



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 110698445 B

(45) 授权公告日 2023.05.12

(21) 申请号 201810745452.0

(22) 申请日 2018.07.09

(65) 同一申请的已公布的文献号  
申请公布号 CN 110698445 A

(43) 申请公布日 2020.01.17

(73) 专利权人 四川大学  
地址 610041 四川省成都市武侯区人民南路三段17号

(72) 发明人 邓勇 罗礼 刘红艳 曹忠诚  
田超全

(51) Int. Cl.

- C07D 307/88 (2006.01)
- A61K 31/365 (2006.01)
- A61K 31/4525 (2006.01)
- A61P 25/28 (2006.01)
- A61P 25/16 (2006.01)
- A61P 25/14 (2006.01)
- A61P 31/18 (2006.01)
- A61P 25/00 (2006.01)
- A61P 27/06 (2006.01)
- A61P 9/10 (2006.01)

(56) 对比文件

- CN 105646417 A, 2016.06.08
- CN 106632181 A, 2017.05.10
- CN 108069942 A, 2018.05.25
- CN 1741995 A, 2006.03.01
- CN 109111415 A, 2019.01.01

WO 9217448 A1, 1992.10.15

US 2017327789 A1, 2017.11.16

WO 2008020607 A1, 2008.02.21

US 6087364 A, 2000.07.11

US 2010267712 A1, 2010.10.21

郑纯智等. 3-亚烷基(亚芳基)异苯并呋喃-1(3H)-酮及其衍生物的合成研究.《有机化学》. 2014, 第1881-1888页.

EDWARD LEETE等. Biosynthesis of shihunine, an alkaloid of the orchid *Dendrobium pierardii*.《J.C.S. CHEM. COMM》. 1973,

Li Luo等. Design, synthesis and evaluation of phthalide alkyl tertiary amine derivatives as promising acetylcholinesterase inhibitors with high potency and selectivity against Alzheimer's disease.《Bioorganic & Medicinal Chemistry》. 2020,

Nicolas Dussart等. Modified Julia Olefination on Anhydrides: Extension and Limitations. Application to the Synthesis of Maculalactone B.《Organic Letters》. 2016, 第4790-4793页. (续)

审查员 蒋维

权利要求书2页 说明书28页

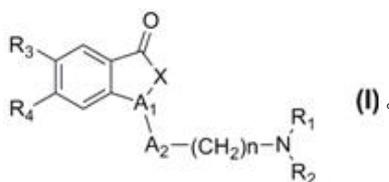
(54) 发明名称

一类3-胺烷基苯酐类化合物、其制备方法和用途

(57) 摘要

本发明公开了一类新型的3-胺烷基苯酐类化合物(I)及其药学上可接受的盐、其制备方法、药物组合物和在制备治疗和/或预防神经系统相关疾病药物中的用途,包括但不限于血管性痴呆、阿尔茨海默氏病、帕金森氏症、亨廷顿氏症、

HIV相关痴呆症、多发性硬化症、肌萎缩侧索硬化症、神经性疼痛、青光眼、缺血性脑卒中、出血性脑卒中、以及脑外伤引起的神经损伤等疾病;



CN 110698445 B

[接上页]

**(56) 对比文件**

Shubhendu Dhara等.Pd-free Sonogashira coupling:one pot synthesis of phthalide via domino Sonogashira coupling and 5-exo-dig cyclization.《RSC Adv.》.2014,

J. A. BARLTROP.The Synthesis of analgesic substances.《Homepage》.1946,

刘君鹏.苯酞哌嗪类化合物的设计与合成.《中国优秀博硕士学位论文全文数据库(硕士)》.2014,



式中： $X$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 和 $n$ 的定义与3-胺烷基苯酐类化合物(I)的化学结构通式相同；

步骤A)：以相应的3-溴化物(1)为起始原料，在适当溶剂中和三苯基膦反应，得相应的3-三苯基膦盐类化合物(2)；

步骤B)：由步骤A)得到的3-三苯基膦盐类化合物(2)与相应的胺烷基醛类化合物(3)在溶剂和碱性条件下经Wittig反应，得相应化合物(4)的E/Z构型混合物；该混合物用常规方法，经硅胶柱层析分离纯化，可分别得到相应的E-式或Z-式构型化合物；

步骤C)：由步骤B)得到的化合物(4)在适当溶剂中经催化氢化将双键还原，得相应的3-胺烷基苯酐类化合物(I)消旋体；再利用常规手性色谱法将相应的3-胺烷基苯酐类化合物(I)消旋体进行分离，即可得到相应的光学异构体；

利用上述方法所得之3-胺烷基苯酐类化合物(I)分子中含有氨基，该氨基呈碱性，可与任何合适的酸通过药理学上常规的成盐方法制得其药理学上可接受的盐。

4. 如权利要求3所述3-胺烷基苯酐类化合物或其药理学上可接受的盐的制备方法，其特征在于所述步骤A)中，反应所用溶剂为： $C_{3-8}$ 脂肪酮、N,N-二甲基甲酰胺、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、乙酸乙酯、乙醚、苯、甲苯、乙腈、1,4-二氧六环、乙二醇二甲醚或 $C_{5-8}$ 烷烃；3-溴化物(1)：三苯基膦的摩尔投料比为1.0:1.0~10.0；反应温度为40~150℃；反应时间为1~120小时。

5. 如权利要求3所述3-胺烷基苯酐类化合物或其药理学上可接受的盐的制备方法，其特征在于所述步骤B)中，反应所用溶剂为： $C_{1-8}$ 脂肪醇、 $C_{3-8}$ 脂肪酮、乙醚、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、N,N-二甲基甲酰胺、二甲基亚砷、二氯甲烷、1,4-二氧六环、苯、甲苯、乙腈或 $C_{5-8}$ 烷烃；反应所用碱为：碱金属氢氧化物、碱土金属氢氧化物、碱金属碳酸盐、碱土金属碳酸盐、碱金属碳酸氢盐、碱土金属碳酸氢盐、 $C_{1-8}$ 醇的碱金属盐、三乙胺、三丁胺、三辛胺、吡啶、N-甲基吗啉、N-甲基哌啶、三乙烯二胺、四丁基氢氧化铵；化合物(2)：化合物(3)：碱的摩尔投料比为1.0:1.0~10.0:1.0~10.0；反应温度为0~120℃；反应时间为20分钟~48小时。

6. 如权利要求3所述3-胺烷基苯酐类化合物或其药理学上可接受的盐的制备方法，其特征在于所述步骤C)中，反应所用溶剂为： $C_{1-6}$ 脂肪醇、 $C_{3-8}$ 脂肪酮、 $C_{1-6}$ 脂肪酸、 $C_{1-6}$ 脂肪醇与 $C_{1-6}$ 脂肪醇所形成酯、乙醚、异丙醚、甲基叔丁基醚、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、乙二醇二甲醚、苯、甲苯或二甲苯、己烷、庚烷、辛烷；催化氢化所用催化剂为：Raney Ni、PtO<sub>2</sub>、1%~30%Pd-C、1%~30%Pd(OH)<sub>2</sub>-C；化合物(4)与催化剂的质量比为1.0:0.01~1.0；反应压力为常压~10.0MPa；反应温度为室温~150℃；反应时间为1~96小时。

7. 一类药物组合物，其特征在于包含如权利要求1-2任一项所述的3-胺烷基苯酐类化合物或其药理学上可接受的盐以及一种或多种药理学上可接受的载体或赋形剂。

8. 如权利要求1-2任一项所述的3-胺烷基苯酐类化合物或其药理学上可接受的盐用于制备通过乙酰胆碱酯酶抑制剂、抑制Aβ<sub>1-42</sub>自身聚集、抗血小板聚集或抗神经炎症进行治疗和/或预防疾病药物中的用途，这类疾病为：血管性痴呆、阿尔茨海默氏病、帕金森氏症、亨廷顿氏症、HIV相关痴呆症、多发性硬化症、肌萎缩侧索硬化症、神经性疼痛、青光眼、缺血性脑卒中、出血性脑卒中、以及脑外伤引起的神经损伤。

## 一类3-胺烷基苯酰胺类化合物、其制备方法和用途

### 技术领域

[0001] 本发明属药物化学领域,涉及一类新型的3-胺烷基苯酰胺类化合物(I)、其制备方法、药物组合和在制备治疗和/或预防神经系统相关疾病药物中的用途,包括但不限于血管性痴呆、阿尔茨海默氏病、帕金森氏症、亨廷顿氏症、HIV相关痴呆症、多发性硬化症、肌萎缩侧索硬化症、神经性疼痛、青光眼、缺血性脑卒中、出血性脑卒中、以及脑外伤引起的神经损伤等疾病。

### 背景技术

[0002] 阿尔茨海默症(Alzheimer's disease, AD, 老年痴呆症)是一种以进行性认知障碍和记忆力损害为主的中枢神经系统退行性疾病,其发病率呈逐年上升趋势,成为仅次于心血管病和癌症的高发性疾病,在欧美等发达国家已上升为死亡原因的第四位。据世界卫生组织报告,全球65岁以上老人有10%智力障碍,其中二分之一发生痴呆,八十五岁以上发病率近50%。在我国AD患者人数约600-700万,发病率超过5%。随着全球人口老龄化进程的加快,其发病率呈明显上升趋势,据Alzheimer's Disease International在2013年12月公布的《阿尔茨海默症的全球影响:2013-2050》报告中指出,AD将成为未来几十年全球面临的重大健康挑战,到2030年,患者人数将由2013年的4400万上升到7600万,到2050年,这一数值将达到惊人的1.35亿。由于AD临床表现为记忆能力、定向能力、思维和判断能力减退,以及日常生活能力降低,甚至出现异常精神行为症状等,使患者护理难度较大,给社会和家庭带来沉重负担。目前已批准用于治疗轻/中度AD的药物有乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,以及用于重度AD治疗的N-甲基-D-天冬氨酸(NMDA)受体拮抗剂,但临床使用表明,这些药物可通过提高患者体内乙酰胆碱水平或者抑制兴奋性氨基酸的兴奋毒性来缓解AD症状,但不能有效阻止或逆转病程,而且还会引起幻觉、意识混沌、头晕、头痛、恶心、肝脏毒性、食欲不振以及大便频繁等严重毒副作用,因而长期疗效不甚理想。因此,临床上迫切需要研发兼具AD症状改善和病程改变的新型AD治疗药物。

[0003] AD属多种因素引起的疾病,发病机理复杂,其发病机制至今还未完全阐明。但研究表明,患者脑内乙酰胆碱水平的下降、 $\beta$ -淀粉样蛋白的过度生成与沉积、脑血管内的血小板聚集、金属离子代谢紊乱、 $\text{Ca}^{2+}$ 平衡失调、*tau*-蛋白过度磷酸化导致的神经纤维缠结、谷氨酸受体活性过高、氧化应激产生大量活性氧(ROS)和自由基以及神经炎症反应等多种因素在AD的发病过程中扮演重要角色。针对上述发病因素,研究人员采用传统“一药一靶”药物设计策略,发现了大量对某一靶点具有高活性和高选择性的药物,如:胆碱酯酶抑制剂和N-甲基-D-天冬氨酸受体拮抗剂等。但这些药物存在作用靶点单一、临床使用毒副作用较多、对AD患者的长期疗效欠佳等问题。

[0004] 近年来,随着对AD致病机理的不断阐明,发现AD的发生和发展具有多机制、多因素作用的特点,不同机制之间又相互关联相互影响,构成了AD发生和发展过程中复杂的网络调控系统。显然,研发可同时作用于AD病理过程中多个环节的治疗药物是目前的必然选择。基于上述结果,研究人员提出了“多靶点导向配基”(Multitarget-directed Ligands,

MTDLs) 策略来研发抗神经退行性疾病药物。所谓“多靶点配基”是指单一化学实体同时作用于疾病网络中的多个靶点,对各靶点的作用可产生协同效应,使总效应大于各单效应之和,此类化合物也称为“Multifunctional”或“Multipotential”药物。多靶点药物与多药联合应用以及复方药物的主要区别在于:可减少服药量、提高治疗效果、避免药物之间的相互作用及由此带来的毒副作用、均一的药代动力学特性、便于使用等。因此,研究开发具有新型化学结构、新型作用机制,且具有多靶点作用、低毒副作用的抗神经退行性疾病治疗药物不仅符合社会老龄化进程的迫切需求,而且具有良好的市场前景。大量临床研究已证实,AChE 抑制剂能有效缓解AD患者症状,短期治疗疗效肯定;因此,在设计多靶点抗AD药物时通常需保留化合物的AChE抑制活性(抑制该酶对改善AD患者症状至关重要),并在此基础上增加一个或多个具有药理协同作用的其它靶标或功能,以达到多靶点AD治疗作用【1、黄淑芳等. 多靶点阿尔茨海默症治疗药物的研究进展. 中国药物化学杂志 2011, 21(6): 433-434; 2、罗稳等. 多靶点小分子抑制剂治疗阿尔茨海默症的研究进展. 中国药物化学杂志 2011, 21(6): 442-443】。显然,设计并发现同时具有抑制乙酰胆碱酯酶、抑制 $\beta$ -淀粉样蛋白的过度生成与沉积、抗氧化应激、抗血小板凝聚、以及抗神经炎症反应的多靶点AD治疗药物仍是目前重要的研究方向。

## 发明内容

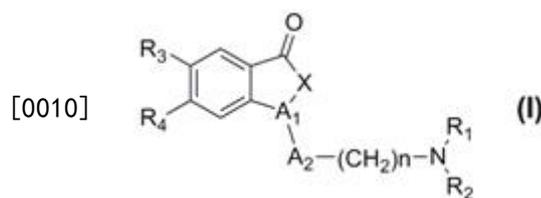
[0005] 本发明目的在于公开一类3-胺烷基苯酰胺类化合物(I)及其药学上可接受的盐;

[0006] 本发明另一目的在于公开该类3-胺烷基苯酰胺类化合物(I)及其药学上可接受的盐的制备方法;

[0007] 本发明的又一目的在于公开包含该类3-胺烷基苯酰胺类化合物(I)及其药学上可接受的盐的药物组合物;

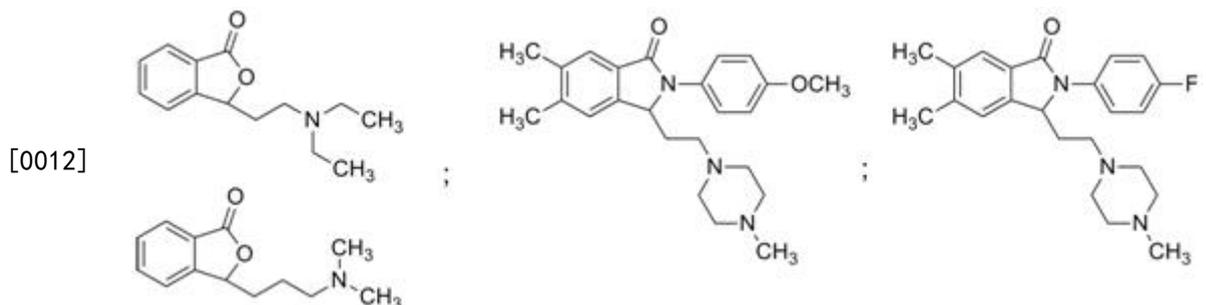
[0008] 本发明再一目的在于公开该类3-胺烷基苯酰胺类化合物(I)及其药学上可接受的盐具有多靶点作用,可用于制备治疗和/或预防神经系统相关疾病药物中的用途,包括但不限于血管性痴呆、阿尔茨海默氏病、帕金森氏症、亨廷顿氏症、HIV相关痴呆症、多发性硬化症、肌萎缩侧索硬化症、神经性疼痛、青光眼、缺血性脑卒中、出血性脑卒中、以及脑外伤引起的神经损伤等疾病。

[0009] 本发明所提供的3-胺烷基苯酰胺类化合物(I)的化学结构通式为:



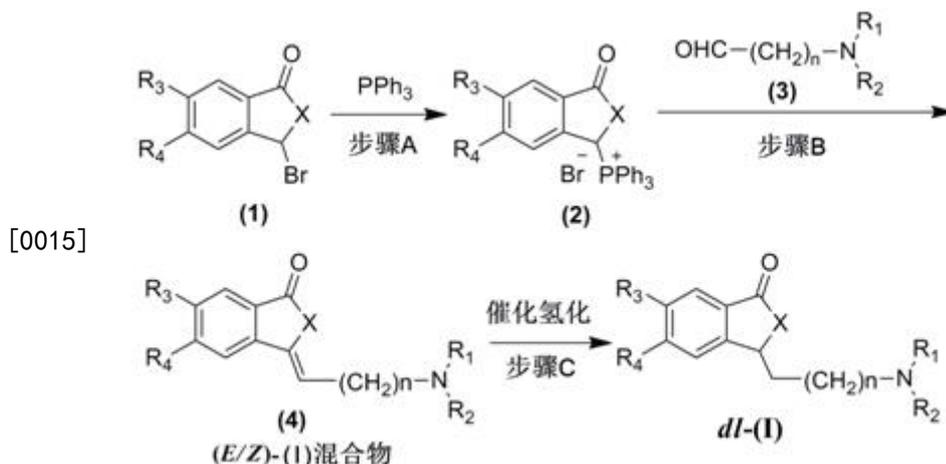
[0011] 式中: X表示O、NR<sub>7</sub>或S; A<sub>1</sub>-A<sub>2</sub>表示CH-CH<sub>2</sub>或C=CH; 当A<sub>1</sub>-A<sub>2</sub>表示C=CH时,所述化合物为Z-式构型、E-式构型、或Z-式和E-式构型的任意比例混合物; 当A<sub>1</sub>-A<sub>2</sub>表示CH-CH<sub>2</sub>时,所述化合物为R构型、S构型、或R构型和S构型的任意比例混合物; n表示1-12; R<sub>3</sub>和R<sub>4</sub>各自独立地表示H、OH、SH、C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>烷基、C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>烷氧基、CN、卤素、NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>或C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>烷硫基; R<sub>5</sub>和R<sub>6</sub>各自独立地表示H、C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>烷基; NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>也表示四氢吡咯基、吗啉基或哌啶基; R<sub>1</sub>表示H、C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>烷基; R<sub>2</sub>表示C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>烷基、苄基或取代苄基; NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>也表示四氢吡咯基、吗啉基、哌啶基、4-位被C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>烷基所取代的哌啶基、4-位被苄基或取代苄基所取代的哌啶基、哌嗪基、4-位被C<sub>1</sub>~C<sub>12</sub>烷基所取代的

哌嗪基、4-位被苄基或取代苄基所取代的哌嗪基； $R_7$ 表示H、 $C_1\sim C_{12}$ 烷基、苯基或取代苯基、苄基或取代苄基；上述术语“卤素”是指F、Cl、Br、或I；“取代苯基”或“取代苄基”是指苯环上被1-4个选自下组的基团所取代的苄基：F、Cl、Br、I、 $C_1\sim C_4$ 烷基、 $C_1\sim C_4$ 烷氧基、 $NR_8R_9$ 、三氟甲基、三氟甲氧基、硝基、羧基、羟基、氰基， $R_8$ 和 $R_9$ 各自独立地表示H或 $C_1\sim C_{12}$ 烷基， $NR_8R_9$ 也表示四氢吡咯基、吗啉基或哌啶基；这些取代基可在苯环的任意可能位置。但本发明所提出的3-胺烷基苯酐类化合物(I)不包括如下化合物：



[0013] 本发明所提出的3-胺烷基苯酐类化合物(I)可通过以下方法制备得到：

[0014] 以相应的3-溴化物(1)为起始原料，在适当溶剂中和三苯基膦反应，得相应的3-三苯基膦盐类化合物(2)；所得化合物2与胺烷基醛类化合物(3)在适当溶剂和碱性条件下经Wittig反应得相应化合物(4)的E/Z构型混合物(也就是E/Z构型的化合物I混合物)；化合物(4)的混合物可用常规方法，经硅胶柱层析分离纯化，分别得到相应的E-式或Z-式构型化合物；所得化合物(4)的混合物也可不经分离纯化，直接在适当溶剂中经催化氢化将双键还原，得相应的3-胺烷基苯酐类化合物(I)消旋体；利用常规手性色谱法将相应的3-胺烷基苯酐类化合物(I)消旋体进行分离，即可得到相应的光学异构体；其反应式如下：



[0016] 式中： $X$ 、 $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 和 $n$ 的定义与3-胺烷基苯酐类化合物(I)的化学结构通式相同。

[0017] 对于上述合成路线，其具体制备方法描述如下：

[0018] 步骤A)：3-溴化物(1)和三苯基膦在适当溶剂中反应，得相应的3-三苯基膦盐类化合物(2)；其中，反应所用溶剂为： $C_{3-8}$ 脂肪酮、 $N,N$ -二甲基甲酰胺、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、乙酸乙酯、乙醚、苯、甲苯、乙腈、1,4-二氧六环、乙二醇二甲醚或 $C_{5-8}$ 烷烃，优选溶剂为2-甲基四氢呋喃、乙酸乙酯、乙腈、甲苯、或1,4-二氧六环；3-溴化物(1)：三苯基膦的摩尔投料比为1.0:1.0~10.0，优选摩尔投料比为1.0:1.0~5.0；反应温度为40~150℃，优选反应温度

为60~120℃;反应时间为1~120小时,优选反应时间为2~72小时。

[0019] 步骤B):由步骤A)得到的3-三苯基膦盐类化合物(2)与胺烷基醛类化合物(3)在适当溶剂和碱性条件下经Wittig反应得相应化合物(4)的E/Z构型混合物;其中,反应所用溶剂为:C<sub>1-8</sub>脂肪醇、C<sub>3-8</sub>脂肪酮、乙醚、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、N,N-二甲基甲酰胺、二甲基亚砜、二氯甲烷、1,4-二氧六环、苯、甲苯、乙腈或C<sub>5-8</sub>烷烃,优选溶剂为:氯仿、二氯甲烷、丙酮、乙腈、四氢呋喃或甲苯;反应所用碱为:碱金属氢氧化物、碱土金属氢氧化物、碱金属碳酸盐、碱土金属碳酸盐、碱金属碳酸氢盐、碱土金属碳酸氢盐、C<sub>1-8</sub>醇的碱金属盐、有机叔胺类或季铵碱类(如:三乙胺、三丁胺、三辛胺、吡啶、N-甲基吗啉、N-甲基哌啶、三乙烯二胺、四丁基氢氧化铵),优选碱为:氢氧化钾、氢氧化钠、碳酸钾、三乙胺、吡啶或甲醇钠;化合物(2):化合物(3):碱的摩尔投料比为1.0:1.0~10.0:1.0~10.0,优选摩尔投料比为1.0:1.0~3.0:1.0~5.0;反应温度为0~120℃,优选反应温度为室温~100℃;反应时间为20分钟~48小时,优选反应时间为1~24小时。

[0020] 步骤C):由步骤B)得到的化合物(4)混合物不经分离纯化,直接在适当溶剂中经催化氢化将双键还原,得相应的3-胺烷基苯酐类化合物(I)消旋体;其中,反应所用溶剂为:C<sub>1-6</sub>脂肪醇、C<sub>3-8</sub>脂肪酮、C<sub>1-6</sub>脂肪酸、C<sub>1-6</sub>脂肪醇与C<sub>1-6</sub>脂肪醇所形成酯、醚类(如乙醚、异丙醚、甲基叔丁基醚、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、乙二醇二甲醚等)、苯、甲苯或二甲苯、脂肪烃(如:己烷、庚烷、辛烷等),优选溶剂为:四氢呋喃、甲醇、乙醇或异丙醇;催化氢化所用催化剂为:Raney Ni、PtO<sub>2</sub>、1%~30%Pd-C、1%~30% Pd(OH)<sub>2</sub>-C,优选催化剂为:Raney Ni、PtO<sub>2</sub>、5%~20%Pd-C;化合物(4)与催化剂的质量比为1.0:0.01~1.0;反应压力为常压~10.0 MPa,优选为常压~2.0 MPa;反应温度为室温~150℃,优选为室温~80℃;反应时间为1~96小时,优选为2~50小时。

[0021] 按照上述方法所得之3-胺烷基苯酐类化合物(I)分子中含有氨基,该氨基呈碱性,可与任何合适的酸通过药学上常规的成盐方法制得其药学上可接受的盐,所述的酸为:盐酸、氢溴酸、硝酸、硫酸、磷酸、胺基磺酸、C<sub>1-6</sub>脂肪羧酸(如:甲酸、乙酸、丙酸等)、三氟乙酸、硬脂酸、扑酸、草酸、苯甲酸、苯乙酸、水杨酸、马来酸、富马酸、琥珀酸、酒石酸、柠檬酸、苹果酸、乳酸、羟基马来酸、丙酮酸、谷氨酸、抗坏血酸、硫辛酸、C<sub>1-6</sub>烷基磺酸(如:甲基磺酸、乙基磺酸等)、樟脑磺酸、萘磺酸、苯磺酸、对甲苯磺酸或1,4-丁二磺酸。

[0022] 本发明的起始原料——3-溴合物(1)和胺烷基醛类化合物(3)可用本领域常见的技术制得,包括但不限于以下文献中所公开的方法:1、Guidong Z. *et al.* WO 2011130478A1;2、Sakamoto F. *et al.* *Chem. Pharm. Bull.* 1983, 31(8), 2698-2707;3、Chunzhi Z. *et al.* *Chinese Journal of Organic Chemistry* 2014, 34, 1881-1888;4、Sugimoto H. *et al.* US 5100901;5、Mingyu W. *et al.* *European Journal of Medicinal Chemistry* 2016, 121, 864-879。

[0023] 本发明所公开的药物组合物包括治疗有效量的一种或多种3-胺烷基苯酐类化合物(I)或其药学上可接受的盐,该药物组合物可进一步含有一种或多种药学上可接受的载体或赋形剂。所述“治疗有效量”是指引起研究者或医生所针对的组织、系统或动物的生物或医药反应的药物或药剂的量;所述“组合物”是指通过将一种以上物质或组份混和而成的产品;所述“药学上可接受的载体”是指药学上可接受的物质、组合物或载体,如:液体或固体填充剂、稀释剂、赋形剂、溶剂或包囊物质,它们携带或转运某种化学物质。本发明所提供



姜黄素为阳性对照。测定结果表明,本发明实施例中所公开的3-胺烷基苯酐类化合物(I)【包括:化合物(4)的E式和Z式构型目标物】对 $\text{A}\beta_{1-42}$ 自身聚集均具有显著抑制活性,在25.0  $\mu\text{M}$ 浓度下对 $\text{A}\beta_{1-42}$ 自身聚集的抑制率在20.0%~55.0%之间;而临床上广泛使用的抗AD药物:多奈哌齐、卡巴拉汀、盐酸美金刚胺、以及上述对照化合物(II)(其化学结构式中的Y分别表示O、NH或S)和对照化合物(III)在25.0  $\mu\text{M}$ 浓度下对 $\text{A}\beta_{1-42}$ 自身聚集的抑制率均小于10%。

[0030] (3) 3-胺烷基苯酐类化合物(I)的抗血小板聚集活性

[0031] 取雄性家兔3只,用利多卡因局部麻醉,手术分离颈总动脉取血,采取3.8%枸橼酸钠1:9抗凝,以500 r/min离心10分钟,制备富血小板血浆(PRP),剩余部分再以3000 r/min离心,制备贫血小板血浆(PPP),按比浊法进行血小板聚集实验。测定管中加入240  $\mu\text{L}$ 的PRP和30  $\mu\text{L}$ 不同浓度受试药物,温孵5分钟,分别以30  $\mu\text{L}$ 二磷酸腺苷(ADP)(终浓度为10  $\mu\text{mol/L}$ ),30  $\mu\text{L}$ 凝血酶(终浓度为0.5 U/mL)和30  $\mu\text{L}$ 花生四烯酸(AA)(终浓度为1.0 mmol/L)为诱导剂,观察记录5分钟内最大聚集率。用生理盐水(NS)作对照,计算各受试化合物的抑制率(%)。测定结果表明,本发明实施例中所公开的3-胺烷基苯酐类化合物(I)【包括:化合物(4)的E式和Z式构型目标物】对ADP诱导、凝血酶诱导和AA诱导的血小板聚集均有显著抑制作用,其在50.0  $\mu\text{M}$ 浓度下的抑制率均大于25.0%。而临床上广泛使用的抗AD药物:多奈哌齐、卡巴拉汀、盐酸美金刚胺、以及上述对照化合物(II)(其化学结构式中的Y分别表示O、NH或S)和对照化合物(III)在相同浓度下对血小板聚集的抑制率均小于15.0%。

[0032] (4) 3-胺烷基苯酐类化合物(I)对神经炎症的抑制活性

[0033] (a) 化合物和脂多糖(LPS)对BV-2细胞活性的影响

[0034] 取对数生长期的BV-2细胞配成细胞悬液接种于96孔板,置37 $^{\circ}\text{C}$ ,5% $\text{CO}_2$ 细胞培养箱内培养24 h待细胞贴壁后换为无血清的新鲜培养液90  $\mu\text{L}$ ,分别加入各浓度待测化合物10  $\mu\text{L}$ 预孵育30 min,每个浓度3个平行孔,同时设空白对照组;然后加或不加LPS,置37 $^{\circ}\text{C}$ ,5% $\text{CO}_2$ 细胞培养箱内继续培养24 h,加入MTT溶液,37 $^{\circ}\text{C}$ 孵育4 h,弃去上清液,每孔加入200  $\mu\text{L}$ DMSO溶液,轻微振荡10 min后,用酶标仪在490 nm处测定OD值,计算各受试样品不同浓度所测得OD值的均值,并按下列公式计算细胞存活率:细胞存活率(%)= 给药组OD均值/对照组OD均值 $\times$ 100%。测试结果表明,本发明实施例中所公开的所有3-胺烷基苯酐类化合物(I)【包括:化合物(4)的E式和Z式构型目标物】和LPS在不超过25  $\mu\text{M}$ 浓度下均未显示出细胞毒性(抑制率小于<5%)。

[0035] (b) 3-胺烷基苯酐类化合物(I)对LPS诱导的BV-2细胞释放NO的影响

[0036] 取对数生长期的BV-2细胞配成细胞悬液接种于96孔板,置37 $^{\circ}\text{C}$ ,5% $\text{CO}_2$ 细胞培养箱内培养24 h待细胞贴壁后换为无血清的新鲜培养液90  $\mu\text{L}$ ,分别加入各浓度待测化合物10  $\mu\text{L}$ 预孵育30 min,每个浓度3个平行孔,同时设空白对照组;然后加入LPS刺激,置37 $^{\circ}\text{C}$ ,5% $\text{CO}_2$ 细胞培养箱内继续培养24 h,取不同处理组细胞培养上清液,加入等体积的Griess试剂I和等体积的Griess试剂II,室温避光反应10 min,在540 nm处测定吸光度以检测细胞上清液中NO水平(具体操作按照NO检测试剂盒说明书进行)。测试结果表明,本发明实施例中所公开的所有3-胺烷基苯酐类化合物(I)【包括:化合物(4)的E式和Z式构型目标物】在0.5  $\mu\text{M}$ 至25  $\mu\text{M}$ 浓度范围内均显示出较强的抑制LPS诱导的BV-2细胞NO生成作用(在2.5  $\mu\text{M}$ 浓度下的抑制率均超过20.0%),并具有明显的量效关系;且它们的抑制活性较相同浓度下的上述对照化合物(II)(其化学结构式中的Y分别表示O、NH或S)和对照化合物(III)显著增强(n=

6,  $P < 0.05$ ), 表明本发明实施例中所公开的3-胺烷基苯酐类化合物(I)具有显著的抗神经炎症活性。试验还进一步发现, 化合物(I)的手性中心对化合物的抗神经炎症活性无显著影响。

### 具体实施方式

[0037] 通过下面的实施例可对本发明进行进一步的描述, 然而, 本发明的范围并不限于下述实施例。本领域的专业人员能够理解, 在不背离本发明的精神和范围的前提下, 可以对本发明进行各种变化和修饰。

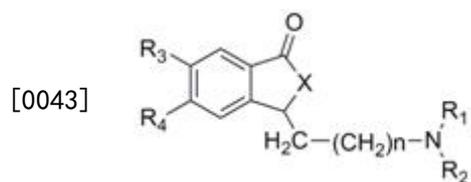
[0038] 实施例1 化合物(4)的制备通法

[0039] 将2.0 mmol相应的3-溴化物(1)、2.4 mmol三苯基膦和20 ml甲苯加入反应瓶中, 升温回流搅拌反应12~24.0小时(反应进程用TLC跟踪); 反应结束后, 将反应液冷至室温, 抽滤, 滤饼依次以甲苯和石油醚洗涤, 干燥, 得相应的3-三苯基膦盐类化合物(2), 收率60.0%-88.0%, 其化学结构均经 $^1\text{H-NMR}$ 确证;

[0040] 将上步制备得到的3-三苯基膦盐类化合物(2) 1.0 mmol、胺烷基醛类化合物(3) 1.3 mmol和二氯甲烷30 ml加入反应瓶中, 搅拌均匀后加入三乙胺1.5 mmol, 然后室温搅拌反应12~24.0小时(反应进程用TLC跟踪); 反应结束后, 减压蒸除溶剂, 残余物中加入30 mL去离子水, 用10%盐酸水溶液调节反应液pH至强酸性, 再用饱和碳酸氢钠水溶液调节反应液pH至弱碱性, 用120 mL二氯甲烷分三次萃取, 有机层合并后用饱和氯化钠水溶液洗涤, 经无水硫酸钠干燥后过滤, 减压蒸除溶剂, 残余物即为化合物(4)的E/Z构型混合物, 收率: 35.6%~85.0%; 将所得混合物用硅胶柱层析分离纯化, 分别得到相应的E-式或Z-式构型化合物, 其化学结构均经 $^1\text{H-NMR}$ 和ESI-MS确证。

[0041] 实施例2 3-胺烷基苯酐类化合物(I)的制备通法

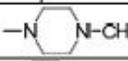
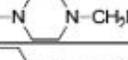
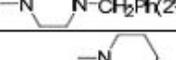
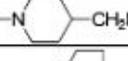
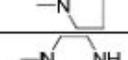
[0042] 将按照实施例1方法所制备得到的化合物(4)混合物1.0 mmol、乙醇25 ml加入反应瓶中, 搅拌均匀后, 加入10%Pd/C 40mg, 通氢气置换三次后, 于室温常压下通氢搅拌反应2.0~24.0小时(反应进程用TLC跟踪), 反应结束后, 减压蒸除溶剂, 残余物经硅胶柱层析纯化(洗脱液: 二氯甲烷: 甲醇=20~30:1 v/v), 得相应的3-胺烷基苯酐类化合物(I), 收率60.5%-92.0%, 其化学结构均经 $^1\text{H-NMR}$ 、 $^{13}\text{C-NMR}$ 和ESI-MS确证; 所得目标物的纯度经HPLC测定均大于97.0%。采用上述通法制备得到的目标物结构如下:



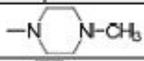
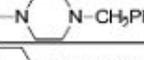
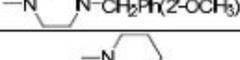
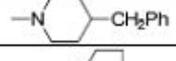
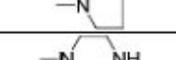
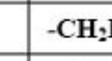
[0044]

化合物 编号	R <sub>3</sub>	R <sub>4</sub>	X	n	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	ESI-MS (+Q) m/z
1-1-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	342.2
1-1-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	372.1
1-1-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	385.2
1-1-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	385.3
1-1-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	356.0
1-1-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	386.2
1-1-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	399.3
1-1-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	399.1
1-2-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	356.2
1-2-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	386.2
1-2-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	440.1
1-2-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	370.2

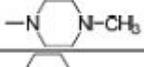
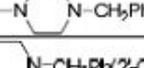
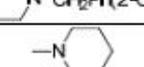
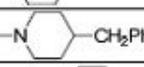
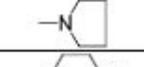
[0045]

1-2-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	424.2
1-2-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	390.2
1-2-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	374.0
1-2-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	434.1
1-2-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	399.2
1-2-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	399.2
1-2-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	370.1
1-2-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	400.3
1-2-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	454.2
1-2-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	384.2
1-2-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	438.3
1-2-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	404.0
1-2-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	388.2
1-2-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	448.3
1-2-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	413.1
1-2-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	413.2
1-2-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	280.0
1-2-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	308.2
1-2-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	294.2
1-2-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			335.2
1-2-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			411.2
1-2-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			441.3
1-2-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			320.2
1-2-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			322.1
1-2-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			348.0
1-2-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			410.2
1-2-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			306.0
1-2-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	2			321.2
1-3-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	370.0
1-3-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	400.1
1-3-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	454.2
1-3-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	384.1

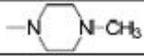
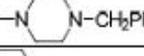
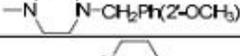
[0046]

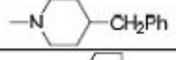
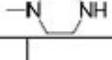
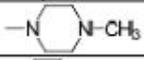
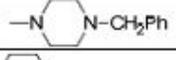
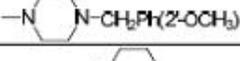
1-3-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	438.2
1-3-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	404.3
1-3-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	388.1
1-3-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	448.3
1-3-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	413.1
1-3-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	413.2
1-3-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	384.0
1-3-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	414.2
1-3-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	468.3
1-3-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	398.1
1-3-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	452.2
1-3-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	418.2
1-3-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	402.1
1-3-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	462.2
1-3-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	427.2
1-3-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	427.2
1-3-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	294.1
1-3-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	322.1
1-3-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	308.0
1-3-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			349.1
1-3-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			425.3
1-3-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			455.2
1-3-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			334.0
1-3-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			336.2
1-3-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			362.2
1-3-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			424.1
1-3-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			320.1
1-3-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	3			335.0
1-5-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	398.2
1-5-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	428.3
1-5-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	482.2
1-5-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	412.0

[0047]

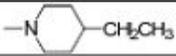
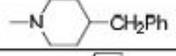
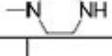
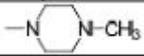
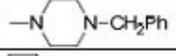
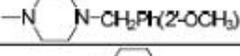
1-5-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	466.3
1-5-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	432.2
1-5-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	416.2
1-5-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	476.3
1-5-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	441.0
1-5-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	441.2
1-5-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	412.2
1-5-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	442.2
1-5-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	496.3
1-5-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	426.2
1-5-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	480.2
1-5-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	446.1
1-5-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	430.3
1-5-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	490.2
1-5-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	455.2
1-5-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	455.3
1-5-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	322.1
1-5-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	350.2
1-5-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	336.3
1-5-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			377.1
1-5-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			453.3
1-5-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			483.3
1-5-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			362.0
1-5-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			364.0
1-5-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			390.2
1-5-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			452.3
1-5-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			348.1
1-5-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	5			363.0
1-7-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	426.2
1-7-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	456.2
1-7-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	469.3
1-7-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	469.1

[0048]

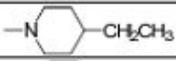
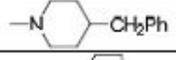
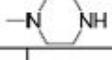
1-7-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	440.2
1-7-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	470.2
1-7-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	483.3
1-7-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	483.4
2-2-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	372.2
2-2-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	402.1
2-2-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	456.3
2-2-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	386.1
2-2-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	440.2
2-2-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	406.3
2-2-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	390.1
2-2-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	450.2
2-2-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	415.2
2-2-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	415.3
2-2-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	386.0
2-2-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	416.2
2-2-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	470.1
2-2-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	400.0
2-2-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	454.2
2-2-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	420.2
2-2-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	404.2
2-2-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	464.2
2-2-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	429.2
2-2-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	429.3
2-2-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	296.1
2-2-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	324.1
2-2-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	310.0
2-2-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2			351.0
2-2-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2			427.1
2-2-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2			457.2
2-2-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2			336.1
2-2-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2			338.0

2-2-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2		364.2	
2-2-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2		426.0	
2-2-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2		322.1	
2-2-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	2		337.1	
2-3-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	386.2
2-3-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	416.0
2-3-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	470.3
2-3-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	400.0
2-3-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	454.1
2-3-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	420.1
2-3-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	404.2
2-3-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	464.2
2-3-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	429.2
2-3-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	429.3
2-3-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	400.2
2-3-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	430.-
2-3-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	484.2
2-3-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	414.0
2-3-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	468.3
2-3-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	434.2
2-3-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	418.2
2-3-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	478.3
2-3-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	443.0
2-3-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	443.2
2-3-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	310.0
2-3-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	338.0
2-3-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	324.1
2-3-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		365.0	
2-3-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		441.2	
2-3-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		471.0	
2-3-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		350.2	
2-3-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		352.1	

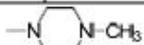
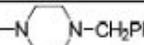
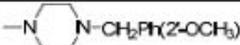
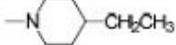
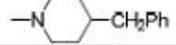
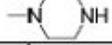
[0049]

2-3-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		378.0	
2-3-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		440.2	
2-3-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		336.0	
2-3-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	3		351.2	
2-5-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	414.2
2-5-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	444.2
2-5-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	498.3
2-5-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	428.1
2-5-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	482.2
2-5-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	448.3
2-5-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	432.2
2-5-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	492.2
2-5-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	457.2
2-5-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	457.1
2-5-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	428.1
2-5-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	458.3
2-5-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	512.2
2-5-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	442.1
2-5-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	496.2
2-5-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	462.3
2-5-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	446.2
2-5-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	506.4
2-5-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	471.3
2-5-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	471.2
2-5-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	338.0
2-5-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	366.2
2-5-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	352.1
2-5-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		393.0	
2-5-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		469.2	
2-5-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		499.2	
2-5-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		378.1	
2-5-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		380.2	

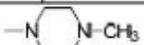
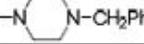
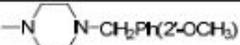
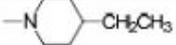
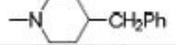
[0050]

2-5-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		406.3	
2-5-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		468.2	
2-5-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		364.0	
2-5-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	5		379.2	
2-7-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	442.1
2-7-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	472.3
2-7-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	485.2
2-7-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	485.2
2-7-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	456.2
2-7-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	486.3
2-7-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	499.2
2-7-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	S	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	499.3
3-2-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	355.1
3-2-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	385.2
3-2-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	439.2
3-2-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	369.0
3-2-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	423.2
3-2-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	389.1
3-2-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	373.2
3-2-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	433.3
3-2-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	398.2
3-2-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	398.1
3-2-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	369.0
3-2-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	399.2
3-2-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	453.3
3-2-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	383.1
3-2-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	437.2
3-2-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	403.0
3-2-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	387.2
3-2-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	447.2
3-2-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	412.2
3-2-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	412.3

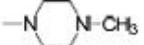
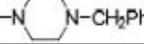
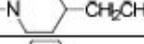
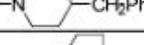
[0051]

3-2-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	279.0
3-2-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	307.1
3-2-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	293.1
3-2-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			334.0
3-2-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			410.2
3-2-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			440.2
3-2-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			319.0
3-2-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			321.2
3-2-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			347.0
3-2-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			409.1
3-2-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			305.2
3-2-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	2			320.1
3-3-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	369.2
3-3-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	399.2
3-3-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	453.3
3-3-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	383.2
3-3-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	437.3
3-3-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	403.2
3-3-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	387.2
3-3-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	447.3
3-3-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	412.2
3-3-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	412.2
3-3-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	383.1
3-3-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	413.1
3-3-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	467.4
3-3-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	397.2
3-3-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	451.2
3-3-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	417.0
3-3-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	401.2
3-3-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	461.3
3-3-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	426.3
3-3-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	426.1

[0052]

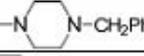
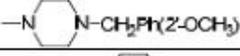
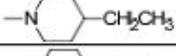
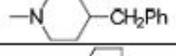
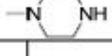
3-3-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	293.0
3-3-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	321.1
3-3-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	307.1
3-3-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			348.2
3-3-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			424.2
3-3-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			454.3
3-3-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			333.2
3-3-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			335.0
3-3-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			361.2
3-3-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			423.3
3-3-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			319.2
3-3-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	3			334.0
3-5-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	397.2
3-5-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	427.2
3-5-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	481.4
3-5-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	411.2
3-5-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	465.2
3-5-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	431.2
3-5-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	415.1
3-5-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	475.2
3-5-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	440.2
3-5-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	440.0
3-5-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	411.2
3-5-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	441.3
3-5-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	495.4
3-5-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	425.2
3-5-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	479.3
3-5-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	445.2
3-5-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	429.1
3-5-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	489.3
3-5-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	454.2
3-5-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	454.2

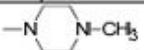
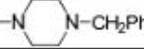
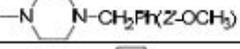
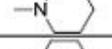
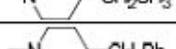
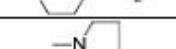
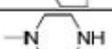
[0053]

3-5-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	321.0
3-5-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	349.3
3-5-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	335.2
3-5-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			376.2
3-5-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			452.2
3-5-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			482.2
3-5-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			361.0
3-5-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			363.2
3-5-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			389.0
3-5-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			451.2
3-5-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			347.0
3-5-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	5			362.2
3-7-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	425.3
3-7-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	455.2
3-7-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	468.2
3-7-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	468.3
3-7-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	439.1
3-7-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	469.4
3-7-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	482.2
3-7-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NH	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	482.3
4-2-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	369.2
4-2-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	399.1
4-2-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	453.3
4-2-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	383.2
4-2-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	437.3
4-2-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	403.2
4-2-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	387.2
4-2-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	447.2
4-2-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	412.0
4-2-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	412.2
4-2-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	383.1
4-2-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	413.0

[0054]

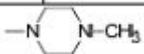
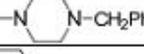
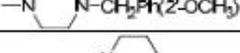
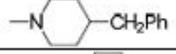
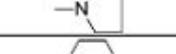
[0055]

4-2-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	467.2
4-2-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	397.2
4-2-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	451.3
4-2-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	417.1
4-2-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	401.0
4-2-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	461.3
4-2-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	426.2
4-2-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	426.2
4-2-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	293.1
4-2-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	321.0
4-2-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	307.0
4-2-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			348.2
4-2-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			424.3
4-2-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			454.1
4-2-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			333.1
4-2-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			335.0
4-2-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			361.0
4-2-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			423.2
4-2-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			319.0
4-2-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	2			334.2
4-3-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	383.1
4-3-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	413.2
4-3-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	467.2
4-3-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	397.0
4-3-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	451.2
4-3-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	417.0
4-3-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	401.1
4-3-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	461.2
4-3-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	426.2
4-3-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	426.3
4-3-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	397.2
4-3-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	427.0

4-3-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	481.3
4-3-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	411.1
4-3-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	465.1
4-3-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	431.2
4-3-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	415.3
4-3-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	475.2
4-3-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	440.2
4-3-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	440.2
4-3-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	307.2
4-3-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	335.0
4-3-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	321.0
4-3-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			362.2
4-3-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			438.3
4-3-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			468.2
4-3-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			347.1
4-3-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			349.1
4-3-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			375.0
4-3-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			437.2
4-3-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			333.0
4-3-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	3			348.2
4-5-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	411.1
4-5-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	441.0
4-5-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	495.3
4-5-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	425.3
4-5-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	479.3
4-5-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	445.2
4-5-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	429.2
4-5-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	489.3
4-5-9	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	454.2
4-5-10	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	454.2
4-5-11	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	425.1
4-5-12	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	455.0

[0056]

[0057]

4-5-13	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCF <sub>3</sub> )	509.2
4-5-14	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CH <sub>3</sub> )	439.3
4-5-15	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-CF <sub>3</sub> )	493.2
4-5-16	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-Cl)	459.2
4-5-17	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-F)	443.2
4-5-18	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(3'-Br)	503.4
4-5-19	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	468.3
4-5-20	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	468.2
4-5-21	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	335.1
4-5-22	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	363.0
4-5-23	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	349.0
4-5-24	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			390.1
4-5-25	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			466.3
4-5-26	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			496.4
4-5-27	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			375.1
4-5-28	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			377.0
4-5-29	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			403.2
4-5-30	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			465.3
4-5-31	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			361.1
4-5-32	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	5			376.0
4-7-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	439.2
4-7-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	469.2
4-7-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	482.3
4-7-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	7	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	482.2
4-7-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	453.2
4-7-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	483.3
4-7-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	496.3
4-7-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	496.4
5-3-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	445.3
5-3-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	475.2
5-3-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	488.3
5-3-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	488.2

[0058]

5-3-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	459.2
5-3-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	489.1
5-3-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	502.2
5-3-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	502.3
5-5-1	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	473.1
5-5-2	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	503.3
5-5-3	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	516.2
5-5-4	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	5	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	516.2
5-5-5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	487.3
5-5-6	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	517.2
5-5-7	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	530.4
5-5-8	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NPh	5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	530.2
6-2-1	H	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	296.2
6-2-2	H	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	326.2
6-2-3	H	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	314.1
6-2-4	H	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	339.2
6-2-5	H	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	339.0
6-2-6	H	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	310.2
6-2-7	H	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	340.0
6-2-8	H	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	328.2
6-2-9	H	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	353.1
6-2-10	H	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	353.2
6-3-1	H	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	310.0
6-3-2	H	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	340.3
6-3-3	H	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	328.2
6-3-4	H	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	353.1
6-3-5	H	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	353.2
6-3-6	H	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	324.2
6-3-7	H	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	354.1
6-3-8	H	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	342.1
6-3-9	H	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	367.2
6-3-10	H	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	367.2

[0059]

7-2-1	Br	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	374.1
7-2-2	Br	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	404.3
7-2-3	Br	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	392.0
7-2-4	Br	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	417.3
7-2-5	Br	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	417.2
7-2-6	Br	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	388.2
7-2-7	Br	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	418.2
7-2-8	Br	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	406.2
7-2-9	Br	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	431.2
7-2-10	Br	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	431.3
7-4-1	Br	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	402.2
7-4-2	Br	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	432.2
7-4-3	Br	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	420.0
7-4-4	Br	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	445.1
7-4-5	Br	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	445.2
7-4-6	Br	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	416.1
7-4-7	Br	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	446.3
7-4-8	Br	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	434.2
7-4-9	Br	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	459.3
7-4-10	Br	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	459.2
8-2-1	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	339.0
8-2-2	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	369.2
8-2-3	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	357.0
8-2-4	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	382.1
8-2-5	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	382.2
8-2-6	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	353.1
8-2-7	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	383.2
8-2-8	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	371.2
8-2-9	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	396.2
8-2-10	Me <sub>2</sub> N	H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	396.0
8-4-1	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	367.2
8-4-2	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	397.3

[0060]

8-4-3	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	385.1
8-4-4	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	410.2
8-4-5	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	410.2
8-4-6	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	381.0
8-4-7	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	411.2
8-4-8	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	399.0
8-4-9	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	424.3
8-4-10	Me <sub>2</sub> N	H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	424.2
9-2-1		H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	365.1
9-2-2		H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	395.0
9-2-3		H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	383.2
9-2-4		H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	408.2
9-2-5		H	O	2	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	408.1
9-2-6		H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	379.0
9-2-7		H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	409.2
9-2-8		H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	397.1
9-2-9		H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	422.3
9-2-10		H	O	2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	422.2
9-4-1		H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	393.2
9-4-2		H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	423.1
9-4-3		H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	411.2
9-4-4		H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	436.2
9-4-5		H	O	4	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	436.1
9-4-6		H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	407.0
9-4-7		H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	437.3
9-4-8		H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	425.2
9-4-9		H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	450.2
9-4-10		H	O	4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	450.3
10-3-1	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	356.2
10-3-2	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	386.1
10-3-3	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	374.2
10-3-4	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	399.1

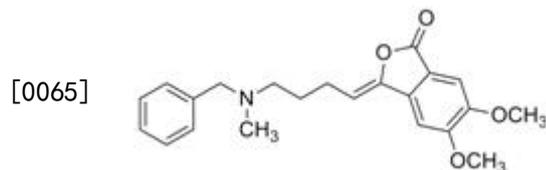
[0061]

10-3-5	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	399.2
10-3-6	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	370.0
10-3-7	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	400.2
10-3-8	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	388.2
10-3-9	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	413.0
10-3-10	OH	OCH <sub>3</sub>	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	413.1
11-3-1	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	356.1
11-3-2	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	386.2
11-3-3	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	374.1
11-3-4	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	399.0
11-3-5	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	399.0
11-3-6	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	370.2
11-3-7	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	400.1
11-3-8	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	388.0
11-3-9	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	413.2
11-3-10	OCH <sub>3</sub>	OH	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	413.2
12-3-1	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	356.2
12-3-2	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	386.0
12-3-3	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	374.0
12-3-4	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	399.2
12-3-5	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	399.1
12-3-6	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	370.0
12-3-7	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	400.2
12-3-8	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	388.2
12-3-9	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	413.1
12-3-10	SCH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	413.2
13-3-1	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	324.0
13-3-2	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	354.1
13-3-3	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	342.0
13-3-4	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	367.1
13-3-5	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	367.2
13-3-6	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	338.1

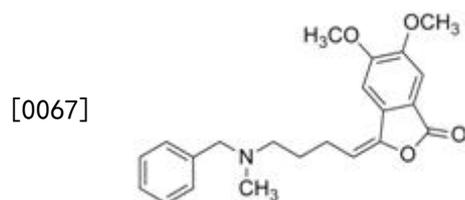
[0062]	13-3-7	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-OCH <sub>3</sub> )	368.0
	13-3-8	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-F)	356.2
	13-3-9	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(2'-NMe <sub>2</sub> )	381.0
	13-3-10	CH <sub>3</sub>	H	O	3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph(4'-NMe <sub>2</sub> )	381.2

[0063] 注:表中R<sub>1</sub>和R<sub>2</sub>共用一个单元格时,表示取代基“-NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>”;

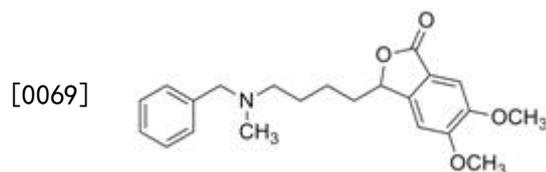
[0064] 部分化合物的<sup>1</sup>H-NMR数据如下:



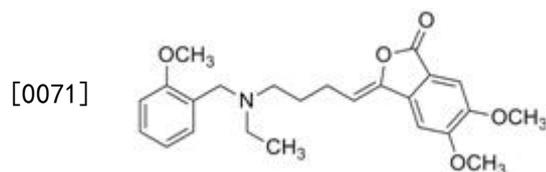
[0066] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>): 7.35-7.27 (m, 4H), 7.26-7.24 (m, 2H), 6.96 (s, 1H), 5.46 (t, *J* = 7.6 Hz, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 3.55 (s, 2H), 2.50 (q, *J* = 7.6 Hz, 2H), 2.49 (t, *J* = 7.6 Hz, 2H), 2.21 (s, 3H), 1.81-1.75 (m, 2H);



[0068] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>): 7.30 (s, 1H), 7.29-7.26 (m, 5H), 7.21 (s, 1H), 5.71 (t, *J* = 8.4 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 3.57 (s, 2H), 2.60 (q, *J* = 8.4 Hz, 2H), 2.57-2.53 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.84 (t, *J* = 7.2 Hz, 2H);

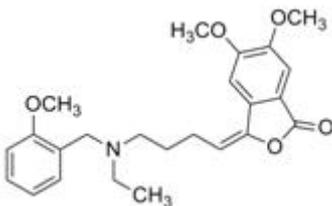


[0070] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>): 7.32-7.25 (m, 6H), 6.80 (s, 1H), 5.37 (dd, *J* = 3.6, 7.6 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 3.52 (s, 2H), 2.41 (t, *J* = 6.8 Hz, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.04-1.99 (m, 1H), 1.73-1.69 (m, 1H), 1.62-1.58 (m, 2H), 1.54-1.47 (m, 2H);



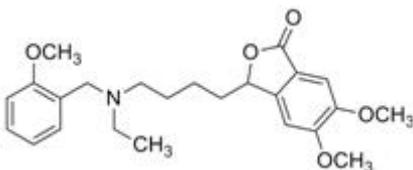
[0072] <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>): 7.67 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.33 (t, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.98 (t, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.89 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 5.53 (t, *J* = 8.0 Hz, 1H), 4.24 (s, 2H), 4.03 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 3.07 (q, *J* = 8.0 Hz, 2H), 2.96 (t, *J* = 6.8 Hz, 2H), 2.48 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 2.21-2.17 (m, 2H), 1.44 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H);

[0073]



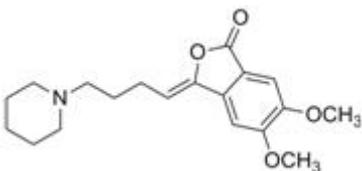
[0074]  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ): 7.46 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.29 (s, 1H), 7.25 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.20 (s, 1H), 6.90 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 6.84 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 5.67 (t,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 3.78 (s, 5H), 2.78-2.70 (m, 4H), 2.62 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 1.98-1.88 (m, 2H), 1.16 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H);

[0075]



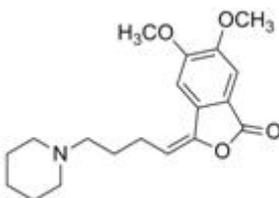
[0076]  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ): 7.44 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.23 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 6.94 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 6.86 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 6.81 (s, 1H), 5.35 (dd,  $J = 3.6, 7.6$  Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.71 (s, 2H), 2.63 (q,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 2.55 (t,  $J = 7.2$  Hz, 2H), 2.04-1.99 (m, 1H), 1.73-1.64 (m, 3H), 1.56-1.47 (m, 2H), 1.12 (t,  $J = 6.8$  Hz, 3H);

[0077]



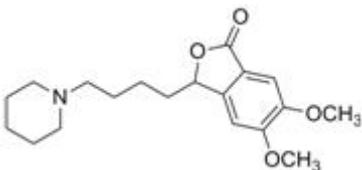
[0078]  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ): 7.24 (s, 1H), 7.02 (s, 1H), 5.52 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 2.62-2.55 (m, 6H), 2.49 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 1.92-1.85 (m, 2H), 1.75-1.72 (m, 4H), 1.55-1.50 (m, 2H);

[0079]



[0080]  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ): 7.30 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 5.73 (t,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.97 (s, 3H), 2.59 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 2.47 (t,  $J = 7.2$  Hz, 6H), 1.87-1.80 (m, 2H), 1.64-1.60 (m, 4H), 1.48-1.45 (m, 2H);

[0081]



[0082]  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ): 7.26 (s, 1H), 6.89 (s, 1H), 5.40 (dd,  $J = 3.2, 8.0$  Hz, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 2.95-2.90 (m, 4H), 2.78 (t,  $J = 8.0$  Hz, 2H),

2.20-2.12 (m, 1H), 1.95-1.88 (m, 6H), 1.80-1.71 (m, 1H), 1.61-1.45 (m, 4H)。

[0083] 实施例3 3-胺烷基苯酐类化合物(I)与酸成盐制备通法

[0084] 在反应瓶中加入按照上述实施例1和实施例2所得之3-胺烷基苯酐类化合物(I) 1.0 mmol和丙酮25 ml,搅拌均匀后加入2.5 mmol相应的酸,升温回流搅拌反应20分钟,反应结束后冷却至室温,减压蒸除溶剂,经常规方法分离纯化即得3-胺烷基苯酐类化合物(I)的盐,其化学结构经<sup>1</sup>H NMR和ESI-MS确证。