環己基碳化二亞胺、二苯烯酮對甲苯亞胺、N,N-二乙胺乙炔、三氧化硫・吡啶錯合物體等)及二甲亞碸(DMSO)來施行,如Swem酸氧化等DMSO氧化;及二氯甲烷或苯中用二氧化錳施行之二氧化錳氧化等,宜在二氯甲烷中施行之PCC氧化、PDC氧化或Swem氧化。

反應温度可視原料化合物、溶劑、氧化劑種類等而定、通常、於-78℃～80℃、宜爲-78℃～30℃下施行。

反應時間可視原料化合物、溶劑、氧化劑種類、反應温度等而定、通常爲10分～48小時、宜爲30分～24小時。

第B3工程

第B3工程爲製造一般式(XIII)化合物之工程、於惰性溶劑中及存在鹼下、將化合物(XI)與化合物(XII)反應來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如、乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類;苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類;二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯

苯、二氯苯等鹵化烴類；乙腈、丙腈等低烷腈類；甲醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇等低烷醇類；或水、宜爲醚類(最宜爲四氫呋喃)。

上述反應中使用之鹼爲對化合物(XI)醛部分以外之部分無影響、並無特限、例如前述A法第A2工程中使用者、宜爲鹼金屬烷氧類(最宜爲第三丁氧化鉀)。

反應温度可視原料化合物、溶劑、鹼種類等而定、通常、於-78℃～200℃下施行、宜爲-50℃～150℃(最宜爲0℃)。

反應時間可視原料化合物、溶劑、鹼、反應温度等而定、通常爲15分～48小時(宜爲30分～8小時)。

第B4工程

第B4工程爲製造一般式(XIV)化合物之工程、於惰性溶劑中及存在鹼下、將化合物(XIII)水解來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應且可溶解出發原料至特定程度則無特限、例如、乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；甲醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類；水；或上述溶劑混合溶劑；或上述溶劑與水之混合溶劑、宜爲醇類與醚類與水之混合溶劑，或醇類與水之混合溶劑(最宜爲甲醇與四氫呋喃與水之混合溶劑或甲醇與水之混合

溶劑）。

上述反應中使用之鹼爲對化合物(XIII)醯基部分以外之部分無影響、並無特限、例如前述A法第A2工程中使用者、宜爲鹼金屬氫氧化物類(最宜爲氫氧化鈉)。

反應温度可視原料化合物、溶劑、鹼種類等而定、通常、於-78℃～150℃、宜爲-50℃～100℃(最宜爲室温)。

反應時間可視原料化合物、鹼、溶劑、反應温度等而定、通常、爲15分～48小時(最宜爲30分～6小時)。

第B5工程

第B5工程爲製造一般式(XV)化合物之工程、於惰性溶劑中、將化合物(XV)與鹼反應來施行。

上述反應使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如、乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丙醇、異丙醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；甲醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類；水；或上述溶劑之混合溶劑；或上述溶劑與水之混合溶劑、宜爲醚類或醯胺類(最宜爲四氫呋喃)。

上述反應中使用之鹼爲習用鹼、並無特限、可如前述A法第A2工程中所使用者同、宜爲金屬烷氧類(最宜爲第三丁氧化鉀)。

反應温度可視原料化合物、溶劑、鹼種類等而定、通常、於-78℃～150℃下施行、宜爲-50℃～100℃(最宜爲0℃～室温)。

反應時間可視原料化合物、溶劑、鹼、反應溫度等而定、通常、爲 15 分～48 小時(宜爲 30 分～8 小時)。

第 B5 工程爲將一般式(XIV)化合物之胺基保護基脫保護後、將 N,N-羰基二咪唑與碳酸二甲酯、碳酸二乙酯等醯化劑反應來施行。

第 B6 工程

第 B6 工程爲製造一般式(XVI)化合物之工程、於惰性溶劑中、存在還原劑下、將化合物(XV)還原(宜爲氫氣下、觸媒還原)來施行。

觸媒還原反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定、例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙酸甲酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸丁酯、碳酸二乙酯等酯類；乙醚、二噁烷、四氫呋喃、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；乙酸、鹽酸等有機酸類；水；上述溶劑與水之混合溶劑。宜爲醇類或醚類(最宜爲甲醇)。

觸媒還原反應中使用之還原爲通常觸媒還原反應中使用者、並無特限、可如前述 A 法第 A3 工程或第 A4 工程中所使用者同、宜爲鈀-碳素(最宜爲 10%鈀-碳素)。

壓力無特定,通常爲１～１０氣壓、宜爲 1 氣壓。

反應溫度可視原料化合物、溶劑、還原劑種類等而定、通常、於-20℃～200℃下施行、宜爲0℃～100℃(最宜爲20℃～30℃)。

反應時間可視主反應溫度、原料化合物、反應試劑或使用溶劑種類而定、通常、爲5分～96小時、宜爲15分～24小時(最宜爲30分～2小時)。

第B7工程

第B7工程爲製造一般式(XVII)化合物之工程、於惰性溶劑中及存在鹼下、將化合物(XVI)水解來施行。

上述反應使用之惰性溶劑無特限、可使用如前述第B4工程中使用者、宜爲醇類及醚類之混合溶劑或醇類與水之混合溶劑(最宜爲甲醇及四氫呋喃與水之混合溶劑或甲醇與水之混合溶劑)。

上述反應使用之鹼爲對化合物(XVI)水解反應隋性、並無特限、例如、前述第B4工程中使用者、宜爲鹼金屬氫氧化物類(最宜爲氫氧化鉀或氫氧化鈉)。

反應溫度可視原料化合物、溶劑、鹼種類等而定、通常、於-78℃～200℃、宜爲0℃～180℃(最宜爲20℃～120℃)。

反應時間可視原料化合物、鹼、溶劑、反應溫度等而定、通常、15分～10日間(最宜爲2小時～5日)。

第B8工程

第B8工程爲製造一般式(IV)化合物之工程、於惰性溶劑中、將化合物(XVII)之羥基及胺基烷化或進行保護。

羥基及胺基烷化或保護之方法可依一般有機合成化

學技術所習知方法、例如、Protective Groups in Organic Synthesis(Third Edition, 1999, John Wiley & Sons, Inc. 發行)所記載之方法來施行。

胺基之烷化或保護方法爲例如、將化合物(XVII)、於惰性溶劑中(宜爲乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；或甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；)、存在下或不存在鹼(宜爲三乙胺、三丁胺、二異丙基乙胺、N-甲嗎啉、吡啶等有機胺類)下、與下述化合物

R^1a-Q (XIX)

[上述式中、R^1a爲低烷基或胺基保護基(定義如上)、Q之定義如上]

於-78℃～150℃(宜爲-50℃～100℃、最宜爲室溫)下、反應10分～48小時(宜爲20分～8小時)來施行。

羥基烷化或保護之方法爲、例如、將化合物(XVII)、於惰性溶劑中(宜爲氯仿、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氯化碳等鹵化烴類；甲醯胺、二甲基甲醯胺、二甲基乙醯胺、六甲基磷醯三胺等醯胺類；二甲亞碸等亞碸類)、於存在鹼下(宜爲氫化鋰、氫化鈉、氫化鉀等鹼金屬氫化物類；三乙胺、三丁胺、二異丙基乙胺、N-甲嗎啉、吡啶等有機胺類)、與下述化合物

R^3a-Q (XX)

[上述式中、R^3a爲低烷基或羥基保護基(定義如上)、Q之定義如上]、於-78℃～150℃(宜爲-50℃～100℃、最宜

爲室温)、反應10分～48小時(宜爲20分～8小時)來施行。

胺基烷化或保護化與羥基烷化或保護化可依不同反應順次來實施。

B法各工程之目的化合物可依常法自反應混合物得。例如、將反應混合物適當中和、若有不溶物時，濾除後,加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑、以水等洗淨後、分離含目的化合物之有機層、以無水硫酸鎂、無水硫酸鈉等乾燥後、蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、或、通常等通常有機化合物之分離精製慣用之方法、例如、矽膠、鋁氧化鋁、鎂-矽膠系之氟氯碳化物等載體之吸附柱層析法；Sephadex LH-20(Pharmacia公司製造)、Amberlite XAD-11(Rhom & Haas公司製造)、Daiyaion HP-20(三菱化學公司製造)等載體之分配柱層析等合成吸附劑之方法、用離子交換層析之方法、或將用矽膠或烷化矽膠之順相・逆相柱層析法(宜高速液體層析)適當組合,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

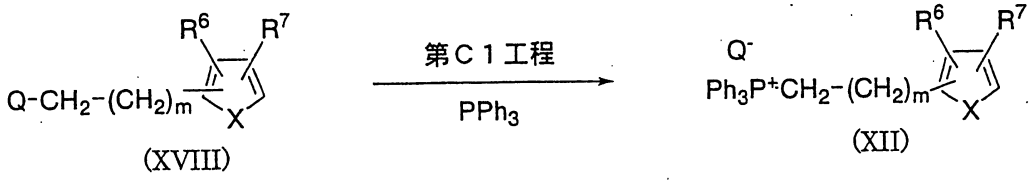
當需分離異構物時、於上述各工程反應終了後、或於所望工程終了後之適當階段依上述分離精製方法來施行。

原料化合物(VIII)及(IX)爲已知、可用已知方法或類似方法自[原料化合物(VIII)：J.Org.Chem., 64,8220(1999)]製造。

(C法)

C 法爲製造一般式(XII)化合物之工程。

C 法



(XVIII)　　(XII)

上述式中、R^6、R^7、X、m、Q及Ph之定義如上

第 C1 工程

第 C1 工程爲製造化合物(XII)之工程、於惰性溶劑中、將一般式(XVIII)化合物與三苯膦反應來施行。

上述反應使用之惰性溶劑只要不影響反應並無特定、例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；乙腈、丙腈等低烷腈類；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇等低烷醇類；或丙酮、甲基乙基酮等低烷酮類、宜爲醚類或腈類。

反應溫度可視原料化合物、溶劑種類等而定、通常、爲-10℃～200℃、宜爲 0℃～150℃(最宜爲 20℃～120℃)。

反應時間可視主反應溫度、原料化合物、使用溶劑種類而定、通常、於 5 分～96 小時、宜爲 15 分～48 小時(最宜爲 1 小時～8 小時)。

本工程目的化合物(XII)必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、或、通常等通常有機化合物之分離精製慣用之

方法、例如、矽膠、鋁氧化鋁、鎂-矽膠系之氟氯碳化物等載體之吸附柱層析法；Sephadex LH-20(Pharmacia公司製造)、Amberlite XAD-11(Rhom & Haas公司製造)、Daiyaion HP-20(三菱化學公司製造)等載體之分配柱層析等合成吸附劑之方法、用離子交換層析之方法、或將用矽膠或烷化矽膠之順相・逆相柱層析法（宜高速液體層析）適當組合,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

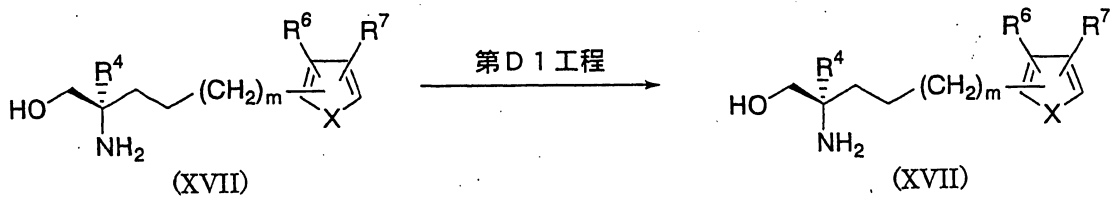
當需分離異構物時、於上述工程反應終了後、作上述分離精製手段來施行。

原料化合物(XVIII)爲已知、可用已知方法或類似方法[當 X=O 時：J. Am. Chem. Soc., 49,1066(1927)、當 X=N-Me 時：J. Org. Chem., 52,19(1987)]製造。

(D 法)

D 法爲提高一般式(XVII)化合物光學純度之工程。

D 法



上述式中、R^4、R^6、R^7、X 及 m 之定義如上。

第 D1 工程

第 D1 工程爲提高化合物(XVII)光學純度之工程、於惰性溶劑中、將化合物(XVII)以光學活性有機酸處理成鹽、必要時可進行再結晶、以提高光學純度、可再處理以鹼、可得一般式(XVII)自由體之工程。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定，例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙酸甲酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯、乙酸丁酯、碳酸二乙酯等酯類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第三丁醇、異戊醇、二乙二醇、甘油辛醇、環己醇、甲基溶纖素等醇類；乙腈、丙腈等腈類；水；或上述溶劑與水之混合溶劑；宜爲醇類(最宜爲甲醇、乙醇)或醇類與水之混合溶劑。

上述反應中使用之光學活性有機酸無特定、例如、酒石酸、苦杏仁酸、莰-10-磺酸、宜爲酒石酸。

所得鹽之自由體(XVII)可用有機溶劑及鹼之習用方法便於施行。

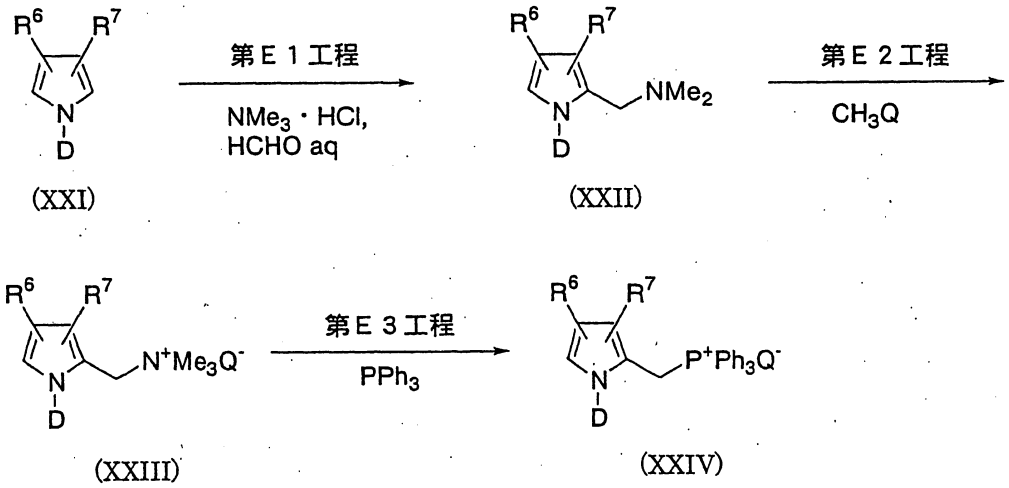
D法各工程之目的化合物可依常法自反應混合物得。例如、將反應混合物適當中和、若有不溶物時，濾除後,加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑、以水等洗淨後、分離含目的化合物之有機層、以無水硫酸鎂、無水硫酸鈉等乾燥後、蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、或、通常等通常有機化合物之分離精製慣用之方法、例如、矽膠、鋁氧化鋁、鎂-矽膠系之氟氯碳化物等載體之吸附柱層析法；Sephadex LH-20(Pharmacia公司製造)、Amberlite XAD-11(Rhom & Haas公司製造)、Daiyaion HP-20(三菱化學公司製造)等

載體之分配柱層析等合成吸附劑之方法、用離子交換層析之方法、或將用矽膠或烷化矽膠之順相・逆相柱層析法(宜高速液體層析)適當組合,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

(E法)

E法爲製造一般式(XXIV)化合物之工程、特當合成C法之X=N-D、m=0化合物時、可依文獻記載之方法(J.Org.Chem., 52, 19(1987))之方法進行。

E法



上述式中、D、R^6、R^7及Q之定義如上。

第E1工程

第E1工程爲製造一般式(XXII)化合物之工程、可依已知方法(例如、J. Am. Chem. Soc, 73, 4921(1951)中載方法等)進行、將化合物(XXI)與福馬林及二甲胺鹽酸鹽反應而進行。

第E2工程

第E2工程爲製造一般式(XXIII)化合物之工程、將化

合物(XXII)與甲基碘等甲基鹵反應成四級鹽之工程。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定，例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；乙腈、丙腈等低烷腈類；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇等低烷醇類；或丙酮、甲基乙基酮等低烷酮類、宜爲醇類。

反應温度可視原料化合物、溶劑種類等而定、通常、於-10℃～200℃、宜爲0℃～50℃。

反應時間可視主反應温度、原料化合物、使用溶劑種類而定、通常、於5分～96小時、宜爲15分～48小時(最宜爲1小時～8小時)。

第E3工程

第E3工程爲製造化合物(XXIV)之工程、於惰性溶劑中、將一般式(XXIII)化合物與三苯膦反應來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定，例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；乙腈、丙腈等低烷腈類；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇等低烷醇類；或丙酮、甲基乙基酮等低烷酮類、宜爲醚類或腈類(最宜爲乙腈)。

反應溫度可視原料化合物、溶劑種類等而定、通常、於室溫～200℃進行、宜爲0℃～150℃(最宜爲20℃～100℃)。

反應時間可視主反應溫度、原料化合物、使用溶劑種類而定、通常、爲5分～96小時、宜爲15分～48小時(最宜爲1小時～8小時)。

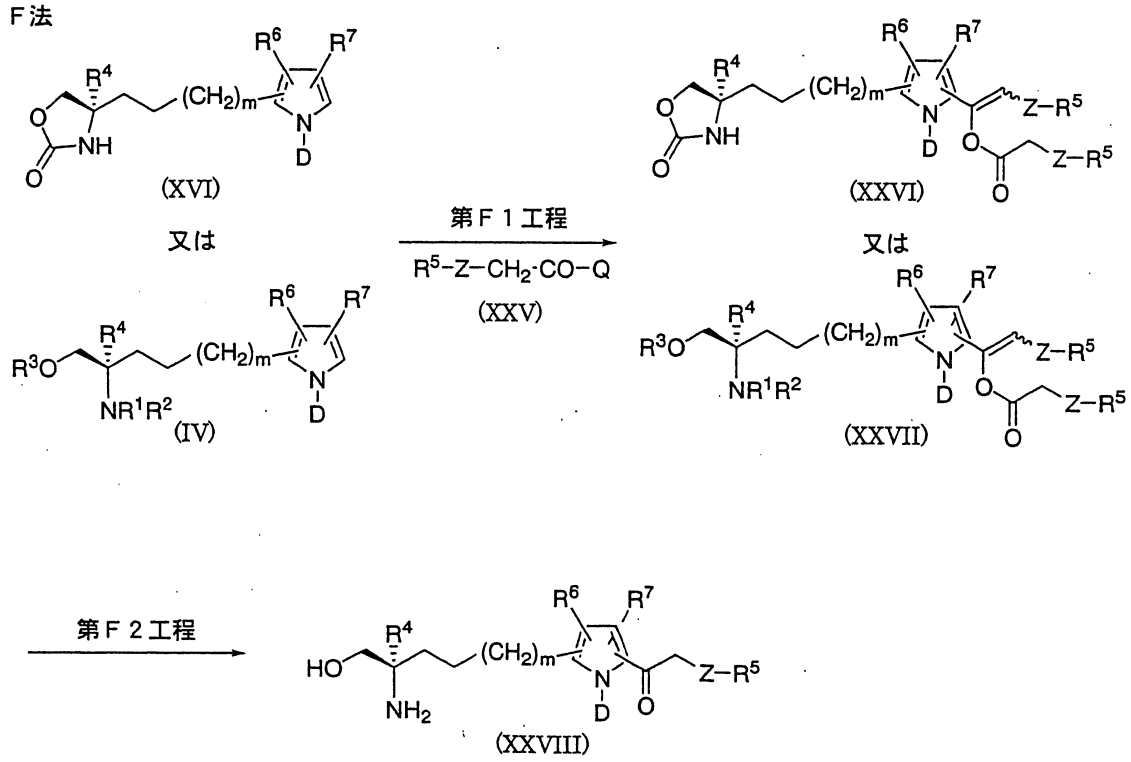
E法各工程之目的化合物可依常法自反應混合物得。例如、將反應混合物適當中和、若有不溶物時，濾除後,加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑、以水等洗淨後、分離含目的化合物之有機層、以無水硫酸鎂、無水硫酸鈉等乾燥後、蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、或、通常等通常有機化合物之分離精製慣用之方法、例如、矽膠、鋁氧化鋁、鎂-矽膠系之氟氯碳化物等載體之吸附柱層析法；Sephadex LH-20(Pharmacia公司製造)、Amberlite XAD-11(Rhom & Haas公司製造)、Daiyaion HP-20(三菱化學公司製造)等載體之分配柱層析等合成吸附劑之方法、用離子交換層析之方法、或將用矽膠或烷化矽膠之順相・逆相柱層析法(宜高速液體層析)適當組合,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

當需分離異構物時、於上述各工程反應終了後、或於所望工程終了後之適當階段依上述分離精製方法來施行。

原料化合物(XXI)爲已知、可用已知方法或類似方法便於製造。

(F 法)

F 法爲自一般式(XVI)或(IV)製造一般式(XXVIII)化合物之工程、其爲 A 法之另一途徑。



上述式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、D、Q、Z 及 m 之定義如上。

第 F1 工程

第 F1 工程爲製造一般式(XXVI)或(XXVII)化合物之工程、將一般式(XVI)或(IV)化合物、於惰性溶劑中、及存在鹼下、與一般式(XXV)進行醯鹵反應來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑只要不影響反應則無特定，例如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類：苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、

四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；乙腈、丙腈等低烷腈類；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇等低烷醇類；或丙酮、甲基乙基酮等低烷酮類、宜爲芳香族烴類(特宜爲苯、甲苯或二甲苯)。

上述反應中使用之鹼爲對化合物(XXV)可活性化、並無特限、例如、4-(N,N-二甲胺基吡啶)或 4-吡咯啶并吡啶。

反應温度可視原料化合物、溶劑、鹼種類等而定、通常、於 0℃～200℃、宜爲室温～150℃。

反應時間可視原料化合物、鹼、溶劑、反應温度等而定、通常、於 15 分～7 日、宜爲 6 小時～3 日。

第 F2 工程

第 F2 工程爲製造一般式(XXVIII)化合物之工程、於惰性溶劑中、存在鹼下、將化合物(XXVI)或化合物(XXVII)進行水解來施行。水解反應可如前第 B7 工程之方法來施行。

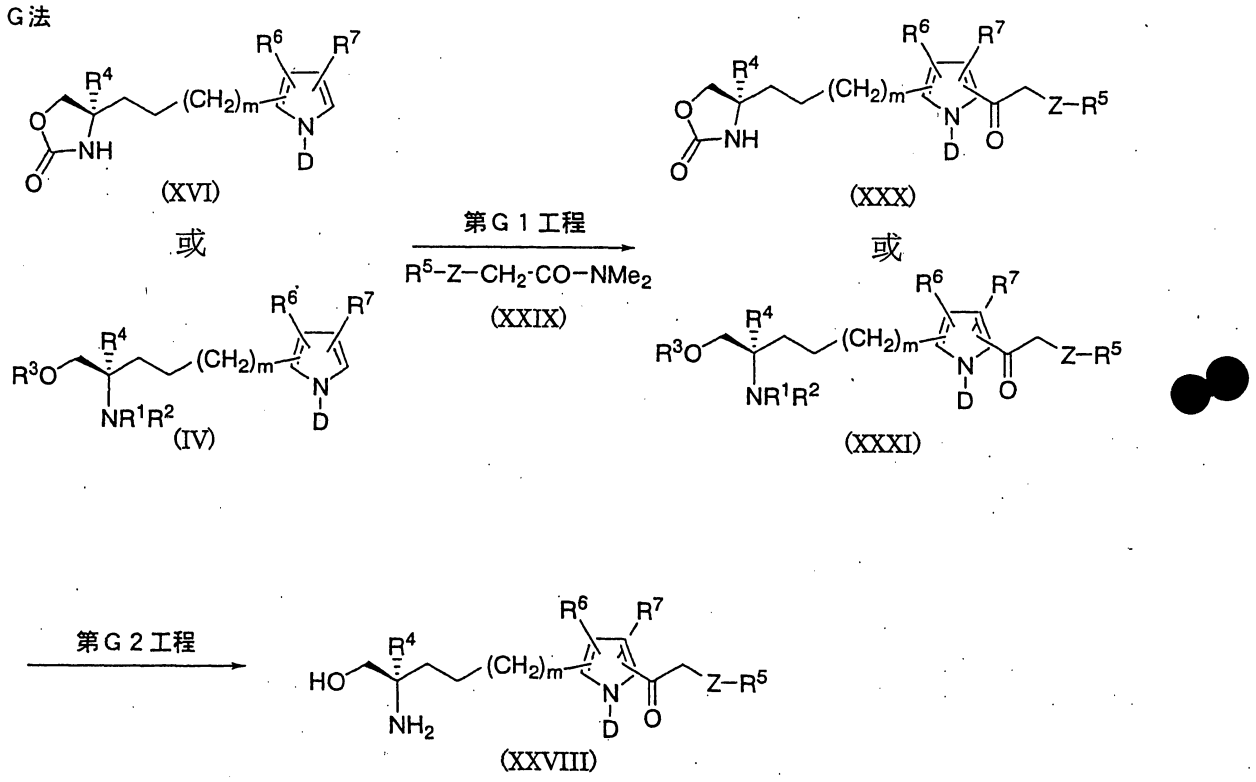
F 法各工程之目的化合物可依常法自反應混合物得。例如、將反應混合物適當中和、若有不溶物時，濾除後,加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑、以水等洗淨後、分離含目的化合物之有機層、以無水硫酸鎂、無水硫酸鈉等乾燥後、蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、或、通常等通常有機化合物之分離精製慣用之方法、例如、矽膠、鋁氧化鋁、鎂-矽膠系之氟氯碳化物等載體之吸附柱層析法；Sephadex LH-20(Pharmacia 公司製造)、Amberlite XAD-11(Rhom &

Haas 公司製造)、Daiyaion HP-20(三菱化學公司製造)等載體之分配柱層析等合成吸附劑之方法、用離子交換層析之方法、或將用矽膠或烷化矽膠之順相・逆相柱層析法(宜高速液體層析)適當組合,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

當需分離異構物時、於上述各工程反應終了後、或於所望工程終了後之適當階段依上述分離精製方法來施行。

(G 法)

G 法爲自一般式(XVI)或(IV)製造一般式(XXVIII)化合物之工程、其爲 F 法之另一途徑。



上述式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、D、Z 及 m 之定義如上。

第 G1 工程

第 G1 工程爲製造一般式(XXX)或(XXXI)化合物之工程、將一般式(XVI)或(IV)化合物、於惰性溶劑中、及存在氧氯化磷或草醯氮下、與化合物(XXIX)等醯胺衍生物反應來施行。此反應爲已知方法(例如、J.Med.Chem.、40,3381(1997)中記載之方法等來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑爲如下但無限定，如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；乙腈、丙腈等低烷腈類；甲醇、乙醇、丙醇、丁醇等低烷醇類；或丙酮、甲基乙基酮等低烷酮類、宜爲芳香族碳化氫類(特宜爲苯或甲苯)。

反應温度可視原料化合物、溶劑、鹼之種類等而定、通常、於 0℃ ～ 200℃、宜爲室温 ～ 150℃。

反應時間可視原料化合物、鹼、溶劑、反應温度等而定、通常、爲 15 分 ～ 7 日、宜爲 6 小時 ～ 3 日。

第 G2 工程

第 G2 工程爲製造一般式(XXVIII)化合物之工程、於惰性溶劑中、存在鹼下、將化合物(XXX)或化合物(XXXI)水解來施行。水解反應可依前述第 B7 工程之方法來施行。

G 法各工程之目的化合物可依常法自反應混合物得。例如、將反應混合物適當中和、若有不溶物時，濾

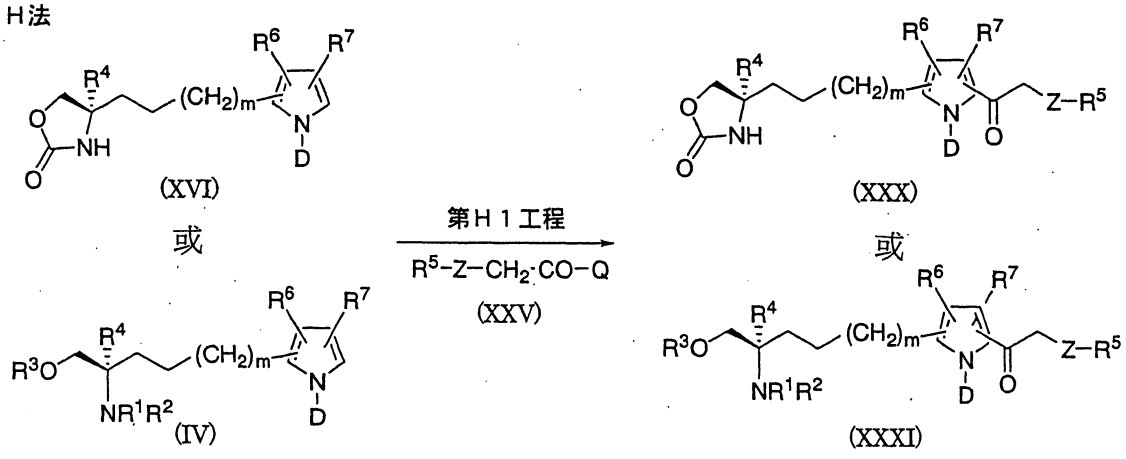
除後,加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑、以水等洗淨後、分離含目的化合物之有機層、以無水硫酸鎂、無水硫酸鈉等乾燥後、蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、或、通常等通常有機化合物之分離精製慣用之方法、例如、矽膠、鋁氧化鋁、鎂-矽膠系之氟氯碳化物等載體之吸附柱層析法;Sephadex LH-20(Pharmacia公司製造)、Amberlite XAD-11(Rhom & Haas公司製造)、Daiyaion HP-20(三菱化學公司製造)等載體之分配柱層析等合成吸附劑之方法、用離子交換層析之方法、或將用矽膠或烷化矽膠之順相・逆相柱層析法(宜高速液體層析)適當組合,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

當需分離異構物時、於上述各工程反應終了後、或於所望工程終了後之適當階段依上述分離精製方法來施行。

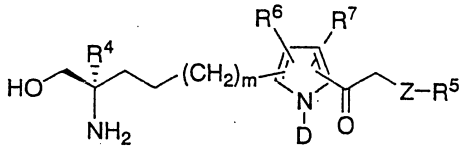
(H法)

H法爲自一般式(XVI)或(IV)製造一般式(XXVIII)化合物之工程、其爲F法之另一途徑。

H法



第H２工程 →



(XXVIII)

上述式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6、R^7、D、Q、Z及m之定義如上。

第H1工程

第H1工程爲製造一般式(XXX)或(XXXI)化合物之工程、將一般式(XVI)或(IV)化合物、於惰性溶劑中、依已知方法(例如Synth.Commun., 19,2721(1989)中記載方法等)來施行、於存在氯化鋁等路易士酸下、將化合物(XXV)等酸鹵進行Friedel-Grafts反應、或將一般式(XVI)或(IV)化合物、於惰性溶劑中、依已知方法(例如、Bioorg.Med.Chem., 9,621(2001)中記載方法等)來施行、與Grignard試劑處理後、與化合物(XXV)等進行醯鹵反應來施行。

上述反應中使用之惰性溶劑爲如下但無限定，如己烷、庚烷、石油英、石油醚等脂族烴類：苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷、氯苯、二氯苯等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷、二甲氧乙烷、二乙二醇二甲醚等醚類；或丙酮、甲基乙基酮等低烷酮類、前者場合宜爲鹵化烴類(特爲二氯甲烷、二氯乙烷)、後者場合宜爲醚類(特爲乙醚、四氫呋喃)。

反應温度可視原料化合物、溶劑、試藥種類等而定、通常、於0℃～100℃、宜爲0℃～50℃。

反應時間可視原料化合物、鹼、溶劑、反應溫度等而定、通常、爲 15 分～24 小時、宜爲 1 小時～12 小時。

第 H2 工程

第 H2 工程爲製造一般式(XXVIII)化合物之工程、於惰性溶劑中、存在鹼下、將化合物(XXX)或化合物(XXXI)水解來施行。水解反應可依前述第 G2 工程之方法進行。

H 法各工程之目的化合物可依常法自反應混合物得。例如、將反應混合物適當中和、若有不溶物時，濾除後,加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑、以水等洗淨後、分離含目的化合物之有機層、以無水硫酸鎂、無水硫酸鈉等乾燥後、蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、或、通常等通常有機化合物之分離精製慣用之方法、例如、矽膠、鋁氧化鋁、鎂-矽膠系之氟氯碳化物等載體之吸附柱層析法；Sephadex LH-20(Pharmacia 公司製造)、Amberlite XAD-11(Rhom & Haas 公司製造)、Daiyaion HP-20(三菱化學公司製造)等載體之分配柱層析等合成吸附劑之方法、用離子交換層析之方法、或將用矽膠或烷化矽膠之順相・逆相柱層析法(宜高速液體層析)適當組合,以適當溶離劑溶出來分離、精製。

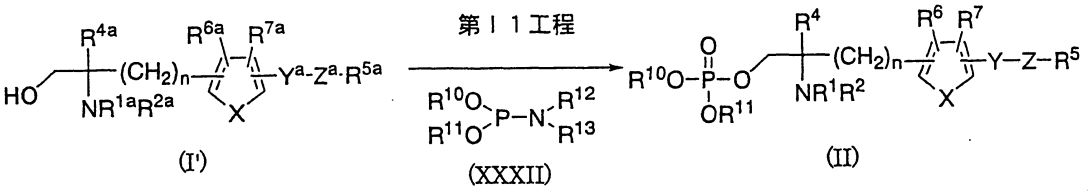
當需分離異構物時、於上述各工程反應終了後、或於所望工程終了後之適當階段依上述分離精製方法來施行。

(I 法)

化合物(II)可選依前述適宜之 A 法～H 法製得、以下

所示 I 法亦可製得。

I 法



(I')　　(XXXII)　　(II)

上述式中、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、R^{10}、R^{11}、X、Y、Z及n之定義如上。R^1a、R^2a、R^4a、R^5a、R^6a、R^7a、Y^a及Z^a各爲R^1a、R^2a、R^4a、R^5a、R^6a、R^7a、Y^a及Z^a中胺基、羥基及/或羧基可有保護之胺基、羥基及/或羧基、R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、Y及Z基之定義如上、R^{12}及R^{13}爲相同或不同、各爲低烷基(特爲乙基或異丙基)。

第 I1 工程

第 I1 工程爲製造一般式(II)化合物之工程、將一般式(I)中R^3爲氫原子之醇體(I')與化合物(XXXII)反應得亞磷酸酯體、再與氧化劑反應、視需要可除去胺基保護基、除去羥基保護基、除去羧基保護基、除去磷酸基保護基來施行。

R^1、R^2、R^4、R^5、R^6、R^7、Y及Z中爲羥基、胺基及/或羧基保護基之除去可依前述第 A7 工程中除去保護基之相同方法處理而除去。

此反應可依不同反應順次來實施、除去保護基之反應可以適宜反應條件來施行。

將具有一級羥基之化合物衍生至磷酸酯體之反應,可

依有機合成化學技術習用之方法來施行。例如、實驗化學講座 22(第 4 版：丸善)「有機合成 IV」第 3 章「磷酸酯」中記載之方法而便於衍生。亦宜以下法來施行。

將醇體(I')與化合物(XXXII)、於惰性溶劑中及存在活性化劑下、反應以製造亞磷酸酯體、再於惰性溶劑中與氧化劑反應。

化合物(I')與化合物(XXXII)反應中使用之惰性溶劑爲如己烷、庚烷等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氯化碳等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃等醚類或上述溶劑之混合溶劑、宜爲鹵化烴類或醚類(最宜爲二氯甲烷或四氫呋喃)。

使用活化劑爲、例如、1H-四唑基、5-甲基-1H-四唑基、5-苯基-1H-四唑基等四唑基類(宜爲 1H-四唑基)。

使用之化合物(XXXII)宜爲二烯丙基 N,N-二異丙胺磷酸鹽、二甲基 N,N-二異丙胺磷酸鹽、二乙基 N,N-二異丙胺磷酸鹽、二第三丁基 N,N-二異丙胺磷酸鹽、二戊烯基 N,N-二異丙胺磷酸鹽、二甲基 N,N-二乙基胺磷酸鹽、二第三丁基 N,N-乙基胺磷酸鹽、二戊烯基 N,N-二乙基胺磷酸鹽、N,N-二乙基-1,5-二氫-2,4,3-苯并二噁磷庚英-3-胺、雙(2-氰乙基)N,N-二異丙胺磷酸鹽或雙(9-芴甲基)N,N-二異丙胺磷酸鹽等胺磷酸鹽類、特宜爲二烯丙基 N,N-二異丙胺磷酸鹽。

反應温度可視原料化合物、溶劑種類等而定、通常、於 10℃ ～ 60℃(宜爲 0℃ ～ 30℃)。

反應時間可視原料化合物、溶劑、反應溫度等而定、通常、爲10分～24小時(宜爲30分～2小時)。

上述反應所得亞磷酸酯體在反應後處理及不經單離即可與氧化劑反應。

氧化劑反應中使用之惰性溶劑與醇體(I')及化合物(XXXII)反應中使用者相同。

所使用氧化劑爲例如、第三丁基氫過氧化物、異丙苯基氫過氧化物、間-氯過苯甲酸、3,5-二硝過苯甲酸、鄰-羧過苯甲酸、二甲噁烷、過乙酸、過三氟乙酸、過酞酸、雙氧水等過氧化物、宜爲第三丁基氫過氧化物或間-氯過苯甲酸。

反應溫度可視所得亞磷酸酯、氧化劑、溶劑之種類等而定、通常、於-78℃～室溫(宜爲-78℃～0℃)。

反應時間可視所得亞磷酸酯、氧化劑、溶劑、反應溫度等而定、通常、爲5分～2小時(宜爲5分～30分)。

當磷酸基保護基爲氰基、可取代之醯基、芳基、雜環基、芳硫基、磺醯基或可取代以鹵素之低烷基時、可於惰性溶劑中及存在水下、以酸水解、再於惰性溶劑中與鹵化三甲醯基(例如、溴三甲醯基或碘三甲醯基)反應以除去該保護基。

上述水解中使用之惰性溶劑爲、例如、甲醇、乙醇等醇類；或乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷等醚類、宜爲醚類、最宜爲二噁烷。

上述反應中使用之酸爲、例如、鹽酸、硫酸、磷酸、硝酸等無機酸、宜爲鹽酸。

反應溫度爲 0℃ ～ 150℃(宜爲 20℃ ～ 100℃)、反應溫度爲 1 小時 ～ 60 小時(宜爲 1 小時 ～ 48 小時)。

上述鹵化三甲醯基反應中使用之惰性溶劑爲、例如、己烷、庚烷等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、二氯甲烷、1,2-二氯乙烷、四氯化碳等鹵化烴類；乙腈等腈類；或上述溶劑之混合溶劑、宜爲鹵化烴類或腈類(宜爲氯仿、二氯甲烷或乙腈)。

反應溫度可視原料化合物、使用溶劑種類等而定、通常、於-78℃ ～ 100℃(宜爲 0℃ ～ 80℃)。

反應時間可視原料化合物、使用溶劑、反應溫度等而定、通常、爲 10 分 ～ 24 小時(宜爲 1 小時 ～ 6 小時)。

當磷酸基保護基爲低烯基時、可於惰性溶劑中、於胺、甲酸、甲酸鹽類、三烷錫化合物或活性亞甲基化合物存在下、與鈀化合物反應來施行、可除去該保護基。

上述反應中使用之惰性溶劑爲如、己烷、庚烷等脂族烴類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；氯仿、二氯甲烷等鹵化烴類；乙腈等腈類；乙酸甲酯、乙酸乙酯、乙酸丙酯等酯類；乙醚、二異丙醚、四氫呋喃、二噁烷等醚類；甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇等醇類；乙酸等有機酸類；水；或上述溶劑與水之混合溶劑、宜爲腈類或醚類(特宜爲乙腈或四氫呋喃)。

上述反應中使用之胺爲、例如、三乙胺、三丁胺、二異丙基乙胺、N-甲嗎啉、1,4-二吖雙環[2.2.2]辛烷(DABCO)等第三級胺類；二乙胺、二甲胺、二異丙胺、吡咯啶等第二級胺類；或乙胺、丙胺、丁胺；N,N-二甲

苯胺、N,N-二乙苯胺等第一級胺類、宜爲吡咯啶。

上述反應中使用之甲酸鹽類、宜爲甲酸銨、甲酸三乙胺鹽或甲酸正丁胺鹽。

上述反應中使用之三烷錫化合物、宜爲三甲錫、三乙錫或三丁錫、特宜爲三丁錫。

上述反應中使用之活性亞甲基化合物、可如丙二酸甲酯、丙二酸乙酯等丙二酸酯類；氰乙酸甲酯等氰乙酸酯類；乙醯乙酸甲酯、乙醯乙酸乙酯、苄醯乙酸乙酯等β-酮乙酸酯類；乙醯丙酮、苄醯丙酮、二苄醯甲酮、1,3-環庚酮、1,3-環己二酮、二甲酮等1,3-二酮類；或上述活性亞甲基化合物之鹼金屬鹽、宜爲1,3-二酮類或丙二酸酯類之鈉鹽。

上述反應中使用之鈀化合物、可如肆(三苯膦)鈀、二乙醯氧鈀、二氯二(三苯膦)鈀、雙(二亞苄基丙酮)鈀等鈀化合物、宜爲肆三苯膦)鈀。

反應温度可視原料化合物、使用溶劑種類等而定、通常、於0℃～100℃(宜爲20℃～80℃)。

反應時間可視原料化合物、使用溶劑、反應温度等而定、通常、爲10分～48小時(宜爲30分～24小時)。

當磷酸基保護基爲芳甲基時、可依前述第A7工程中、以上述胺基保護基爲芳烷基類或芳烷氧羰基類時之相同方法處理而除去。

當磷酸基保護基爲芳基時、可依前述第A7工程中、以上述胺基保護基爲低級脂族醯類、芳族醯類、低級烷氧羰基類或形成許夫鹼之取代亞甲基時之相同方法處

理而除去。

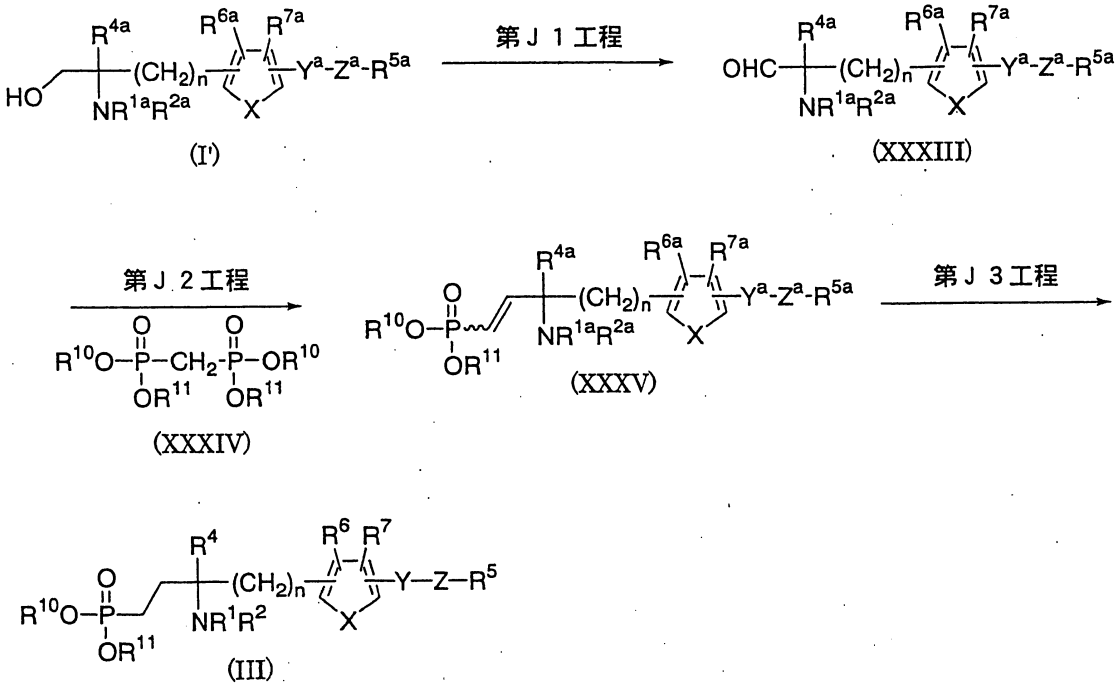
磷酸基保護基爲醯胺類時、可依前述第A7工程中、以上述胺基保護基爲脂族醯類、芳族醯類、烷氧羰基類或形成許夫鹼之取代亞甲基時之相同方法處理而除去。

反應終了後、各反應之目的化合物可依常法自反應混合物回收。例如、將反應混合物適當中和、當存在氧化劑時適宜地以還原劑分解、或、若有不溶物時、濾除後、加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑、分離含目的化合物之有機層、以水等洗淨後、無水硫酸鎂、無水硫酸鈉、無水碳酸氫鈉等乾燥後、蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、層析等通常有機化合物之分離精製慣用之方法適當組合來分離及精製。

(J法)

化合物(III)可選依前述適宜之A法～H法製得、以下所示J法亦可製得

J法



上述式中、R^1、R^1a、R^2、R^2a、R^4、R^4a、R^5、R^5a、R^6、R^6a、R^7、R^7a、R^{10}、R^{11}、Y、Y^a、Z、Z^a及n之定義如上。

第J1工程

第J1工程爲將一般式(I')化合物氧化、製造一般式(XXXIII)醛之工程。

氧化反應只要能從二級醇生成醛之氧化反應則無特定、例如、在二氯甲烷中用吡啶及鉻酸之Collins氧化；二氯甲烷中用氯化鉻酸吡錠(PCC)施行PCC氧化；二氯甲烷中用二鉻酸吡錠(PDC)施行之PDC氧化；二氯甲烷中用親電子劑（例如乙酐、三氟乙酐、磺醯氯、亞磺醯氯、草醯氯、二環已基碳化二亞胺、二苯烯酮對甲苯亞胺、N,N-二乙胺乙炔、三氧化硫・吡啶錯合物等）及二甲亞碸(DMSO)來施行,如Swern氧化等DMSO氧化；及二氯甲烷或苯中用二氧化錳施行之二氧化錳氧化；或二氯甲烷中用Dess-Martin全碘已環施行之Dess-Martin氧化、宜在二氯甲烷中施行之Dess-Martin氧化、PDC氧化或Swern氧化。

反應温度可視原料化合物、溶劑、氧化劑種類等而定、通常、於-78℃～100℃、宜爲-78℃～30℃。

反應時間可視原料化合物、溶劑、氧化劑種類、反應温度等而定、爲通常10分～2日、宜爲30分～24小時。

第J2工程

第J2工程爲於惰性溶劑中及存在鹼下、將醛(XXXIII)與一般式(XXXIV)化合物反應、衍生α,β-不飽和磷酸酯

體(XXXV)之工程。

上述反應中使用之惰性溶劑只要可溶解出發原料至特定程度則無特限，宜爲苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；二氯甲烷、氯仿、四氯化碳等鹵化烴類；乙醚、二異丙醚、第三丁基甲基醚、四氫呋喃等醚類；乙腈、異丁腈等腈類；甲醯胺等醯胺類：或二甲亞碸等亞碸類、宜爲芳香族烴類或醚類(特宜爲苯或四氫呋喃)。

所使用之鹼只要與化合物(XXXIV)反應而得相對陰碳離子、並無特限、宜爲碳酸鈉、碳酸鉀等鹼金屬碳酸鹽類；碳酸氫鈉、碳酸氫鉀等鹼金屬碳酸氫鹽類；氫化鈉、氫化鉀等鹼金屬氫化物類；氫氧化鈉、氫氧化鉀等鹼金屬氫氧化物類；甲氧化鈉、乙氧化鈉、第三丁氧化鉀、乙氧化鉀等鹼金屬烷氧類；N-甲嗎啉、三乙胺等有機胺類；或丁基鋰、二異丙醯胺鋰等有機金屬鹼類、宜爲鹼金屬烷氧類、鹼金屬氫化物類及有機金屬鹼類、特宜爲氫化鈉。

反應溫度可視原料化合物、溶劑、鏻鹽種類、鹼種類等而定、通常、於-80℃～100℃、宜爲-20℃～50℃。

反應時間可視原料化合物、溶劑、鏻鹽種類、鹼種類等而定、通常爲10分～2日、宜爲10分～12小時。

第J3工程

第J3工程爲製造一般式(III)化合物之工程、將不飽和磷酸酯化合物(XXXV)於惰性溶劑中、於存還原觸媒下、與氫反應而還原、視需要可除去胺基保護基、除去羥基保護基、除去羧基保護基、除去磷酸基保護基來施

行。

不飽和磷酸酯化合物(XXXV)與氫反應中使用之惰性溶劑、只要不影響反應且可溶解出發原料至特定程度則無特限，宜爲甲醇、乙醇、異丙醇等醇類；乙醚、二異丙醚、第三丁基甲基醚、四氫呋喃、二噁烷等醚類；苯、甲苯、二甲苯等芳族烴類；己烷、環己烷等脂族烴類；或乙酸乙酯、乙酸丙酯等酯類、宜爲醇類(特宜爲甲醇或乙醇)。

使用觸媒還原觸媒宜爲鈀碳、氫氧化鈀-碳、鈀黑、氧化鉑、鉑黑、銠-氧化鋁、三苯膦-氯化銠(Wilkinson錯合物)、鈀-硫酸鋇、阮來鎳、宜爲鈀碳或三苯膦-氯化銠(Wilkinson錯合物)。

壓力無特定,通常爲１～１０氣壓、宜爲１氣壓。

反應溫度可視原料化合物、溶劑、鹼之種類等而定、通常、於0℃～100℃(宜爲0℃～50℃)。

反應時間可視原料化合物、反應溫度、溶劑、鹼之種類而定、通常、爲5分～48小時(宜爲30分～24小時)。

反應終了後、各反應之目的化合物可依常法自反應混合物回收。例如、將反應混合物適當中和、當存在氧化劑時適宜地以還原劑分解、或、若有不溶物時、濾除後、加水及乙酸乙酯等不混和之有機溶劑、分離含目的化合物之有機層、以水等洗淨後、無水硫酸鎂、無水硫酸鈉、無水碳酸氫鈉等乾燥後、蒸除溶劑。所得目的化合物必要時依常法、例如再結晶、再沈殿、層析等通常有機化合物之分離精製慣用之方法適當組合來分離及精製。

視需要所進行胺基保護基之除去反應、羥基保護基之除去反應、羧基保護基之除去反應可依前述第 A7 工程之相同方法來施行、磷酸基保護基之除去反應可依前述第 I1 工程之相同方法來施行。

本發明之胺醇衍生物(I)、式(II)磷酸酯或式(III)膦酸衍生物、其藥理容許鹽或藥理容許酯毒性低而有優異免疫抑制作用、含有本發明之式(I)、(II)及(III)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯爲有效成分之醫藥組成物尤其可作爲預防劑或治療劑(宜爲治療藥)以防治哺乳動物(特指人)之各種器官移植或皮膚移植時的排斥反應、全身性紅斑性狼瘡症、慢性関節風濕、多發性肌炎、結合組織炎、骨骼肌炎、骨関節炎、變形性関節症、皮膚肌炎、鞏皮症、bechet 病、Chron 病、潰瘍性大腸炎、自體免疫性肝炎、再生不良性貧血症、特發性血小板減少性紫斑病、自體免疫性溶血性貧血症、多發性硬化症、自體免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症候群、Wegener 肉芽腫、葡萄膜炎、Sjoegren 症候群、特發性間質性肺炎、Goodpasture 症候群、肉瘤類肉瘤病、過敏性肉芽腫性血管炎、支氣管氣喘、心肌炎、心肌症、主動脈炎症候群、心肌梗塞後症候群、原發性肺高血壓症、微小變化型腎病、膜性腎症、膜性增殖性腎炎、巢狀球體硬化症、半月體形成性腎炎、重肌無力症、炎症性神經症、異位性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、褥瘡、Sydenham 舞踏病、硬化症、成人發症糖尿病、胰島素依存性糖尿病、若年性糖尿病、粥樣性動脈

硬化症、腎小球腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原發性膽汁性肝硬化、原發性硬化性膽管炎、劇症肝炎、病毒性肝炎、GVHD、接觸皮膚炎、敗血症等自體免疫疾病或其他免疫有關疾病、以及真菌、枝原體mycoplasma、病毒、原虫等感染症、心衰竭、心室肥大、心律不整、狹心症、心缺血、動脈塞栓、動脈痛、靜脈癌、血液循環障礙等循環系統疾病、阿茲海默症、痴呆、帕金森氏症、中風、腦梗塞、腦缺血、鬱病、燥鬱症、綜合失調症、杭廷頓氏舞蹈氏、器官痛、痙攣、過動症、腦炎、髓膜炎、食慾不振和飲食過量等中樞系統疾病、淋巴腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等各種疾病(特指各種器官移植或皮膚移植之排斥反應、全身性紅斑性狼瘡症、慢性関節風濕、多發性硬化症、異位性皮膚炎等自體免疫疾病。

本發明一般式(I)、(II)及(III)化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯當作醫藥時,可以其本身,或混合適當藥理容許之賦形劑、稀釋劑等而以錠、膠囊、顆粒、散、糖漿等口服或以注射劑等非經口投予。

這些製劑可依常法在主藥配合賦形劑(例如、乳糖、白糖、葡萄糖、甘露糖、山梨糖等糖衍生物;玉米澱粉、馬鈴薯澱粉、α澱粉、糊精等澱粉衍生物;結晶纖維素等纖維素衍生物;阿拉伯膠;聚葡萄糖;聚三葡萄糖等有機賦形劑:及輕質矽酐、合成矽酸鋁、矽酸鈣、偏矽酸鋁鎂等矽等衍生物;磷酸氫鈣等磷酸鹽;碳酸鈣等碳酸鹽;硫酸鈣等硫酸鹽等無機賦形劑等。)、滑劑(例如、

硬脂酸、硬脂酸鈣、硬脂酸鎂等硬脂酸金屬鹽；滑石；膠狀矽石；蜂膠、鯨蠟等蠟；硼酸；硬酸鈉；硫酸鈉等硫酸鹽；乙二醇；反丁烯二酸；苯甲酸鈉；DL白胺酸；脂肪酸鈉鹽；十二基硫酸鈉、十二基硫酸鎂等十二基硫酸鹽；矽酐、矽酸水合物等矽酸類;及上述澱粉衍生物。)、結合劑(例如、羥丙基纖維素、羥丙基甲基纖維素、聚乙烯吡咯啶酮、聚乙二醇、及前述賦形劑等。)、崩散劑(如低取代羥丙基纖維素、羧甲基纖維素、羧甲基纖維素鈣、內部架橋羧甲基纖維素鈉等纖維素衍生物；羧甲基澱粉、羧甲基澱粉鈉、架橋聚乙烯基吡咯啶酮等化學改質之澱粉纖維素。)、安定劑(對羥苯甲酸甲酯、對羥苯甲酸丙酯等對羥苯甲酸酯；氯丁醇、苄醇、苯乙醇等醇；苄烷氯化銨；苯酚、甲酚等酚類；硫柳汞；脫氫乙酸;及山梨酸等。)、矯味劑(例如、習用之甜味劑、酸味料、香料等。)、稀釋劑等添加劑依習知方法製造。

投予依症狀、年齡等而定、例如成人口服時每次每日下限爲0.05mg(宜爲5mg)、上限爲200mg(宜爲40mg)、靜脈投予時每次每日下限0.01mg(宜爲1mg)、上限爲100mg(宜爲10mg)、視需要每日可作1～6次投予。

【實施發明之最佳形態】

下面舉實施例及試驗例更詳細說明本發明,但本發明之範圍不限於此。

[實施例]

(實施例1)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁

-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-621)

(1a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷

將參考例 6 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-溴呋喃-2-基)丁烷 0.3016g(0.91 毫莫耳)、5-苯戊-1-烯 0.3974g(2.76 毫莫耳)、二環雙(三苯膦)鈀(II)63.0mg(0.090 毫莫耳)及碘化銅(I)35.4mg(0.19 毫莫耳)溶在 N,N-二甲基甲醯胺(9.0 毫升)、加入三乙胺 1.25ml(9.0 毫莫耳)、於氮氣及室溫下攪拌 10 小時。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、加入水及乙酸乙酯、於室溫攪拌 30 分、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=1/1)純化、可得標題化合物 0.2841g(產率 79%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.31-7.27 (m, 2H), 7.22-7.18 (m, 3H), 6.38 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 5.98 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.29 (d, J = 11.2 Hz), 4.18 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 2.77 (t, 2H, J = 7.8 Hz), 2.64 (dt, 2H, J = 8.5 Hz, 17.0 Hz), 2.44 (t, 2H, J = 7.1 Hz), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.01-1.88 (m, 6H), 1.35 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CHCl$_3$) : 3691, 3444, 2947, 1737, 1681, 1601, 1511, 1453, 1374, 1251, 1042, 812, 803。

MS (FAB$^+$), m/z : 396((M+H)$^+$)。

(1b) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基呋喃-2-基)丁-1-醇草酸鹽

將實施例(1a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷 0.2710g(0.69毫莫耳)溶在四氫呋喃(1.4毫升)-甲醇(1.4毫升)、加入水(1.4毫升)及氫氧化鋰1水合物 0.2854g(6.80毫莫耳)、於50℃下攪拌4小時。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=100/1)純化、得粗製(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇 0.2072g。將所得粗製物溶在甲醇、加入98%草酐 59.2mg(0.64毫莫耳)、於室溫攪拌30分。減壓濃縮、加入乙酸乙酯並濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物 0.2344g(產率 91%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.29-7.25 (m, 2H), 7.21-7.14 (m, 3H), 6.40 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 6.09 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.77-2.65 (m, 4H), 2.41 (t, 2H, J = 7.0 Hz), 2.07-1.83 (m, 4H), 1.29 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3353, 3128, 2940, 1720, 1645, 1614, 1598, 1542, 1403, 1220, 1078, 789, 713, 700。

MS (FAB$^+$), m/z : 312($(M+H)^+$; free体)。

(實施例 2)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-570)

以參考例 6 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-溴呋喃-2-基)丁烷及 5-環己基戊-1-烯爲原料、依

實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率68%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 6.36 (d, 1H, J = 3.1 Hz), 6.08 (d, 1H, J = 3.1 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 11.5 Hz), 3.49 (d, 1H, J = 11.5 Hz), 2.77-2.64 (m, 2H), 2.39 (t, 2H, J = 7.2 Hz), 2.07-1.90 (m, 2H), 1.76-1.54 (m, 7H), 1.35-1.12 (m, 9H), 0.96-0.86 (m, 2H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3362, 3124, 2923, 2850, 1720, 1611, 1597, 1542, 1467, 1403, 1279, 1220, 1067, 967, 791, 721, 700。

MS (FAB$^+$), m/z : 318((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 3)

(2R)-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基)丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼 : 在式 Ia-1 中 1-842)

以參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷及4-環己氧基丁-1-烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率66%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 6.40 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 6.09 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 3.63 (t, 2H, J = 6.6 Hz), 3.58 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.39-3.32 (m, 1H), 2.77-2.62 (m, 4H), 2.07-1.89 (m, 4H), 1.77-1.73 (m, 2H), 1.56-1.53 (m, 1H), 1.36-1.23 (m, 8H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3360, 3099, 2932, 2857, 1719, 1614, 1597, 1542, 1403, 1219, 1106, 967, 785, 720, 711。

MS トル (FAB$^+$), m/z : 320((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 4)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼 : 在式 Ia-1

中 1-1836)

參考例 6 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-溴呋喃-2-基)丁烷及 3-(3,4-二甲基)苯氧基-1-丙烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 46%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.02 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 6.77 (d, 1H, J = 2.7 Hz), 6.71 (dd, 1H, J = 8.3 Hz, 2.7 Hz), 6.55 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 6.14 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 4.88 (s, 2H), 3.58 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.49 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.79-2.66 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.07-1.90 (m, 2H), 1.28 (s,3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3358, 3134, 2921, 2582, 1720, 1649, 1616, 1579, 1542, 1499, 1370, 1286, 1250, 1223, 1166, 1122, 1046, 1025, 802, 712。

MS (FAB$^+$), m/z : 328((M+H)$^+$;free體)。

(實施例 5)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼 : 在式 Ia-1 中 1-1093)

將實施例(1b)所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基呋喃-2-基)丁-1-醇草酸鹽 0.3440g(1.11 毫莫耳)溶在甲醇(3.5 毫升)、加入 6M 之硫酸水溶液(3.5 毫升)、加熱回流 4 小時。冷却後、加入飽和碳酸氫鈉水溶液以中和、加入水及二氯甲烷並攪拌 30 分後、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以鹼性矽膠柱(NH 型)層析(溶離液 : 二氯甲烷/甲醇=100/1)純化後、溶在甲醇、加入草酐(98%)91.8mg(1.00 毫莫耳)、於室溫攪

拌 30 分。減壓濃縮、加入乙酸乙酯、濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨後減壓乾燥、可得標題化合物 0.3687g(產率 90%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.31 (d, 1H, J = 3.6 Hz), 7.25-7.22 (m, 2H), 7.17-7.12 (m, 3H), 6.36 (d, 1H, J = 3.6 Hz), 3.61 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.52 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.89-2.76 (m, 4H), 2.64 (t, 2H, J = 7.2 Hz), 2.13-1.95 (m, 2H), 1.75-1.63 (m, 4H), 1.30 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3108, 3027, 2981, 2935, 1718, 1698, 1661, 1604, 1542, 1516, 1202, 1093, 1082, 1047, 797, 700。

MS (FAB$^+$), m/z : 330((M+H)$^+$; free 體)。

(實施例 6)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-93)

(6a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁烷

將 10%鈀—碳(50%含水)25mg 溶在甲醇(1 毫升)、加入含實施例(1a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷 0.1245g(0.32 毫莫耳)之甲醇(1.5 毫升)溶液、於氫氣及室溫攪拌 8 小時。取代以氮後、將反應液中 Pd-C 以矽藻土過濾、將矽藻土以乙酸乙酯洗淨。結合濾液及洗液、於減壓下濃縮乾燥、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2)純化、可得標題化合物 0.1029g(產率 82%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.29-7.26 (m, 2H), 7.19-7.16 (m, 3H), 5.87 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 5.83 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 5.36 (br s, 1H),

4.31 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 2.64-2.54 (m, 4H), 2.25-2.17 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 2.05-1.91 (m, 1H), 1.92 (s, 3H), 1.69-1.60 (m, 4H), 1.43-1.37 (m, 2H), 1.35 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z：400((M+H)$^+$;free體)。

(6b) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽

將實施例(6a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁烷 99.7mg(0.25毫莫耳)溶在四氫呋喃(0.5毫升)及甲醇(0.5毫升)、加入水(0.5毫升)及氫氧化鋰1水合物 0.1037g(2.47毫莫耳)、於50℃下攪拌4小時。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=100/1)純化、得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁-1-醇 74.6mg(產率 95%)。將其溶在甲醇(2.3ml)、加入草酐(98%)21.1mg(0.23毫莫耳)、於室溫攪拌1小時。減壓濃縮、加入乙酸乙酯濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物 78.1mg(產率 85%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.25-7.21 (m, 2H), 7.15-7.11 (m, 3H), 5.94 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 5.87 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 3.58 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.49 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.69-2.53 (m, 6H), 2.04-1.88 (m, 2H), 1.67-1.59 (m, 4H), 1.40-1.32 (m, 2H), 1.28 (s,3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3119, 3025, 2979, 2928, 2855, 1719, 1610, 1543, 1466, 1402, 1197, 1094, 1078, 1012, 786, 746, 721, 699。

MS (FAB$^+$), m/z：316((M+H)$^+$;free體)。

(實施例 7)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基甲氧苯基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-1433)

(7a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基甲氧苯基)呋喃-2-基]丁烷

將參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷 0.2047g(0.51 毫莫耳)、2-(4-環己基甲氧苯基)-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二噁硼烷 0.2400g(0.76 毫莫耳)、二環雙(三苯膦)鈀(II)36.1mg(0.051 毫莫耳)及碳酸銫 0.6738g(2.03 毫莫耳)溶在二甲氧乙烷(4.0 毫升)及水(1 毫升)、於 80℃ 下攪拌 4 小時。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣溶在二氯甲烷(5.0 毫升)、加入三乙胺 0.72ml(5.2 毫莫耳)、乙酐 0.24ml(2.6 毫莫耳)及 4-二甲胺吡啶 6.4mg(0.052 毫莫耳)、於室溫攪拌 2 小時。加入甲醇 0.10ml(2.5 毫莫耳)以中止反應、加入乙酸乙酯及水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以水、飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2)純化、可得標題化合物 45.3mg(產率 20%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.55-7.51 (m, 2H), 7.00-6.87 (m, 2H), 6.39 (d, 1H, J = 3.1 Hz), 6.06 (d, 1H, J = 3.1 Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.34 (d, J = 11.2 Hz), 4.20 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 3.76 (d, 2H, J = 2.5 Hz), 2.73-2.69 (m, 2H), 2.35-2.27 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.08-1.99 (m, 1H), 1.91 (s, 3H), 1.93-1.69 (m, 6H), 1.38 (s, 3H), 1.37-1.18(m, 3H),

1.10-1.00(m, 2H)。

MS (FAB$^+$), m/z：442((M+H)$^+$), 441(M$^{+\cdot}$)。

(7b) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基甲氧苯基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽

將實施例(7a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基甲氧苯基)呋喃-2-基]丁烷 44.0mg(0.10毫莫耳)溶在四氫呋喃(0.4毫升)及甲醇(0.4毫升)、加入水(0.4毫升)及氫氧化鋰1水合物 43.6mg(1.04毫莫耳)、於50℃下攪拌4小時。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=50/1)純化、得生成物 35.2mg(產率 99%)。將生成物溶在甲醇(2.0毫升)、加入草酐 (98%)8.9mg(0.10毫莫耳)、於室溫攪拌30分。減壓濃縮、加丙酮並濾集結晶、以丙酮洗淨並減壓乾燥、可得標題化合物 28.2mg(產率 66%)。

^{1}H NMR (CD_3OD-DMSO-d_6, 400MHz), δ : 7.55 (d, 2H, J = 8.7Hz), 6.93 (d, 2H, J = 8.7Hz), 7.16 (t, 1H, J = 2.0Hz), 6.53 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 6.17 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 3.79 (d, 2H, J = 6.4 Hz), 3.58 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.28-3.27 (m, 2H), 2.09-1.69 (m, 8H), 1.38-1.04 (m, 8H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr)：3387, 3235, 2924, 2852, 2578, 1618, 1568, 1499, 1466, 1448, 1390, 1288, 1245, 1174, 1024, 828, 783, 765。

MS (FAB$^+$), m/z：358((M+H)$^+$)。

(實施例 8)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-1444)

以參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷及 2-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二噁硼烷爲原料、依實施例 7 之方法反應、可得標題化合物(產率 21%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.27 (t, 1H, J = 8.0Hz), 7.21 (dd, 1H, J = 8.0Hz, 2.0Hz), 7.16 (t, 1H, J = 2.0Hz), 6.80 (dd, 1H, J = 8.0Hz, 2.0Hz), 6.69 (d, 1H, J = 3.5 Hz), 6.21 (d, 1H, J = 3.5 Hz), 4.04 (t, 2H, J = 6.6 Hz), 3.61 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.52 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.83-2.78 (m, 2H), 2.62-2.60 (m, 1H), 2.13-1.97 (m, 2H), 1.81-1.65 (m, 6H), 1.59-1.49 (m, 1H), 1.31-1.02 (m, 6H), 1.00-0.96 (m, 2H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3213, 2925, 2850, 2571, 1720, 1701, 1614, 1600, 1578, 1563, 1548, 1449, 1300, 1216, 1205, 1052, 1033, 1017, 863, 772, 721, 689。

MS (FAB$^+$), m/z : 372((M+H)$^+$;free體)。

(實施例 9)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-621)

以參考例 13 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲基-5-碘吡咯-2-基)丁烷及 5-苯丁-1-烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 57%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.28-7.14 (m, 5H), 6.16 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.80 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 3.63 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.57 (s, 3H), 3.54 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.77 (t, 2H, J = 7.6 Hz), 2.66-2.61 (m, 2H), 2.43 (t, 2H, J = 7.0 Hz), 2.04-1.96 (m, 1H), 1.92-1.84 (m, 3H), 1.33 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3212, 3026, 2935, 2897, 2571, 1719, 1700, 1611, 1521, 1496, 1454, 1405, 1279, 1218, 1053, 767, 721, 700。

MS (FAB$^+$), m/z : 325($(M+H)^+$;free 體)。

(實施例 10)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧丁-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1/2 草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-842)

以參考例 13 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲基-5-碘吡咯-2-基)丁烷及 4-環己氧丁-1-烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 32%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 6.13 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.79 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 3.65 (t, 2H, J = 6.8 Hz), 3.61 (d, 1H, J = 11.5 Hz), 3.56 (s, 3H), 3.53 (d, 1H, J = 11.5 Hz), 3.39-3.34 (m, 1H), 2.68-2.61 (m, 4H), 2.01-1.83 (m, 4H), 1.78-1.74 (m, 2H), 1.56-1.54 (m, 1H), 1.35-1.21 (m, 8H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3348, 2931, 2856, 1590, 1452, 1364, 1309, 1106, 762。

MS (FAB$^+$), m/z : 333($(M+H)^+$;free 體)。

(實施例 11)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-

炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇 1/2 草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia- 2 中 1-833)

以參考例 13 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲基-5-碘吡咯-2-基)丁烷及 3-(4-甲苯氧基)-1-丙烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 29%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.09 (d, 1H, J = 8.5 Hz), 6.90 (d, 1H, J = 8.5 Hz), 6.26 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.83 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.93 (s, 2H), 3.60 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.53 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.51 (s, 3H), 2.65-2.60 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.01-1.93 (m, 1H), 1.89-1.82 (m, 1H), 1.30 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3356, 2944, 2602, 2220, 1586, 1510, 1455, 1365, 1295, 1228, 1178, 1071, 1042, 1015, 815, 762。

MS (FAB$^+$), m/z : 327($(M+H)^+$; free體)。

(實施例 12)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇 1/2 草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-1836)

以參考例 13 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲基-5-碘吡咯-2-基)丁烷及 3-(3,4-二甲苯氧基)-1-丙烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 33%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.02 (d, 1H, J = 8.2 Hz), 6.81 (d, 1H, J = 2.5 Hz), 6.73 (dd, 1H, J = 8.2 Hz, 2.5 Hz), 6.26 (d, 1H, J = 3.9 Hz), 5.83 (d, 1H, J = 3.9 Hz), 4.91 (s, 2H), 3.61 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 3.53 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 3.52 (s, 3H), 2.65-2.61 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.99-1.93 (m, 1H), 1.90-1.82 (m, 1H), 1.31 (s, 3H)。

IR　　ν_{max} cm^{-1} (KBr)：3420, 2943, 2631, 2213, 1584, 1503, 1455, 1365, 1301, 1251, 1207, 1163, 1025, 806, 762。

MS　　(FAB$^+$), m/z：341((M+H)$^+$;free體)。

(實施例 13)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯丁-1-炔基)吠喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-559)

以參考例 6 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-溴吠喃-2-基)丁烷及 4-苯丁-1-烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 61%)。

^{1}H NMR　　(CD_3OD, 400MHz), δ : 7.29-7.17 (m, 5H), 6.35 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 6.07 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.87 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.77-2.64 (m, 4H), 2.06-1.89 (m, 2H), 1.29 (s, 3H)。

IR　　ν_{max} cm^{-1} (KBr)：3353, 3140, 2924, 2896, 1724, 1651, 1617, 1598, 1542, 1403, 1221, 1075, 1054, 1010, 784, 713, 501。

MS　　(ESI$^+$), m/z：298((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 14)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氯苯基)戊-1-炔基]吠喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-628)

以參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘吠喃-2-基)丁烷及 5-(4-氯苯基)戊-1-烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 60%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.28-7.25 (m, 2H), 7.20 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 6.40 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 6.09 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.51 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.78-2.65 (m, 4H), 2.42 (t, 2H, J = 6.8 Hz), 2.08-1.83 (m, 4H), 1.29 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3257, 3105, 2936, 1718, 1598, 1540, 1493, 1405, 1280, 1202, 1093, 1015, 828, 792, 721, 701, 502。

MS (FAB$^+$), m/z : 346((M+H)$^+$; free 體)。

(實施例 15)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(3-三氟甲苯基)戊-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸:鹽(例示化合物號碼:在式 Ia-1 中 1-640)

以參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷及 5-(3-三氟甲苯基)戊-1-烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 58%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.51-7.48 (m, 4H), 6.41 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 6.10 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.51 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.85 (t, 2H, J = 7.4 Hz), 2.78-2.66 (m, 2H), 2.44 (t, 2H, J = 7.0 Hz), 2.08-1.87 (m, 4H), 1.29 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3358, 3139, 2935, 1722, 1651, 1615, 1597, 1542, 1403, 1326, 1222, 1168, 1119, 1073, 797, 721, 713, 703, 503。

MS (FAB$^+$), m/z : 380((M+H)$^+$; free 體)。

(實施例 16)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼:在式 Ia- 1 中 1-833)

以參考例 6 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基

-4-(5-溴呋喃-2-基)丁烷及3-(4-甲苯氧基)-1-丙烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率11%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.13-7.06 (m, 2H), 6.92-6.84 (m. 2H), 6.55 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 6.13 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 4.90 (s, 2H), 3.59 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.34-3.28 (m, 2H), 2.80-2.64 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.07-1.87 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3352, 3138, 2921, 2893, 1727, 1653, 1616, 1596, 1544, 1511, 1373, 1224, 1018, 713。

MS (FAB$^+$), m/z : 314((M+H)$^+$; free體)。

(實施例17)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式Ia-1中1-838)

將參考例6所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-溴呋喃-2-基)丁烷及3-(4-甲硫苯氧基)-1-丙烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率15%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.30-7.25 (m, 2H), 6.99-6.94 (m, 2H), 6.57 (d, 1H, J = 3.5 Hz), 6.14 (d, 1H, J = 3.5 Hz), 4.94 (s, 2H), 3.59 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.80-2.65 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.08-1.88 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3359, 3136, 3089, 2920, 2230, 1722, 1646, 1618, 1594, 1542, 1493, 1373, 1279, 1230, 1073, 1039, 1015, 820, 797, 712。

MS (FAB$^+$), m/z : 346((M+H)$^+$; free體)。

(實施例18)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-893)

以參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷及 4-苯氧丁-1- 烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 42%)。

^{1}H NMR (DMSO-d_6, 400MHz), δ : 7.32-7.28 (m, 2H), 6.98-6.93 (m, 3H), 6.78 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 6.16 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 4.13 (t, 2H, J = 6.4 Hz), 3.40 (dd, 2H, J = 19.8 Hz, 11.4 Hz), 2.93 (t, 2H, J = 6.4 Hz), 2.66 (t, 2H, J = 8.5 Hz), 1.95-1.75 (m, 2H), 1.16 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3115, 2978, 2940, 1719, 1600, 1547, 1498, 1248, 1204, 1081, 1039, 752, 700。

MS (FAB$^+$), m/z : 314($(M+H)^+$; free體)。

元素分析值 ($C_{19}H_{23}NO_3 \cdot C_2H_2O_4$ %),

計算值：C : 62.52, H : 6.25 , N : 3.47。

實測值：C : 62.47, H : 6.14 , N : 3.42。

(實施例 19)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-570)

(19a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷

將參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷 4.1685g(10.99 毫莫耳)、5-環己基戊-1-烯 4.48g(29.8 毫莫耳)、二環雙(三苯膦)鈀(II)0.7730g(1.10 毫莫耳)及碘化銅(I)0.4205g(2.21 毫莫耳)溶在 N,N-二甲基甲醯胺(110 毫升)、加入三乙胺

15.3ml(110.1 毫莫耳)、於氮氣下及 60℃ 下攪拌 2 小時。冷卻後、加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、加入水及乙酸乙酯、於室溫攪拌 30 分、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2)純化、可得標題化合物 2.6576g(產率 60%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 6.36 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 5.97 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.29 (d, J = 11.0 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 2.63 (t, 2H, J = 8.1 Hz), 2.40 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.29-2.21 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.00-1.93 (m, 1H), 1.92 (s, 3H), 1.72-1.51 (m, 7H), 1.35 (s, 3H), 1.33-1.08 (m, 6H), 0.93-0.84 (m, 2H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 402((M+H)$^+$)。

(19b) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽

將實施例(19a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷 1.2996g(3.24 毫莫耳)溶在四氫呋喃(6.4 毫升)-甲醇(6.4 毫升)、加入水(6.4 毫升)及氫氧化鋰 1 水合物 1.3590g(32.39 毫莫耳)、於 50℃ 下攪拌 4 小時。冷卻後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以鹼性矽膠柱(NH 型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=100/1)純化、可得粗製之(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇 1.0048g。將所得粗製物溶在甲醇(16 毫升)、加入 4M 之

鹽酸一二噁烷溶液 0.79ml(3.16毫莫耳)、於室溫攪拌 10分。減壓濃縮、加入乙醚並濾集結晶、以乙醚洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物 1.0392g(產率 91%)。

熔點：117-118℃。

旋光度,[α]。=+2.43(c=1.00, MeOH)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 6.36 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 6.08 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.49 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.77-2.64 (m, 2H), 2.39 (t, 2H, J = 7.1 Hz), 2.07-1.89 (m, 2H), 1.76-1.54 (m, 7H), 1.35-1.12 (m, 9H), 0.96-0.86 (m, 2H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3138, 2921, 2850, 2693, 2571, 1615, 1595, 1534, 1448, 1402, 1369, 1298, 1197, 1058, 788。

MS (FAB$^+$), m/z : 318((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 20)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-842)

以參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷及 4-環己氧丁-1-烯爲原料、依實施例(19a)及(19b)之方法反應、可得標題化合物(產率 57%)。

熔點：115-118℃。

旋光度,[α]。=+2.63(c=1.00, MeOH)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 6.40 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 6.09 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 3.63 (t, 2H, J = 6.6 Hz), 3.58 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.39-3.32 (m, 1H), 2.76-2.62 (m, 4H), 2.07-1.87 (m, 4H), 1.78-1.73 (m, 2H), 1.56-1.53 (m, 1H), 1.35-1.19 (m, 8H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3204, 2931, 2858, 2667, 2570, 1611, 1597, 1537, 1450, 1390, 1364, 1199, 1107, 1067, 1032, 1002, 967, 952, 786。

MS (FAB$^+$), m/z：320((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 21)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯氧丁醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇反丁烯二酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-1199)

(21a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯氧丁醯基)呋喃-2-基]丁烷

將參考例(5b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)丁烷 0.2589g(1.02毫莫耳)、4-苯氧丁醯氯 0.2446g(1.23毫莫耳)溶在二氯甲烷(9.0毫升)、於氮氣下及-78℃下、於 5 分內加入含氯化錫(IV)之正庚烷(1.0mmol/l)溶液 2.05ml(2.05毫莫耳)、於同溫下攪拌 2 小時。加入飽和碳酸氫鈉水溶液以中止反應、回溫至室溫、加入乙酸乙酯以稀釋、濾除不溶物。將濾液以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=2/1～1/0)純化、可得標題化合物 0.1483g(產率 35%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.29-7.25 (m, 2H), 7.13 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 7.00-6.87 (m, 3H), 6.18 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 5.42 (br s, 1H), 4.30 (d, J = 11.2 Hz), 4.15 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 4.04 (t, 2H, J = 6.0 Hz), 3.00 (t, 2H, J = 7.2 Hz), 2.75-2.68 (m, 2H), 2.38-2.30 (m, 1H), 2.26-2.17 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 2.07-2.1.99 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z：416((M+H)$^+$)。

(21b) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯氧丁醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇反丁烯二酸鹽

將實施例(21a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯氧丁醯基)呋喃-2-基]丁烷 0.2031g(0.49毫莫耳)溶在四氫呋喃(1.0ml)-甲醇(1.0毫升)、加入水(1.0毫升)及氫氧化鋰1水合物 0.2065g(4.92毫莫耳)、於50℃下攪拌4小時。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=100/1)純化、得粗製(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯氧丁醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇 58.4mg。將所得粗製物溶在甲醇(1.7毫升)、加入反丁烯二酸 20.1mg(0.17毫莫耳)、於室溫攪拌30分。減壓濃縮、加入乙酸乙酯濾集結晶、以乙酸乙酯洗浄、減壓乾燥、可得標題化合物 61.5mg(產率 29%)。

^{1}H NMR スペクトル (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.33 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 7.26-7.21 (m, 2H), 6.91-6.84 (m, 3H), 6.35 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 6.25 (s, 2H), 4.03 (t, 2H, J = 6.0 Hz), 3.60 (d, J = 11.7 Hz), 3.51 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.01 (t, 2H, J = 7.2 Hz), 2.88-2.75 (m, 2H), 2.18-1.95 (m, 4H), 1.30 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) :3112, 3038, 2961, 1671, 1583, 1517, 1498, 1386, 1357, 1245, 1081, 1039, 869, 757, 719, 693。

MS (FAB$^+$), m/z : 332($(M+H)^+$; free体)。

元素分析値 ($C_{19}H_{25}NO_4 \cdot C_4H_4O_4$ %),

計算値：C : 61.73, H : 6.53 , N : 3.13。

實測値：C : 61.57, H : 6.40 , N : 2.93。

(實施例 22)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-1 中 1-1831)

(22a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(3-羥丙-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷

將參考例 7 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷 1.5900g(4.19 毫莫耳)、3-丙烯-1-醇 0.73ml(12.54 毫莫耳)、二環雙(三苯膦)鈀(II)0.2940g(0.42 毫莫耳)及碘化銅(I)0.161g(0.85 毫莫耳)溶在 N,N-二甲基甲醯胺(42 毫升)、加入三乙胺 5.85ml(42.9 毫莫耳)、於氮氣及 60℃下攪拌 2 小時。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、加入水及乙酸乙酯、於室溫攪拌 30 分、以乙酸乙酯萃取、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=2/1～1/0)純化、可得標題化合物 1.0748g(產率 83%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.50 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 6.01 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 5.39 (br s, 1H), 4.50 (s, 2H), 4.29 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 4.16 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 2.70-2.60 (m, 2H), 2.32-2.24 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.03-1.95 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.77 (br s, 1H), 1.34 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 308($(M+H)^+$)。

(22b) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(3-溴丙-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷

將實施例(22a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-

甲基-4-[5-(3-羥丙-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷 0.9515g(3.10毫莫耳)、三苯膦 1.2375g(3.73毫莫耳)溶在二氯甲烷(15毫升)、於冰冷卻下、加入四溴化碳 1.0545g(4.02毫莫耳)、於同溫度攪拌 30分。加入甲醇 0.2ml以中止反應、回溫至室溫、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：二氯甲烷/丙酮=9/1)純化、可得標題化合物 0.9278g(產率 82%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 6.54 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 6.02 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 5.37 (br s, 1H), 4.29 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.18 (s, 2H), 4.16 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 2.69-2.60 (m, 2H), 2.32-2.24 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.02-1.95 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

(22c) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷

將 NaH(60%含量)40.0mg(1.00毫莫耳)溶在 N,N-二甲基甲醯胺(4毫升)、於冰冷卻下、加入 4-氯苯酚 0.1302g(1.01毫莫耳)、於室溫攪拌 30分。於冰冷卻下、加入含實施例(22b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(3-溴丙-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷 0.3050g(0.82毫莫耳)之 N,N-二甲基甲醯胺(4毫升)、於室溫攪拌 30分。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、加入水及乙酸乙酯以稀釋、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：二氯甲烷/丙酮=10/1)純化、可得標題化合物 0.3188g(產率 93%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.28-7.25 (m, 2H), 6.96-6.92 (m, 2H), 6.52 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 6.01 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.90 (s, 2H), 4.29 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 4.15 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 2.67-2.59 (m, 2H), 2.31-2.24 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.02-1.94 (m, 1H), 1.93 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CHCl$_3$) : 3444, 2225, 1738, 1681, 1511, 1491, 1450, 1373, 1286, 1249, 1173, 1093, 1039, 1014, 824。

MS (FAB$^+$), m/z : 418((M+H)$^+$)。

(22d) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽

將實施例(22c)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁烷0.3083g(0.74毫莫耳)溶在四氫呋喃(1.5毫升)-甲醇(1.5毫升)、加入水(1.5毫升)及氫氧化鋰1水合物0.3096g(7.38毫莫耳)、於50℃攪拌4小時。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=50/1)純化、可得粗製之(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇0.2156g。將所得粗製物溶在甲醇(6.4毫升)、加入98%草酐59.1mg(0,64毫莫耳)、於室溫攪拌30分。減壓濃縮、加入丙酮並濾集結晶、以丙酮洗淨後、減壓乾燥、可得標題化合物0.2307g(產率75%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.30-7.26 (m, 2H), 7.01-6.97 (m, 2H), 6.57 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 6.14 (d, 1H, J = 3.2 Hz), 4.96 (s, 2H), 3.58 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.79-2.66 (m, 2H), 2.07-1.89 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3401, 3120, 2979, 2925, 2228, 1725, 1615, 1547, 1492, 1373, 1234, 1217, 1200, 1086, 1044, 1016, 830, 795, 698, 506。

MS (FAB$^+$), m/z : 334((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 23)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-三氟甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式Ia-1中 1-1838)

以實施例(22b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-[5-(3-溴丙-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷及(3-三氟甲基)苯酚爲原料、依實施例(22c)及(22d)之方法反應、可得標題化合物(產率 76%)。

^{1}H NMR (DMSO-d_6, 400MHz), δ : 7.60-7.55 (m, 1H), 7.36-7.53 (m, 3H), 6.77 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 6.21 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 5.21 (s, 2H), 3.43 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 3.37 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 2.67 (t, 2H, J = 8.6 Hz), 1.91-1.76 (m, 2H), 1.15 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3126, 2980, 2220, 1719, 1614, 1593, 1546, 1455, 1328, 1207, 1167, 1130。

MS (FAB$^+$), m/z : 368((M+H)$^+$; free體), 336。

(實施例 24)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼：在式

Ia-1中1-1842)

以實施例(22b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[5-(3-溴丙-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷及3,4-二甲氧苯酚爲原料、依實施例(22c)及(22d)之方法反應、可得標題化合物(產率68%).

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 6.87 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 6.66 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 6.57-6.52 (m, 2H), 6.14 (d. 1H, J = 3.6 Hz), 4.90 (s, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.59 (d, 1H, J = 11.5 Hz), 3.50 (d, 1H, J = 11.5 Hz), 2.79-2.66 (m, 2H), 2.08-1.88 (m, 2H), 1.29 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3393, 3093, 2969, 2224, 1722, 1598, 1537, 1513, 1467, 1452, 1278, 1260, 1228, 1194, 1157, 1135, 1021, 796, 721, 698。

MS (FAB$^+$), m/z : 360((M+H)$^+$; free體)。

(實施例25)

(2R)-2-胺基-2-乙基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽(例示化合物號碼:在式Ia-1中1-1660)

(25a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-乙基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷

將參考例18所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-乙基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷79.1mg(0.357毫莫耳)、4-環己氧丁-1-烯168.2mg(1.10毫莫耳)、二環雙(三苯膦)鈀(II)25.1mg(0.036毫莫耳)及碘化銅(I)13.8mg(0.072毫莫耳)溶在N,N-二甲基甲醯胺(3.6毫升)、加入三乙胺0.5ml(0.36毫莫耳)、於氮氣下於80℃下攪拌4小時。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、加入水及乙酸乙

酯、於室溫攪拌30分、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=1/1～1/2)純化、得粗製物68.4mg、以分取用逆層HPLC柱[TSK-GEL ODS-80Ts(2.0cm×25cm)、東曹公司製造、溶離液：乙腈/水=70/30]純化、可得標題化合物46.5mg(產率31%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 6.38 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 5.96 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 5.27 (br s, 1H), 4.28 (s, 2H), 3.65 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 3.33-3.26 (m, 1H), 2.68 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.59 (t, 2H, J = 8.4 Hz), 2.20-2.13 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 2.05-1.98 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.90 (m, 1H), 1.84-1.70 (m, 5H), 1.64 (m, 1H), 1.34-1.18 (m, 5H), 0.87 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CDCl$_3$) : 3307, 3078, 2934, 2858, 2220, 1744, 1658, 1540, 1452, 1369, 1237, 1103, 1042, 788, 756。

MS (FAB$^+$), m/z : 418 ((M+H)$^+$)。

(25b) (2R)-2-胺基-2-乙基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽

將實施例(25a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-乙基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁烷溶在四氫呋喃(0.5毫升)、甲醇(0.5ml)及水(0.5毫升)、加入氫氧化鋰1水合物44.7m(1.07毫莫耳)、於50℃下攪拌4小時。冷却後、於反應液中加入水以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析

(溶離液：二氯甲烷/甲醇=1/0－50/1)純化、得粗製(2R)-2-胺基-2-乙基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇 35.3mg(產率 99%)。將所得粗製物溶在甲醇、加入 98%草酐 9.5mg(0.106 毫莫耳)、於室溫攪拌 30 分。減壓濃縮、加入異丙醚並濾集結晶、以異丙醚洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物 39.9mg(產率 89%)。

^{1}H NMR (DMSO-d_6, 400MHz), δ : 6.56 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 6.16 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 4.19 (br s, 3H), 3.55 (t, 2H, J = 6.7 Hz), 3.44 (s, 2H), 3.33-3.28 (m, 1H), 2.67-2.60 (m, 4H), 1.83-1.79 (m, 4H), 1.66-1.55 (m, 4H), 1.53-1.46 (m, 1H), 1.25-1.20 (m, 5H), 0.86 (t, 3H, J = 7.5 Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3402, 2931, 1918, 1611, 1542, 1198, 1106, 1089, 721, 700。

MS (FAB$^+$), m/z : 356 ($(M+Na)^+$), 334 ($(M+H)^+$; free體)。

(實施例 26)

磷酸單(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯(例示化合物號碼：在式 IIa- 1 中 5-1072)

(26a) (2R)-2-烯丙氧羰胺基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇

將實施例 20 所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇 0.5305g(1.66 毫莫耳)溶在乙酸乙酯(16 毫升)及水(16 毫升)、加入碳酸氫鉀.1995g(1.99 毫莫耳)、及甲酸烯丙酯 0.21ml(1.98 毫莫耳)、於室溫攪拌 30 分。反應液中加入乙酸乙酯稀釋、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於

無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、可得標題化合物 0.6202g(產率 93%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.38 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 5.97 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 5.96-5.86 (m, 1H), 5.30 (ddd, 1H, J = 17.6 Hz, 2.9 Hz, 1.5 Hz), 5.22 (dt, 1H, J = 9.5 Hz, 1.5 Hz), 4.82 (br s, 1H), 4.52 (br d, J = 5.1 Hz), 3.73-3.62 (m, 4H), 3.51 (br s, 1H), 3.33-3.26 (m, 1H), 2.74-2.58 (m, 4H), 2.13 (ddd, 1H, J = 13.9 Hz, 11.0 Hz, 5.1 Hz), 1.97-1.89 (m, 3H), 1.75-1.72 (m, 2H), 1.56-1.51 (m, 1H), 1.34-1.18 (m, 8H)。

(26b)磷酸(2R)-2-烯丙氧羰胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁基二烯丙酯

將實施例(26a)所得(2R)-2-烯丙氧羰胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇 0.6202g(1.54毫莫耳)溶在二氯甲烷(15毫升)、於冰冷卻下、加入 1H-四唑 0.7220g(10.31毫莫耳)及二烯丙基二異丙胺磷酸鹽 0.81ml(3.06毫莫耳)、於室温下攪拌 2 小時。於冰冷卻下、加入間-氯過苯甲酸(70%含量)0.7556g(3.07毫莫耳)、於同温度攪拌 10 分。加入 10%硫代硫酸鈉水溶液以中止反應、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層以飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/2)純化、可得標題化合物 0.7049g(產率 81%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 6.37 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 5.99-5.85 (m, 3H), 5.40-5.19 (m, 6H), 4.87 (br s, 1H), 4.16 (dd, 1H, J = 10.3 Hz, 5.9 Hz), 4.03 (dd, 1H, J = 10.3 Hz, 5.9 Hz), 3.65 (d, 2H, J = 7.3 Hz), 3.33-3.26 (m, 1H), 2.70-2.59 (m, 4H), 2.22-2.14 (m, 1H), 1.96-1.88 (m, 3H), 1.75-1.72 (m, 2H), 1.56-1.53 (m, 1H), 1.34-1.22 (m, 8H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 563($M^{+\cdot}$)。

(26c)磷酸單(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯

將實施例(26b)所得磷酸(2R)-2-烯丙氧羰胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-基)呋喃-2-基]-1-丁二烯丙酯 0.7037g(1.25 毫莫耳)、三苯膦 69.0mg(0.26 毫莫耳)及肆(三苯膦)鈀(O)75.8mg(0.066 毫莫耳)溶在乙腈(13 毫升)、於氮氣下加入吡咯啶 0.66ml(7.91 毫莫耳)、於室溫攪拌 15 小時。將反應液減壓濃縮、加入 50%含水之乙醇(40 毫升)以稀釋、加入乙酸至 pH4 可析出結晶。濾集結晶、以水及乙醇洗淨得粗結晶。將粗結晶溶在甲醇(300 毫升)及水(60 毫升)中並加熱溶解、加入活性碳並過濾、減壓濃縮、加入乙醇並濾集結晶、以乙醇洗淨後乾燥、可得標題化合物 0.2672g(產率 54%)。

^{1}H NMR (CD_3CO_2D, 400MHz), δ : 6.42 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.09 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.10 (d, 2H, J = 10.3 Hz), 3.70 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 3.43-3.37 (m, 1H), 2.83-2.72 (m, 2H), 2.69 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.18-2.06 (m, 2H), 1.94 (br d, 2H, J = 10.3 Hz), 1.76-1.73 (m, 2H), 1.56-1.52 (m, 1H), 1.40 (s, 3H), 1.38-1.18 (m, 5H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3413, 2931, 2857, 1645, 1566, 1540, 1469, 1449, 1212, 1184, 1102, 1067, 1043, 949, 796, 511。

MS (ESI⁻), m/z：398((M-H)⁻)。

(實施例 27)

磷酸單(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯(例示化合物號碼：在式 IIa-1 中 5-824)

以實施例 2 所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇草酸鹽爲原料、依實施例(26a)、(26b)及(26c)之方法反應、可得標題化合物(產率 24%)。

^{1}H NMR (CD_3CO_2D, 400MHz), δ：6.39 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.07 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.10 (d, 2H, J = 10.3 Hz), 2.79-2.75 (m, 2H), 2.40 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.17-2.05 (m, 2H), 1.75-1.44 (m, 7H), 1.41 (s, 3H), 1.35-1.12 (m, 6H), 0.95-0.90 (m, 2H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr)：3233, 2922, 2850, 2559, 1642, 1594, 1537, 1448, 1256, 1184, 1078, 1029, 942, 825, 794, 572, 514。

MS (FAB⁻), m/z：396((M-H)⁻)。

(實施例 28)

磷酸單(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯(例示化合物號碼：在式 IIa-1 中 5-2278)

以實施例 4 所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3、4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇草酸鹽爲原料、依實施例(26a)、(26b)及(26c)之方法反應、可得標題化合物(產率 21%)。

^{1}H NMR (CD_3CO_2D, 400MHz), δ : 7.02 (d, 1H, J = 8.1 Hz), 6.78 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 6.73 (dd, 1H, J = 8.1 Hz, 3.0 Hz), 6.56 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.13 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.90 (s, 2H), 4.10 (d, 2H, J = 10.3 Hz), 2.84-2.72 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.15-2.05 (m, 2H), 1.40 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3411, 2922, 2227, 1616, 1536, 1501, 1451, 1371, 1286, 1250, 1202, 1185, 1166, 1045, 1028, 931, 799, 573, 514。

MS (FAB$^-$), m/z : 406($(M-H)^-$)。

(實施例 29)

(3R)-3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]丁膦酸(例示化合物號碼：在式 IIIa-1 中 5-1344)

(29a) (2R)-2-第三丁氧羰胺基--2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇

將實施例 5 所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇 97.8mg(0.30 毫莫耳)溶在二氯甲烷(3 毫升)、加入碳酸二第三丁酯 77.3mg(0.35 毫莫耳)及三乙胺 85μ1(0.61 毫莫耳)、於室溫攪拌 19 小時。減壓濃縮、於反應液中加入水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、以無水硫酸鎂乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=1/1)純化、可得標題化合物 112.2mg(產率 88%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.29-7.23 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 3H), 7.08 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.18 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.63 (br s, 1H),

4.03 (br s, 1H), 3.66 (d, 2H, J = 5.9 Hz), 2.84-2.68 (m, 4H), 2.65 (t, 2H, J = 8.1 Hz), 2.18 (ddd, 1H, J = 16.6 Hz, 11.0 Hz, 5.1 Hz), 1.98 (ddd, 1H, J = 16.6 Hz, 11.7 Hz, 5.1 Hz), 1.81-1.65 (m, 4H), 1.43 (s, 9H), 1.19 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z：430($(M+H)^+$)。

(29b) (2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]-1-丁醛

將實施例(29a)所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇 110.2mg(0.26毫莫耳)溶在二氯甲烷(2.6毫升)、加入 Dess-Martin 試藥 165.0mg(2.28毫莫耳)、於氮氣及室溫下攪拌1小時。減壓濃縮、反應液中加入10%硫代硫酸鈉水溶液以分解過剩之試藥、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層以飽和碳酸氫鈉水及飽和食鹽水洗淨、以無水硫酸鎂乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/1)純化、可得標題化合物 105.9mg(產率97%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ：9.34 (s, 1H), 7.29-7.25 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 3H), 7.06 (d, 1H, J = 3.6 Hz), 6.16 (d, 1H, J = 3.6 Hz), 5.16 (br s, 1H), 2.77 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.74-2.56 (m, 4H), 2.40-2.36 (m, 1H), 2.22-2.14 (m, 1H), 1.80-1.65 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 1.37 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z：428($(M+H)^+$)。

(29c) (3R)-3-第三丁氧羰胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]戊-1-炔基膦酸二乙酯

將 NaH(60%含量)16.0mg(0.40毫莫耳)溶在四氫呋喃

(1 毫升)、於冰冷卻下及 5 分間加入四乙基亞甲基二磷醯胺 0.100ml(0.40 毫莫耳)、於室溫攪拌 1 小時。於冰冷卻下及 5 分間、在反應液中加入含實施例(29b)所得二乙基(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]-1-丁醛 104.5mg(0.24 毫莫耳)之四氫呋喃(4 毫升)、於同溫度下攪拌 15 分。反應液中加入乙酸 22μl(0.38 毫莫耳)以中和並減壓濃縮、於反應液中加入水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以水及飽和食鹽水洗淨、以無水硫酸鎂乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯)純化、可得標題化合物 129.0mg(產率 94%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.29-7.24 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 3H), 7.07 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.75 (dd, 1H, J = 22.7 Hz, 17.6 Hz), 6.16 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.71 (t, 1H, J = 17.6 Hz), 4.60 (br s, 1H), 4.15-4.04 (m, 4H), 2.77 (t, 2H, J = 8.1 Hz), 2.74-2.63 (m, 4H), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.09-2.01 (m, 1H), 1.81-1.65 (m, 4H), 1.42 (s, 9H), 1.40 (s, 3H), 1.33 (t, 6H, J = 7.3 Hz)。

MS (FAB$^+$), m/z : 562($(M+H)^+$)。

(29d) (3R)-3-第三丁氧羰胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸二乙酯

將實施例(29c)所得(3R)-3-第三丁氧羰胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]戊-1-炔基膦酸二乙酯 127.8mg(0.23 毫莫耳)溶在乙醇(2.3 毫升)、加入氯化參(三苯膦)銠(I)22.0mg(0.024 毫莫耳)、於氫氣及 50℃下攪拌 8 小時。冷却後、再加入氯化參(三苯膦)銠

(I)21.5mg(0.023 毫莫耳)、於氫氣及 50℃下攪拌 8 小時。減壓蒸除、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯)純化、得粗製物 142.1mg、以分取用逆層 HPLC 柱[Inertsil ODS-3(2.0cm×25cm)、GL Science 公司製造、溶離液：乙腈/水=75/25、流速:10ml/min]純化、得標題化合物 109.5mg(產率 85%)。

^{1}H NMR (400MHz, $CDCl_3$), δ : 7.29-7.25 (m, 2H), 7.19-7.15 (m, 3H), 7.07 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.15 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.36 (br s, 1H), 4.15-4.10 (m, 4H), 2.77 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.72-2.63 (m, 4H), 2.22-2.17 (m, 2H), 1.92-1.85 (m, 1H), 1.80-1.63 (m, 7H), 1.42 (s, 9H), 1.33 (t, 6H, J = 7.3 Hz), 1.19 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 564($(M+H)^+$)。

(29e) (3R)-3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸

將實施例(29d)所得(3R)-3-第三丁氧羰胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸二乙酯 108.2mg(0.19 毫莫耳)溶在二氯甲烷(1.9 毫升)、加入溴化三甲矽烷 0.255ml(1.93 毫莫耳)、於氮氣及室溫下攪拌 4 小時。減壓蒸除溶劑、加入含水乙醇以稀釋、加入氨水溶液及乙酸至 pH4 可析出結晶。濾集結晶、以水及乙醇洗淨後乾燥、可得標題化合物 51.4mg(產率 66%)。

^{1}H NMR (CD_3CO_2D, 400MHz), δ : 7.29 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 7.26-7.23 (m, 2H), 7.18-7.12 (m, 3H), 6.35 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 2.85 (t, 4H, J = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.23-1.92 (m, 6H), 1.78-1.64 (m, 4H), 1.44 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr)：3160, 2934, 2860, 2560, 2529, 1670, 1552, 1516, 1453, 1391, 1314, 1140, 1068, 1046, 913, 882, 804, 723, 700, 568, 525, 490, 468。

MS (FAB$^-$), m/z：406($(M-H)^-$)。

(實施例 30)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯丁-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1/2 草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-559)

以參考例 13 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲基-5-碘吡咯-2-基)丁烷及 4-苯丁-1-烯爲原料、依實施例(1a)及(1b)之方法反應、可得標題化合物(產率 58%)。

^1H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.30-7.26 (m, 4H), 7.21-7.16 (m, 1H), 6.09 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.76 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.52 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.41 (s, 3H), 2.88 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.73 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.62-2.58 (m, 2H), 1.98-1.80 (m, 2H), 1.29 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr)：3362, 3026, 2943, 2224, 2080, 1591, 1496, 1454, 1300, 1073。

MS (FAB$^+$), m/z：311($(M+H)^+$; free體)。

(實施例 31)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1/2 草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-93)

(31a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁烷

將參考例 13 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲基-5-碘吡咯-2-基)丁烷 0.2918g(0.74 毫莫耳)、5-苯戊-1-烯 0.3225g(2.24 毫莫耳)、二環雙(三苯膦)鈀(II)52.3mg(0.075 毫莫耳)及碘化銅(I)29.0mg(0.15 毫莫耳)溶在 N,N-二甲基甲醯胺(7.4 毫升)、加入三乙胺 1.04ml(7.5 毫莫耳)、於氮氣及室溫攪拌 1 小時。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、加入水及乙酸乙酯、於室溫攪拌 30 分、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2)純化、可得標題化合物 0.2205g(產率 73%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.31-7.27 (m, 2H), 7.22-7.18 (m, 3H), 6.26 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.81 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.35 (br s, 1H), 4.32 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 4.18 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 3.55 (s, 3H), 2.78 (t, 2H, J = 7.7 Hz), 2.55 (t, 2H, J = 8.2 Hz), 2.46 (t, 2H, J = 7.0 Hz), 2.27-2.19 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.97-1.84 (m, 6H), 1.37 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} ($CHCl_3$) : 3443, 2944, 2861, 1736, 1679, 1603, 1512, 1454, 1374, 1251, 1042。

MS (FAB$^+$), m/z : 409($(M+H)^+$), 408($M^{+\cdot}$)。

(31b) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊基)吡咯-2-基]丁烷

將實施例(31a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁烷 77mg(0.19 毫莫耳)溶在甲醇(2 毫升)、加入 10%鈀-碳(50%含水)4.3mg、於氫氣及室溫攪拌 1 小時。取代氮後、反

應液中 Pd-C 以矽藻土過濾後、將矽藻土以乙酸乙酯洗淨。結合濾液及洗液並減壓濃縮乾燥、可得標題化合物 75.5mg(產率 97%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.28-7.25 (m, 2H), 7.18-7.15 (m, 3H), 5.79 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.77 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.36, (br s, 1H), 4.32 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.19 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 3.37 (s, 3H), 2.61 (t, 2H, J = 7.7 Hz), 2.55-2.47 (m, 4H), 2.23-2.15 (m, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.94-1.87 (m, 1H),1.90 (s, 3H), 1.70-1.59 (m, 4H), 1.53 (s, 3H), 1.47-1.39 (m, 2H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 412((M+H)$^+$)。

(31c) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1/2 草酸鹽

將實施例(31b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊基)吡咯-2-基]丁烷 75.0mg(0.18 毫莫耳)溶在四氫呋喃(1 毫升)及甲醇(1 毫升)、加入水(1 毫升)及氫氧化鋰 1 水合物 76mg(1.81 毫莫耳)、於 50℃下攪拌 6 小時。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH 型)層析(溶離液 : 二氯甲烷/甲醇 =1/0～ 50/1)純化、得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊基)吡咯-2-基]丁-1-醇 53.6mg(產率 90%)。將所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊基)吡咯-2-基]丁-1-醇 53.6mg 溶在甲醇(1.6 毫升)、加入草酐(98%)7.4mg(0.082 毫莫耳)、於室溫攪拌 1 小時。減壓濃

縮、加入乙酸乙酯並濾集所析出結晶、以乙酸乙酯洗淨、減壓下乾燥、可得標題化合物 49.2mg(產率 81%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.25-7.21 (m, 2H), 7.16-7.11 (m, 3H), 5.71 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.66 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 3.60 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.52 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.41 (s, 3H), 2.65-2.56 (m, 4H), 2.53-2.49 (m, 2H), 1.99-1.81 (m, 2H), 1.68-1.56 (m, 4H), 1.44-1.37 (m, 2H), 1.30 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3315, 2930, 2092, 1632, 1591, 1549, 1455, 1304, 1073。

MS (FAB$^+$), m/z : 329($(M+H)^+$; free體)。

(實施例 32)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1/2 草酸鹽(例示化合物號碼:在式 Ia-2 中 1-31)

以參考例 13 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲基-5-碘吡咯-2-基)丁烷及 4-苯丁-1-烯爲原料、依實施例(31a)、(31b)及(31c)之方法反應、可得標題化合物(產率 28%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.25-7.21 (m, 2H), 7.16-7.11 (m, 3H), 5.71 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 5.66 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 3.60 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.53 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.39 (s, 3H), 2.66-2.53 (m, 6H), 1.98-1.81 (m, 2H), 1.72-1.55 (m, 4H), 1.30 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3347, 3024, 2933, 2858, 1589, 1454, 1299, 1072, 763, 745, 698。

MS (FAB$^+$), m/z : 315($(M+H)^+$; free體)。

(實施例 33)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-1093)

(33a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-{1-甲基-[5-苯基-1-(5-苯戊醯氧)戊-1-烯基]吡咯-2-基}丁烷

將參考例(19b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷 4.23g(15.4 毫莫耳)溶在甲苯(100 毫升)、加入含 4-二甲胺吡啶 9.41g(77.0 毫莫耳)及 5-氟戊醯氯(98%)7.92g(39.5 毫莫耳)之甲苯(50 毫升)溶液、於 110℃下攪拌 48 小時。回溫至室溫、反應液中加入乙酸乙酯及水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以水及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2～2/1)純化、可得標題化合物 4.03g(產率 45%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.26-7.23 (m, 4H), 7.17-7.11 (m, 6H), 6.96(d, 1H, J = 4.2 Hz), 5.97 (d, 1H, J = 4.2 Hz), 5.41 (br s, 1H), 4.31 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.15 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.11 (t, 1H, J = 8.1 Hz), 3.83 (s, 3H), 2.67-2.39 (m, 8H), 2.34-2.26 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.04-1.86 (m, 6H), 1.61-1.48 (m, 6H), 1.36 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CHCl$_3$) : 3443, 2938, 2861, 1733, 1681, 1634, 1487, 1454, 1374, 1249, 1044, 。

MS (FAB$^+$), m/z : 587((M+H)$^+$)。

(33b) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽

將實施例(33a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-{1-甲基-[5-苯基-1-(5--苯戊醯氧基)戊-1-烯基]吡咯-2-基}丁烷 4.0270g(6.86毫莫耳)溶在四氫呋喃(14毫升)及甲醇(14毫升)、加入水(14毫升)及氫氧化鋰 1水合物 2.8820g(68.68毫莫耳)、於 50℃下攪拌 4小時。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=100/1)純化、可得粗製(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇 2.1152g。將所得粗製物溶在甲醇(31毫升)、加入 4M之鹽酸-二噁烷溶液 1.54ml(6.16毫莫耳)、於室溫攪拌 10分。減壓濃縮、加入乙酸乙酯並濾集所析出結晶、以乙酸乙酯洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物 2.0685g(產率 79%)。

熔點：130-131℃。

旋光度。[α]$_D$ =-4.81(c=1.00。MeOH)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.25-7.21 (m, 2H), 7.17-7.11 (m, 3H), 7.05 (d, 1H, J = 4.2 Hz), 6.03 (d, 1H, J = 4.2 Hz), 3.86 (s, 3H), 3.65 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 3.55 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 2.78-2.67 (m, 4H), 2.63 (t, 2H, J = 7.2 Hz), 2.02 (ddd, 1H, J = 13.8 Hz, 9.4 Hz, 7.6 Hz), 1.90 (ddd, 1H, J = 13.8 Hz, 11.5 Hz, 6.3 Hz), 1.70-1.64 (m, 4H), 1.34 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3215, 2937, 2883, 2691, 2571, 1646, 1525, 1482, 1457, 1380, 1294, 1228, 1182, 1055, 998, 913, 770, 751, 700。

MS (FAB$^+$), m/z：343((M+H)$^+$; free体)。

元素分析值 ($C_{21}H_{30}N_2O_2 \cdot HCl$ %),

計算值：C : 66.56, H : 8.25 , N : 7.39 , Cl : 9.36。

實測值：C : 66.51, H : 8.20 , N : 7.47 , Cl : 9.08。

(實施例 34)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]吡咯-2-基}丁-1-醇鹽酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-1094)

以參考例(19b)所得(2.R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷及 5-(4-氟苯基)戊醯氯爲原料、依實施例(33a)及(33b)之方法反應、可得標題化合物(產率 42%)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.20-7.13 (m, 2H), 7.05 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 6.99-6.92 (m, 2H), 6.03 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 3.86 (s, 3H), 3.65 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 3.55 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 2.76 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.74-2.66 (m, 2H), 2.62 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.08-1.86 (m, 2H), 1.73-1.60 (m, 4H), 1.35 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3352, 3210, 3153, 3035, 2930, 2863, 1634, 1601, 1509, 1480, 1464, 1371, 1349, 1222, 1175, 1067, 823, 766。

MS (FAB$^+$), m/z：361((M+H)$^+$;free體)。

(實施例 35)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-1082)

以參考例(19b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷及 4-苯丁醯氯爲原料、依實

施例(33a)及(33b)之方法反應、可得標題化合物(產率48%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.28-7.12 (m, 5H), 6.97 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 6.02 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 3.86 (s, 3H), 3.65 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.55 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.78-2.62 (m, 6H), 2.08-1.85 (m, 4H), 1.35 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3203, 3025, 2941, 2572, 2029, 1649, 1518, 1482, 1457, 1382, 1297, 1179, 1140, 1057, 989, 915, 752, 699。

MS (FAB$^+$), m/z : 329((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 36)

(2R-r2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(3-苯丙醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽(例示化合物號碼:在式 Ia-2 中 1-1080)

以參考例(19b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷及 3-苯丙醯氯爲原料、依實施例(33a)及(33b)之方法反應、可得標題化合物(產率42%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.27-7.11 (m, 5H), 7.03 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 6.01 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 3.86 (s, 3H), 3.65 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.55 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.09-3.02 (m, 2H), 2.99-2.92 (m, 2H), 2.76-2.62 (m, 2H), 2.08-1.85 (m, 2H), 1.34 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3376, 3026, 2932, 2559, 1640, 1605, 1484, 1455, 1410, 1381, 1294, 1225, 1135, 1069, 983, 924, 770, 747, 699。

MS (FAB$^+$), m/z : 315((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 37)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯

-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia- 2 中 1-1083)

以參考例(19b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷及 5-環己基戊醯氯爲原料、依實施例(33a)及(33b)之方法反應、可得標題化合物(產率 29%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.05 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 6.04 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 3.87 (s, 3H), 3.65 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.55 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.78-2.64 (m, 4H), 2.09-1.86 (m, 2H), 1.76-1.58 (m, 7H), 1.40-1.10 (m, 11H), 0.95-0.80 (m, 2H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3354, 3212, 3156, 3034, 2921, 2850, 1637, 1498, 1480, 1464, 1379, 1370, 1292, 1224, 1175, 1066, 1054, 914, 762。

MS (FAB$^+$), m/z : 349((M+H)$^+$; free 體)。

(實施例 38)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-4-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1/2 草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ib-2 中 2-252)

(38a) (4R)-4-甲基-4-{2-[1-甲基-4-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]乙基}-1,3-噁唑啶-2-酮

將參考例 11 所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 100mg(0.48 毫莫耳)溶在苯(4 毫升)、加入 N,N-二甲基-5-苯戊醯胺 99mg(0.48 毫莫耳)及氧三氯化磷 43μ1(0.46 毫莫耳)、加熱回流 6 小時。將反應液中加入 20%乙酸鈉水溶液 2ml，於 80℃下攪拌 15 分。回溫至室溫、加入水並以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙

酯層清洗以飽和食鹽水、以無水硫酸鎂乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=1/1～3/2～4/1)純化、可得標題化合物11mg(產率6%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 500MHz), δ：7.30-7.24 (m, 2H), 7.20-7.15 (m, 4H), 6.31 (s, 1H), 5.72 (br s, 1H), 4.17 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 4.10 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 3.57 (s, 3H), 2.70-2.55 (m, 6H), 1.94 (t, 2H, J = 8.2 Hz), 1.78-1.60 (m, 4H), 1.43 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z：369((M+H)$^+$)。

(38b) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-4-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1/2 草酸鹽

將實施例(38a)所得(4R)-4-甲基-4-{2-[1-甲基-4-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]乙基}-1,3-噁唑啶-2-酮11mg(0.03毫莫耳)溶在四氫呋喃(1毫升)-甲醇(1毫升)、加入5M之氫氧化鉀水溶液(1毫升)、加熱回流2日。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、可得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-4-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇9mg。將所得粗製物6.5mg溶在甲醇(0.5毫升)、加入草酐(98%含量)0.85mg(0.0095毫莫耳)、於室溫攪拌10分。減壓濃縮乾燥、可得標題化合物7.0mg(產率84%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 500MHz), δ：7.42 (s, 1H), 7.26-7.20 (m, 2H), 7.17-7.11 (m, 3H), 6.32 (s, 1H), 3.65-3.60 (m, 4H), 3.57 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.74-2.60 (m, 6H), 2.04-1.86 (m, 2H), 1.73-1.62 (m, 4H), 1.33 (s, 3H)。

IR. ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3339, 3025, 2929, 2859, 2565, 1611, 1525, 1497, 1453, 1438, 1355, 1310, 1176, 1069, 928, 818, 774, 749, 700。

MS (FAB+), m/z : 343((M+H)+; free體)。

(實施例 39)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基-1-羥丁基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1/2 草酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-2 中 1-1399)

將實施例(33b)所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽 185mg(0.49 毫莫耳)溶在二氯甲烷(10 毫升)、於 5 分鐘期間加入 1M 之氫氧化鈉水溶液並攪拌後、以二氯甲烷萃取、以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇。將所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇溶在甲醇 5ml、於冰冷卻下、加入硼氫化鈉 28mg(0.74 毫莫耳)、於室溫下攪拌 1 小時。反應液中追加硼氫化鈉 28mg(0.74 毫莫耳)、於室溫攪拌 20 小時。再追加硼氫化鈉 28mg(0.74 毫莫耳)、於室溫攪拌 7 小時、於反應液中加入水並以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以水及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓濃縮乾燥、將殘渣以分取用逆層 HPLC 柱[Inertsil ODS-3(2.0cm×25cm)、GL Science 公司製造、溶離液：乙腈/0.1%乙酸銨水溶液=70/30 流速 10ml/min]純化、可得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基-1-羥戊基)吡咯-2-基]丁-1-醇

79mg。將所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基-1-羥戊基)吡咯-2-基]丁-1-醇 79mg(0.23毫莫耳)溶在甲醇(2毫升)、加入98%草酐 9.3mg(0.11毫莫耳)、於室溫攪拌30分。減壓濃縮乾燥、可得標題化合物 57mg(產率30%)。

^{1}H NMR (CD$_3$OD, 400MHz), δ : 7.25-7.20 (m, 2H), 7.17-7.09 (m, 3H), 5.91 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 5.76 (d, 1H, J = 3.4 Hz), 4.57 (t, 1H, J = 6.6 Hz), 3.59 (d, 1H, J = 12.0 Hz), 3.54 (s, 3H), 3.53 (d, 1H, J = 12.0 Hz), 2.65-2.55 (m, 4H), 2.00-1.80 (m, 4H), 1.70-1.58 (m, 2H), 1.54-1.44 (m, 1H), 1.43-1.32 (m, 1H), 1.30 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3212, 3026, 2935, 2897, 2571, 1719, 1700, 1611, 1521, 1496, 1454, 1405, 1279, 1218, 1053, 767, 721, 700。

MS ・トル (FAB$^+$), m/z : 325((M+H)$^+$; free體)。

(實施例 40)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-1-甲吡咯-2-基}丁-1-醇 1/2草酸鹽(例示化合物號碼：在式Ia-2中 1-1444)

(40a) (4R)-4-甲基-4-[2-(5-碘-1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮

將參考例11所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 0.6187g(2.97毫莫耳)溶在四氫呋喃(30毫升)、於冰冷卻下、加入吡啶 1.2ml(14.9毫莫耳)及碘 1.5060g(5.93毫莫耳)、於同溫下攪拌10分。加入10%硫代硫酸鈉水溶液以中止反應、減壓濃縮至約1/2、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以飽和碳酸氫鈉水溶液

及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓濃縮乾燥、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2)純化、可得標題化合物 0.6660g(產率 67%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.30 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.93 (d, 1H, J =3.7 Hz), 5.17 (br s, 1H), 4.15 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.09 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 3.50 (s, 3H), 2.76-2.63 (m, 2H), 1.96-1.85 (m, 2H), 1.42 (s, 3H)。

(40b) (4R)-4-甲基-4-〔2-{2-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-1-甲吡咯-2-醯基}乙基〕-1,3-噁唑啶-2-酮

將實施例(40a)所得(4R)-4-甲基-4-[2-(5-碘-1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 0.3101g(0.92 毫莫耳)、2-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二噁硼烷 0.4646g(1.41 毫莫耳)、二環雙(三苯膦)鈀(II)63.1mg(0.09 毫莫耳)及碳酸銫 0.6006g(1.81 毫莫耳)溶在二甲氧乙烷(8 毫升)及水(2 毫升)、於 80℃下攪拌 6 小時。冷却後、於反應液中加入水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、以無水硫酸鎂乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2)純化可得粗製物、以分取用逆層 HPLC 柱[Inertsil ODS-3(2.0cm×25cm)、GL Science 公司製造、溶離液：乙腈/水=75/25 流速 10ml/min]純化、可得標題化合物 41.1mg(產率 11%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.30-7.26 (m, 1H), 6.93-6.89 (m, 2H), 6.85-6.83 (m, 1H), 6.14 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.95 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.27 (br s, 1H), 4.18 (d, J = 8.8 Hz), 4.10 (d, 1H, J = 8.8 Hz),

4.01 (t, 2H, J = 6.6 Hz), 3.52 (s, 3H), 2.77-2.64 (m, 2H), 2.06-1.94 (m, 2H), 1.78-1.64 (m, 6H), 1.55-1.46 (m, 1H), 1.45 (s, 3H), 1.31-1.11 (m, 4H), 1.02-0.92 (m, 2H)。

MS (FAB$^+$), m/z：411((M+H)$^+$)。

(40c) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-1-甲吡咯-2-基}丁-1-醇 1/2 草酸鹽

將實施例(40b)所得(4R)-4-甲基-4-〔2-{2-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-1-甲吡咯-2-基}乙基〕-1,3-噁唑啶-2-酮41.0g(0.10毫莫耳)溶在四氫呋喃(1毫升)-甲醇(0.5毫升)、加入5M之氫氧化鉀水溶液(0.5毫升)、加熱回流4日。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=50/1)純化、得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-1-甲吡咯-2-基}丁-1-醇 36.5mg。將所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-1-甲吡咯-2-基}丁-1-醇 36.2mg溶在甲醇(1毫升)、加入草酐(98%含量)4.4mg(0.05毫莫耳)、於室溫攪拌30分。減壓濃縮、加入2-丙醇、濾集結晶、以2-丙醇洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物35.6mg(產率86%)。

^{1}H NMR, (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.27 (t, 1H, J = 8.1 Hz), 6.89 (d, 1H, J = 8.1 Hz), 6.85-6.81 (m, 2H), 6.03 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.91 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.02 (t, 1H, J = 6.6 Hz), 3.63 (d, J = 11.7 Hz), 3.56 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.54 (s, 3H), 2.77-2.65 (m, 2H), 2.07-1.90

(m, 2H), 1.81-1.64 (m, 7H), 1.59-1.47 (m, 1H), 1.34 (s, 3H), 1.32-1.15 (m, 3H), 1.05-0.95 (m, 2H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3354, 2923, 2851, 1595, 1579, 1509, 1463, 1301, 1211, 1066, 1049, 763, 698。

MS (FAB$^+$), m/z : 385 ($(M+H)^+$; free體)。

(實施例 41)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽(例示化合物號碼：在式 Ia-5 中 4-12)

(41a) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-{1-乙基-[5-苯基-1-(5-苯戊醯氧基)戊-1-烯基]吡咯-2-基}丁烷

將參考例 24 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-乙吡咯-2-基)丁烷 2.1g(7.49 毫莫耳)溶在甲苯(100 毫升)、加入二甲胺吡啶 4.58g(37.5 毫莫耳)、並加入含 5-苯戊醯氯 4.4g(22.5 毫莫耳)之甲苯(20 毫升)、加熱回流 5 日。回溫至室溫、於反應液中加入水、以乙酸乙酯萃取、以水及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓濃縮乾燥、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=4/6)純化可得粗製物、分取用逆層 HPLC 柱 Inertsil ODS-3(2.0cm×25cm)、GL Science 公司製造、溶離液：乙腈/0.1%乙酸銨水溶液=70/30 流速 10ml/min]純化、可得標題化合物 2.8g(產率 66%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.26-7.21 (m, 4H), 7.18-7.09 (m, 6H), 6.98 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 5.97 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 5.43 (br s, 1H), 4.35-4.28 (m, 1H), 4.33 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.12 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 2.65-2.25 (m, 9H), 2.10 (s, 3H), 2.07-1.86 (m, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.62-1.47 (m, 6H), 1.37 (s, 3H), 1.25 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

(41b) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽

將實施例(41a)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-{1-乙基-[5-苯基-1-(5-苯戊醯氧基)戊-1-烯基]吡咯-2-基}丁烷 2.8g(4.66毫莫耳)溶在甲醇(12毫升)、四氫呋喃(12毫升)及水(12毫升)、加入氫氧化鋰1水合物1.96g(46.6毫莫耳)、於50℃下攪拌5小時。回溫至室溫、加入水並以二氯甲烷萃取、以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=100/1)純化、可得粗製(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1.53g。將所得粗製物 1.53g 溶在乙醇(15毫升)、於冰冷卻下、加入4M之鹽酸一二噁烷溶液1.07ml(4.26毫莫耳)。於冰冷卻下攪拌30分後、減壓濃縮乾燥、將殘渣以乙酸乙酯再結晶、可得標題化合物1.46g(產率 80%)。

^{1}H NMR (DMSO-d_6, 400MHz), δ : 7.90 (br s, 2H), 7.29-7.24 (m, 2H), 7.20-7.13 (m, 3H), 7.06 (d, 1H, J = 4.0 Hz), 5.94 (d, 1H, J =4.0 Hz), 5.53 (t, 1H, J = 4.8 Hz), 4.29 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 3.49 (dd, 1H, J = 11.0 Hz, 4.8 Hz), 3.43 (dd, 1H, J = 11.0 Hz, 4.8 Hz), 2.79-2.70 (m, 2H), 2.69-2.55 (m, 4H), 1.94-1.88 (m, 2H), 1.64-1.53 (m, 4H), 1.22 (s, 3H), 1.17 (t, 3H, J = 7.3Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3377, 2936, 1639, 1479, 1393, 1068。

MS (FAB$^+$), m/z : 357($(M+H)^+$; free體)。

(實施例 42)

(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇(例示化合物號碼：在式 Ia-4 中 3-12)

(42a)(4R)-4-甲基-4-{2-[5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]乙基}-1,3-噁唑啶-2-酮

將參考例 28 所得(4R)-4-甲基-4-[2-(吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 138mg(0.71 毫莫耳)溶在四氫呋喃(5 毫升)、加入含甲基溴化鎂之乙醚(3.0M)溶液 0.50ml(1.49 毫莫耳)、加熱回流 30 分。冷却後、於室温攪拌下加入含 5-苯戊醯氯 0.169g(22.5 毫莫耳)之四氫呋喃(1 毫升)、加熱回流 1 小時。回温至室温、於反應液中加入水、以乙酸乙酯萃取、以水及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓下濃縮乾燥、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=2/1)純化可得粗製物、以分取用逆層 HPLC 柱[Inertsil ODS-3(2.0cm×25cm)、GL Science 公司製造、溶離液：乙腈/水=70/30 流速 20ml/min]純化、可得標題化合物 41mg(產率 16%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 9.67 (br s, 1H), 7.31-7.22 (m, 3H), 7.20-7.13 (m, 2H), 6.85-6.78 (m, 1H), 6.03-5.96 (m, 1H), 5.70 (br s, 1H), 4.16 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.07 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 2.80-2.67 (m, 4H), 2.67-2.58 (m, 2H), 2.01-1.88 (m, 2H), 1.81-1.61 (m, 4H), 1.37 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} ($CHCl_3$) :3442, 3271, 2935, 2861, 1758, 1632, 1492, 1454, 1410, 1382, 1046, 940。

MS (FAB$^+$), m/z : 355($(M+H)^+$)。

(42b)(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇

將實施例(42a)所得(4R)-4-甲基-4-{2-[5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]乙基}-1,3-噁唑啶-2-酮 41.0mg(0.12毫莫耳)溶在甲醇(2毫升)、四氫呋喃(2毫升)及水(2毫升)、加入10M之氫氧化鈉水溶液 0.12ml(1.17毫莫耳)、加熱回流4日。回温至室温、加入水以乙酸乙酯萃取、以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=20/1)純化、可得標題化合物 30.0mg(產率 79%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ :9,90 (br s, 1H), 7.32-7.22 (m, 3H), 7.20-7.12 (m, 2H), 6.79 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.98 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 3.40 (d, 1H, J = 10.3 Hz), 3.35 (d, 1H, J = 10.3 Hz), 2.80-2.59 (m, 6H), 2.01-1.62 (m, 6H), 1.11 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} ($CHCl_3$) :3272, 2927, 2857, 1624, 1494, 1454, 1410, 1363, 1293, 1263, 1210, 1048, 915, 801, 749, 700。

MS (FAB$^+$), m/z : 329($(M+H)^+$)。

(實施例 43)

磷酸單(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯(例示化合物號碼：在式 IIa-2 中 5-1344)

(43a) (2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇

將實施例(33b)所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇鹽酸鹽 1.4647g(3.87毫莫耳)溶在二氯甲烷(38毫升)、加入碳酸二第三丁酯

1.0126g(4.64 毫莫耳)及三乙胺 1.62ml(11.65 毫莫耳)、於室温下攪拌 18 小時。減壓濃縮、於反應液中加入水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、以無水硫酸鎂乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/2)純化、可得標題化合物 1.6928g(產率 99%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.28-7.24 (m, 2H), 7.18-7.14 (m, 3H), 6.90 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.95 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.63 (br s, 1H), 3.98 (br s, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.68 (d, 2H, J = 6.6 Hz), 2.75 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.70-2.62 (m, 3H), 2.55 (ddd, 1H, J = 15.4 Hz, 12.4 Hz, 5.1 Hz), 2.13-2.04 (m, 1H), 1.96-1.89 (m, 1H), 1.79-1.64 (m, 4H), 1.43 (s, 9H), 1.21 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z：443($(M+H)^+$)。

(43b)磷酸(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁基二烯丙酯

將實施例(43a)所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇 1.6928g(3.83 毫莫耳)溶在二氯甲烷((19 毫升)、於冰冷卻下、加入 1H-四唑 1.7933g(25.60 毫莫耳)及二烯丙二異丙胺基磷酸鹽 2.02ml(7.64 毫莫耳)、於室溫攪拌 2 小時。反應液中、於冰冷卻下加入含第三丁基過氧化氫之正癸烷(5-6mol/l)溶液 2.3ml(11.5 毫莫耳)、於同温下攪拌 15 分。加入亜硫酸鈉水溶液以中止反應、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層以飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗浄、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶

劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/2)純化、可得標題化合物 1.5690g(產率 68%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.28-7.24 (m, 2H), 7.18-7.14 (m, 3H), 6.89 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.99-5.89 (m, 3H), 5.39-5.29 (m, 4H), 4.62 (br s, 1H), 4.60-4.52 (m, 4H), 4.21 (dd, 1H, J = 9.5 Hz, 5.1 Hz), 4.01 (dd, 1H, J = 9.5 Hz, 5.9 Hz), 3.86 (s, 3H), 2.74 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, J = 8.1 Hz), 2.58 (t, 2H, J = 8.1 Hz), 2.22-2.12 (m, 1H), 1.90-1.81 (m, 1H), 1.79-1.64 (m, 4H), 1.43 (s, 9H), 1.26 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 603((M+H)$^+$)。

(43c)磷酸單(2R)-2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯

將實施例(43b)所得磷酸(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁基二烯丙酯 1.5665g(2.60 毫莫耳)、三苯膦 0.1402g(0.54 毫莫耳)及肆(三苯膦)鈀(O)0.1503g(0.13 毫莫耳)溶在乙腈(26 毫升)、於氮氣下、加入吡咯啶 1.1ml(13 毫莫耳)、於室溫下攪拌 24 小時。將反應液減壓濃縮、加入 1M 之鹽酸溶液並以二氯甲烷萃取、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑得粗製物 1.4625g。將所得粗製物 1.4625g 溶在二氯甲烷(26 毫升)、於冰冷卻下加入三氟乙酸(8.6 毫升)、於室溫攪拌 2 小時。將反應液減壓濃縮、加入乙醇、濾集結晶得粗結晶。將所得粗結晶溶在甲醇(200 毫升)及水(67 毫升)、處理以活性碳、以矽藻土過濾。減壓濃縮、加入乙醇並濾集結晶、以乙醇洗淨後乾燥、可得標題化合物 0.5554g(產率 51%)。

^{1}H NMR (CD_3CO_2D, 400MHz), δ : 7.25-7.22 (m, 2H), 7.17-7.11 (m, 3H), 7.07 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 6.04 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 4.17 (d, 2H, J = 10.3 Hz), 3.87 (s, 3H), 2.82-2.71 (m, 4H), 2.63 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.20-2.01 (m, 2H), 1.75-1.63 (m, 4H), 1.46 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3429, 2934, 2857, 2717, 2603, 1639, 1557, 1480, 1455, 1378, 1182, 1056, 1041, 946, 915, 821, 748, 699, 580, 511。

MS (FAB$^-$), m/z : 421($(M-H)^-$)。

(實施例 44)

(3R)-3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸(例示化合物號碼：在式 IIIa-2 中 5- 1344)

(44a) (2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁醛

將實施例(43a)所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇 0.3520g(0.80 毫莫耳)溶在二氯甲烷(8 毫升)、加入分子篩 4A(0.2234g)及二鉻酸吡錠 0.4594g(1.22 毫莫耳)、於室温下攪拌 20 小時。於反應液中加入乙醚、過濾後、減壓蒸除濾液、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/2)純化、可得標題化合物 0.2195g(產率 63%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 9.36 (s, 1H), 7.28-7.25 (m, 2H), 7.18-7.15 (m, 3H), 6.89 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.92 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.20 (br s, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.74 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.59-2.52 (m, 1H), 2.45-2.28 (m, 2H), 2.09-2.03 (m, 1H), 1.78-1.64 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 1.40 (s, 3H)。

(44b) (3R)-3-第三丁氧羰胺基-23-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊-1-烯膦酸二乙酯

將NaH(60%含量)31.0mg(0.78毫莫耳)溶在四氫呋喃(1毫升)、於冰冷卻及5分間加入四乙基亞甲基二磷醯胺0.185ml(0.75毫莫耳)、於室温下攪拌30分。於冰冷卻及5分間加入含實施例(44a)所得二乙基(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁醛0.2155g(0.49毫莫耳)之四氫呋喃(4毫升)、於同温度攪拌30分。加入乙酸42μl(0.73毫莫耳)以中和並減壓濃縮、於反應液中加入水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以水及飽和食鹽水洗淨、以無水硫酸鎂乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=2/1～1/0)純化、可得標題化合物0.2348g(產率85%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.28-7.25 (m, 2H), 7.18-7.15 (m, 3H), 6.90 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 6.77 (dd, 1H, J = 22.7 Hz, 17.6 Hz), 5.92 (d, 1H, J = 4.4 Hz), 5.72 (t, 1H, J = 17.6 Hz), 4.59 (br s, 1H), 4.12-4.05 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 2.74 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.59-2.50 (m, 2H), 2.26-2.18 (m, 1H), 2.01-1.93 (m, 1H), 1.78-1.64 (m, 4H), 1.42 (s, 12H), 1.32 (t, 6H, J = 7.3 Hz)。

MS (FAB$^+$), m/z : 575($(M+H)^+$)。

(44c) (3R)-3-第三丁氧羰胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸二乙酯

將實施例(44b)所得(3R)-3-第三丁氧羰胺基-23-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊-1-烯膦酸二

乙酯 145.4mg(0.25 毫莫耳)溶在乙醇(2.5 毫升)、加入氯化參(三苯膦)銠(I)23.7mg(0.026 毫莫耳)、於氫氣及 50℃下攪拌 5 小時。冷却後、反應液中加入氯化參(三苯膦)銠(I)24.3mg(0.026 毫莫耳)、於氫氣及 50℃下攪拌 5 小時。減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯)純化、可得粗製物 154.0mg、分取用逆層 HPLC 柱[Inertsil ODS-3(2.0cm×25cm)、GL Science 公司製造、溶離液：乙腈/水=80/20、流速:10ml/min]純化、可得標題化合物 116.1mg(產率 80%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.28-7.24 (m, 2H), 7.18-7.14 (m, 3H), 6.89 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.92 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.37 (br s, 1H), 4.14-4.05 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.74 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.64 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.59-2.50 (m, 2H), 2.24-2.15 (m, 2H), 1.83-1.64 (m, 8H), 1.42 (s, 9H), 1.33 (t, 3H, J =7.3 Hz), 1.32 (t, 3H, J = 7.3 Hz), 1.21 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 577((M+H)$^+$)。

(44d) (3R)-3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸

將實施例(44c)所得(3R)-3-第三丁氧羰胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸二乙酯 114.0mg(0.20 毫莫耳)溶在二氯甲烷(2.0 毫升)、加入溴化三甲矽烷 0.26ml(1.97 毫莫耳)、於氮氣及室溫攪拌 5 小時。減壓蒸除溶劑、加入含水乙醇以稀釋、加入氨水溶液及乙酸以調至 pH4 可析出結晶。濾集結晶、以水及乙醇洗淨後乾燥、可得標題化合物 52.0mg(產率 63%)。

^{1}H NMR : (CD_3CO_2D, 400MHz), δ : 7.26-7.22 (m, 2H), 7.18-7.12 (m, 3H), 7.07 (d, 1H, J = 4.1 Hz), 6.05 (d, 1H, J = 4.1 Hz), 3.88 (s, 3H), 2.80 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.73 (t, 2H, J = 8.8 Hz), 2.63 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.23-1.94 (m, 6H), 1.76-1.64 (m, 4H), 1.48 (s, 3H)。

IR スペクトル, ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3171, 3025, 2936, 2859, 2549, 1640, 1552, 1484, 1461, 1380, 1136, 1064, 1051, 914, 881, 772, 741, 699。

MS (FAB$^-$), m/z : 419($(M-H)^-$)。

(參考例 1)

溴化(呋喃-2-基)甲三苯膦酸鹽

將呋喃甲醇 29.43g(300 毫莫耳)溶在四氫呋喃(300 毫升)、於冰冷卻攪拌下、於 30 分期間加入含三溴化磷 10ml(105 毫莫耳)之四氫呋喃(30 毫升)、於室溫攪拌 1 小時。反應混合物中加入氫氧化鈉水溶液(30.23g 溶在水 75ml)以中和、分離有機層、加入氫氧化鈉 10g 並將有機層乾燥。以傾斜法分離有機層、加入無水硫酸鈉及活性碳、過濾後、加入四氫呋喃(150 毫升)及三苯膦 78.64g(300 毫莫耳)、於 70℃ 下攪拌 2 小時。冷却後、濾集所析出之結晶、以乙酸乙酯洗淨後減壓乾燥、可得標題化合物 98.84g(產率 78%)。

(參考例 2)

(2R)-2-第三丁氧羰胺基-1-正己醯氧基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)-3-丁烷

(2a) (2R)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-甲基-1-丙醇

將 2-第三丁氧羰胺基-2-甲基丙-1,3-二醇 20.0g(97.4

毫莫耳)溶在異丙醚(200毫升)、加入己酸乙烯酯16.3ml(0.10莫耳)及脂肪酶[得自假單孢菌之固定脂肪酶,TOYOBO公司製造、0.67U/mg]0.8g、於室溫攪拌2小時。過濾反應液後、將濾液減壓蒸除。以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=10/1～2/1)純化、可得標題化合物25.0g(產率85%)。

將所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-甲基-1-丙醇以分取用光學活性HPLC柱[ChiralCel OF(0.46cm×25cm)、Daicel公司、溶離液：己烷/2-丙醇=70/30、流速:0.5ml/min]以測定光學純度。

先溶出之(8.2分)爲2S體、後溶出之(10.5分)爲2R體、光學純度爲85%ee、旋光度,[α]。=-8.5(c=1.86, $CHCl_3$)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 4.86 (s, 1H), 4.25 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 4.19 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 3.86 (br s, 1H), 3.70-3.55(m, 2H), 2.36 (t, 2H, J = 7.4 Hz), 1.44 (s, 9H), 1.40-1.30 (m, 4H), 1.25 (s, 3H), 0.90 (t, 3H, J = 7.0 Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} (Liquid Film) : 3415, 3380, 2961, 2935, 2874, 1721, 1505, 1458, 1392, 1368, 1293, 1248, 1168, 1076。

MS (FAB$^+$), m/z : 304($(M+H)^+$)。

(2b) (2S)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-甲基-1-丙醇

將參考例(2a)所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-甲基-1-丙醇30.70g(0.101莫耳)溶在二氯甲烷(600毫升)、於冰冷卻下加入分子篩4A(220g)及氯化鉻

酸吡錠 43.6g(0.202 莫耳)、於室溫攪拌 2 小時。於反應液中加入乙醚、過濾後、減壓蒸除濾液、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=10/1～5/1)純化、可得標題化合物 28.81g(產率 95%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ: 9.45 (s, 1H), 5.26 (br s, 1H), 4.44 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 4.32 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 2.32 (t, 2H, J = 7.46 Hz), 1.70-1.55 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.38 (s, 3H), 1.40-1.25 (m, 4H), 0.90 (t, 3H, J = 7.0 Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} (Liquid Film): 3367, 2961, 2935, 2874, 1742, 1707, 1509, 1458, 1392, 1369, 1290, 1274, 1254, 1166, 1100, 1078。

MS (FAB$^+$), m/z: 302($(M+H)^+$)。

(2c) (2R)-2-第三丁氧羰胺基-1-正己醯氧基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)-3-丁烷

將參考例 1 所得溴化(呋喃-2-基)甲三苯膦酸鹽 33.65g(79.5 毫莫耳)溶在四氫呋喃(90 毫升)、於冰冷卻攪拌下、於 10 分期間加入含第三丁氧化鉀 8.94g(79.7 毫莫耳)之四氫呋喃(90 毫升)、於冰冷卻下攪拌 15 分。於 15 分期間加入含參考例(2b)所得(2S)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-甲基-1-丙醇 16.18g(53.7 毫莫耳)之四氫呋喃(60 毫升)、於冰冷卻下攪拌 30 分。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、回溫至室溫、減壓濃縮、加入水及乙酸乙酯、以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽後、於無水硫酸鈉下乾燥、過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=10/1)純化、可得標題化合物 19.32g(產率 98%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.45 (d, 1H, J = 1.6 Hz), 7.33 (d, 1H, J = 1.5 Hz), 6.41 (dd, 1H, J = 2.9Hz, 1.6 Hz), 6.36-6.35 (m, 計 2H), 6.33 (d, 1H, J =15.9 Hz), 6.26-6.22 (m, 計 2H), 6.20 (d, 1H, J =15.9 Hz), 5.59 (d, 1H, J = 12.7 Hz), 5.22 (br s, 1H), 4.82 (br s, 1H), 4.43 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.32 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.25 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.18 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 2.36-2.32 (m, 計 4H), 1.67-1.22 (m, 計 40H), 0.92-0.87 (s, 計 6H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (Liquid Film) : 3445, 2962, 2933, 2873, 2250, 1720, 1497, 1457, 1391, 1368, 1249, 1165, 1075, 1015。

MS (FAB$^+$), m/z : 388((M+Na)$^+$), 366((M+H)$^+$)。

(參考例 3)

(4R)-4-甲基-4-[2-(呋喃-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮

將參考例(2c)所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-1-正己醯氧基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)-3-丁烷 19.32g(52.9 毫莫耳)溶在四氫呋喃(53 毫升)及甲醇(53 毫升)、加入 2M 之氫氧化鈉水溶液 53ml、於室溫攪拌 1 小時。反應液中加入水及二氯甲烷、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、得粗製物 14.84g(產率 100%)。將粗製物溶在四氫呋喃(150 毫升)、於冰冷卻及 10 分期間加入含第三丁氧化鉀 7.20g(64.2 毫莫耳)之四氫呋喃(50 毫升)、於同温下攪拌 1 小時。反應液中加入乙酸 3.65ml(63.8 毫莫耳)以中和、減壓濃縮、加入水及乙酸乙酯、以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥、過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶

離液：己烷/乙酸乙酯=1/1)純化、可得標題化合物10.04g(產率 98%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.49 (d, 1H, J = 1.6 Hz), 7.36 (d, 1H, J = 1.6 Hz), 6.46 (d, 1H, J = 2.1 Hz), 6.43 (d, 1H, J =16.1 Hz), 6.04-6.37 (m, 計 2H), 6.30 (br s, 1H), 6.30 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 6.21 (d, 1H, J = 12.7 Hz), 6.18 (d, 1H, J =16.1 Hz), 5.88 (br s, 1H), 5.62 (d, 1H, J = 12.7 Hz), 4.41 (d, 1H, J = 8.5 Hz), 4.37 (d, 1H, J = 8.5 Hz), 4.23 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 1.65 (s, 3H), 1.54 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CDCl$_3$) : 3451, 2252, 1757, 1396, 1374, 1281, 1165, 1044, 1016。

MS (EI$^+$), m/z: 193(M$^+$), 178(base), 163, 148, 135, 120, 107, 91, 81, 65。

(參考例 4)

(4R)-4-甲基-4-[2-(呋喃-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮

將 10%Pd-C(50%含水)1.00g 溶在甲醇(20mL)、加入含參考例 3 所得(4R)-4-甲基-4-[2-(呋喃-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮 10.04g(52.0 毫莫耳)之甲醇(180ml)溶液、於氫氣及室溫攪拌 40 分鐘。反應液中 Pd-C 以矽藻土過濾後、將濾液減壓蒸除。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/2～ 1/1)純化、可得標題化合物 7.95g(產率 78%)。

將所得(4R)-4-甲基-4-[2-(呋喃-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮、以分析用光學活性 HPLC 柱(ChiralPak AD(0.46cm×25cm)、Daicel 公司、溶離液：正己烷/2-丙

醇=85/15、流速:1.0ml/min]以測定光學純度。

先溶出之(13.09分)爲4S體、後溶出之(15.43分)爲4R體、光學純度爲84%ee。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.31 (br s, 1H,), 6.29 (br d, 1H, J = 2.6 Hz), 6.03 (d, 1H, J = 2.6 Hz), 5.92 (br s, 1H), 4.11 (d, 1H, J = 8.4 Hz), 4.04 (d, 1H, J = 8.4 Hz), 2.72 (t, 2H, J = 8.0 Hz), 1.98-1.94 (m, 2H), 1.68-1.61 (m, 2H), 1.38 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} ($CDCl_3$) : 3450, 2975, 2928, 2250, 1755, 1599, 1508, 1400, 1381, 1147, 1045, 1010。

MS (EI^+), m/z : 195(M^+), 178, 164, 134, 121, 100(base), 96, 94, 81, 56。

(參考例 5)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)丁烷

(5a)(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)丁-1-醇

1/2D-(一)-酒石酸鹽

將參考例4所得(4R)-4-甲基-4-[2-(呋喃-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 29.9g(153.2毫莫耳)溶在四氫呋喃(150毫升)及甲醇(150毫升)、加入5M之氫氧化鉀水溶液(150毫升)、加熱回流3日。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣溶在乙醇250ml、加入含D-(-)-酒石酸鹽11.5g(76.6毫莫耳)之乙醇(100毫升)並攪拌10分、將所析出之粗結晶溶在乙醇(300毫升)及水(75毫升)以再結晶、得無色板狀結晶之標題化合物24.4g(產率65%)。

將所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)丁-1-醇1/2D-(-)-酒石酸鹽 51.2mg(0.16毫莫耳)溶在二氯甲烷(1.6毫升)、加入碳酸二第三丁酯 0.17g(0.78毫莫耳)、三乙胺 0.22ml(1.58毫莫耳)及4-二甲胺吡啶 3.0mg(0.025毫莫耳)、於室溫攪拌 20分鐘。加入水、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=1/1)純化、得(4R)-4-甲基-4-[2-(呋喃-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 18.0mg(產率 58%)。

將所得(4R)-4-甲基-4-[2-(呋喃-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮、依參考例4之方法、以分析用光學活性HPLC柱[ChiralPak AD(0.46cm×25cm)、Daicel公司、溶離液：正己烷/2-丙醇=85/15、流速:1.0ml/min]以測定光學純度。

先溶出(13.09分)爲4S體、後溶出之(15.43分)爲4R體、光學純度爲 99.3%ee。

可知先得之(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)丁-1-醇 1/2D-(-)-酒石酸鹽之光學純度爲 99.3%以上。

熔點：225℃。

旋光度,[α]D=-13.43(c=1.00, MeOH)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 7.36 (d, 1H, J = 2.0 Hz), 6.30 (dd, 1H, J = 2.8 Hz, 2.0 Hz), 6.09 (d, 1H, J = 2.8 Hz), 3.58 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 3.51 (d, 1H, J = 11.6 Hz), 2.77-2.68 (m, 2H), 2.07-1.88 (m, 2H), 1.28 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3405, 3226, 3135, 2943, 2597, 1598, 1528, 1401, 1299, 1228, 1124, 1079, 1003, 740。

MS (FAB$^+$), m/z：170((M+H)$^+$;free体)。

元素分析值 ($C_9H_{15}NO_2 \cdot 1/2C_4H_6O_6$ %),

計算值：C：54.09, H：7.43, N：5.73。

實測值：C：53.93, H：7.30, N：5.79。

(5b)(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)丁烷

將參考例(5a)所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)丁-1-醇 1/2D-(-)-酒石酸鹽 24.21g(99.1毫莫耳)溶在二氯甲烷(400毫升)及水(100毫升)、加入氫氧化鈉水溶液(97%氫氧化鈉 22.34g溶在水 100ml)、於室溫攪拌20分鐘。反應液以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣溶在二氯甲烷(500毫升)、加入三乙胺 138ml(993毫莫耳)、乙酐 46.5ml(493毫莫耳)及4-二甲胺吡啶 1.21g(9.9毫莫耳)、於室溫攪拌1小時、加入甲醇以中止反應、減壓蒸除溶劑。加入乙酸乙酯及水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=2/1)純化、可得標題化合物 25.11g(產率 100%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ：7.30(d, 1H, J = 1.8 Hz), 6.28 (dd, 1H, J = 3.0 Hz, 1.8 Hz), 6.01 (d, 1H, J = 3.0 Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.30 (d, 1H, J = 11.1 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 11.1 Hz), 2.66 (t, 2H, J = 8.3 Hz), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.02-1.94 (m, 1H), 1.92 (s, 3H), 1.35 (s, 3H)。

MS (EI$^+$), m/z：253(M^+), 211, 194, 180, 138, 134(base), 121, 99, 94, 81, 74, 57, 43。

(參考例 6)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-溴呋喃-2-基)丁烷

將參考例(5b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(呋喃-2-基)丁烷 5.85g(23.1 毫莫耳)溶在 N,N-二甲基甲醯胺(100 毫升)、於冰冷卻下少量加入 N-溴丁二醯亞胺 4.32g(24.3 毫莫耳)、於同溫度下攪拌 30 分。加入 10%硫代硫酸鈉水溶液及飽和碳酸氫鈉水溶液、以乙醚萃取、將乙醚層以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶出溶媒:乙酸乙酯/己烷=2/1)純化、將所得粗製物以分取用逆層 HPLC 柱 LTSK-GEL ODS-80Ts(5.0cm×30cm)、東曹公司製造、溶離液:乙腈/水=50/50、流速:40ml/min]純化、可得標題化合物 2.95g(產率 38%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.18 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 5.99 (d, 1H, J = 3.3 Hz), 5.37 (br s, 1H), 4.29 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 4.16 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 2.70-2.57 (m, 2H), 2.30-2.22 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.01-1.93 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (Liquid film) : 3300, 3074, 2978, 2938, 1742, 1658, 1549, 1510, 1450, 1373, 1241, 1128, 1012, 945, 922, 784, 733, 605。

MS (FAB$^+$), m/z : 332($(M+H)^+$)。

(參考例 7)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷

將參考例(5b)所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲

基-4-(呋喃-2-基)丁烷 5.11g(19.8毫莫耳)溶在氯仿(100毫升)、加入吡啶 8.0ml(99.1毫莫耳)及碘 10.07g(39.7毫莫耳)、於60℃下攪拌3小時。冷却後、加入10%硫代硫酸鈉水溶液以中止反應、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層以水、飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2)純化、得粗製物 5.57g、以分取用逆層 HPLC 柱[TSK-GEL ODS-80Ts(5.0cm×30cm)、東曹公司製造、溶離液：乙腈/水=50/50、流速:40ml/min]純化、可得標題化合物 2.9467g(產率 39%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.42 (d, 1H, J = 3.1 Hz), 5.95 (d, 1H, J = 3.1 Hz), 5.37 (br s, 1H), 4.29 (d, 1H, J = 11.1 Hz), 4.16 (d, 1H, J = 11.1 Hz), 2.72-2.63 (m, 2H), 2.29-2.21 (m, 1H), 2.10 (s, 3H), 2.05-1.93 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.34 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} ($CHCl_3$) : 3444, 2941, 1736, 1681, 1598, 1512, 1374, 1252, 1103, 1043, 1011, 947, 912。

MS (FAB$^+$), m/z : 380($(M+H)^+$)。

(參考例 8)

碘化(1-甲吡咯-2-基)甲三苯膦酸鹽

1-甲吡咯 21.42g(264.1毫莫耳)中於冰冷卻以1小時30分加入35%甲醛水溶液 20.8ml(264.3毫莫耳)及二甲胺鹽酸鹽 22.70g(278.4毫莫耳)、於室溫攪拌6小時。反應液中加入10%氫氧化鈉水溶液(150毫升)、以乙醚萃取、以飽和食鹽水洗淨後、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾

後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=10/1)純化、得 2-(N,N-二甲胺甲基)-1-甲吡咯 31.47g(產率 86%)。將 2-(N,N-二甲胺甲基)-1-甲吡咯 30.00g(217.5 毫莫耳)溶在乙醇(220 毫升)、於冰冷卻下、加入甲基碘 16.2ml(260.2 毫莫耳)、於室温下攪拌 2 小時。於反應液中加入乙酸乙酯(220 毫升)、濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨後乾燥、得碘化(1-甲吡咯-2-基)甲三甲銨鹽 55.34g(產率 91%)。

將碘化(1-甲吡咯-2-基)甲三甲銨鹽 55.34g(197.5 毫莫耳)溶在乙腈(400 毫升)、加入三苯膦 62.20g(237.1 毫莫耳)、於 80℃下攪拌 10 小時。冷却後、減壓濃縮至約 1/2、加入乙酸乙酯(200 毫升)、濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物 77.14g(產率 81%)。

(參考例 9)

(2R)-2-第三丁氧羰胺基-1-正己醯氧基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)-3-丁烷

以參考例 8 所得碘化(1-甲吡咯-2-基)甲三苯膦酸鹽及參考例(2b)所得(2S)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-甲基-1-丙醇爲原料、參考例(2c)之方法反應、可得標題化合物(產率 80%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.60 (t, 1H, J = 2.3 Hz), 6.57 (t, 1H, J = 2.3 Hz), 6.38 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 6.30-6.26 (m, 計 2H), 6.27 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 6.11 (t, 1H, J = 3.2Hz), 6.08 (t, 1H, J = 3.2Hz), 5.99 (d, 1H, J =16.1 Hz), 5.58 (d, 1H, J = 12.5 Hz) 5.04 (br s, 1H), 4.81 (br s, 1H), 4.34-4.16 (m, 計 4H), 3.60 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 2.36-2.30

(m, 計 4H), 1.67-1.22 (m, 計 4H), 0.92-0.87 (s, 計 6H)。

MS (EI$^+$), m/z : 280(M^+), 249, 224, 193(base), 164, 149, 132, 108, 94, 57。

(參考例 10)

(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮

以參考例 9 所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-1-正己醯氧基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)-3-丁烷爲原料、依參考例 3 之方法反應、可得標題化合物(產率 76%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.67 (t, 1H, J = 2.1 Hz), 6.62 (t, 1H, J = 1.5 Hz), 6.48 (d, 1H, J = 15.7 Hz), 6.36 (dd, 1H, J =3.7 Hz, 1.5Hz), 6.31 (d, 1H, J = 12.2 Hz), 6.14-6.10 (m, 計 2H), 6.07 (br d, 1H, J = 3.6Hz), 5.99 (d, 1H, J =15.7 Hz), 5.65 (d, 1H, J = 12.2 Hz) 5.46 (br s, 1H), 5.11 (br s, 1H), 4.31 (d, 1H, J = 8.2 Hz), 4.22 (d, 1H, J = 8.2 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 8.2 Hz), 4.16 (d, 1H, J = 8.2 Hz), 3.62 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 1.59 (s, 3H), 1.57 (s, 3H)。

MS (EI$^+$), m/z : 206(M^+, base), 191, 176, 161, 147, 132, 120, 106, 94, 81, 77。

(參考例 11)

(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮

以參考例 10 所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮爲原料、依參考例 4 之方法反應、可得標題化合物(產率 78%)

將所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-

噁唑啶-2-酮、以分析用光學活性 HPLC 柱[ChiralCel OJ(0.46cm×'25cm)、Daicel 公司、溶離液：正己烷/2-丙醇=70/30、流速:1.0ml/min]以測定光學純度。

先溶出之(12.29 分)爲 4S 體、後溶出之(15.39 分)爲 4R 體、光學純度爲 75%ee。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 6.58 (t, 1H, J = 2.4 Hz), 6.05 (dd, 1H, J = 3.2 Hz, 2.4 Hz), 5.88 (br d, 1H, J = 3.2 Hz), 5.15 (br s, 1H), 4.14 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 4.07 (d, 1H, J = 8.3 Hz), 2.70-2.58 (m, 2H), 2.00-1.87 (m, 2H), 1.42 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3289, 3103, 2977, 2938, 1759, 1713, 1495, 1397, 1381, 1309, 1281, 1231, 1032, 945, 928, 776, 718, 706, 656。

MS (EI$^+$), m/z : 208(M$^+$), 108(base), 94, 81, 56, 42。

(參考例 12)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷

將參考例 11 所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 1.53g(7.36 毫莫耳)溶在四氫呋喃(30 毫升)及甲醇(15 毫升)、加入 5M 之氫氧化鉀水溶液 15ml(75 毫莫耳)、加熱回流 5 日。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、殘渣以鹼性矽膠柱(NH 型)層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=100/1)純化、得生成物 1.32g(產率 98%)。將生成物 1.32g(7.24 毫莫耳)溶在二氯甲烷(36 毫升)、加入三乙胺 10.0ml(71.9 毫莫耳)、乙酐 3.4ml(36.1 毫莫耳)及 4-二甲胺吡啶 88mg(0.72 毫莫

耳)、於室溫攪拌40分鐘。加入甲醇1.46 ml(36.0毫莫耳)以中止反應、減壓濃縮。將殘渣中加入乙酸乙酯及水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以水、飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓濃縮乾燥、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2～1/0)純化、可得標題化合物1.89g(產率98%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 6.54(t, 1H, J = 2.4 Hz), 6.04 (t, 1H, J = 2.4 Hz), 5.88 (d, 1H, J = 2.4 Hz), 5.39 (br s, 1H), 4.33 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 4.20 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 2.60-2.51 (m, 2H), 2.26-2.19 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.97-1.89 (m, 4H), 1.38 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 267((M+H)$^+$), 266(M$^{+\cdot}$)。

(參考例13)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲基-5-碘吡咯-2-基)丁烷

將參考例12所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷1.89g(7.10毫莫耳)溶在氯仿(35毫升)、於冰冷卻下加入吡啶2.9ml(35.9毫莫耳)及碘3.60g(14.17毫莫耳)、於同溫度下攪拌10分。加入10%硫代硫酸鈉水溶液以中止反應、於室溫減壓下濃縮至約1/2、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓濃縮乾燥、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=3/2)純化、可得標題化合物1.40g(產率50%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 6.28 (d, 1H, J = 3.6 Hz), 5.94 (d, 1H, J = 3.6 Hz), 5.36 (br s, 1H), 4.32 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.17 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 3.49 (s, 3H), 2.67-2.59 (m, 2H), 2.27-2.19 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.96-1.87 (m, 4H), 1.36 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 393((M+H)$^+$), 392(M$^{+\cdot}$)。

(參考例 14)

(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-乙基-1-正己醯氧基-4-(呋喃-2-基)-3-丁烯

(14a) (2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-乙基-3-正己醯氧基-1-丙醇

將 2-第三丁氧羰胺基-2-乙基丙-1,3-二醇 52.9g(241 毫莫耳)溶在異丙醚(1.01)、加入己酸乙烯酯 41ml(254 毫莫耳)及脂肪酶[得自假單孢菌之固定脂肪酶, TOYOBO 公司製造、0.67U/mg]2.1g、於室温下攪拌 4 小時。將反應液過濾後、減壓蒸濾液。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液:己烷/乙酸乙酯=7/1～4/1～2/1)純化、可得標題化合物 66.8g(產率 87%)。

將所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-乙基-3-正己醯氧基-1-丙醇以分析用光學活性 HPLC 柱[ChiralCel OF(0.46cm×25cm)、Daicel 公司、溶離液:己烷/2-丙醇=80/20、流速:0.5ml/min]以測定光學純度。

先溶出之(7.35 分)爲 2S 體、後溶出之(7.86 分)爲 2R 體、光學純度爲 93%ee。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 4.76 (br s, 1H), 4.24 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.10 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 3.65-3.62 (m, 2H), 2.35 (t, 2H, J = 7.7 Hz), 1.78-1.69 (m, 1H), 1.63-1.53 (m, 4H), 1.44 (s, 9H), 1.30-1.25 (m, 4H), 0.87-0.83 (m, 6H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 340($(M+Na)^+$), 318($(M+H)^+$)。

(14b) (2S)-2-第三丁氧羰胺基-2-乙基-3-正己醯氧基-1-丙醇

將參考例(14a)所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-乙基-1-丙醇 66.7g(210 毫莫耳)溶在二氯甲烷(700 毫升)、於冰冷卻下加入分子篩 4A(117g)及二鉻酸吡錠 117g(311 毫莫耳)、於室溫攪拌 2 小時。於反應液中加入乙醚、過濾後、減壓蒸除濾液、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=10/1～5/1)純化、可得標題化合物 45.9g(產率 69%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 9.34, (s, 1H), 5.30 (br s, 1H), 4.60 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 4.40 (d, 1H, J = 11.4 Hz), 2.28 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.18-2.06 (m, 1H), 1.79-1.69 (m, 1H), 1.62-1.55 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.34-1.22 (m, 4H), 0.90 (t, 3H, J = 7.3 Hz), 0.81 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

MS (FAB$^+$), m/z : 338($(M+Na)^+$), 316($(M+H)^+$)。

(14c) (2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-乙基-1-正己醯氧基-4-(呋喃-2-基)-3-丁烷

將參考例 1 所得溴化(呋喃-2-基)甲三苯膦酸鹽 4.04g(9.54 毫莫耳)溶在四氫呋喃(32.4 毫升)、於冰冷卻攪拌下加入第三丁氧化鉀 1.06g(9.45 毫莫耳)、再於冰冷卻下攪拌 15 分。於 5 分期間加入含參考例(14b)所得

(2S)-2-第三丁氧羰胺基-2-乙基-3-正己醯氧基-1-丙醇2.01g(6.37毫莫耳)之四氫呋喃(10毫升)、於冰冷卻下攪拌30分。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、回温至室温後減壓濃縮、加入水及乙酸乙酯並以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水後、於無水硫酸鈉下乾燥、過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=5/1)純化、可得標題化合物2.385g(產率 99%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.44 (br d, 1H, J = 1.5 Hz), 7.33 (br d, 1H, J = 1.5 Hz), 6.41 (dd, 1H, J = 2.9 Hz, 1.5 Hz), 6.38 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 6.36 (dd, 1H, J = 2.9 Hz, 1.5 Hz), 6.29 (d, 1H, J = 16.8 Hz), 6.28 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 6.22 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 6.09 (d, 1H, J = 16.8 Hz), 5.47 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 5.21 (br s, 1H), 4.66 (br s, 1H), 4.50 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 4.41 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 4.33 (br s, 2H), 2.31 (q, 計4H, J = 7.7 Hz), 2.08-1.88 (m, 計4H), 1.47-1.42 (m, 計10H), 1.32-1.26 (m, 計18H), 0.93-0.86 (m, 計12H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CHCl$_3$) : 3446, 2970, 2933, 2873, 1722, 1494, 1459, 1391, 1380, 1368, 1249, 1163。

MS (FAB$^+$), m/z : 402((M+Na)$^+$), 379(M$^+$)。

(參考例 15)

(4R)-4-乙基-4-[2-(呋喃-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮

將參考例14所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-乙基-1-正己醯氧基-4-(呋喃-2-基)-3-丁烷 2.33g(6.14毫莫耳)溶在四氫呋喃(7毫升)及甲醇(7毫升)、加入1.8M之氫氧化鈉水溶液 7ml、於室温下攪拌3小時。反應液中加入

水及乙酸乙酯、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、可得粗製物 1.68g(產率 97%)。將粗製物溶在四氫呋喃(30 毫升)、加入第三丁氧化鉀 1.21g(10.8 毫莫耳)、於同溫下攪拌 3 小時。反應液中加入水及乙酸乙酯、以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥、過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/1～1/1)純化、可得標題化合物 1.24g(產率定量)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.43 (d, 1H, J = 1.5 Hz), 7.32 (d, 1H, J = 1.5 Hz), 6.45 (dd, 1H, J = 3.7 Hz, 1.5 Hz), 6.44 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 6.39 (dd, 1H, J = 3.7 Hz, 1.5 Hz), 6.37 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.29 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 6.25 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 6.13 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 5.62 (br s, 計 2H), 5.53 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 4.44 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.36 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.24 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.22 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 1.93 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 1.85-1.76 (m, 2H), 0.99 (t, 3H, J = 7.3 Hz), 0.98 (t, 1H, J = 7.3 Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} ($CDCl_3$) : 3453, 2975, 1757, 1396, 1373, 1053, 1015。

MS (EI^+), m/z : 207(M^+), 178(base), 135, 107。

(參考例 16)

(4R)-4-乙基-4-[2-(呋喃-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮

將參考例 15 所得(4R)-4-乙基-4-[2-(呋喃-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮 1.24g(5.99 毫莫耳)之甲醇溶液(40 毫升)、加入 10%鈀-碳(50%含水)124mg、於氫氣及室溫攪拌 2 小時。取代氮後、將反應液中 Pd-C 以矽藻土過

濾後、將矽藻土以乙酸乙酯洗淨。結合濾液及洗液並減壓濃縮乾燥、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=1/1～1/2)純化、可得標題化合物144.4mg(產率12%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.32 (br d, 1H, J = 2.2 Hz), 6.29 (t, 1H, J = 2.2 Hz), 6.03 (br d, 1H, J = 2.2 Hz), 5.40 (m, 1H), 4.11 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.07 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 2.74-2.67 (m, 2H), 1.97-1.93 (m, 2H), 1.72-1.64 (m, 2H), 0.96 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CDCl$_3$) : 3453, 2973, 229, 1757, 1601, 1397, 1380, 1052。

MS (EI$^+$), m/z : 209(M$^+$), 178, 114, 81(base)。

(參考例17)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-乙基-4-(呋喃-2-基)丁烷

將參考例16所得(4R)-4-乙基-4-[2-(呋喃-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮溶在四氫呋喃(2毫升)、甲醇(2毫升)及水(2毫升)、加入氫氧化鉀(310mg)、加熱回流3日。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=1/0～50/1)純化、(2R)-2-胺基-2-乙基-4-(呋喃-2-基)丁-1-醇104.9mg(產率83%)。

將所得(2R)-2-胺基-2-乙基-4-(呋喃-2-基)丁-1-醇溶在二氯甲烷(2.0毫升)、加入三乙胺0.64ml(4.59毫莫耳)、乙酐0.32ml(3.39毫莫耳)及4-二甲胺吡啶28mg(0.23毫莫耳)、於室溫攪拌2.5小時、加入甲醇以

中止反應、減壓蒸除溶劑。於殘渣中加入乙酸乙酯及水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=1/4)純化、可得標題化合物 146.5mg(產率 96%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.29 (d, 1H, J = 2.2 Hz), 6.28 (dd, 1H, J = 2.9 Hz, 2.2 Hz), 6.00 (d, 1H, J = 2.9 Hz), 5.24 (br s, 1H), 4.30 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 4.28 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.62 (t, 2H, J = 8.1 Hz), 2.21-2.13 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 2.08-1.99 (m, 1H), 1.94 (s, 3H), 1.86-1.72 (m, 2H), 0.87 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CDCl$_3$) : 3442, 2975, 1739, 1680, 1600, 1510, 1462, 1383, 1368, 1248, 1043。

MS (FAB$^+$), m/z : 290((M+Na)$^+$), 268((M+H)$^+$)。

(參考例 18)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-乙基-4-(5-碘呋喃-2-基)丁烷

將參考例 17 所得(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-乙基-4-(呋喃-2-基)丁烷溶在氯仿(5.4 毫升)、加入吡啶 0.22ml(2.73 毫莫耳)及碘 278mg(1.10 毫莫耳)、於 60℃下攪拌 8 小時。冷却後、加入 10%硫代硫酸鈉水溶液以中止反應、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=1/4～1/6)純化、得粗製物 151mg、以分取用逆層 HPLC 柱[TSK-GEL ODS-80Ts(2.0cm×25cm)、東

曹公司製造、溶離液：乙腈/水=60/40]純化、可得標題化合物 74.0mg(產率 35%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.42 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.95 (d, 1H, J = 3.7 Hz), 5.23 (m, 1H), 4.27 (s, 2H), 2.64 (t, 2H, J = 8.4 Hz), 2.18-2.12 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 2.05-1.97 (m, 1H), 1.95 (s, 3H), 1.81-1.76 (m, 2H), 0.87 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

IR ν_{max} cm^{-1} ($CDCl_3$) : 3442, 2976, 1740, 1681, 1598, 1511, 1462, 1383, 1368, 1246, 1105, 1043。

MS (FAB$^+$), m/z : 416((M+Na)$^+$), 394((M+H)$^+$)。

(參考例 19)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷

(19a) (2R)-2-胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁-1-醇 1/2D-(-)-酒石酸鹽

將參考例 11 所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 17.92g(86.0 毫莫耳)溶在四氫呋喃(250 毫升)及甲醇(125 毫升)、加入 5M 之氫氧化鉀水溶液(125 毫升)、加熱回流 4 日。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣溶在乙醇(260 毫升)、加入 D-(-)-酒石酸鹽 6.45g(43.0 毫莫耳)並攪拌 2 小時、濾集結晶得粗結晶 20.67g。將粗結晶 18.65g 溶在乙醇(370 毫升)及水(37 毫升)之混合溶劑以再結晶、將所得結晶以乙醇(300 毫升)及水(30 毫升)之混合溶劑再結晶、將所得結晶以乙醇(240 毫升)及水(24 毫升)之混

合溶劑再結晶、可得無色鱗片狀結晶之標題化合物10.50g(產率 53%)。

將所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁-1-醇 1/2D-(一)-酒石酸鹽 41.4mg(0.16毫莫耳)溶在二氯甲烷(1.6毫升)、加入碳酸二第三丁酯 0.1758g(0.81毫莫耳)、三乙胺 0.225ml(1.62毫莫耳)及 4-二甲胺吡啶 2.0mg(0.016毫莫耳)、於室溫下攪拌30分。加入水、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/2～2/1)純化、(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 17.7mg(產率 53%)。

所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-甲吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮可依參考例11之方法、以分析用光學活性HPLC柱[ChiralCel OJ(0.46cm×25cm)、Daicel公司、溶離液：正己烷/2-丙醇=70/30、流速：1.0ml/min]以測定光學純度。

先溶出之(12.49分)爲4S體、後溶出之((15.48分)爲4R體、光學純度爲99.7%ee。

由此確認先得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁-1-醇 1/2D-(-)-酒石酸鹽之光學純度爲99.7%以上。

熔點：198-199℃。

旋光度,[α]D=+(c=1.00, H_2O)。

^{1}H NMR (CD_3OD, 400MHz), δ : 6.54 (t, 1H, J = 2.3 Hz), 5.91 (dd, 1H, J = 3.7 Hz, 2.3 Hz), 5.82 (br d, 1H, J = 3.7 Hz), 4.32 (s, 1H), 3.61 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 3.55 (s, 3H), 3.54 (d, 1H, J = 11.3 Hz), 2.69-2.57 (m, 2H), 1.97 (ddd, 1H, J = 13.8 Hz, 9.4 Hz, 7.6 Hz), 1.88 (ddd,

1H, J = 13.8 Hz, 11.0 Hz, 6.3 Hz), 1.28 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (KBr) : 3480, 3430, 2926, 2634, 2545, 1586, 1516, 1389, 1359, 1309, 1291, 1105, 1039, 710, 690。

MS (FAB$^+$), m/z : 183((M+H)$^+$; free 体)。

元素分析值 ($C_{10}H_{18}N_2O \cdot 1/2C_4H_6O_6$ %),

計算值 : C : 56.01, H : 8.23 , N : 10.89。

實測值 : C : 55.81, H : 8.22 , N : 10.89。

(19b)(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁烷

將參考例(19a)所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(1-甲吡咯-2-基)丁-1-醇 1/2D-(-)-酒石酸鹽 3.98g(15.5 毫莫耳)溶在二氯甲烷(50 毫升)及水(12.5 毫升)、加入氫氧化鈉水溶液(97%氫氧化鈉 3.20g 溶在水 12.5ml)、於室溫攪拌 20 分鐘。反應液以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣溶在二氯甲烷(78 毫升)、加入三乙胺 21.5ml(154.7 毫莫耳)、乙酐 7.3ml(77.4 毫莫耳)及 4-二甲胺吡啶 0.1893g(1.55 毫莫耳)、於室溫攪拌 1 小時、加入甲醇以中止反應、減壓蒸除溶劑。於殘渣中加入乙酸乙酯及水、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層以水、飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液 : 乙酸乙酯)純化、可得標題化合物 4.23g(產率定量)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 6.54(t, 1H, J = 2.4 Hz), 6.04 (t, 1H, J = 2.4 Hz), 5.88 (d, 1H, J = 2.4 Hz), 5.39 (br s, 1H), 4.33 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 4.20 (d, 1H, J = 11.2 Hz), 2.60-2.51 (m, 2H), 2.26-2.19 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.97-1.89 (m, 4H), 1.38 (s, 3H)。

MS (FAB$^+$), m/z : 267((M+H)$^+$), 266(M$^{+\cdot}$)。

(參考例 20)

碘化(1-乙吡咯-2-基)甲三苯膦酸鹽

將 1-乙吡咯 10.0g(105 毫莫耳)中、於冰冷卻攪拌下、於 1 小時 30 分間加入 35%甲醛水溶液 9ml(105 毫莫耳)及二甲胺鹽酸鹽 9.0g(110 毫莫耳)、於室溫攪拌 6 小時。反應液加入 10%氫氧化鈉水溶液(150 毫升)、以乙醚萃取、以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=9/1)純化、可得 2-(N,N-二甲胺甲基)-1-乙吡咯 15.6g(產率 97%)。

將 2-(N,N-二甲胺甲基)-1-乙吡咯 15.6g(102 毫莫耳)溶在乙醇(150ml)、於冰冷卻下、加入甲基碘 7.7ml(124 毫莫耳)、於室溫攪拌 3 小時。反應液中加入乙酸乙酯(150 毫升)、濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨後乾燥、可得碘化(1-乙吡咯-2-基)甲三甲銨鹽 20g(產率 66%)。

將碘化(1-乙吡咯-2-基)甲三甲銨鹽 20g(68.0 毫莫耳)溶在乙腈(200 毫升)、加入三苯膦 22.0g(83.9 毫莫耳)、於 80℃下攪拌 9 小時。冷却後、減壓濃縮至約 1/2、加入乙酸乙酯(100 毫升)、濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物 27.5g(產率 81%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ :7.94-7.89 (m, 3H), 7.78-7.71 (m, 6H), 7.64-7.57 (m, 6H), 6.82-6.79 (m, 1H), 5.96-5.92 (m, 1H), 5.51-5.47 (m, 1H), 5.10 (d, 2H, J = 13.9Hz), 3.35 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 0.96 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

(參考例 21)

(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-(1-乙吡咯-2-基)-1-正己醯氧基-3-丁烷

將參考例 20 所得碘化(1-乙吡咯-2-基)甲三苯膦酸鹽 19.8g(39.8 毫莫耳)溶在四氫呋喃(100 毫升)、於冰冷卻攪拌下及 30 分間加入第三丁氧化鉀 4.47g(39.8 毫莫耳)之四氫呋喃(70 毫升)、於冰冷卻下攪拌 1 小時 30 分。於 30 分間加入含參考例(2b)所得(2S)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-甲基-1-丙醇 10g(33.2 毫莫耳)之四氫呋喃(50 毫升)、於冰冷卻下 1 小時。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、回溫至室溫、減壓濃縮、加入水及乙酸乙酯、以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水後、於無水硫酸鈉下乾燥、過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=4/1)純化、可得標題化合物 11.7g(產率 90%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ :6.67-6.62 (m, 2H), 6.42-6.36 (m, 1H,), 6.31-6.26 (m, 3H), 6.13-6.08 (m, 2H), 6.02-5.96 (m, 1H), 5.63-5.58 (m, 1H), 4.35-4.08 (m, 4H), 3.96-3.86 (m, 4H), 2.85-2.81 (m, 4H), 1.67-1.58 (m, 4H), 1.48-1.24 (m, 38H), 0.93-0.86 (m, 6H)。

(參考例 22)

(4R)-4-甲基-4-[2-(1-乙吡咯-2-基)乙烯基]-1,3-噁

唑啶-2-酮

將參考例21所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-(1-乙吡咯-2-基)-1-正己醯氧基-3-丁烷11.7g(29.8毫莫耳)溶在四氫呋喃(40毫升)及甲醇(40毫升)、加入2M之氫氧化鈉水溶液40ml、於室溫下攪拌1小時30分。加入乙酸1.5ml以中止反應、將反應液注至水中、以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯層以水、以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、得粗製物8.7g。將粗製物溶在四氫呋喃(100毫升)、於冰冷卻下及10分間加入第三丁氧化鉀4.0g(35.6毫莫耳)之四氫呋喃(30毫升)、於同溫下攪拌1小時。反應液中加入乙酸2ml以中和、減壓濃縮、加入水及乙酸乙酯、以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥、過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/2)純化、可得標題化合物5.7g(產率86%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.73-6.65 (m, 2H), 6.52-6.46 (m, 1H,), 6.36-6.29 (m, 2H), 6.15-6.10 (m, 2H), 6.05-5.97 (m, 2H), 5.69-5.65 (m, 2H), 4.31-4.09 (m, 4H), 3.97-3.83 (m, 4H), 1.60-1.53 (m, 6H), 1.39-1.31 (m, 6H)。

(參考例23)

(4R)-4-甲基-4-[2-(1-乙吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮

將10%鈀—碳(50%含水)500mg溶在乙醇(10毫升)、加入含參考例22所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-乙吡咯-2-基)

乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮 5.7g(25.9毫莫耳)之乙醇(50毫升)、於氫氣及室溫攪拌1小時。將反應液中之鈀一碳以矽藻土過濾後、減壓蒸除濾液。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=3/7)純化、可得標題化合物5.0g(產率87%)。

將所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-乙吡咯-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮、以分析用光學活性HPLC柱[ChiralPak OJ(0.46cm=25cm)、Daicel公司、溶離液：正己烷/2-丙醇=70/30、流速:1.0ml/min]測定光學純度。

先溶出之(7.5分)爲4S體、後溶出之(8.3分)爲4R體、光學純度爲83.7%ee。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.66-6.63 (m, 1H), 6.10-6.07 (m, 1H), 5.89-5.86 (m, 1H), 5.00 (br s, 1H), 4.15 (d, 1H, J = 8.1 Hz), 4.08 (d, 1H, J = 8.1 Hz), 3.84 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 2.67-2.61 (m, 2H), 1.99-1.92 (m, 2H), 1.43 (s, 3H), 1.87 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

(參考例24)

(2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-乙吡咯-2-基)丁烷

(24a)(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(1-乙吡咯-2-基)丁-1-醇1/2D-(-)-酒石酸鹽

將參考例23所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-乙吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮4.9g(22.0毫莫耳)溶在四氫呋喃(80毫升)及甲醇(40毫升)、加入5.5M之氫氧化鉀水溶液(40毫升)、加熱回流4日。冷却後、於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾

燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣溶在乙醇 200ml、加入含 D-(-)-酒石酸鹽 1.59g(10.5 毫莫耳)之乙醇(20 毫升)並靜置 4 小時、將所析出之粗結晶以乙醇(100ml)及水(10 毫升)之混合溶劑再結晶。將所得結晶再以乙醇(50 毫升)及水(5 毫升)之混合溶劑再結晶、可得無色板狀結晶之標題化合物 2.8g(產率 37%)。

將所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(1-乙吡咯-2-基)丁-1-醇 1/2D-(-)-酒石酸鹽 55.5hg(0.16 毫莫耳)溶在二氯甲烷(1.6 毫升)、加入碳酸二第三丁酯 0.17g(0.78 毫莫耳)、三乙胺 0.22ml(1.58 毫莫耳)及 4-二甲胺吡啶 3.0mg(0.025 毫莫耳)、於室溫攪拌 20 分鐘。加入水、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=1/1)純化、得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-乙吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮 18.0mg(產率 58%)。

將所得(4R)-4-甲基-4-[2-(1-乙吡咯-2-基)乙基]-1,3-噁唑啶-2-酮、以分析用光學活性 HPLC 柱[ChiralPak 0J(0.46cm×25cm)、Daicel 公司、溶離液：正己烷/2-丙醇=70/30、流速:1.0ml/min]測定光學純度、99.9%ee。

可知先前所得(2R)-2-甲基-2-胺基-4-(1-乙吡咯-2-基)丁-1-醇 1/2D-(-)-酒石酸鹽之光學純度爲 99.9%以上。

^{1}H NMR (DMSO-d_6, 400MHz), δ : 6.58-6.54 (m, 1H), 5.93-5.89 (m, 1H), 5.79-5.76 (m, 1H), 4.27 (s, 1H), 3.85 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 3.68 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 3.51 (d, 1H, J = 11.7 Hz), 2.62-2.56 (m, 2H), 1.99-1.82 (m, 2H), 1.29 (t, 3H, J = 7.3 Hz), 1.27 (s, 3H)。

(24b) (2R)-1-乙醯氧基-2-乙醯胺基-2-甲基-4-(1-乙吡咯-2-基)丁烷

將參考例(24a)所得(2R)-2-胺基-2-甲基-4-(1-乙吡咯-2-基)丁-1-醇 1/2D-(一)-酒石酸鹽 2.7g(7.80毫莫耳)溶在二氯甲烷(30毫升)、加入三乙胺 17.0ml(122毫莫耳)、乙酐 7.6ml(80.4毫莫耳)及 4-二甲胺吡啶 20mg(0.16毫莫耳)、於室溫攪拌 3小時 30分鐘。於反應液中加入水、以二氯甲烷萃取、二氯甲烷層以水及飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓濃縮乾燥、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯)純化、可得標題化合物 2.2g(產率 96%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 6.62-6.59 (m, 1H), 6.09-6.06 (m, 1H), 5.89-5.87 (m, 1H), 5.41 (br s, 1H), 4.34 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 4.21 (d, 1H, J = 11.0 Hz), 3.85 (q, 2H, J = 7.3 Hz), 2.60-2.51 (m, 2H), 2.26-2.18 (m, 1H), 2.08 (s, 3H), 1.98-1.93 (m, 1H), 1.92(s, 3H), 1.38 (s, 3H), 1.37 (t, 3H, J = 7.3 Hz)。

(參考例 25)

碘化(1-第三丁氧羰吡咯-2-基)甲三苯膦酸鹽

於吡咯 2.72g(40.47毫莫耳)中、於室溫攪拌及 20分間加入 35%甲醛水溶液 3.2ml(40.7毫莫耳)及二甲胺鹽酸鹽 3.44g(42.2毫莫耳)、於室溫攪拌 2小時。反應液中加入 10%氫氧化鈉水溶液(18毫升)、以二氯甲烷萃取、以飽和食鹽水洗淨、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：二氯甲烷/甲醇=10/1)純化、得 2-(N,N-二甲胺甲基)吡咯 4.55g(產

率定量)。

將2-(N,N-二甲胺甲基)吡咯4.54g(40.41毫莫耳)溶在乙醇(40毫升)、於冰冷卻下加入甲基碘3.05ml(49.0毫莫耳)、於室溫攪拌7小時。反應液中加入乙酸乙酯、濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨後乾燥、得碘化(吡咯-2-基)甲三甲銨鹽7.59g(產率71%)。

將碘化(吡咯-2-基)甲三甲銨鹽7.59g(28.52毫莫耳)溶在乙腈(60毫升)、加入三苯膦8.98g(34.2毫莫耳)、於80℃下攪拌6小時。冷却後、減壓濃縮至約1/2、加入乙酸乙酯(100毫升)、濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨、減壓乾燥、得碘化(吡咯-2-基)甲三甲膦酸鹽12.33g(產率92%)。

將碘化(吡咯-2-基)甲三甲膦酸鹽12.30g(26.21毫莫耳)溶在乙腈(115毫升)、加入碳酸二第三丁酯7.61g(34.87毫莫耳)及4-二甲胺吡啶0.16g(1.31毫莫耳)、於室溫攪拌24小時、減壓濃縮、加入乙酸乙酯(50毫升)及二氯甲烷(4毫升)、濾集結晶、以乙酸乙酯洗淨、減壓乾燥、可得標題化合物14.02g(產率94%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.82-7.78 (m, 3H), 7.68-7.58 (m, 12H), 7.09-7.07 (m, 1H), 6.42-6.39 (m, 1H), 6.11 (t, 1H, J = 3.7Hz), 5.68 (d, 2H, J = 13.2 Hz), 1.29 (s, 3H)。

(參考例26)

(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-(1-第三丁氧羰吡咯-2-基)-1-正己醯氧基-3-丁烷

將參考例25所得碘化(1-第三丁氧羰吡咯-2-基)甲三

苯膦酸鹽 3.30g(5.80 毫莫耳)溶在四氫呋喃(60ml)、於冰冷卻攪拌下、加入含第三丁氧化鉀 0.65g(5.8 毫莫耳)之四氫呋喃(5.8ml)、於冰冷卻下攪拌 15 分。加入含參考例(2b)所得(2S)-2-第三丁氧羰胺基-3-正己醯氧基-2-甲基-1-丙醇 1.46g(4.83 毫莫耳)之四氫呋喃(3 毫升)、於冰冷卻下攪拌 1 小時。加入飽和氯化銨水溶液以中止反應、回溫至室溫、加入水及乙酸乙酯、以乙酸乙酯萃取。將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水後、於無水硫酸鈉下乾燥、過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=5/1)純化、可得標題化合物 2.12g(產率 94%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.25-7.20 (m, 計 2H), 7.11 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 6.61 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 6.39-6.24 (m, 計 2H), 6.18-6.08 (m, 計 2H), 6.08 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 5.64 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 4.92-4.75 (m, 計 2H), 4.34-4.23 (m, 計 2H), 4.22-4.16 (m, 計 2H), 2.38-2.29 (m, 計 4H), 1.69-1.20 (m, 計 54H), 0.94-0.82 (m, 計 6H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CHCl$_3$) :3445, 2981, 2934, 1734, 1495, 1457, 1393, 1370, 1333, 1252, 1163, 1123, 1066。

MS (FAB$^+$), m/z : 465((M+H)$^+$)。

(參考例 27)

(4R)-4-甲基-4-[2-(吡咯-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮

將參考例 26 所得(2R)-2-第三丁氧羰胺基-2-甲基-4-(1-第三丁氧羰吡咯-2-基)-1-正己醯氧基-3-丁烷 1.78g(3.82 毫莫耳)溶在四氫呋喃(20 毫升)及甲醇(20 毫升)、加入 1M 之氫氧化鈉水溶液 20ml、於室溫攪拌 1

小時。於反應液中加入水並以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、可得粗製物。將所得粗製物溶在四氫呋喃(60毫升)、加入第三丁氧化鉀 0.557g(4.96毫莫耳)、於室溫攪拌 1 小時。於反應液中加入水並以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、於無水硫酸鈉下乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=2/1)純化、可得標題化合物 0.259g(產率 35%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 8.69-8.22 (m, 計 2H), 6.88-6.76 (m, 計 2H), 6.48 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 6.34 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 6.39-6.18 (m, 計 4H), 5.82 (d, 1H, J = 16.1 Hz), 5.47 (br s, 1H), 5.37 (d, 1H, J = 12.5 Hz), 5.16 (br s, 1H), 4.40 (d, 計 2H, J = 8.8 Hz), 4.19 (d, 計 2H, J = 8.8 Hz), 1.59 (s, 3H), 1.55 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} (CHCl$_3$) :3467, 2976, 2929, 1759, 1637, 1477, 1455, 1373, 1280, 1165, 1041, 954, 909。

MS (FAB$^+$), m/z : 192(M$^+$)。

(參考例 28)

(4R)-4-甲基-4-[2-(吡咯-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮

參考例 27 所得(4R)-4-甲基-4-[2-(吡咯-2-基)乙烯基]-1,3-噁唑啶-2-酮 0.259g(1.35毫莫耳)溶在甲醇(6毫升)、加入 10%Pd-C(50%含水)26mg、於氫氣及室溫攪拌 30 分。反應液中 Pd-C 以矽藻土過濾後、將濾液減壓蒸除。以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=2/1)純化、可得標題化合物 0.238g(產率 91%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 8.41-8.15 (m, 1H), 6.73-6.68 (m, 1H), 6.17-6.10 (m, 1H), 5.96-5.90 (m, 1H), 5.75 (br s, 1H), 4.12 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 4.05 (d, 1H, J = 8.8 Hz), 2.76-2.61 (m 2H), 2.00-1.83 (m, 2H), 1.37 (s, 3H)。

IR ν_{max} cm^{-1} ($CHCl_3$) :3472, 2980, 2933, 1754, 1571, 1479, 1457, 1400, 1382, 1250, 1162, 1093, 1044, 942。

MS (FAB$^+$), m/z : 194(M^+)。

(參考例 29)

5-(4-氟苯基)戊-1-炔

將 NaH 2.11g(48.4 毫莫耳)溶在無水四氫呋喃 60ml、於冰冷卻下滴加入二乙磷乙酸乙酯 10.84g(48.4 毫莫耳)、攪拌 10 分鐘。於同溫下滴加入含 4-氟苄醛 5.00g(40.3 毫莫耳)之無水四氫呋喃 60ml。攪拌 3 小時、倒至冰水中 150ml、以乙酸乙酯萃取。將有機層於無水硫酸鎂下乾燥、減壓蒸除溶劑、將殘渣以驟層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=10/1～3/1)純化、可得 4-氟苯烯丙酸乙酯之無色油狀物 6.69g(86%)。

將此酯 6.52g(33.6 毫莫耳)溶在乙酸乙酯 100ml 中、加入 5%銠/鋁 1.30g、於氫氣及室溫攪拌 8 小時。將反應混合物以矽藻土過濾、減壓濃縮濾液、將殘渣溶在無水四氫呋喃 30ml 中。於冰冷卻下、滴加入含鋁氫化鋰 1.26g(33.2 毫莫耳)之無水四氫呋喃 60ml。於同溫下攪拌 30 分、加入飽和硫酸鈉水溶液、於室溫攪拌 10 分。混合物以矽藻土過濾後、將濾液以乙酸乙酯萃取。將有機層清洗以飽和食鹽水、以無水硫酸鎂乾燥。減壓蒸除

溶劑、將殘渣以驟層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=5/1～1/1)純化、可得33-(4-氟苯基)丙-1-醇之無色油狀物4.86g(95%)。

將所得3-(4-氟苯基)丙-1-醇4.83g(31.3毫莫耳)溶在二氯甲烷50ml中、於冰冷卻下、加入三乙胺6.55ml(47.0毫莫耳)及甲磺醯氯2.91ml(37.6毫莫耳)、於氮氣下攪拌30分鐘。將反應混合物以二氯甲烷50ml稀釋、依次清洗以冰冷10%鹽酸及飽和食鹽水、以無水硫酸鎂乾燥。減壓蒸除溶劑、將殘渣溶在丙酮100ml。加入碘化鈉9.39g(62.6毫莫耳)、於氮氣及50℃下攪拌2小時。稀釋以乙酸乙酯250ml、依次清洗以10%硫代硫酸鈉水溶液及飽和食鹽水後、以無水硫酸鎂乾燥。減壓蒸除溶劑、將殘渣以驟層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=5/1～2/1)純化、可得3-(4-氟苯基)-1-碘丙烷之淡黃色油狀物7.12g(86%)。

於六甲磷醯胺20ml中加入乙醯鈉(18%喹啉懸浮液)50ml、於冰冷卻下、加入上述4-氟苯基-1-碘丙烷7.00g(.26.5毫莫耳)之無水二甲基甲醯胺20ml。於室溫攪拌2小時。於冰冷卻下小心加入冰水、以乙酸乙酯萃取。將有機層清洗以飽和食鹽水、以硫酸鎂乾燥。減壓蒸除溶劑、將殘渣以驟層析(溶離液：己烷)純化、可得標題化合物之無色油狀物2.67g(62%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.14 (m, 2H), 6.97 (m, 2H), 2.71 (t, 2H, J = 7.5 Hz), 2.19 (m, 2H), 1.99 (t, 1H, J=2.6 Hz), 1.82 (m, 2H)。

MS (EI), m/z : 162(M^+)。

(參考例 30)

5-苯戊-1-炔

仿參考例 29 之方法、使用 3-苯基-1-碘丙烷及乙醯鈉、可得標題化合物。

^{1}H NMR (400MHz, $CDCl_3$), δ : 7.32-7.26 (m, 2H), 7.23-7.16 (m, 3H), 2.74 (t, 2H, J = 7.6 Hz), 2.21 (dt, 2H, J = 7.6 Hz, 2.8 Hz), 1.99 (t, 1H, J=2.8 Hz), 1.89-1.81 (m, 2H)。

MS (EI), m/z : 144(M^+)。

(參考例 31)

5-(4-氯苯基)戊-1-炔

仿參考例 29 之方法、使用 3-(4-氯苯基)-1-碘丙烷及乙醯鈉、可得標題化合物。

^{1}H NMR (400MHz, $CDCl_3$), δ : 7.26-7.23 (m, 2H), 7.13-7.11 (m, 2H), 2.71 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.19 (dt, 2H, J = 7.3 Hz, 2.9 Hz), 1.99 (t, 1H, J = 2.9 Hz), 1.85-1.78 (m, 2H)。

(參考例 32)

5-(3-三氟甲苯基)戊-1-炔

仿參考例 29 之方法、使用 3-(3-三氟甲苯基)-1-碘丙烷及乙醯鈉、可得標題化合物。

^{1}H NMR (400MHz, $CDCl_3$), δ : 7.46-7.37 (m, 4H), 2.81 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.22 (dt, 2H, J = 7.3 Hz, 2.9 Hz), 2.01 (t, 1H, J = 2.9 Hz), 1.90-1.83 (m, 2H)。

(參考例 33)

5-環己基戊-1-炔

仿參考例 29 之方法、使用 3-環己基-1-碘丙烷及乙醯

鈉、可得標題化合物。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 2.16 (dt, 2H, J = 7.2 Hz, 2.8, Hz), 1.94 (t, 1H, J = 2.8 Hz), 1.59-1.48 (m, 2H), 1.38-0.75 (m, 13H)。

MS (EI), m/z : 150(M^+)。

(參考例 34)

4-環己氧基戊-1-炔

將環己酮 32ml(0.31 莫耳)溶在無水二氯甲烷 950ml、加入 1,3-丙烷二醇 33.5ml(0.46 莫耳)、正甲酸三乙酯 51.5ml(0.31 莫耳)、氯化鋯 1.44g(6.18 毫莫耳)、於氮氣下、於室溫攪拌 1 小時。於冰冷卻下加入 1M 之氫氧化鈉水溶液 1.5l、以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層以水洗淨。將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥後、減壓蒸除溶劑。將殘渣減壓蒸除而純化、得環己酮三亞甲基縮酮 26.8g(55%)。

將氯化鋯 24.9g(0.11 莫耳)溶在四氫呋喃 500ml、於氮氣下緩慢加入硼氫化鈉 20.5g(0.54 莫耳)、於室溫下攪拌 20 分。於反應液中、於氮氣及冰冷卻下滴加入上述環己酮三亞甲基縮酮 16.9g(0.11 莫耳)之四氫呋喃 170ml 溶液、於室溫下攪拌過夜。於冰冷卻下、加入 2M 之鹽酸 600ml、反應終了後、將四氫呋喃減壓濃縮。將水層以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水。於無水硫酸鈉下乾燥後、減壓蒸除溶劑。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液 : 己烷/乙酸乙酯=10/1～5/2)純化、可得 3-環己氧基丙-1-醇 13.4g(78%)。

將所得 3-環己氧基丙-1-醇 11.5g(72.9 毫莫耳)溶在二

氯甲烷 240ml、於冰冷卻下、加入分子篩 4A58g 及重鉻酸吡錠 23.8g(0.11 莫耳)、於氮氣下攪拌 1 小時 40 分。於反應液中加入乙醚、以矽藻土過濾。將濾液以乙醚清洗後、結合濾液、減壓蒸除溶劑。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=20/1～10/1)純化、可得粗製之 3-環己氧基丙醛 8.60g。

將四溴化碳 36.5g(0.11 莫耳)溶在二氯甲烷 120ml、於氮氣下及冰冷卻下加入含三苯膦 57.7g(0.22 莫耳)之二氯甲烷 120ml、攪拌 5 分。於氮氣及於冰冷卻下加入含上述粗製 3-環己氧基丙醛 8.60g 之二氯甲烷 90ml、於同溫度攪拌 25 分鐘。將反應液稀釋以二氯甲烷、以飽和碳酸氫鈉水溶液及飽和食鹽水洗淨。將二氯甲烷層於無水硫酸鈉下乾燥後、減壓蒸除溶劑。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=100/1～33/1)純化、得 4-環己氧基-1,1-二溴丁-1-烯 12.6g(55%、2 工程)。

將所得 4-環己氧基-1,1-二溴丁-1-烯 12.6g(40.4 毫莫耳)溶在四氫呋喃 130ml、於氮氣及-78℃下加入正丁鋰之己烷(1.5mol/l)溶液 54ml(81.0 毫莫耳)、於-78℃下攪拌 1 小時、緩慢地回溫至室溫。於室溫攪拌 50 分鐘、於冰冷卻下加入水以中止反應。以乙醚萃取、將乙醚層以飽和食鹽水洗淨。將乙醚層於無水硫酸鈉下乾燥後、減壓蒸除溶劑。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=100/1=50/1)純化、可得標題化合物 4.35g(71%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 3.59 (t, 2H, J = 7.2 Hz), 3.32-3.23 (m, 1H), 2.45 (dt, 2H, J = 7.2 Hz, 2.8 Hz), 1.97 (t, 1H, J = 2.8 Hz), 1.95-1.85 (m, 2H), 1.81-1.67 (m, 2H), 1.58-1.48 (m, 1H), 1.36-1.13 (m, 5H)。

MS (EI), m/z : 153($(M+H)^+$)。

(參考例 35)

4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔

將 4-氟苯酚 5.00g(44.6 毫莫耳)、3-丁-1-醇 3.38ml(44.6 毫莫耳)、三苯膦 17.5g(66.9 毫莫耳)溶在四氫呋喃 100ml、於冰冷卻下、加入疊氮二碳酸二乙酯 11.7g(66.9 毫莫耳)、於室溫攪拌 18 小時。減壓濃縮溶劑、加入己烷 200ml 及乙酸乙酯 20ml、濾除結晶、將濾液減壓濃縮。將殘渣以驟層析(溶離液：己烷)純化、可得標題化合物。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.02-6.94 (m, 2H), 6.90-6.82 (m, 2H), 4.07 (t, 2H, J = 7.0 Hz), 2.70-2.63 (m, 2H), 2.05 (t, 1H, J = 2.7 Hz)。

MS (EI), m/z : 164(M^+)。

(參考例 36)

4-苯氧丁-1 炔

仿參考例 35 之方法、使用苯酚及 3-丁-1-醇、可得標題化合物。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.29 (dd, 2H, J = 8.8 Hz, 7.3 Hz), 6.96 (t, 1H, J = 7.3 Hz), 6.92 (d, 2H, J = 8.8 Hz), 4.11 (t, 2H, J = 6.6 Hz), 2.68 (dt, 2H, J = 6.6 Hz, 2.2 Hz), 2.04 (t, 1H, J = 2.2 Hz)。

(參考例 37)

3-(3,4-二甲苯氧基)-1-丙炔

仿參考例35之方法、使用3,4-二甲苯酚及炔丙醇、可得標題化合物。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.04 (d, 1H, J = 8.0 Hz), 6.78 (d, 1H, J = 2.4 Hz), 6.72 (dd, 1H, J = 8.0 Hz, 2.4 Hz), 4.65 (d, 2H, J = 2.4 Hz), 2.49 (t, 1H, J = 2.4 Hz), 2.24 (s, 3H), 2.20 (s, 3H)。

MS (EI), m/z : 160(M^+)。

(參考例 38)

3-(4-甲苯氧基)-1-丙炔

仿參考例35之方法、使用4-甲苯酚及炔丙醇、可得標題化合物。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.10 (d, 2H, J = 8.4 Hz), 6.88 (d, 2H, J = 8.4 Hz), 4.67 (d, 2H, J = 2.4 Hz), 2.50 (t, 1H, J = 2.4 Hz), 2.29 (s, 3H)。

MS (EI), m/z : 146(M^+)。

(參考例 39)

3-(4-甲硫苯氧基)-1-丙炔

仿參考例35之方法、4-甲硫苯酚及炔丙醇、可得標題化合物。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.27 (d, 2H, J = 8.9 Hz), 6.93 (d, 2H, J = 8.9 Hz), 4.68 (d, 2H, J = 2.4 Hz), 2.52 (t, 1H, J = 2.4 Hz), 2.45 (s, 3H)。

MS (EI), m/z : 178(M^+)。

(參考例 40)

2-[4-(環己基甲氧基)苯基]-4,4,5,5-四甲基-[1,3,2]-二噁硼烷

將 4-溴苯酚 6.0g(34.7 毫莫耳)、環己基甲苯酚 4.3ml(34.7 毫莫耳)、及三苯膦 9.1g(34.7 毫莫耳)之四氫呋喃(100 毫升)溶液、於 0℃下緩慢加入疊氮二碳酸二乙酯之 40%甲苯溶液 15.1ml(34.7 毫莫耳)、將反應液於室溫攪拌 3 小時。反應終了後、減壓蒸除溶劑、將殘渣中加入己烷。過濾後、再減壓蒸除溶劑。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=1/20)純化得 1-溴-4-(環己基甲氧基)苯 5.1g(產率 54%)。將含 1-溴-4-(環己基甲氧基)苯 3.0g(11.1 毫莫耳)、雙(頻那醇化物)二硼烷 3.4g(13.3 毫莫耳)、氯化鈀-二苯膦二茂鉄錯合物 450mg(0.551 毫莫耳)、及乙酸鉀 2.2g(22.2 毫莫耳)之二甲亞碸(50 毫升)溶液於 80℃下攪拌 30 分、以乙酸乙酯稀釋。加入活性碳、於室溫攪拌 30 分後、過濾後、減壓蒸除溶劑。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=1/100)純化、可得標題化合物 1.72g(產率 49%)。

^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400MHz), δ : 7.73 (d, 2H, J = 8.5 Hz), 6.88 (d, 2H, J = 8.5 Hz), 3.77 (d, 2H, J = 5.9 Hz), 1.93-1.64 (m, 5H), 1.33 (s, 12H), 1.33-1.14 (m, 4H), 1.12-0.97 (m, 2H)。

(參考例 41)

2-[3-(2-環己基乙氧基)苯基]-4,4,5,5-四甲基-[1,3,2]-二噁硼烷

將 3-溴苯酚 15.0g(86.7 毫莫耳)、2-環己基乙苯酚

12.0ml(86.7 毫莫耳)、及三苯膦 23.0g(86.7 毫莫耳)之四氫呋喃(200 毫升)溶液、於 0℃下緩慢加入疊氮二碳酸二乙酯之 40%甲苯溶液 38.0ml(86.7 毫莫耳)、將反應液於室溫攪拌 7 小時。反應終了後、減壓蒸除溶劑、將殘渣中加入己烷。過濾後、再減壓蒸除溶劑。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=1/100)純化得 1-溴-3-(2--環己基乙氧基)苯 23.0g(產率 94%)。將 1-溴-3-(2-環己基乙氧基)苯 5.0g(17.7 毫莫耳)、雙(頻那醇化物)二硼烷 5.4g(21.2 毫莫耳)、氯化鈀-二苯膦二茂鐵錯合物 140g(1.77 毫莫耳)、及乙酸鉀 3.5g(35.4 毫莫耳)之二甲亞碸(80 毫升)溶液於 80℃下攪拌 30 分、於乙酸乙酯稀釋。加入活性碳、於室溫攪拌 30 分、過濾後、減壓蒸除溶劑。將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：乙酸乙酯/己烷=1/100)純化、可得標題化合物 4.70g(產率 80%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.38-7.24 (m, 3H), 7.00 (dd, 1H, J = 8.1, 2.9 Hz), 4.02 (t, 2H, J = 6.6 Hz), 1.81-1.63 (m, 8H), 1.34 (s, 12H), 1.31-1.12 (m, 3H), 1.06-0.88 (m, 2H)。

(參考例 42)

4-苯氧丁醯氯

(42a) 4-苯氧丁酸

將 NaH(60%含量)2.41g(60.3 毫莫耳)溶在 N,N-二甲基甲醯胺(60 毫升)、於氮氣及冰冷卻下、於 20 分間加入苯酚 5.70g(60.6 毫莫耳)之 N,N-二甲基甲醯胺(30 毫升)、於室溫攪拌 1.5 小時。加入含 γ-丁醯內酯 5.01g(58.2 毫莫耳)之 N,N-二甲基甲醯胺(30 毫升)、於 130℃下攪拌

6小時。冷却後減壓濃縮、加入水並以二氯甲烷萃取、將二氯甲烷層水洗。在水層中加入1M之鹽酸水溶液(72毫升)以酸化、以乙酸乙酯萃取、將乙酸乙酯層清洗以飽和食鹽水、以無水硫酸鎂乾燥。過濾後、減壓蒸除溶劑、將殘渣以矽膠柱層析(溶離液：己烷/乙酸乙酯=5/1～2/1)純化、可得標題化合物3.58g(產率34%)。

^{1}H NMR (CDCl$_3$, 400MHz), δ : 7.30-7.27 (m, 2H), 6.96-6.87 (m, 3H), 4.03 (t, 2H, J = 5.9 Hz), 2.60 (t, 2H, J = 7.3 Hz), 2.16-2.09 (m, 2H)。

(42b) 4-苯氧丁醯氯

將參考例(42a)所得4-苯氧丁酸0.5066g(2.81毫莫耳)溶在苯(5毫升)、加入磺醯氯0.42ml(5.76毫莫耳)及N,N-二甲基甲醯胺2μl、於80℃下攪拌1小時。冷却後減壓濃縮、可得標題化合物0.5556g(產率99%)。

(試驗例1)

<u>對鼠HvGR(宿主對移植反應)抑制活性之測定</u>

(1)用2系統鼠〔路易士(雄、6週齡、日本查爾斯河河公司)及WKAH/Hkm(雄、7週齡)日本SLC公司〕。每組5只鼠(宿主)。

(2)HvGR之誘導

從WKAH/Hkm鼠或路易士鼠之脾臟單離脾臟細胞,在RPMI1640培養基(LIFE TECHNOLOGIES,Rockville MD U.S.A.)懸浮爲1x10^{8}個/ml之濃度。在路易士鼠之兩後肢蹠之皮下注射WKAH/Hkm鼠或路易士鼠之脾臟細胞懸浮液100μl(脾臟細胞数1x10^7)。

(3)化合物之投予

化合物懸浮在0.5%黃耆膠液。懸浮之化合物對化合物投予組(注射WKAH/Hkm鼠脾臟細胞而投予檢體之路易士鼠)依5ml/kg之比例每日1次從脾臟細胞注射日起連續4日經口投予鼠。又在同系組(注射路易士鼠脾臟細胞之路易士鼠組)及對照組(注射WKAH/Hkm鼠脾臟細胞而無投予檢體之路易士鼠),檢體代之以0.5%黃耆膠液經口投予。

(4)對HvGR之抑制活性之測定方法

從各個體之膝腿淋巴節重量減去同系組之平均膝腿淋巴節重量(「依HvGR之膝腿淋巴節重量」),從對於對照組之平均「依HvGR之膝腿淋巴節重量」之化合物投予組之各個體之「依HvGR之膝腿淋巴節重量」算出抑制率。化合物之抑制活性乃以從化合物之投予量及抑制率用最小二乘法算出之ID_{50}值(mg/kg)表示。

本試驗之結果,本發明化合物呈現出優異之抑制活性。

表 9

化合物	HvGRID_{50}值(mg/kg)
實施例2	0.714
實施例3	0.116
實施例9	0.120
實施例10	0.276
實施例15	0.304
實施例19	0.097

實施例 20	0.082
實施例 33	0.013

(試驗例 2)

對佐藥關節炎發症之抑制活性之測定

(1)佐藥之調製

Mycobacterium butyricum 之死菌在液態石蠟以 2 mg/ml 之比例懸浮,施行超音波處理來調製。

(2)被驗化合物之調製

被驗化合物乃懸浮或溶解在 0.5 %黃耆膠液。

(3)佐藥關節炎之誘導

將(1)調製之佐藥 0.05 ml 在鼠(通常路易士系)之右後肢足蹠皮內注射。通常 1 組之隻数爲 5。另設 1 組未注射佐藥之組(正常組)。

(4)化合物之投予

將(2)調製之化合物對鼠之體重每 kg 依 5 ml 之比例從佐藥注射日起每日 1 次、連續 21 日經口投予。投予佐藥之 1 組(對照組)及無注射佐藥之組則投予 0.5 %黃耆膠液。

(5)化合物之發症抑制活性之算出法

最終投予 1 日後將右後肢之體積以足蹠測定裝置測定,從各個體之值減去正常組之平均值, 以其值爲腫脹體積。從對照組之平均腫脹體積對投予化合物之各個體之腫脹體積算出抑制率。從化合物之投予量及各(組之平均)抑制率算出 ID_{50} 值。

本試驗之結果,本發明之化合物具有優異之抑制活

性。

表 10

化合物	ID_{50}值(mg/kg)
實施例 2	0.0899
實施例 3	0.0774
實施例 19	0.108
實施例 20	0.102
實施例 33	0.0941

(試驗例 3)

對鼠 HvGR(宿主對移植反應)抑制活性之測定

(1) 用 2 系統鼠〔路易士(雄、6 週齡、日本查爾斯河公司)及 WKAH/Hkm(雄、7 週齡)日本 SLC 公司〕。每組 5 只鼠(宿主)。

(2)HvGR 之誘導

從 WKAH/Hkm 鼠或路易士鼠之脾臟單離脾臟細胞,在 RPMI1640 培養基(LIFE TECHNOLOGIES 公司製造)懸浮爲 $1x10^8$ 個/ml 之脾臟細胞懸浮液。將 WKAH/Hkm 脾臟細胞懸浮液 0.1ml 在路易士鼠之兩後肢蹠皮內(HvGR 誘發組)、或將路易士鼠之脾臟細胞懸浮液 0.1ml 在路易士鼠之兩後肢蹠皮內(同系組)注射。

(3)化合物之投予

將環孢素 A、大環內酯(Tacrolimus)、及例示化合物號碼:在式 Ia-3 中爲 1-1093 化合物{2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇}之順丁烯二酸鹽(以下稱爲化合物 A)、懸浮在 0.5%黃耆膠液、得

0.08mg/5ml、0.08mg/5ml 及 0.008mg/5ml 之濃度。

環孢素 A 及化合物 A 投予群爲投予環孢素 A 懸浮液及化合物 A 懸浮液、大環內酯及化合物 A 投予群爲投予大環內酯及化合物 A 懸浮液、依 5 ml/kg 之比例每日 1 次從脾臟細胞注射日起連續 4 日經口投予鼠。

環孢素 A 投予群爲投予環孢素 A 懸浮液及 0.5%黃耆膠液、大環內酯投予群爲投予大環內酯懸浮液及 0.5%黃耆膠液、化合物 A 投予群爲投予化合物 A 懸浮液及 0.5%黃耆膠液、依 5 ml/kg 之比例每日 1 次從脾臟細胞注射日起連續 4 日經口投予鼠。

又在同系組(注射路易士鼠脾臟細胞但不投予化合物之路易士鼠組)及對照組(注射 WKAH/Hkm 鼠脾臟細胞但不投予化合物之路易士鼠),代之以 0.5%黃耆膠液經口投予。

(4)對 HvGR 之抑制活性之測定方法

從各個體之膝腿淋巴節重量減去同系組之平均膝腿淋巴節重量(「由 HvGR 之膝腿淋巴節重量」)、對於對照組之平均「由 HvGR 之膝腿淋巴節重量」之化合物投予組之各個體之「由 HvGR 之膝腿淋巴節重量」算出抑制率。

表 11

投予組	HvGR 抑制率(%)
環孢素 A 投予組	18.7
大環內酯投予組	25.8
化合物 A 投予組	16.0

環孢素 A+化合物 A 投予組　　36.1

大環內酯+化合物 A 投予組　　44.8

（試驗例 4）

對小白鼠 GvHD（移植對宿主疾病）抑制活性之測定

(1) 用 2 系統小白鼠[BDF1(雄、6 週齡、日本查爾斯河公司)及 C57BL/6(雄、7 週齡、日本查爾斯河公司)]。每組 5 只鼠（宿主）。

(2) GvHD 之誘導

從 C57BL/6 小白鼠或 BDF1 小白鼠之脾臟單離脾臟細胞,在 RPMI1640 培養基（LIFE TECHNOLOGIES）懸浮爲 $2x10^7$ 個/ml 之濃度。將 C57BL/6 小白鼠脾臟細胞懸浮液 0.5ml 在 BDF1 小白鼠尾靜脈內(GvHD 誘導組)注射或將 BDF1 小白鼠脾臟細胞浮游液 0.5ml 在 BDF1 小白鼠尾靜脈內(同系組)注射。

(3)化合物之投予

將環孢素 A、大環內酯、及例示化合物號碼：在式 Ia-3 中爲 1-1093 化合物{2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇}之鹽酸鹽(以下稱爲化合物 B)、懸浮在 0.5%甲基纖維素(MC)、得 0.1mg/10ml、0.2mg/10ml 及 0.01mg/10ml 濃度之懸浮液。

環孢素 A 及化合物 B 投予組爲投予環孢素 A 懸浮液及化合物 B 懸浮液、大環內酯及化合物 B 投予組爲投予大環內酯懸浮液及化合物 B 懸浮液、依 10ml/kg 之比例每日 1 次從脾臟細胞注射日起連續 10 日經口投予小白鼠。

環孢素 A 投予組爲投予環孢素 A 懸浮液及 0.5%MC 液、大環內酯投予組爲投予大環內酯懸浮液及 0.5%MC、化合物 B 投予組爲投予化合物 B 懸浮液及 0.5%MC 液、依 10ml/kg 之比例每日 1 次從脾臟細胞注射日起連續 10 日經口投予鼠。

又在同系組(注射 BDF1 小白鼠脾臟細胞,但不投予化合物之 BDF1 小白鼠)及對照組(注射 C57BL/6 小白鼠脾臟細胞,但不投予化合物之 BDF1 小白鼠)、代之以 0.5%MC 液經口投予。

(4)對 GvHD 之抑制活性之測定方法

將體重及脾臟重量測定、脾臟重量除以體重,算出「由 GvHD 以體重(g)補正之脾臟重量(mg)」。從各個體之「由 GvHD 以體重補正之脾臟重量」減去同系組之平均「由 GvHD 以體重補正之脾臟重量」、從對於對照組之平均「由 GvHD 以體重補正之脾臟重量」之化合物投予組之各個體之「由 GvHD 以體重補正之脾臟重量」算出抑制率。

表 12

投予組	GvHD 抑制率(%)
環孢素 A 投予組	12.5
大環內酯投予組	7.6
化合物 B 投予組	−2.9
環孢素 A+化合物 B 投予組	28.4
大環內酯+化合物 B 投予組	13.4

(試驗例 5)

對小白鼠皮膚移植抑制活性之測定

(1) 用2系統小白鼠[C57BL/6N(雌、5週齡、日本查爾斯河公司)及BALB/cAnN(雌、5週齡、日本查爾斯河公司)]。每組10只鼠(被移植個體)。

(2)皮膚移植手續

將C57BL/6N小白鼠用頸椎脫臼來安樂死、剝離皮膚。其皮膚用生檢盤(MK706、8mm、加伊工業公司)切成直徑8mm之大小。次在麻醉BALB/cAnN小白鼠之背部用生檢盤、予以直徑8mm大小之傷。沿傷以眼科以剪刀除去皮膚。將先前切取之C57BL/6N小白鼠之皮膚移植於BALB/cAnN小白鼠之除去部分。移植部分以外科用亞龍α(三共公司)固定。於移植之部分貼SOFRATYUL(1片(10cm×10cm)中含有弗萊塞黴素10.8mg、Aventis Pharma公司)及滅菌紗布、捲上膠包帶(小号、3M公司)、該膠帶之兩端以絹布(1号、Alcare公司)固定。

(3)化合物之投予

將環孢素A、大環內酯、及例示化合物號碼：在式Ia-2中爲1-1093化合物{2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇}之鹽酸鹽(以下稱爲化合物B)、懸浮在0.5%甲基纖維素(MC)、得30mg/10ml、3mg/10ml及0.1mg/10ml濃度之懸浮液。

環孢素A及化合物B投予組爲投予環孢素A及化合物B、大環內酯及化合物B投予組爲投予大環內酯及化合物B之0.5%MC懸浮液。依10ml/kg之比例、自移植當日每日1次、連續投予14日。

(4)對移植皮膚片排斥之抑制活性之測定方法

移植後(移植日爲0日)6日、用剪刀不傷及皮膚地除去膠帶、絹布、滅菌紗布及SOFRATYUL。次日起每日1回、至移植後第20日判定移植皮膚有無排斥。判定全以盲試施行、算出移植皮膚片排斥日数之中央値。

表 13

投予組	移植皮膚片排斥日数中央値(日)
0.5%MC投予組	10.0
環孢素A投予組	12.0
大環內酯投予組	11.0
化合物B投予組	15.0
環孢素A+化合物B投予組	17.5
大環內酯+化合物B投予組	16.5

(製劑例1)

錠劑

環孢素A	50.0mg
化合物A	10.0mg
乳糖	113.0mg
玉米澱粉	25.0mg
硬脂酸鎂	2.0mg
	200 mg

將上述處方粉末混合、以打錠機製錠得1錠爲200mg之錠劑。

上述處方中、化合物A爲2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇順丁烯二酸鹽。

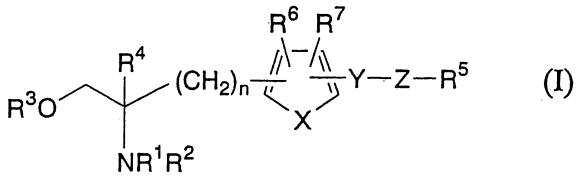
[產業上利用價值]

本發明化合物及本發明醫藥組成物有優異免疫抑制作用且毒性低、且本發明醫藥組成物於該組成物中含有加強發揮藥理效果之免疫抑制劑，並且降低該免疫抑制劑單獨存在之副作用而可作爲醫藥使用、例如、可作爲預防劑或治療劑(宜爲治療藥)以防治哺乳動物(特指人)之各種器官移植或皮膚移植時的排斥反應、全身性紅斑性狼瘡症、慢性関節風濕、多發性肌炎、結合組織炎、骨骼肌炎、骨関節炎、變形性関節症、皮膚肌炎、鞏皮症、bechet病、Chron病、潰瘍性大腸炎、自體免疫性肝炎、再生不良性貧血症、特發性血小板減少性紫斑病、自體免疫性溶血性貧血症、多發性硬化症、自體免疫性水疱症、尋常性乾癬、血管炎症候群、Wegener肉芽腫、葡萄膜炎、Sjoegren症候群、特發性間質性肺炎、Goodpasture症候群、肉瘤類肉瘤病、過敏性肉芽腫性血管炎、支氣管氣喘、心肌炎、心肌症、主動脈炎症候群、心肌梗塞後症候群、原發性肺高血壓症、微小變化型腎病、膜性腎症、膜性增殖性腎炎、巢狀球體硬化症、半月體形成性腎炎、重肌無力症、炎症性神經症、異位性皮膚炎、慢性光線性皮膚炎、日光過敏症、褥瘡、Sydenham舞踏病、硬化症、成人發症糖尿病、胰島素依存性糖尿病、若年性糖尿病、粥樣性動脈硬化症、腎小球腎炎、IgA腎症、尿細管間質性腎炎、原發性膽汁性肝硬化、原發性硬化性膽管炎、劇症肝炎、病毒性肝炎、GVHD、接觸皮膚炎、敗血症等自體免疫疾病或其他免

疫有關疾病、以及真菌、枝原體 mycoplasma、病毒、原虫等感染症、心衰竭、心室肥大、心律不整、狹心症、心缺血、動脈塞栓、動脈痛、靜脈癌、血液循環障礙等循環系統疾病、阿茲海默症、痴呆、帕金森氏症、中風、腦梗塞、腦缺血、鬱病、燥鬱症、綜合失調症、杭廷頓氏舞蹈氏、器官痛、痙攣、過動症、腦炎、髓膜炎、食慾不振和飲食過量等中樞系統疾病、淋巴腫、白血病、多尿、頻尿、糖尿病性網膜症等各種疾病(特指各種器官移植或皮膚移植之排斥反應、全身性紅斑性狼瘡症、慢性関節風濕、多發性硬化症、異位性皮膚炎等自體免疫疾病。

肆、中文發明摘要

本發明爲有關具優異免疫抑制作用之如下式(I)胺醇衍生物或膦酸衍生物或其藥理容許鹽及其酯

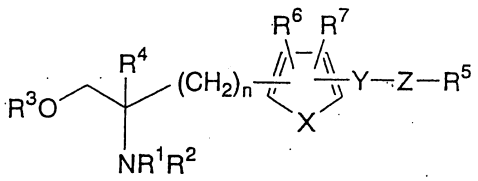


(I)

[式中 R^1 及 R^2：H或胺基保護基；R^3：H或羥基保護基；R^4：低烷基；n：1-6；X：O或無取代或有低伸烷基取代之N等；Y：伸乙基；Z：C_{1-10}伸烷基；R^5：芳基或有取代之芳基；R^6 及 R^7：H，但 R^5 爲H時，Z爲單鍵或C_{1-10}直伸烷基之外之基]，及其醫藥組成物。

伍、英文發明摘要

The present invention relates to a aminoalcohol derivative or a phosphonic acid derivative of the formula (I)



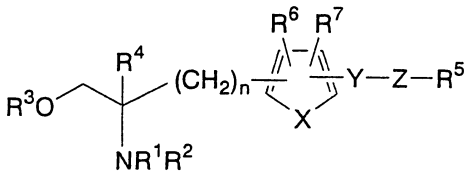
(I)

[wherein, R^1 and R^2 : H or an amino-protecting group; R^3 : H or a hydroxy-protecting group; R^4 : a lower alkyl group; n:an integer of 1-6; X:oxygen atom or nitrogen atom unsubstituted or substituted with a lower alkylene group etc.; Y: ethylene group ; Z: a C_{1-10}alkylene group; R^5 :an aryl group or a substituted aryl group; R^6 and R^7 :H, provided that when R^5 is H, then Z is a single bond or a group other than a straight C_{1-10}alkylene group;], or the pharmaceutically acceptable esters or the pharmaceutically acceptable salts thereof, which have the excellent immusuppressive effects, and the pharmaceutical composition containing thereof.

陸、(一)、本案指定代表圖爲：第____圖

(二)、本代表圖之元件代表符號簡單說明：

柒、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



(I)

修正頁

96年3月22日修(更)正替換頁

戊基膦酸、

(123)如(60)～(122)中任一項之醫藥組成物，其中免疫抑制劑爲：

對T細胞中細胞素表現有關之細胞內訊號傳達有阻礙作用之藥劑(該藥劑爲環孢素A、大環內酯(Tacrolimus)、雷帕黴素(Rapamycin)、加士帕力母士(gusperimus)、艾布羅力母士(everolimus)、得列士帕力母士(tresperimus)、安尼士帕力母士(anisperimus)、SDZ-281-240、ABT-281、奇苦得力母士、A-119435或17-乙基-1,14-二羥基-12-[2-[4-(2-苯肼羰氧基)-3-甲氧環己基]-1-甲基乙烯基]-23, 25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,28-二噁-4-吖三環[22.3.1.$0^{4,9}$]二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮)、

對免疫細胞中核苷合成有阻礙作用之藥劑(該藥劑爲咪唑力平、吖硫嘌呤(azathioprine)、菌酚酸、列氟諾邁德、美力面伯地布、HMR-1279、TSK-204或SP-100030)

對免疫細胞中細胞素有阻礙作用之具抗風溼作用藥劑(該藥劑爲T-614、阿克達利德(actarit)、沙唑硫吡啶(salazosulfapyridine)或CDC-801)、

因DNA鏈破壞或DNA合成障礙所致細胞死亡之烷化劑(該烷化劑爲環磷醯胺)、

抑制葉酸產生以阻礙核酸代謝之代謝拮抗劑爲美索多列奇雪德(methotrexate)、

有TNF-α抑制作用之蛋白質製劑(該蛋白質製劑爲列米克德、緣布列路、達克力志嗎布、巴西力奇志嗎布、阿木志嗎布、歐嗎利志嗎布、BMS-188667、CDP—571、

96年3月21日修(更)正替換頁

伊諾利莫嗎布、ATM－027或BTI-322)、

在細胞內類固醇受體結合形成複合體、在染色體上反應部位結合而合成蛋白質而具免疫抑制作用之類固醇荷爾蒙劑(該類固醇爾蒙劑爲1-烯氫可體松)或可抑制前列腺素產生之物質及/或對前列腺素作用有拮抗之非類固醇系抗炎症劑(該非類固醇系抗炎症劑爲羅奇索普羅芬鈉(loxoprofen-Na)、地克羅芬那克鈉(diclofenac-Na)、美羅奇西茨(meloxicam)、西列可奇西布(celecoxib)、羅非可奇西布(rofecoxib))所選擇一以上藥劑之醫藥組成物。

(124)如(60)～(122)中任一項之醫藥組成物，其中免疫抑制劑爲：

環孢素A、大環內酯、雷帕黴素、列氟諾邁德、美索多列奇雪德、列米克德、緣布列路所選擇一以上藥劑之醫藥組成物。

本發明之其他目的爲提供：

(125)含(1)～(59)中任一項化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯爲有效成份之醫藥組成物。

(126)如(125)之醫藥組成物，其可預防或治療自體免疫病。

(127)如(126)之醫藥組成物，其中自體免疫病爲慢性関節風溼病。

(128)如(125)之醫藥組成物，其可抑制器官移植之排斥反應。

(129)一種預防或治療自體免疫病之方法，將有效量選自如(60)～(125)中任一項之醫藥組成物投予至哺乳動物。

US5,656,272 號公報及 Drugs,vol.59(6), 1341-1359(2000)中記載之列米克德(infliximab)、

WO94/06,476 號公報、US5,605,690 號公報及 Expert.Opin.Pharmacother., July vol.2(7), 1137-1148(2001)中記載之緣布列路(etanercept)、

WO92/11018 號公報,US5,530,101 號公報及 N.Engl.J.Med.,vol.338(3), 161-165(1997)中記載達克力志嗎布(daclizumab)、

EP449,769 號公報及 Clin.Pharmacol.Ther., vol.64(1), 66-72(1998)中記載之巴西力奇志嗎布(basiliximab)、

WO89/07452 號公報、US5,846,534 號公報及 J.Clin.Oncol., vol.15(4)、1567-1574(1997)中記載之阿木志嗎布(alemtuzumab)、

US5,965,709 號公報及 Drugs vol.61(2), 253-60(2001)中記載之歐嗎利志嗎布(omalizumab)、

EP613,944 號公報及 J.Pharm.Sci., vol.84(12)、1488-1489(1995)中記載之 BMS-188667、

Arthritis-Rheum.Vol.37(9), Suppl., S295,(1994)中記載之 CDP-571、

Transplant, June vol.55、1320-1327(1993)中記載之伊諾利莫嗎布(inolimomab)、

ATM-027 及

Blood, Dec1, vol.92(11), 4066-4071(1998)中記載之 BTI-322 等。

(7)在細胞內類固醇受體結合形成複合體、在染色體上反

I283574
公告本

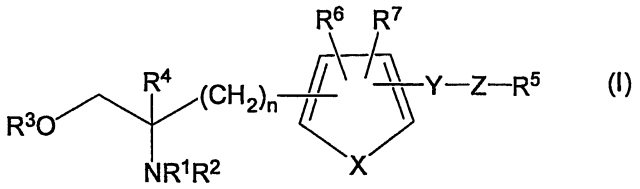
96年3月22日修(X)正本

第 92100460 號「胺醇衍生物或磺酸衍生物及含有這些之醫藥組成物」專利案

(2007 年 3 月 22 日修正)

拾、申請專利範圍

1.一種如下式(I)化合物，



[式中、

R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-6烷基、C1-6烷氧基羰基或C1-6脂族醯基；

R^3爲氫原子、C1-6烷基、磷酸基或磷酸二-C1-6烷基酯基；

R^4爲C1-6烷基、

n爲1～6整數、

X爲氧原子或式N-D之基(式中、D爲氫原子或C1-6烷基)；

Y爲伸乙基、伸乙烯基、伸乙炔基、或式-E-CH_2-之基(式中、E爲羰基或式-CH(OH)-之基)；

Z爲單鍵、C1-10伸烷基或碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之C1-10伸烷基；

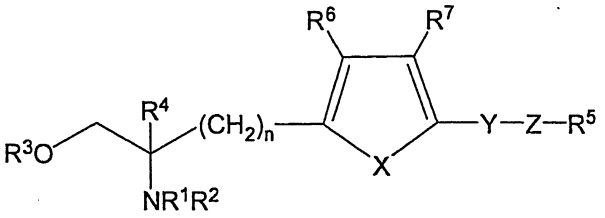
R^5爲氫原子、C3-10環烷基、C6-10芳基、或有選自取代基群a之1～3個取代之C6-10芳基；

R^6及R^7爲氫原子；

取代基群a爲鹵原子、C1-6烷基、鹵C1-6烷基、C1-6烷氧基、及C1-6烷硫基組成之群；

當 R^5 爲氫原子時，Z 爲分岐鏈 C1-10 伸烷基、或碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基]、其藥理容許鹽或其藥理容許酯。

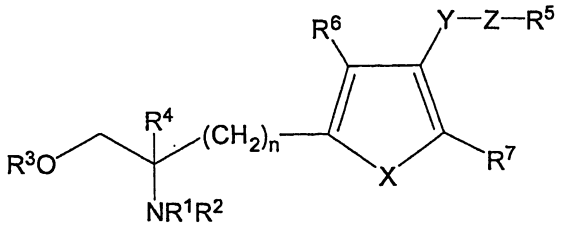
2.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其中式(I)化合物爲式(Ia)：



(Ia)

化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯。

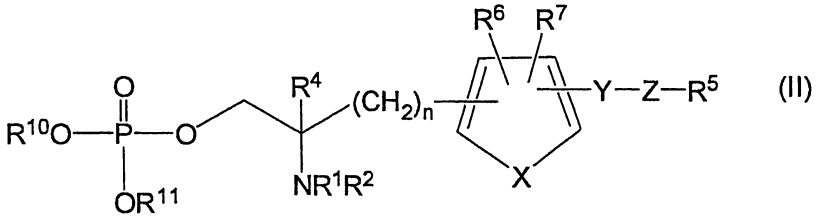
3.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其中式(I)化合物爲式(Ib)：



(Ib)

化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯。

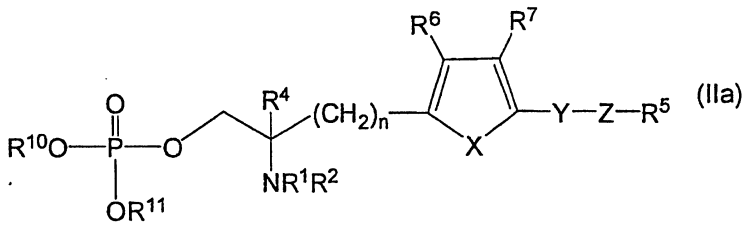
4.如申請專利範圍第 1 項之化合物,其中式(I)化合物之藥理容許酯爲式(II)：



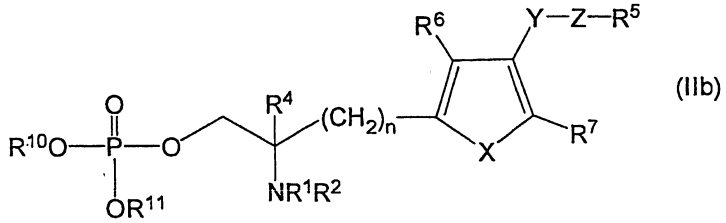
(II)

(式中 R^{10} 及 R^{11} 相同或相異爲 H 或 C1-6 烷基)化合物或其藥理容許鹽。

5.如申請專利範圍第 4 項之化合物,其中式(II)之酯爲式(IIa)：

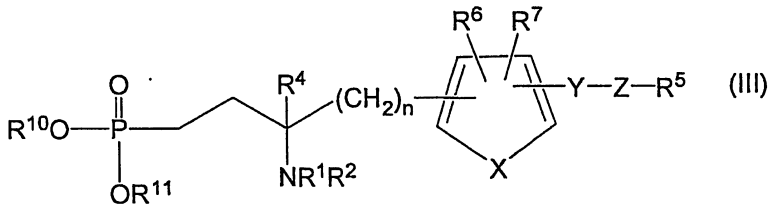


6.如申請專利範圍第 4 項之化合物,其中式(II)之酯爲式(IIb)



(式中 R^{10} 及 R^{11} 相同或相異爲 H 或 C1-6 烷基)化合物或其藥理容許鹽。

7.一種如下式(III)化合物,



[式中、

R^1 及 R^2 爲相同或不同、各爲氫原子、C1-6 烷基、C1-6 烷氧基羰基或 C1-6 脂族醯基；

R^4 爲 C1-6 烷基；

n 爲 1～6 整數；

X 爲氧原子或式 N-D 之基(式中、D 爲氫原子或 C1-6 烷基)；

Y 爲伸乙基、伸乙烯基、伸乙炔基、式 -E-CH_2- 之基(式中、E 爲羰基或式 -CH(OH)- 之基)；

Z 爲單鍵、C1-10 伸烷基、或碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基；

R^5 爲氫原子、C3-10 環烷基、C6-10 芳基、或有選自取代基群 a 之 1～3 個取代之 C6-10 芳基；

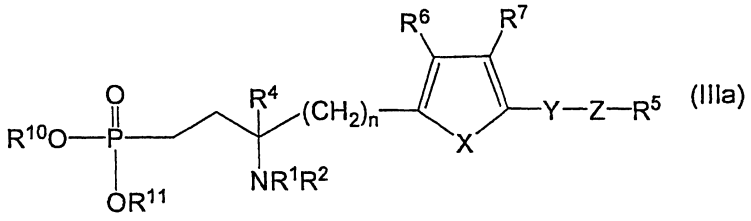
R^6 及 R^7 爲氫原子；

R^{10}、R^{11} 相同或相異爲 H 或 C1-6 烷基；

取代基群 a 爲鹵原子、C1-6 烷基、鹵 C1-6 烷基、C1-6 烷氧基、C1-6 烷硫基；

當 R^5 爲氫原子時，Z 爲分岐鏈 C1-10 伸烷基、或碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基]、其藥理容許鹽或其藥理容許酯。

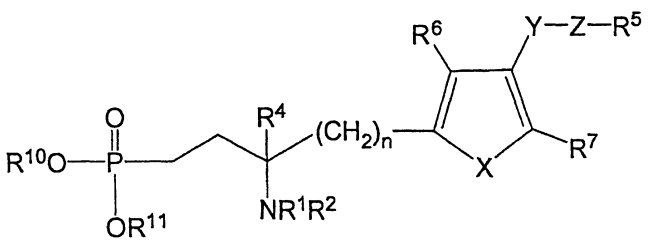
8.如申請專利範圍第 7 項之化合物,其中式(III)化合物爲式(IIIa)



(IIIa)

化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯。

9.如申請專利範圍第 7 項之化合物,其中式(III)化合物爲式(IIIb)



(IIIb)

化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯。

10.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-6脂族醯基或C1-6烷氧羰基,

或其藥理容許鹽。

11.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-4脂族醯基或C1-4烷氧羰基,

或其藥理容許鹽。

12.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-2脂族醯基或C1-2烷氧羰基,

或其藥理容許鹽。

13.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、乙醯基或甲氧羰基,

或其藥理容許鹽。

14.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中R^1及R^2爲氫原子,

或其藥理容許鹽。

15.如申請專利範圍第1～3項中任一項之化合物,其中R^3爲氫原子、C1-6烷基、或C1-6脂族醯基,

或其藥理容許鹽。

16.如申請專利範圍第1～3項中任一項之化合物,其中R^3爲氫原子或C1-6烷基,

或其藥理容許鹽。

17.如申請專利範圍第1～3項中任一項之化合物,其中R^3爲氫原子或C1-4烷基,

或其藥理容許鹽。

18.如申請專利範圍第1～3項中任一項之化合物,其中R^3爲氫原子、甲基或乙基,

或其藥理容許鹽。

19.如申請專利範圍第1～3項中任一項之化合物,其中R^3爲氫原子,

或其藥理容許鹽。

20.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中R^4爲C1-4烷基,

或其藥理容許鹽。

21.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中R^4爲C1-2烷基,

或其藥理容許鹽。

22.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中R^4爲甲基,

或其藥理容許鹽。

23.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中n爲2或3,

或其藥理容許鹽。

24.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中n爲2,

或其藥理容許鹽。

25.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中X為氧原子,

或其藥理容許鹽。

26.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中X為式N-D之基(式中、D為氫原子、或C1-4烷基),

或其藥理容許鹽。

27.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中X為式$-NCH_3$之基,或其藥理容許鹽。

28.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Y為伸乙基、伸乙炔基、式$-CO-CH_2-$之基、或式$-CH(OH)-CH_2-$之基,

或其藥理容許鹽。

29.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Y為伸乙基、伸乙炔基、或式$-CO-CH_2-$之基,

或其藥理容許鹽。

30.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z為C1-10伸烷基,

或其藥理容許鹽。

31.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z為C1-6伸烷基或以1～3個羥基取代之C1-6伸烷基,

或其藥理容許鹽。

32.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z為C1-5伸烷基或以1～3個羥基取代之C1-5伸烷基,

或其藥理容許鹽。

33.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z

爲伸乙基、三亞甲基、四亞甲基、或以1個羥基取代之伸乙基、三亞甲基或四亞甲基、

或其藥理容許鹽。

34.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z爲伸乙基、三亞甲基或四亞甲基,

或其藥理容許鹽。

35.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z爲伸乙基或三亞甲基,

或其藥理容許鹽。

36.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z爲碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之C1-10伸烷基,

或其藥理容許鹽。

37.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z爲碳鏈中或鏈端有氧原子之C1-10伸烷基,

或其藥理容許鹽。

38.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z爲碳鏈中或鏈端有氧原子之C1-6伸烷基,

或其藥理容許鹽。

39.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z爲$-O-CH_2-$、$-O-(CH_2)_2-$、$-O-(CH_2)_3-$、$-CH_2-O-$、$-(CH_2)_2-O-$或$-(CH_2)_3-O-$之基,

或其藥理容許鹽。

40.如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物,其中Z爲$-CH_2-O-$或$-(CH_2)_2-O-$之基,

或其藥理容許鹽。

41.如申請專利範圍第 1～9 項中任一項之化合物,其中 R^5 爲氫原子,

或其藥理容許鹽。

42.如申請專利範圍第 1～9 項中任一項之化合物,其中 R^5 爲 C3-10 環烷基、C6-10 芳基、或有選自鹵原子、C1-6 烷基、鹵 C1-6 烷基及 C1-6 烷氧基之 1～3 個取代之 C6-10 芳基,

或其藥理容許鹽。

43.如申請專利範圍第 1～9 項中任一項之化合物,其中 R^5 爲 C5-C6 環烷基、苯基或萘基、

或其藥理容許鹽。

44.如申請專利範圍第 1～9 項中任一項之化合物,其中 R^5 爲環己基或苯基、

或其藥理容許鹽。

45.如申請專利範圍第 4～9 項中任一項之化合物,其中 R^{10} 及 R^{11} 爲相同或不同、各爲氫原子或 C1-4 烷基、

或其藥理容許鹽。

46.如申請專利範圍第 4～9 項中任一項之化合物,其中 R^{10} 及 R^{11} 爲相同或不同、各爲氫原子、甲基或乙基,

或其藥理容許鹽。

47.如申請專利範圍第 4～9 項中任一項之化合物, 其中 R^{10} 及 R^{11} 爲氫原子,

或其藥理容許鹽。

48.如申請專利範圍第 1 項之化合物,係選自下列任一化合物或其藥理容許鹽:

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己氧戊醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇、及

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲基苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇。

49.如申請專利範圍第1項之化合物,係選自下列任一化合物或其藥理容許鹽：

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[4-(4-甲基苯基)丁醯基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇及

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇。

50.如申請專利範圍第4項之化合物,係選自如下任一化合物或其藥理容許鹽：

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃

-2-基]-1-丁酯及

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯。

51.如申請專利範圍第4項之化合物,係選自如下任一化合物或其藥理容許鹽:

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基戊-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[4-(4-甲基苯基)丁醯基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯及

磷酸單 2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯。

52.如申請專利範圍第 7 項之化合物，其係選自下列任一化合物或其藥理容許鹽：

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸及

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸。

53.如申請專利範圍第 7 項之化合物,其係選自下列任一化合物或其藥理容許鹽：

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己氧基戊-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸及

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸。

54.一種用於預防或治療自體免疫疾病、或抑制器官移植排斥反應之醫藥組成物,內含至少一種免疫抑制劑選自:

對T細胞中細胞素表現有關之細胞內訊號傳達有阻礙作用之藥劑(該藥劑爲環孢素A、大環內酯

(Tacrolimus)、雷帕黴素(Rapamycin)、加士帕力母士(gusperimus)、艾布羅力母士(everolimus)、得列士帕力母士(tresperimus)、安尼士帕力母士(anisperimus)、SDZ-281-240、ABT-281、奇苦得力母士、A-119435 或 17-乙基-1,14-二羥基-12-[2-[4-(2-苯肼羰氧基)-3-甲氧環己基]-1-甲基乙烯基]-23,25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,28-二噁-4-吖三環[22.3.1.$0^{4,9}$]二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮)、

對免疫細胞中核苷合成有阻礙作用之藥劑(該藥劑爲咪唑力平(mizoribine)、吖硫嘌呤(azathioprine)、菌酚酸、列氟諾邁德(leflunomide)、美力面伯地布(merimempodib)、HMR-1279、TSK-204 或 SP-100030)、

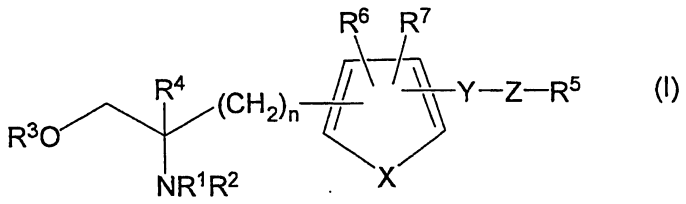
對免疫細胞中細胞素有阻礙作用之具抗風溼作用藥劑(該藥劑爲 T-614、阿克達利德(actarit)、沙唑硫吡啶(salazosulfapyridine)或 CDC-801)、

因 DNA 鏈破壞或 DNA 合成障礙所致細胞死亡之烷化劑(該烷化劑爲環磷醯胺)、

抑制葉酸產生以阻礙核酸代謝之代謝拮抗劑(該代謝拮抗劑爲美索多列奇雪德(methotrexate))、

有 TNF-α 抑制作用之蛋白質製劑(該蛋白質製劑爲列米克德(infliximab)、緣布列路(etanercept)、達克力志嗎布(daclizumab)、巴西力奇志嗎布(basiliximab)、阿木志嗎布(alemtuzumab)、歐嗎利志嗎布(omalizumab)、BMS-188667、CDP—571、伊諾利莫嗎布(inolimomab)、ATM-027 或 BTI-322)、

在細胞內類固醇受體結合形成複合體、在染色體上反應部位結合而合成之蛋白質而具免疫抑制作用之類固醇荷爾蒙劑(該類固醇爾蒙劑爲 1-烯氫可體松)及可抑制前列腺素產生之物質及/或對前列腺素作用有拮抗之非類固醇系抗炎症劑(該非類固醇系抗炎症劑爲羅奇索普羅芬鈉(loxoprofen-Na)、地克羅芬那克鈉(diclofenac-Na)、美羅奇西茨(meloxicam)、西列可奇西布(celecoxib)、羅非可奇西布(rofecoxib)),與至少一種選自下式(I)化合物及其藥理容許鹽及其酯:



(I)

[式中、

R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-6烷基、C1-6烷氧羰基或C1-6脂族醯基;

R^3爲氫原子、C1-6烷基、C1-6烷氧羰基或C1-6脂族醯基;

R^4爲C1-6烷基、

n爲1～6整數、

X爲硫原子、氧原子或式N-D之基(式中、D爲氫原子或C1-6烷基);

Y爲伸乙基、伸乙烯基、伸乙炔基、式-E-CH_2-之基(式中、E爲羰基或式-CH(OH)-之基);

Z 爲單鍵、C1-10 伸烷基、或碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基；

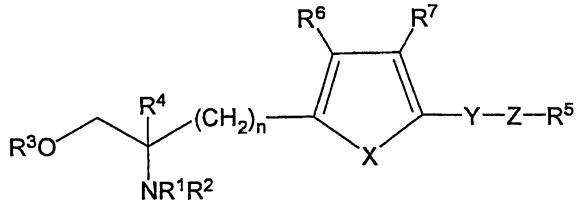
R^5 爲氫原子、C3-10 環烷基、C6-10 芳基、或有選自取代基群 a 之 1～3 個取代之 C6-10 芳基；

R^6 及 R^7 爲氫原子；

取代基群 a 爲鹵原子、C1-6 烷基、鹵 C1-6 烷基、C1-6 烷氧基、及 C1-6 烷硫基

當 R^5 爲氫原子時，Z 爲分岐鏈 C1-10 伸烷基、或碳鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基]。

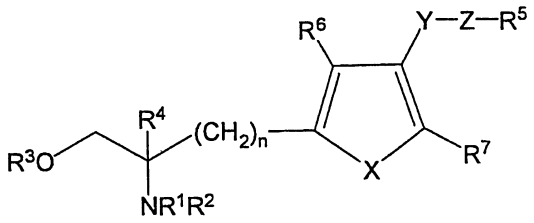
55.如申請專利範圍第 54 項之醫藥組成物，其中式(I)化合物爲如下式(Ia)化合物：



(Ia)

。

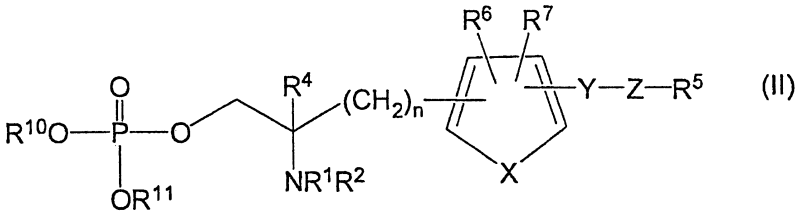
56.如申請專利範圍第 54 項之醫藥組成物，其中式(I)化合物爲如下式(Ib)化合物：



(Ib)

。

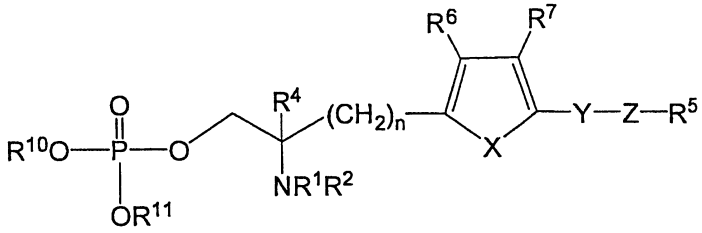
57.如申請專利範圍第 54 項之醫藥組成物，其中式(I)化合物之藥理容許酯爲式(II)化合物或其藥理容許鹽：



(II)

(式中 R^{10} 及 R^{11} 爲相同或不同、各爲氫原子或 C1-6 烷基)。

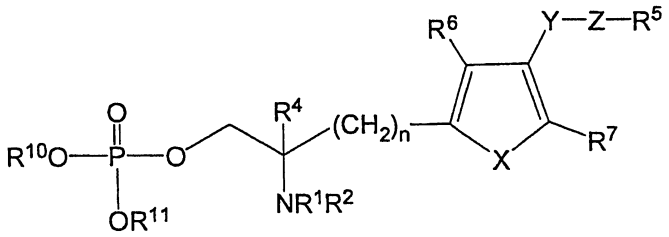
58.如申請專利範圍第 57 項之醫藥組成物,其中式(II)酯爲式(IIa)化合物或其藥理容許鹽:



(IIa)

。

59.如申請專利範圍第 57 項之醫藥組成物,其中式(II)之酯爲式(IIb)化合物或其藥理容許鹽:



(IIb)

。

60.一種用於預防或治療自體免疫疾病、或抑制器官移植排斥反應之醫藥組成物,內含至少一種免疫抑制劑選自:

對 T 細胞中細胞素表現有關之細胞內訊號傳達有阻礙作用之藥劑(該藥劑爲環孢素 A、大環內酯、雷帕黴素、加士帕力母士、艾布羅力母士、得列士帕力母

士、安尼士帕力母士、SDZ-281-240、ABT-281、奇苦得力母士、A-119435 或 17-乙基-1,14-二羥基-12-[2-[4-(2-苯肼羰氧基)-3-甲氧環己基]-1-甲基乙烯基]-23,25-二甲氧基-13,19,21,27-四甲基-11,28-二噁-4-吖三環[22.3.1.$0^{4,9}$]二十八碳-18-烯-2,3,10,16-四酮)、

對免疫細胞中核苷合成有阻礙作用之藥劑(該藥劑爲咪唑力平、吖硫嘌呤、菌酚酸、列氟諾邁德、美力面伯地布、HMR-1279、TSK-204 或 SP-100030)、

對免疫細胞中細胞素有阻礙作用之具抗風溼作用藥劑(該藥劑爲 T-614、阿克達利德、沙唑硫吡啶或 CDC-801)、

因 DNA 鏈破壞或 DNA 合成障礙所致細胞死亡之烷化劑(該烷化劑爲環磷醯胺)、

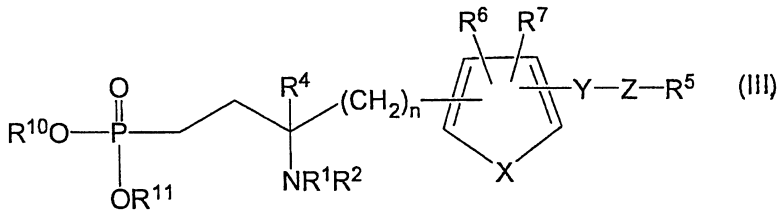
抑制葉酸產生以阻礙核酸代謝之代謝拮抗劑(該代謝拮抗劑爲美索多列奇雪德)、

有 TNF-α 抑制作用之蛋白質製劑(該蛋白質製劑爲列米克德、緣布列路、達克力志嗎布、巴西力奇志嗎布、阿木志嗎布、歐嗎利志嗎布、BMS-188667、CDP-571、伊諾利莫嗎布、ATM-027 或 BTI-322)、

在細胞內類固醇受體結合形成複合體、在染色體上反應部位結合而合成之蛋白質而具免疫抑制作用之類固醇荷爾蒙劑(該類固醇爾蒙劑爲 1-烯氫可體松)及可抑制前列腺素產生之物質及/或對前列腺素作用有拮抗之非類固醇系抗炎症劑(該非類固醇系抗炎症劑

爲羅奇索普羅芬鈉、地克羅芬那克鈉、美羅奇西玻、西列可奇西布、羅非可奇西布),

與至少一種選自式(III)化合物或其藥理容許鹽及其酯：



(III)

[式中、

R^1及R^2爲相同或不同、各爲氫原子、C1-6烷基、C1-6烷氧基羰基或C1-6脂族醯基；

R^4爲C1-6烷基、

n爲1～6整數、

X爲硫原子、氧原子或式N-D之基(式中、D爲選自氫原子或C1-6烷基)、

Y爲伸乙基、伸乙烯基、伸乙炔基、或式-E-CH_2-之基(式中、E爲羰基或式-CH(OH)-之基)；

Z爲單鍵、C1-10伸烷基、或碳鏈中或鏈端含氧原子或硫原子之C1-10伸烷基；

R^5爲氫原子、C3-10環烷基、C6-10芳基或有選自取代基群a之1～3個取代之C6-10芳基；

R^6及R^7爲氫原子；

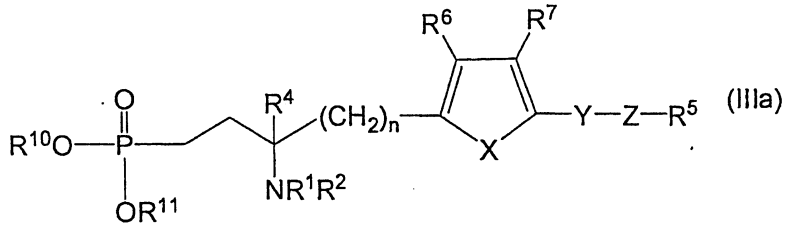
R^{10}及R^{11}爲相同或不同、各爲氫原子或C1-6烷基；

取代基群a爲鹵原子、C1-6烷基、鹵C1-6烷基、C1-6烷氧基、及C1-6烷硫基

當R^5爲氫原子時，Z爲分岐鏈C1-10伸烷基、或碳

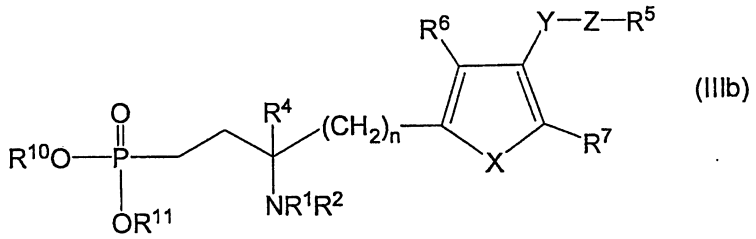
鏈中或鏈端有氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基]。

61.如申請專利範圍第 60 項之醫藥組成物,其中式(III)化合物爲有式(IIIa)化合物：



。

62.如申請專利範圍第 60 項之醫藥組成物,其中式(III)化合物爲式(IIIb)化合物：



。

63.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物,其中化合物或其藥理容許鹽之 R^1 及 R^2 爲相同或不同、各爲氫原子、C1-4 脂族醯基或 C1-4 烷氧羰基。

64.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物,其中化合物或其藥理容許鹽之 R^1 及 R^2 爲相同或不同、各爲氫原子、C1-2 脂族醯基或 C1-2 烷氧羰基。

65.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物,其中化合物,或其藥理容許鹽之 R^1 及 R^2 爲相同或不同、各爲氫原子、乙醯基或甲氧羰基。

66.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物,

其中化合物或其藥理容許鹽之 R^1 及 R^2 爲氫原子。

67.如申請專利範圍第 54～56 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^3 爲氫原子或 C1-6 烷基。

68.如申請專利範圍第 54～56 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^3 爲氫原子或 C1-4 烷基。

69.如申請專利範圍第 54～56 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^3 爲氫原子、甲基或乙基。

70.如申請專利範圍第 54～56 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^3 爲氫原子。

71.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^4 爲 C1-4 烷基。

72.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^4 爲 C1-2 烷基。

73.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^4 爲甲基。

74.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 n 爲 2 或 3。

75.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 n 爲 2。

76.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 X 爲硫原子。

77.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，

其中化合物或其藥理容許鹽之X爲氧原子。

78.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之X爲式N-D之基(式中、D爲氫原子或C1-4烷基)。

79.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之X爲式$N-CH_3$之基。

80.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之Y爲伸乙基、伸乙炔基、式$-CO-CH_2-$之基、或式$-CH(OH)-CH_2-$之基。

81.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之Y爲伸乙基、伸乙炔基、或式$-CO-CH_2-$基。

82.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之Z爲C1-10伸烷基。

83.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之Z爲C1-6伸烷基。

84.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之Z爲C1-5伸烷基。

85.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之Z爲伸乙基、三亞甲基、四亞甲基。

86.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之Z爲伸乙基或三亞甲基。

87.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之Z爲碳鏈中或鏈端有

氧原子或硫原子之 C1-10 伸烷基。

88.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子之 C1-10 伸烷基。

89.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物，或其藥理容許鹽之 Z 爲碳鏈中或鏈端有氧原子之 C1-6 伸烷基。

90.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 Z 爲 $-O-CH_2-$、$-O-(CH_2)_2-$、$-O-(CH_2)_3-$、$-CH_2-O-$、$-(CH_2)_2-O-$或$-(CH_2)_3-O-$之基。

91.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 Z 爲 $-CH_2-O-$或$-(CH_2)_2-O-$之基。

92.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^5 爲氫原子。

93.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^5 爲 C3-10 環烷基、C6-10 芳基、或有選自鹵原子、C1-6 烷基、鹵 C1-6 烷基及 C1-6 烷氧基之 1～3 個取代之 C6-10 芳基。

94.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^5 爲 C5-C6 環烷基、苯基或萘基。

95.如申請專利範圍第 54～62 項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之 R^5 爲環己基或苯基。

96.如申請專利範圍第57～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之R^{10}及R^{11}爲相同或不同、各爲氫原子或C1-4烷基。

97.如申請專利範圍第57～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之R^{10}及R^{11}爲相同或不同、各爲氫原子、甲基或乙基。

98.如申請專利範圍第57～62項中任一項之醫藥組成物，其中化合物或其藥理容許鹽之R^{10}及R^{11}爲氫原子。

99.如申請專利範圍第54項之醫藥組成物，其中式(I)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自如下化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯：

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]

丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯丁醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基] 噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基] 噻吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻

吩-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩--2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩--2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇及

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}丁-1-醇。

100.如申請專利範圍第54項之醫藥組成物,其中式(I)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自如下化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯:

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]丁-1-醇及

2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}丁-1-醇。

101.如申請專利範圍第54項之醫藥組成物,其中式(I)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自如下化合

物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯：

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯基戊-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[4-(4-甲基苯基)丁醯基]吡咯-2-基}丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇、

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇及

2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]丁-1-醇。

102.如申請專利範圍第57項之醫藥組成物,其中式(II)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自如下化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯:

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基] 噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基] 噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(3-環己基甲氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苄氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-苯丁醯基)噻吩-2-

基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-乙基-4-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯及

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}-1-丁酯。

103.如申請專利範圍第57項之醫藥組成物,其中式(II)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯：

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]-1-丁酯及

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}-1-丁酯。

104.如申請專利範圍第57項之醫藥組成物,其中式(II)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自如下化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯：

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)

丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-{1-甲基-5-[4-(4-甲基苯基)丁醯基]吡咯-2-基}-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯、

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯及

磷酸單2-胺基-2-甲基-4-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]-1-丁酯。

105.如申請專利範圍第60項之醫藥組成物,其中式(III)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自下述化

合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯：

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲氧苯氧基)丁基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苄氧丁基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基丁-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苯丁-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯基戊-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-氟苯基)戊-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-甲氧苯基)戊-1-炔基]噻吩

-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-乙苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-甲硫苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-氟苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[4-(4-甲苯氧基)丁-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(3-環己基甲氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苄氧丁-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己基丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-苯丁醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[5-(4-氟苯基)戊醯基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-乙基-5-[5-(5-環己基戊醯基)噻吩-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-氯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3-甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3-甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基] 噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,5-二甲氧苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(4-乙醯苯氧基)丙-1-炔基]噻吩-2-基}戊基膦酸。

106.如申請專利範圍第60項之醫藥組成物,其中式(III)

化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯：

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-苯戊-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(4-環己氧基丁-1-炔基)呋喃-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[5-(5-環己基戊醯基)呋喃-2-基]戊基膦酸及

3-胺基-3-甲基-5-{5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]呋喃-2-基}戊基膦酸。

107.如申請專利範圍第60項之醫藥組成物,其中式(III)化合物、其藥理容許鹽及其藥理容許酯係選自下述化合物、其藥理容許鹽及藥理容許鹽酯：

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊-1-炔基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(4-甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己氧基丁-1-炔基)吡咯-2-基] 戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-{1-甲基-5-[3-(3,4-二甲苯氧基)丙-1-炔基]吡咯-2-基}戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-甲基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-苯戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸、

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(5-環己基戊醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-苯丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸及

3-胺基-3-甲基-5-[1-乙基-5-(4-環己基丁醯基)吡咯-2-基]戊基膦酸。

108.如申請專利範圍第54～62項中任一項之醫藥組成物，其中免疫抑制劑爲：

環孢素A、大環內酯、雷帕黴素、列氟諾邁德、美索多列奇雪德、列米克德、緣布列路所選擇一以上藥劑。

109.一種用於預防或治療自體免疫疾病、或抑制器官移植排斥反應之醫藥組成物,內含如申請專利範圍第1～9項中任一項之化合物、其藥理容許鹽或藥理容許酯爲有效成份。

110.如申請專利範圍第109項之醫藥組成物，其可預防

或治療自體免疫病。

111.如申請專利範圍第110項之醫藥組成物，其中自體免疫病爲慢性關節風溼病。

112.如申請專利範圍第109項之醫藥組成物，其可抑制器官移植之排斥反應。