

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第6603720号
(P6603720)

(45) 発行日 令和1年11月6日(2019.11.6)

(24) 登録日 令和1年10月18日(2019.10.18)

(51) Int.Cl.		F I	
AO 1 N 43/40	(2006.01)	AO 1 N 43/40	1 O 1 E
AO 1 P 3/00	(2006.01)	AO 1 P 3/00	
AO 1 N 47/12	(2006.01)	AO 1 N 47/12	Z
AO 1 N 37/02	(2006.01)	AO 1 N 37/02	

請求項の数 29 (全 319 頁)

(21) 出願番号	特願2017-534643 (P2017-534643)	(73) 特許権者	501035309
(86) (22) 出願日	平成27年12月21日 (2015.12.21)		ダウ アグロサイエンシズ エルエルシ
(65) 公表番号	特表2018-500367 (P2018-500367A)		ー
(43) 公表日	平成30年1月11日 (2018.1.11)		アメリカ合衆国 インディアナ州 462
(86) 国際出願番号	PCT/US2015/067204		68, インディアナポリス, ジオンス
(87) 国際公開番号	W02016/109303		ヴィレ ロード, 9330
(87) 国際公開日	平成28年7月7日 (2016.7.7)	(74) 代理人	100092783
審査請求日	平成30年12月10日 (2018.12.10)		弁理士 小林 浩
(31) 優先権主張番号	62/098,089	(74) 代理人	100095360
(32) 優先日	平成26年12月30日 (2014.12.30)		弁理士 片山 英二
(33) 優先権主張国・地域又は機関	米国 (US)	(74) 代理人	100120134
(31) 優先権主張番号	62/098,097		弁理士 大森 規雄
(32) 優先日	平成26年12月30日 (2014.12.30)	(74) 代理人	100126354
(33) 優先権主張国・地域又は機関	米国 (US)		弁理士 藤田 尚

最終頁に続く

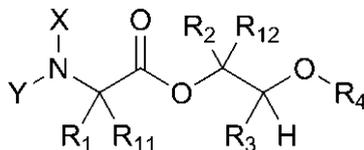
(54) 【発明の名称】 殺真菌活性を有するピコリンアミド化合物の使用

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :

【化1】



I

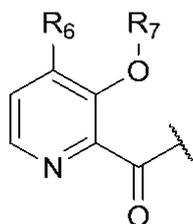
[式中、

X は、水素または C (O) R₅ であり ;

Y は、水素、C (O) R₅ または Q であり ;

Q は、下記式 :

【化 2】



であり；

R₁ および R₁₁ は、水素またはアルキルから独立して選択され、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており； 10

あるいは、R₁ および R₁₁ は一緒になって、3員～6員の飽和または部分的に飽和されている炭素環式または複素環式の環を形成してもよく、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており；

R₂ および R₁₂ は、水素、アルキル、アリールまたはアルケニルから独立して選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており；

R₃ は、メチルであり；

R₄ は、アルキル、アリールまたはアシルから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており；

R₅ は、アルコキシまたはベンジルオキシから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており； 20

R₆ は、水素、アルコキシまたはハロゲンから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており；

R₇ は、水素、-C(O)R₉ または -CH₂OC(O)R₉ から選択され；

R₈ は、水素、アルキル、アリール、アシル、ハロゲン、アルケニル、アルコキシまたはヘテロシクリルから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R₁₀ で任意選択で置換されており；

R₉ は、アルキル、アルコキシまたはアリールから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており；

R₁₀ は、水素、アルキル、アリール、アシル、ハロゲン、アルケニル、アルコキシまたはヘテロシクリルから選択される] の少なくとも1つの化合物の混合物を含む、真菌病原体の防除のための組成物。 30

【請求項 2】

X が水素であり、Y が Q である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

R₆ がアルコキシである、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

R₇ が水素である、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 5】

R₁ および R₁₁ が、水素またはアルキルから独立して選択され、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されている、請求項 4 に記載の組成物。 40

【請求項 6】

R₂ および R₁₂ が、水素またはアルキルから独立して選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されている、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 7】

R₄ がアリールであり、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されている、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 8】

R₁ および R₁₁ が水素またはアルキルから独立して選択され、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており、R₂ および R₁₂ が水素またはアルキルから独立し 50

て選択され、それぞれ 0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており、R₄ がアリアルであり、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されている、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 9】

R₇ が、-C(O)R₉ または -CH₂O C(O)R₉ から選択される、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 10】

R₁ および R₁₁ が、水素またはアルキルから独立して選択され、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されている、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

R₂ および R₁₂ が、水素またはアルキルから独立して選択され、それぞれ 0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されている、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 12】

R₄ がアリアルであり、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されている、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 13】

R₁ および R₁₁ が水素またはアルキルから独立して選択され、R₂ および R₁₂ が水素またはアルキルから独立して選択され、それぞれ 0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されており、R₄ がアリアルであり、0、1つ、または複数の R₈ で任意選択で置換されている、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 14】

R₉ が、-CH₃、-CH₂OCH₂CH₃、-CH₂CH₂OCH₃、-CH(CH₃)₂、-CH₂CH₂CH₂CH₃、-シクロプロピルから選択される、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

請求項 8 に記載の少なくとも 1 つの組成物と、植物学的に許容される担体材料とを含む、真菌病原体の防除のための組成物。

【請求項 16】

請求項 13 に記載の少なくとも 1 つの組成物と、植物学的に許容される担体材料とを含む、真菌病原体の防除のための組成物。

【請求項 17】

請求項 14 に記載の少なくとも 1 つの組成物と、植物学的に許容される担体材料とを含む、真菌病原体の防除のための組成物。

【請求項 18】

請求項 8 に記載の少なくとも 1 つの組成物と、殺真菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、節足動物駆除剤、殺菌剤およびこれらの組み合わせを含む別の殺有害生物剤との混合物を含む、真菌病原体の防除のための組成物。

【請求項 19】

請求項 13 に記載の少なくとも 1 つの組成物と、殺真菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、節足動物駆除剤、殺菌剤およびこれらの組み合わせを含む別の殺有害生物剤との混合物を含む、真菌病原体の防除のための組成物。

【請求項 20】

請求項 14 に記載の少なくとも 1 つの組成物と、殺真菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、節足動物駆除剤、殺菌剤およびこれらの組み合わせを含む別の殺有害生物剤との混合物を含む、真菌病原体の防除のための組成物。

【請求項 21】

前記真菌病原体が、コムギの葉枯病 (チモセプトリアトリチシ (*Zymoseptoria tritici*))、コムギ褐色さび病 (プッシニアトリチシナ (*Puccinia triticina*))、紋さび病 (プッシニアストリイホルミス (*Puccinia striiformis*))、リンゴのそうか病 (ベンツリアイナエクアリス (*Venturia inaequalis*))、トウモロコシの黒穂病 (Blister Smut)

10

20

30

40

50

(ウスチラゴマイジス (*Ustilago maydis*))、ブドウのうどんこ病(ウンシヌラネカトル (*Uncinula necator*))、オオムギ雲形病(リンコスポリウムセカリス (*Rhynchosporium secalis*))、イネのいもち病(ピリクラオリザ (*Pyricularia oryzae*))、ダイズのさび病(ファコプソラパキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*))、コムギの包えい枯病(レプトスファエリアノドルム (*Leptosphaeria nodorum*))、コムギのうどんこ病(ブルメリアグラミニス分化型トリチチ (*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*))、オオムギのうどんこ病(ブルメリアグラミニス分化型ホルデイ (*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*))、ウリ科植物のうどんこ病(エリシフェシコラセアルム (*Erysiphe cichoracearum*))、ウリ科植物の炭疽病(コレトトリクムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*))、カエンサイの葉斑病(セルコスボラベチコラ (*Cercospora beticola*))、トマトの夏疫病(アルテルナリアソラニ (*Alternaria solani*))およびオオムギの網斑病(ピレノホラテレス (*Pyrenophora teres*))のうちの1つである、請求項1に記載の組成物。

10

【請求項22】

前記真菌病原体が、コムギの葉枯病(チモセプトリアトリチシ (*Zymoseptoria tritici*))、コムギ褐色さび病(プッシニアトリチシナ (*Puccinia triticina*))、ダイズのさび病(ファコプソラパキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*))、リンゴのそうか病(ベンツリアイナエクアリス (*Venturia inaequalis*))、オオムギ雲形病(リンコスポリウムセカリス (*Rhynchosporium secalis*))、イネのいもち病(ピリクラオリザ (*Pyricularia oryzae*))、コムギの包えい枯病(レプトスファエリアノドルム (*Leptosphaeria nodorum*))、ウリ科植物の炭疽病(コレトトリクムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*))、カエンサイの葉斑病(セルコスボラベチコラ (*Cercospora beticola*))およびトマトの夏疫病(アルテルナリアソラニ (*Alternaria solani*))のうちの1つである、請求項8に記載の組成物。

20

【請求項23】

前記真菌病原体が、コムギの葉枯病(チモセプトリアトリチシ (*Zymoseptoria tritici*))、コムギ褐色さび病(プッシニアトリチシナ (*Puccinia triticina*))、ダイズのさび病(ファコプソラパキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*))、リンゴのそうか病(ベンツリアイナエクアリス (*Venturia inaequalis*))、オオムギ雲形病(リンコスポリウムセカリス (*Rhynchosporium secalis*))、イネのいもち病(ピリクラオリザ (*Pyricularia oryzae*))、コムギの包えい枯病(レプトスファエリアノドルム (*Leptosphaeria nodorum*))、ウリ科植物の炭疽病(コレトトリクムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*))、カエンサイの葉斑病(セルコスボラベチコラ (*Cercospora beticola*))およびトマトの夏疫病(アルテルナリアソラニ (*Alternaria solani*))のうちの1つである、請求項13に記載の組成物。

30

【請求項24】

前記真菌病原体が、コムギの葉枯病(チモセプトリアトリチシ (*Zymoseptoria tritici*))、コムギ褐色さび病(プッシニアトリチシナ (*Puccinia triticina*))、ダイズのさび病(ファコプソラパキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*))、リンゴのそうか病(ベンツリアイナエクアリス (*Venturia inaequalis*))、オオムギ雲形病(リンコスポリウムセカリス (*Rhynchosporium secalis*))、イネのいもち病(ピリクラオリザ (*Pyricularia oryzae*))、コムギの包えい枯病(レプトスファエリアノドルム (*Leptosphaeria nodorum*))、ウリ科植物の炭疽病(コレトトリクムラゲナリウム (*Colletotrichum lagenarium*))、カエンサイの葉斑病(セルコスボラベチコラ (*Cercospora beticola*))およびトマトの夏疫病(アルテルナリアソラニ (*Alternaria solani*))のうちの1つである、請求項14に記載の組成物。

40

【請求項25】

植物への真菌攻撃を防除および予防する方法であって、殺真菌有効量の請求項8に記載の少なくとも1つの組成物を、前記植物、前記植物に隣接する区域、前記植物の成長を支持するように適合された土壌、前記植物の根および前記植物の葉のうちの少なくとも1つに施用する工程を含む、方法。

50

【請求項 26】

植物への真菌攻撃を防除および予防する方法であって、殺真菌有効量の請求項 13 に記載の少なくとも 1 つの組成物を、前記植物、前記植物に隣接する区域、前記植物の成長を支持するように適合された土壌、前記植物の根および前記植物の葉のうちの少なくとも 1 つに施用する工程を含む、方法。

【請求項 27】

植物への真菌攻撃を防除および予防する方法であって、殺真菌有効量の請求項 14 に記載の少なくとも 1 つの組成物を、前記植物、前記植物に隣接する区域、前記植物の成長を支持するように適合された土壌、前記植物の根および前記植物の葉のうちの少なくとも 1 つに施用する工程を含む、方法。

10

【請求項 28】

植物への真菌攻撃を防除および予防する方法であって、殺真菌有効量の請求項 17 に記載の少なくとも 1 つの組成物を、前記植物、前記植物に隣接する区域、前記植物の成長を支持するように適合された土壌、前記植物の根および前記植物の葉のうちの少なくとも 1 つに施用する工程を含む、方法。

【請求項 29】

植物への真菌攻撃を防除および予防する方法であって、殺真菌有効量の請求項 20 に記載の少なくとも 1 つの組成物を、前記植物、前記植物に隣接する区域、前記植物の成長を支持するように適合された土壌、前記植物の根および前記植物の葉のうちの少なくとも 1 つに施用する工程を含む、方法。

20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

関連出願の相互参照

本出願は、2014年12月30日出願の米国特許仮出願第62/098089号、2014年12月30日出願の同第62/098097号、2015年11月13日出願の同第62/255125号、および2015年11月13日出願の同第62/255131号の利益を主張し、これらは参照として本明細書に明確に組み込まれる。

【背景技術】

【0002】

殺真菌剤は、農学的に関連する真菌により引き起こされる被害に対して植物を保護および/または治療するように作用する、天然または合成由来の化合物である。一般に、全ての状況に有用な単一の殺真菌剤はない。したがって、良好な性能を有することができ、使用が容易であり、安価である殺真菌剤を製造するために、研究が進行中である。

30

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

本開示は、ピコリンアミドおよび殺真菌剤としてのそれらの使用に関する。本開示の化合物は、子囊菌綱、担子菌綱、不完全菌綱および卵菌綱に対して保護を提供することができる。

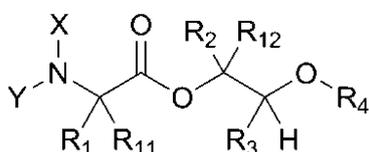
40

【0004】

本開示の 1 つの実施形態は、式 I :

【0005】

【化 1】



I

50

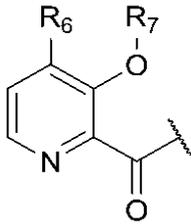
[式中、X は、水素または $C(O)R_5$ であり；

Y は、水素、 $C(O)R_5$ または Q であり；

Q は、下記式：

【 0 0 0 6 】

【 化 2 】



10

であり；

R_1 および R_{11} は、水素またはアルキルから独立して選択され、0、1つ、または複数の R_8 で任意選択で置換されており；

あるいは、 R_1 および R_{11} は一緒になって、3員～6員の飽和または部分的に飽和されている炭素環式または複素環式の環を形成してもよく、0、1つ、または複数の R_8 で任意選択で置換されており；

R_2 および R_{12} は、水素、アルキル、アリアルまたはアルケニルから独立して選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R_8 で任意選択で置換されており；

20

R_3 は、メチルであり；

R_4 は、アルキル、アリアルまたはアシルから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R_8 で任意選択で置換されており；

R_5 は、アルコキシまたはベンジルオキシから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R_8 で任意選択で置換されており；

R_6 は、水素、アルコキシまたはハロゲンから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R_8 で任意選択で置換されており；

R_7 は、水素、 $-C(O)R_9$ または $-CH_2OC(O)R_9$ から選択され；

R_8 は、水素、アルキル、アリアル、アシル、ハロゲン、アルケニル、アルコキシまたはヘテロシクリルから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R_{10} で任意選択で置換されており；

30

R_9 は、アルキル、アルコキシまたはアリアルから選択され、それぞれ0、1つ、または複数の R_8 で任意選択で置換されており；

R_{10} は、水素、アルキル、アリアル、アシル、ハロゲン、アルケニル、アルコキシまたはヘテロシクリルから選択される]の化合物を含むことができる。

【 0 0 0 7 】

本開示の別の実施形態は、上記に記載された化合物および植物学的に許容される担体材料を含む、真菌攻撃を防除または予防するための殺真菌組成物を含むことができる。

【 0 0 0 8 】

本開示のなお別の実施形態は、植物への真菌攻撃を防除または予防する方法であって、殺真菌有効量の上記に記載された1つ以上の化合物を、少なくとも1つの真菌、植物および植物に隣接する区域に施用する工程を含む方法を含むことができる。

40

【 0 0 0 9 】

以下の用語がそれらの定義の範囲内で一般的な「R」基を含むことができ、例えば、「用語アルコキシが、 $-OR$ 置換基を指す」ことは、当業者によって理解される。以下の用語の定義に範囲内で、これらの「R」基が例示目的で含まれ、式Iにおける置換を限定するものまたは式Iにおける置換により限定されるものとして考慮されるべきではないことも、理解される。

【 0 0 1 0 】

用語「アルキル」は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、イソプロピル、イソブチル

50

、第三級ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどが含まれるが、これらに限定されない、分岐鎖、非分岐鎖または飽和環状の炭素鎖を指す。

【0011】

用語「アルケニル」は、エテニル、プロベニル、ブテニル、イソプロベニル、イソブテニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニルなどが含まれるが、これらに限定されない、1つ以上の二重結合を含有する分岐鎖、非分岐鎖または環状の炭素鎖を指す。

【0012】

用語「アルキニル」は、プロピニル、ブチニルなどが含まれるが、これらに限定されない、1つ以上の三重結合を含有する分岐鎖または非分岐鎖の炭素鎖を指す。

10

【0013】

用語「アリール」および「Ar」は、0個のヘテロ原子を含有する、任意の芳香族環の単環式または二環式を指す。

【0014】

用語「ヘテロシクリル」は、1個以上のヘテロ原子を含有する、任意の芳香族または非芳香族環の単環式または二環式を指す。

【0015】

用語「アルコキシ」は、-OR置換基を指す。

【0016】

用語「アシルオキシ」は、-OC(O)R置換基を指す。

20

【0017】

用語「シアノ」は、-CN置換基を指す。

【0018】

用語「ヒドロキシル」は、-OH置換基を指す。

【0019】

用語「アミノ」は、-N(R)₂置換基を指す。

【0020】

用語「アリールアルコキシ」は、-O(CH₂)_nArを指し、ここでnは、1、2、3、4、5または6のリストから選択される整数である。

30

【0021】

用語「ハロアルコキシ」は、Xが、Cl、F、BrもしくはIまたはこれらの任意の組み合わせである、-OR-X置換基を指す。

【0022】

用語「ハロアルキル」は、Cl、F、IもしくはBrまたはこれらの任意の組み合わせにより置換されている、アルキルを指す。

【0023】

用語「ハロゲン」または「ハロ」は、F、Cl、BrおよびIと定義される1個以上のハロゲン原子を指す。

【0024】

用語「ニトロ」は、-NO₂置換基を指す。

40

【0025】

「チオアルキル」という用語は、-SR置換基を指す。

【0026】

開示の全体にわたって、式Iの化合物への参照は、その全ての立体異性体、例えば、ジアステレオマー、鏡像異性体およびこれらの混合物も含むものとして読み取られる。別の実施形態において、式Iは、その塩および水和物も含むものとして読み取られる。例示的な塩には、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩およびトリフルオロメタンスルホン酸塩が含まれるが、これらに限定されない。

【0027】

50

化学結合の法則および歪みエネルギーが満たされ、生成物が依然として殺真菌活性を示す限り、特に指示のない限りは追加の置換が許容されうることも、当業者により理解される。

【0028】

本開示の別の実施形態は、式Iの化合物または化合物を含む組成物を、土壌、植物、植物の一部、葉、および/または根に施用することを含む、植物病原性生物による攻撃から植物を保護するためまたは植物病原性生物が発生している植物を処理するための式Iの化合物の使用である。

【0029】

加えて、本開示の別の実施形態は、式Iの化合物および植物学的に許容される担体材料を含む、植物病原性生物による攻撃から植物を保護するためおよび/または植物病原性生物が発生した植物を処理するために有用な組成物である。

【発明を実施するための形態】

【0030】

本開示の化合物は、化合物としてまたは化合物を含む製剤として、多様な既知の技術のいずれかにより施用することができる。例えば、化合物は、植物の商業的な価値を損なうことなく、多様な真菌の防除のために植物の根または葉に施用することができる。材料は、一般に使用される製剤型、例えば液剤、粉剤、水和剤、フロアブル剤 (flowable concentrate) または乳剤のいずれかの形態により施用することができる。

【0031】

好ましくは、本開示の化合物は、1つ以上の式Iの化合物を植物学的に許容される担体と共に含む製剤の形態で施用される。濃縮製剤は、施用のために水もしくは他の液体に分散することができるか、または製剤は、粉剤状もしくは粒剤であり、これを更に処理することなく施用することができる。製剤は、農業技術において慣用の手順に従って調製することができる。

【0032】

本開示は、1つ以上の化合物が殺真菌剤として送達および使用されるように製剤化されるための全てのピヒクルを考慮する。典型的には、製剤は、水性懸濁剤または乳濁剤として施用される。そのような懸濁剤または乳濁剤は、通常は水和剤として知られている固体である、水溶性、水懸濁性もしくは乳化製剤から、または通常は乳剤、水性懸濁剤もしくはサスペンション剤 (suspension concentrates) として知られている液体から製造することができる。容易に理解されるように、これらの化合物の抗真菌性薬剤としての活性を有意に妨げることなく所望の有用性を生じる限り、これらの化合物を加えることができる任意の材料を使用することができる。

【0033】

圧縮して水和粒剤を形成することができる水和剤は、1つ以上の式Iの化合物、不活性担体および界面活性剤の密接な混合物を含む。水和剤における化合物の濃度は、水和剤の総重量に基づいて約10重量パーセントから約90重量パーセント、より好ましくは約25重量パーセントから約75重量パーセントでありうる。水和剤の製剤の調製において、化合物を、パイロフィライト、タルク、白亜、石膏、フラー土、ベントナイト、アタパルジャイト、デンプン、カゼイン、グルテン、モンモリロナイト粘土、珪藻土、精製ケイ酸塩などの任意の微細固体と共に配合することができる。そのような操作では、微細担体および界面活性剤を、典型的には化合物とブレンドし、摩砕する。

【0034】

式Iの化合物の乳剤は、乳剤の総重量に基づいて約1重量パーセントから約50重量パーセントなどの都合の良い濃度の化合物を、適切な液体中に含むことができる。化合物を、水混和性溶媒または水不混和性有機溶媒と乳化剤の混合物のいずれかの不活性担体に溶解することができる。乳剤を水および油で希釈して、水中油乳濁剤の形態の散布混合物を形成することができる。有用な有機溶媒には、ヘビー芳香族ナフサなどの石油の芳香族、特に高沸点ナフタレンおよびオレフィン部分が含まれる。他の有機溶媒、例えば、ロジン

10

20

30

40

50

誘導体を含むテルペン溶媒、シクロヘキサノンなどの脂肪族ケトンおよび2-エトキシエタノールなどのアルコール錯体を使用することもできる。

【0035】

本明細書において有利に用いることができる乳化剤は、当業者により容易に決定することができ、多様な非イオン性、アニオン性、カチオン性および両性乳化剤または2つ以上の乳化剤のブレンドが含まれる。乳剤の調製に有用な非イオン性乳化剤の例には、ポリアルキレングリコールエーテル、アルキルおよびアリールフェノール、脂肪族アルコール、脂肪族アミンまたは脂肪酸とエチレンオキシドとの縮合物、エトキシ化アルキルフェノールなどのプロピレンオキシド、ならびにポリオールまたはポリオキシアルキレンで可溶化されたカルボン酸エステルが含まれる。カチオン性乳化剤には、第四級アンモニウム化合物および脂肪アミン塩が含まれる。アニオン性乳化剤には、アルキルアリールスルホン酸の油溶性塩（例えば、カルシウム）、硫酸化ポリグリコールエーテルの油溶性塩、およびリン酸化ポリグリコールエーテルの適切な塩が含まれる。

10

【0036】

本開示の化合物の乳剤の調製に用いることができる代表的な有機液体は、キシレン、プロピルベンゼン画分などの芳香族液体；または混合ナフタレン画分、鉱油、フタル酸ジオクチルのような置換芳香族有機液体；灯油；ジエチレングリコールのn-ブチルエーテル、エチルエーテルまたはメチルエーテル、トリエチレングリコールのメチルエーテルなどの多様な脂肪酸のジアルキルアミド、特に脂肪グリコールおよびグリコール誘導体のジメチルアミド、鉱油、芳香族溶媒、パラフィン油などの石油画分または炭化水素；ダイズ油、ナタネ油、オリーブ油、ヒマシ油、ヒマワリ種子油、ヤシ油、トウモロコシ油、綿実油、アマニ油、パーム油、ピーナッツ油、ベニバナ油、ゴマ油、キリ油などの植物油；上記の植物油のエステルなどである。2つ以上の有機液体の混合物を乳剤の調製に用いることもできる。有機液体には、キシレンおよびプロピルベンゼン画分が含まれ、いくつかの場合においてキシレンが最も好ましい。表面活性分散剤は、典型的には、液体製剤に用いられ、分散剤と1つ以上の化合物とを組み合わせた重量に基づいて、0.1~20重量パーセントの量で用いられる。製剤は、他の適合性のある添加剤、例えば植物成長調節剤および農業に使用される他の生物学的に活性な化合物を含有することもできる。

20

【0037】

水性懸濁剤は、水性懸濁剤の総重量に基づいて約1~約50重量パーセントの範囲の濃度で水性ビヒクルに分散した1つ以上の式Iの水不溶性化合物の懸濁剤を含む。懸濁剤は、1つ以上の化合物を微粉碎し、粉碎材料を、水および上記に考察されたものと同じ種類から選択された界面活性剤から構成されるビヒクルで激しく混合することにより調製される。無機塩および合成または天然ゴムなどの他の成分を加えて、水性ビヒクルの密度および粘度を増加させることもできる。

30

【0038】

式Iの化合物は粒剤の製剤として施用することもでき、これは土壌への施用に特に有用である。粒剤の製剤は、通常、粒剤の製剤の総重量に基づいて約0.5~約10重量パーセントの化合物を、アタパルジャイト、ベントナイト、ケイ藻土、粘土または同様の安価な物質などの粗く分割された不活性材料から完全にまたは大部分が構成される不活性担体に分散して含有する。そのような製剤は、通常、化合物を適切な溶媒に溶解し、約0.5~約3mmの範囲の適切な粒径に予め形成された粒状担体に適用することにより調製される。適切な溶媒は、化合物が実質的または完全に可溶性である溶媒である。そのような製剤は、担体、化合物および溶媒の軟塊またはペーストを作製し、砕き、乾燥して、所望の顆粒状粒子を得ることによっても調製することができる。

40

【0039】

式Iの化合物を含有する粉剤は、粉末形態の1つ以上の化合物を、例えば、カオリン粘土、粉碎火山岩などの適切な粉状農業用担体と密接に混合して調製することができる。粉剤は、適切には粉剤の総重量に基づいて約1~約10重量パーセントの化合物を含有することができる。

50

【 0 0 4 0 】

製剤は、追加的に補助界面活性剤を含有して、標的作物または生物への化合物の付着、湿潤および浸透を増強することができる。これらの補助界面活性剤を、任意選択で、製剤の成分としてまたはタンクミックスとして用いることができる。補助界面活性剤の量は、水の散布量に基づいて、典型的には0.01~1.0容量パーセント、好ましくは0.05~0.5容量パーセントに変わる。適切な補助界面活性剤には、エトキシ化ノニルフェノール、エトキシ化合成または天然アルコール、スルホコハク酸のエステルの塩、エトキシ化有機シリコン、エトキシ化脂肪アミン、界面活性剤と鉱油または植物油のブレンド、作物油濃縮剤 (crop oil concentrate) (鉱油 (85%) + 乳化剤 (15%)) ; ノニルフェノールエトキシレート ; ベンジルココアルキルジメチル第四級アンモニウム塩 ; 石油炭化水素とアルキルエステルと有機酸とアニオン性界面活性剤とのブレンド ; C₉ ~ C₁₁ アルキルポリグリコシド ; リン酸化アルコールエトキシレート ; 天然第一級アルコール (C₁₂ ~ C₁₆) エトキシレート ; ジ - s e c - ブチルフェノール E O - P O ブロックコポリマー ; ポリシロキサン - メチルキャップ ; ノニルフェノールエトキシレート + 硝酸尿素アンモニウム (urea ammonium nitrate) ; 乳化メチル化種子油 ; トリデシルアルコール (合成) エトキシレート (8 E O) ; タローアミンエトキシレート (15 E O) ; P E G (400) ジオレエート - 99 が含まれるが、これらに限定されない。製剤には、米国特許出願公開第 11 / 495 , 228 号明細書に開示されているものなどの水中油乳濁剤も含まれることがあり、この開示は、参照により本明細書に明確に組み込まれる。

10

20

【 0 0 4 1 】

製剤は、任意選択で、他の殺有害生物化合物を含有する組み合わせを含むことができる。そのような追加的な殺有害生物化合物は、施用のために選択された媒体中の本開示の化合物と適合性があり、本発明の化合物の活性と拮抗しない殺真菌剤、殺虫剤、除草剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、節足動物駆除剤 (arthropodicide)、殺菌剤またはこれらの組み合わせでありうる。したがって、そのような実施形態において、他の殺有害生物化合物は、同じまたは異なる殺有害生物用途において補足毒物として用いられる。組み合わせにおける式 I の化合物と殺有害生物化合物は、一般に、1 : 100 ~ 100 : 1 の重量比で存在することができる。

【 0 0 4 2 】

本開示の化合物を、他の殺真菌剤と組み合わせることで殺真菌混合物およびその相乗的混合物を形成することもできる。本開示の殺真菌化合物は、多種多様な望ましくない病気を防除するため、多くの場合に1つ以上の他の殺真菌剤と共に施用される。他の殺真菌剤と共に使用される場合、本発明が特許請求する化合物を他の殺真菌剤と製剤化すること、他の殺真菌剤とタンクミックスすることまたは他の殺真菌剤に続けて施用することができる。そのような他の殺真菌剤には、2 - (チオシアナトメチルチオ) - ベンゾチアゾール、2 - フェニルフェノール、8 - ヒドロキシキノリンスルフェート、アメトクトラジン、アミスルブロム、アンチマイシン、アンペロミセススキスカリス (Ampelomyces quisqualis)、アザコナゾール、アゾキシストロビン、バチルススブチリス (Bacillus subtilis)、バチルススブチリス (Bacillus subtilis) 株 Q S T 7 1 3、ベナラキシル、ベノミル、ベンチアルパリカルブイソプロピル、ベンゾピండిフルピル、ベンジルアミノベンゼンスルホン酸 (B A B S) 塩、重炭酸塩、ピフェニル、ピスメルチアゾール、ピテルタノール、ピキサフェン、プラストサイジン - S、ホウ砂、ボルドー液、ボスカリド、ブロムコナゾール、ブプリメート、多硫化カルシウム、カプタホール、カプタン、カルベンダジム、カルボキシシン、カプロパミド、カルボン、クラザフェノン (chlazafenone)、クロロネブ、クロロタロニル、クロゾリネート、コニオチリウムミニタンス (Coniothyrium minitans)、水酸化銅、オクタン酸銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、硫酸銅 (三塩基)、コウモキシストロビン (coumoxystrobin)、酸化第一銅、シアゾファミド、シフルフェンアミド (cyflufenamid)、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ダゾメット、デバカルブ (debacarb)、二アンモニウムエチレンビス (ジチオカルバメート)、ジクロフルアニド

30

40

50

、ジクロロフェン、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフェンゾクアットイオン、ジフルメトリム、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、ジノブトン、ジノカップ、ジフェニルアミン、ジピメチロン (dipymetitrone)、ジチアノン、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、ドジン、ドジン遊離塩基、エジフェンホス、エネストロビン、エネストロブリン、エノキサストロビン (enoxastrobin)、エポキシコナゾール、エタボキサム、エトキシキン、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェンアミドン、フェナミノストロビン (fenaminostrobin)、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、フェンチン、酢酸フェンチン、水酸化フェンチン、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキサニル、フルフェノキシストロビン (flufenoxystrobin)、フルモルフ、フルオピコリド、フルオピラム、フルオロイミド、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルチアニル、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルペット、ホルムアルデヒド、ホセチル、ホセチルアルミニウム、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、グアザチン、グアザチンアセテート、G Y - 8 1、ヘキサクロロベンゼン、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、イマザリル、イマザリルスルフェート、イミベンコナゾール、イミノクタジン、イミノクタジントリアセテート、イミノクタジントリス (アルベシレート)、ヨードカルブ、イブコナゾール、イブフェンピラゾロン (ipfenpyrazolone)、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソフェタミド (isofetamid)、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、クレソキシムメチル、ラミナリン、マンカップー (mancopper)、マンコゼブ、マンデストロビン (mandestrobin)、マンジプロパミド、マンネブ、メフェノキサム、メパニピリム、メプロニル、メプチルジノカブ (meptyl-dinocap)、塩化第二水銀、酸化第二水銀、塩化水銀、メタラキシル、メタラキシル - M、メタム、メタムアンモニウム、メタムカリウム、メタムナトリウム、メトコナゾール、メタスルホカルブ、ヨウ化メチル、メチルイソチオシアネート、メチラム、メトミノストロビン、メトラフェノン、ミルジオマイシン、ミクロブタニル、ナバム、ニトロタールイソプロピル、ヌアリモル、オクチリノン、オフラセ、オレイン酸 (脂肪酸)、オリサストロビン、オキサジキシル、オキサチアピプロリン (oxathiapiprolin)、オキシシン銅、オキスポコナゾールフマル酸塩、オキシカルボキシシン、ペフラゾエート、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンタクロロフェノール、ペンタクロロフェノールラウレート、ペンチオピラド、酢酸フェニル水銀、ホスホン酸、フタリド、ピカルブトラゾクス (picarbutrazox)、ピコキシストロビン、ポリオキシシン B、ポリオキシシン、ポリオキシソリム、重炭酸カリウム、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロバモカルブ、プロバモカルブ塩酸塩、プロピコナゾール、プロピネブ、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン (pyraoxystrobin)、ピラジフルミド (pyraziflumid)、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリブチカルブ、ピリフェノキス、ピリメタニル、ピリオフェノン、ピリソオキサゾール (pyrisoxazole)、ピロキロン、キノクラミン、キノキシフェン、キントゼン、レイノウトリアサカリネンシス (Reynoutria sachalinensis) 抽出物、セダキサン、シルチオフアム、シメコナゾール、ナトリウム 2 - フェニルフェノキシド、重炭酸ナトリウム、ナトリウムペンタクロロフェノキシド、スピロキサミン、硫黄、S Y P - Z 0 4 8、タール油、テブコナゾール、テブフロキン、テクナゼン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオフアネートメチル、チラム、チアジニル、トルクロホスメチル、トルプロカルブ (tolprocarb)、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアゾキシド、トリクロピリカルブ (triclopyricarb)、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフルミゾール、トリホリン、トリチコナゾール、バリダマイシン、バリフェナレート、バリフェナール (valiphenal)、ピンクロゾリン、ジネブ、ジラム、ゾキサミド、カンジダオレオフィラ (Candida oleophila)、フザリウムオキシスポラム (Fusarium ox

10

20

30

40

50

ysporum)、グリオクラジウム (Gliocladium) 種、フレビオプシスギガンテア (Phlebiopsis gigantea)、ストレプトミセスグリセオピリジス (Streptomyces griseoviridis)、トリコデルマ (Trichoderma) 種、(RS) - N - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 2 - (メトキシメチル) - スクシンイミド、1, 2 - ジクロロプロパン、1, 3 - ジクロロ - 1, 1, 3, 3 - テトラフルオロアセトン水和物、1 - クロロ - 2, 4 - ジニトロナフタレン、1 - クロロ - 2 - ニトロプロパン、2 - (2 - ヘプタデシル - 2 - イミダゾリン - 1 - イル) エタノール、2, 3 - ジヒドロ - 5 - フェニル - 1, 4 - ジチ - イン 1, 1, 4, 4 - テトラオキシド、2 - メトキシエチル水銀アセテート、2 - メトキシエチル水銀クロリド、2 - メトキシエチル水銀シリケート、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルローダニン、4 - (2 - ニトロプロパ - 1 - エニル) フェニルチオシアナテム、アンプロピルホス、アニラジン、アジチラム、バリウムポリスルフィド、Bayer 32394、ベノダニル、ベンキノックス、ベントロン、ベンザマクリル、ベンザマクリルイソブチル、ベンザモルフ、ピナパクリル、硫酸ビス(メチル水銀)、酸化ビス(トリブチルスズ)、プチオベート、カドミウムカルシウム銅亜鉛クロメートスルフェート (cadmium calcium copper zinc chromate sulfate)、カルバモルフ、CECA、クロベンチアゾン、クロラニホルメタン、クロルフェナゾール、クロルキノックス、クリンバゾール、銅ビス(3 - フェニルサリチレート)、カップージンククロメート (copper zinc chromate)、クフラネブ、ヒドラジニウム硫酸銅 (cupric hydrazinium sulfate)、クプロバム (cuprobam)、シクラフラミド、シペンダゾール、シプロフラム、デカフェンチン (decafenitin)、ジクロン、ジクロゾリン、ジクロブトラゾール、ジメチリモール、ジノクトン、ジノスルホン、ジノテルボン、ジピリチオン、ジタリンホス、ドジシン (dodocin)、ドラゾキソロン、EBP、ESBP、エタコナゾール、エテム (etem)、エチリム (ethirim)、フェアマノスルフ (fenaminosulf)、フェナパニル、フェニトロパン、フルオロトリマゾール、フルカルバニル、フルコナゾール、フルコナゾール - シス、フルメシクロックス、フロファナート、グリオジン、グリセオフルピン、ハラクリナート、Hercules 3944、ヘキシルチオホス、ICIA 0858、イソパンホス (isopamphos)、イソバルジオン (isovaledione)、メベニル、メカルピンジド、メタゾキソロン、メトフロキサム、メチル水銀ジシアンジアミド、メトスルホバックス、ミルネブ、ムココル酸無水物、ミクロゾリン、N - 3, 5 - ジクロロフェニル - スクシンイミド、N - 3 - ニトロフェニルイタコンイミド、ナタマイシン、N - エチルメルクリオ - 4 - トルエンスルホンアニリド、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)、OCH、フェニル水銀ジメチルジチオカルバメート、硝酸フェニル水銀、ホスジフェン、プロチオカルブ、プロチオカルブ塩酸塩、ピラカルボリド、ピリジニトリル、ピロキシクロル、ピロキシフル、キナセトール、キナセトール硫酸塩、キナザミド、キンコナゾール、ラベンザゾール、サリチルアニリド、SSF - 109、スルトロペン、テコラム、チアジフルオル (thiadifluor)、チシオフェン、チオクロルフェンフィム、チオファネート、チオキノックス、チオキシミド、トリアミホス、トリアリモール、トリアズブチル、トリクラミド、ウルバシド (urbacid)、ザリラミドおよびこれらの任意の組み合わせが含まれる。

【0043】

加えて、本明細書に記載されている化合物を、施用のために選択された媒体において本開示の化合物と適合性があり、本発明の化合物の活性と拮抗しない、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、節足動物駆除剤、殺菌剤またはこれらの組み合わせを含む他の殺有害生物剤と組み合わせて、殺有害生物混合物およびその相乗的混合物を形成することができる。本開示の殺真菌化合物は、多種多様な望ましくない有害生物を防除するため、1つ以上の他の殺有害生物剤と共に施用することができる。他の殺有害生物剤と共に使用される場合、本発明が特許請求する化合物を他の殺有害生物剤と製剤化すること、他の殺有害生物剤とタンクミックスすることまたは他の殺有害生物剤に続けて施用することができる。典型的な殺有害生物剤には、1, 2 - ジクロロプロパン、アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アセチオン、アセトプロール、アクリナトリン、アクリロニトリル、アフィドピロペン (afidopyropen)、アラニカルブ、アルジカルブ、アルドキシカルブ、アルドリン

10

20

30

40

50

、アレスリン、アロサミジン、アリキシカルブ、アルファ - シベルメトリン、アルファ - エクジソン、アルファ - エンドスルファン、アミジチオン、アミノカルブ、アミトン、アミトンオキサレート、アミトラズ、アナバシン、アチダチオン、アザジラクチン、アザメチホス、アジンホスエチル、アジンホスメチル、アトゾエート、ヘキサフルオロケイ酸バリウム、バルトリン、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ベータ - シフルトリン、ベータ - シベルメトリン、ビフェントリン、ビオアレトリン、ビオエタノメトリン (bioethanometrin)、ビオペルメトリン、ビストリフルロン、ホウ砂、ホウ酸、プロフラニリド (broflanilide)、ブロンフェンピンホス、プロモシクレン、プロモ - D D T、プロモホス、プロモホスエチル、プフェンカルブ、ププロフェジン、プタカルブ、プタチオホス、プトカルボキシム、プトネート (butonate)、プトキシカルボキシム、カズサホス、ヒ酸カルシウム、多硫化カルシウム、カンフェクロール、カルバノレート、カルバリル、カルボフラン、二硫化炭素、四塩化炭素、カルボフェノチオン、カルボスルファン、カルタップ、カルタップ塩酸塩、クロラントラニリプロール、クロルビシクレン、クロルデン、クロルデコン、クロルジメホルム、クロルジメホルム塩酸塩、クロレトキシホス、クロルフェナピル、クロルフェンピンホス、クロルフルアズロン、クロルメホス、クロロホルム、クロロピクリン、クロルホキシム、クロルプラゾホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クロルチオホス、クロマフェノジド、シネリン I、シネリン II、シネリン類、シスメトリン、クラシホス (clacyfos)、クロエトカルブ、クロサンテル、クロチアニジン、酢酸亜ヒ酸銅、ヒ酸銅、ナフテン酸銅、オレイン酸銅、クーマホス、クミトエート、クロタミトン、クロトキシホス、クロホメート、クリライト、シアノフェンホス、シアノホス、シアントエート、シアントラニリプロール、シクラニリプロール (cyclaniliprole)、シクレトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、シハロトリン、シベルメトリン、シフェノトリン、シロマジン、シチオエート (cythioate)、D D T、デカルボフラン、デルタメトリン、デメフィオン、デメフィオン - O、デメフィオン - S、デメトン、デメトンメチル、デメトン - O、デメトン - O - メチル、デメトン - S、デメトン - S - メチル、デメトン - S - メチルスルホン、ジアフェンチウロン、ジアリホス、珪藻土、ダイアジノン、ジカプトン、ジクロフェンチオン、ジクロルボス、ジクロロメゾチアズ (dicloromezotiaz)、ジクレシル、ジクロトホス、ジシクラニル、ディルドリン、ジフルベンズロン、ジロル (dilor)、ジメフルトリン、ジメホックス、ジメタン、ジメトエート、ジメトリン、ジメチルピンホス、ジメチラン、ジネックス、ジネックス - ジクレキシ (diclexine)、ジノプロブ、ジノサム、ジノテフラン、ジオフェノラン、ジオキサベンゾホス、ジオキサカルブ、ジオキサチオン、ジスルホトン、ジチクロホス、d - リモネン、D N O C、D N O C - アンモニウム、D N O C - カリウム、D N O C - ナトリウム、ドラメクチン、エクジステロン、エマメクチン、エマメクチン安息香酸塩、E M P C、エンペントリン、エンドスルファン、エンドチオン、エンドリン、E P N、エポフェノナン、エブリノメクチン、エスデパレトリン (esdepallethrine)、エスフェンバレレート、エタホス、エチオフェンカルブ、エチオン、エチプロール、エトエートメチル、エトプロホス、ギ酸エチル、エチル - D D D、二臭化エチレン、二塩化エチレン、酸化エチレン、エトフェンプロックス、エトリムホス、E X D、ファムフル、フェナミホス、フェナザフロル、フェンクロルホス、フェネタカルブ、フェンフルトリン、フェニトロチオン、フェノブカルブ、フェノキサクリム、フェノキシカルブ、フェンピリトリン (fenpirithrin)、フェンプロパトリン、フェンスルホチオン、フェンチオン、フェンチオンエチル、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン (flometoquin)、フロニカミド、フルベンジアミド、フルコフロン、フルシクロクスロン、フルシトリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェンプロックス (flufenprox)、フルフィプロール (flufiprole)、フルヘキサホン (fluhexafon)、フルピラジフロン (flupyradifurone)、フルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホルメタネート塩酸塩、ホルモチオン、ホルムパラネート、ホルムパラネート塩酸塩、ホスメチラン、ホスピレート、ホスチエタン、フラチオカルブ、フレトリン、ガンマ - シハロトリン、ガンマ - H C H、ハルフェンプロックス、ハロフェノジド、H C H、H E O D、ヘプタクロル、ヘプタフルトリン (hept

10

20

30

40

50

afluthrin)、ヘプテノホス、ヘテロホス、ヘキサフルムロン、HHDN、ヒドラメチル
 ノン、シアン化水素、ヒドロブレン、ヒキンカルブ、イミダクロプリド、イミプロトリン
 、インドキサカルブ、ヨードメタン、IPSP、イサゾホス、イソベンザン、イソカルボ
 ホス、イソドリン、イソフェンホス、イソフェンホスメチル、イソプロカルブ、イソプロ
 チオラン、イソチオエート、イソキサチオン、イベルメクチン、ジャスモリンI、ジャス
 モリンII、ジヨドフェンホス(jodfenphos)、幼若ホルモンI、幼若ホルモンII、幼
 若ホルモンIII、カッパ-ピフェントリン(kappa-bifenthrin)、カッパ-テフルトリ
 ン(kappa-tefluthrin)、ケレバン、キノブレン、ラムダ-シハロトリン、ヒ酸鉛、レピ
 メクチン、レプトホス、リンデン、リリンホス、ルフエヌロン、リチダチオン、マラチオ
 ン、マロノベン、マジドックス、メカルバム、メカルホン、メナゾン、メホスホラン、塩
 化第一水銀、メスルフェンホス、メタフルミゾン、メタクリホス、メタミドホス、メチダ
 チオン、メチオカルブ、メトクロトホス、メトミル、メトブレン、メトキシクロル、メト
 キシフェノジド、臭化メチル、イソチオシアン酸メチル、メチルクロロホルム、塩化メチ
 レン、メトフルトリン、メトルカルブ、メトキサジアゾン、メビンホス、メキサカルベ
 ート、ミルベメクチン、ミルベマイシンオキシム、ミパホックス、マイレックス、モロスル
 タップ(molosultap)、モンフルオロトリン(momfluorothrin)、モノクロトホス、モノ
 メヒポ(monomehypo)、モノスルタップ、モルホチオン、モキシデクチン、ナフタロホス
 、ナレド、ナフタレン、ニコチン、ニフルリジド、ニテンピラム、ニチアジン、ニトリ
 ラカルブ、ノバルロン、ノビフルムロン、オメトエート、オキサミル、オキシデメトンメ
 チル、オキシデプロホス、オキシジスルホトン、パラ-ジクロロベンゼン、パラチオン、
 パラチオンメチル、ペンフルロン、ペンタクロロフェノール、ベルメトリン、フェンカプ
 トン、フェノトリン、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスホラン、ホスメット、
 ホスニクロル(phosnichlor)、ホスファミドン、ホスフィン、ホキシム、ホキシムメチ
 ル、ピリメタホス、ピリミカルブ、ピリミホスエチル、ピリミホスメチル、亜ヒ酸カリウ
 ム、チオシアン酸カリウム、pp'-DDT、プラレトリン、プレコセンI、プレコセン
 II、プレコセンIII、プリミドホス、プロフェノホス、プロフルラリン、プロマシル
 、プロメカルブ、プロパホス、プロペタンホス、プロボクスル、プロチダチオン、プロチ
 オホス、プロトエート、プロトリフェンブト、ピフルブミド(pyflubumide)、ピラクロ
 ホス、ピラフルプロール、ピラゾホス、ピレスメトリン、ピレトリンI、ピレトリンII
 、ピレトリン類、ピリダベン、ピリダリル、ピリダフェンチオン、ピリフルキナゾン、ピ
 リミジフェン、ピリミノストロビン(pyriminostrobin)、ピリミテート、ピリプロール
 、ピリプロキシフェン、ニガキ、キナルホス、キナルホスメチル、キノチオン、ラフォキ
 サニド、レスメトリン、ロテノン、リアニア、サバジラ、シュラダン、セラメクチン、シ
 ラフルオフエン、シリカゲル、亜ヒ酸ナトリウム、フッ化ナトリウム、六フッ化ケイ酸ナ
 トリウム、チオシアン酸ナトリウム、ソファミド、スピネトラム、スピノサド、スピロメ
 シフェン、スピロテトラマト、スルコフロン、スルコフロンナトリウム、スルフルラミド
 、スルホテップ、スルホキサフロル、フッ化スルフルル、スルプロホス、タウ-フルバリ
 ネット、タジムカルブ、TDE、テブフェノジド、テブフェンピラド、テブピリムホス、
 テフルベンズロン、テフルトリン、テメホス、TEPP、テラレトリン、テルブホス、テ
 トラクロロエタン、テトラクロルピンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、
 テトラニリプロール(tetraniliprole)、シータ-シペルメトリン、チアクロプリド、チ
 アメトキサム、チクロホス、チオカルボキシム、チオシクラム、チオシクラムシュウ酸塩
 、チオジカルブ、チオファノックス、チオメトン、チオスルタップ、チオスルタップニナ
 トリウム、チオスルタップ-ナトリウム、ツリングエンシン、チオキサザフェン(tioxaz
 afen)、トルフェンピラド、トラロメトリン、トランスフルトリン、トランスベルメトリン
 、トリアラテン、トリアザメート、トリアゾホス、トリクロルホン、トリクロロメタホ
 ス-3、トリクロロナト(trichloronat)、トリフェノホス、トリフルメゾピリム(trif
 lumezopyrim)、トリフルムロン、トリメタカルブ、トリブレン、バミドチオン、バニリ
 プロール、XMC、キシリルカルブ、ゼータ-シペルメトリン、ゾラプロホスおよびこれ
 らの任意の組み合わせが含まれるが、これらに限定されない。

10

20

30

40

50

【 0 0 4 4 】

加えて、本明細書に記載されている化合物を、施用のために選択された媒体において本開示の化合物と適合性があり、本発明の化合物の活性と拮抗しない除草剤と組み合わせて、殺有害生物混合物およびその相乗的混合物を形成することができる。本開示の殺真菌化合物は、多種多様な望ましくない植物を防除するため、1つ以上の他の除草剤と共に施用することができる。除草剤と共に使用される場合、本発明が特許請求する化合物を除草剤と製剤化すること、除草剤とタンクミックスすることまたは除草剤に続けて施用することができる。典型的な除草剤には、4 - C P A、4 - C P B、4 - C P P、2, 4 - D、3, 4 - D A、2, 4 - D B、3, 4 - D B、2, 4 - D E B、2, 4 - D E P、3, 4 - D P、2, 3, 6 - T B A、2, 4, 5 - T、2, 4, 5 - T B、アセトクロル、アシフルオルフェン、アクロニフェン、アクロレイン、アラクロル、アリドクロル、アロキシジム、アリルアルコール、アロラック、アメトリジオン、アメトリン、アミブジン、アミカルバゾン、アミドスルフロン、アミノシクロピラクロル、アミノピラリド、アミプロホスメチル、アミトロール、アンモニウムスルファメート、アニロホス、アニスロン、アシュラム、アトラトン、アトラジン、アザフェニジン、アジムスルフロン、アジプロトリン、バルバン、B C P C、ベフルブタミド、ベナゾリン、ベンカルバゾン、ベンフルラリン、ベンフレセート、ベンスルフロン、ベンスリド、ベントゾン、ベンザドクス、ベンズフェンジゾン、ベンジプラム、ベンゾピシクロン、ベンゾフェナップ、ベンゾフルオル、ベンゾイルプロップ、ベンズチアズロン、ピシクロピロン、ピフェノックス、ピラナホス、ピスピリバック、ホウ砂、プロマシル、プロモボニル、プロモブチド、プロモフェノキシム、プロモキシニル、プロモピラゾン、ブタクロル、ブタフェナシル、ブタミホス、ブテナクロル、ブチダゾール、ブチウロン、ブトラリン、ブトロキシジム、ブツロン、ブチレート、カコジル酸、カフェンストロール、塩素酸カルシウム、カルシウムシアナミド、カンベンジクロル、カルバスラム、カルベタミド、カルボキサゾールクロルプロカルブ、カルフェントラゾン、C D E A、C E P C、クロメトキシフェン、クロランベン、クロラノクリル、クロラジホップ、クロラジン、クロルブロムロン、クロルブファミン、クロレツロン、クロルフェナク、クロルフェンプロップ、クロルフルラゾール、クロルフルレノール、クロリダゾン、クロリムロン、クロルニトロフェン、クロロポン、クロロトルロン、クロロクスロン、クロロキシニル、クロルプロファミン、クロルスルフロン、クロルタール、クロルチアミド、シニドンエチル、シンメチリン、シノスルフロン、シスアニリド、クレトジム、クリオジネート、クロジナホップ、クロホップ (clofop)、クロマゾン、クロメプロップ、クロプロップ、クロプロキシジム、クロピラリド、クロランスラム、C M A、硫酸銅、C P M F、C P P C、クレダジン、クレゾール、クミルウロン、シアナトリン、シアナジン、シクロエート、シクロピリモレート (cyclopyrimorate)、シクロスルファミン、シクロキシジム、シクルロン、シハロホップ、シペルクアット、シプラジン、シプラゾール、シプロミド、ダイムロン、ダラポン、ダゾメット、デラクロル、デスメジファミン、デスメトリン、ジアレート、ジカンバ、ジクロベニル、ジクロラール尿素、ジクロルメート、ジクロルプロップ、ジクロルプロップ - P、ジクロホップ、ジクロスラム、ジエタムクアット、ジエタチル、ジフェノペンテン、ジフェノクスロン、ジフェンゾクアット、ジフルフェニカン、ジフルフェンゾピル、ジメフロン、ジメピペレート、ジメタクロル、ジメタメトリン、ジメテンアミド、ジメテンアミド - P、ジメキサノ、ジミダゾン、ジニトラミン、ジノフェネート、ジノプロップ、ジノサム、ジノセブ、ジノテルブ、ジフェンアミド、ジプロペトリン、ジクアット、ジスル、ジチオピル、ジウロン、D M P A、D N O C、D S M A、E B E P、エグリナジン、エンドタール、エプロナズ、E P T C、エルボン、エスプロカルブ、エタルフルラリン、エタメトスルフロン、エチジムロン、エチオレート、エトフメセート、エトキシフェン、エトキシスルフロン、エチノフェン、エトニプロミド、エトベンザニド、E X D、フェナスラム、フェノプロップ、フェノキサプロップ、フェノキサプロップ - P、フェノキサスルホン、フェンキノトリオン (fenquinotriol)、フェンテラコール、フェンチアプロップ、フェントラザミド、フェヌロン、硫酸第一鉄、フランプロップ、フランプロップ - M、フラザスルフロン、フロラスラム、フル

10

20

30

40

50

アジホップ、フルアジホップ - P、フルアゾレート、フルカルバゾン、フルセトスルフロ
 ン、フルクロラリン、フルフェナセット、フルフェニカン、フルフェンピル、フルメツラ
 ム、フルメジン、フルミクロラック、フルミオキサジン、フルミプロピン、フルオメツロ
 ン、フルオロジフェン、フルオログリコフェン、フルオロミジン、フルオロニトロフェン
 、フルオチウロン、フルボキサム、フルプロパシル、フルプロパネート、フルピルスルフ
 ロン、フルリドン、フルロクロリドン、フルロキシピル、フルルタモン、フルチアセット
 、ホメサフェン、ホラムスルフロ、ホサミン、フリルオキシフェン、グルホシネート、
 グルホシネート - P、グリフォセート、ハロキシフェン、ハロサフェン、ハロスルフロ
 ン、ハロキシジン、ハロキシホップ、ハロキシホップ - P、ヘキサクロロアセトン、ヘキサ
 フルレート、ヘキサジノン、イマザメタベンズ、イマザモックス、イマザピック、イマザ
 ピル、イマザキン、イマゼタピル、イマゾスルフロ、インダノファン、インダジフラム
 、ヨードボニル、ヨードメタン、ヨードスルフロ、イオフェンスルフロ (iofensulfu
 ron)、アイオキシニル、イパジン、イプフェンカルバゾン、イプリミダム、イソカルバ
 ミド、イソシル、イソメチオジン、イソノルロン、イソポリネート、イソプロパリン、イ
 ソプロツロン、イソウロン、イソキサベン、イソキサクロルトール、イソキサフルトール
 、イソキサピリホップ、カルブチレート、ケトスピラドックス、ラクトフェン、レナシル
 、リヌロン、M A A、M A M A、M C P A、M C P A - チオエチル、M C P B、メコプロ
 ップ、メコプロップ - P、メジノテルブ、メフェナセット、メフルイジド、メソプラジン
 、メソスルフロ、メソトリオン、メタム、メタミホップ、メタミトロン、メタザクロル
 、メタゾスルフロ、メトフルラゾン、メタベンズチアズロン、メタルプロパリン、メタ
 ゴール、メチオベンカルブ、メチオゾリン、メチウロン、メトメトン、メトプロトリン、
 臭化メチル、メチルイソチオシアネート、メチルジムロン、メトベンズロン、メトプロム
 ロン、メトラクロル、メトスラム、メトクスロン、メトリブジン、メトスルフロ、モリ
 ネート、モナリド、モニソウロン、モノクロロ酢酸、モノリヌロン、モヌロン、モルファ
 ムクアット、M S M A、ナプロアニリド、ナプロパミド、ナプロブアミド - M (napropam
 ide-M)、ナブタラム、ネブロン、ニコスルフロ、ニピラクロフェン、ニトラリン、ニ
 トロフェン、ニトロフルオルフェン、ノルフルラゾン、ノルロン、O C H、オルベンカル
 ブ、オルト - ジクロロベンゼン、オルトスルファミロン、オリザリン、オキサジアルギル
 、オキサジアゾン、オキサピラゾン、オキサスルフロ、オキサジクロメホン、オキシフ
 ルオルフェン、パラフルロン、パラクアット、ペブレート、ペラルゴン酸、ペンジメタリ
 ン、ベノキススラム、ペンタクロロフェノール、ペンタノクロル、ペントキサゾン、ベル
 フルイドン、ペトキサミド、フェニソファミ、フェンメジファミ、フェンメジファミエチ
 ル、フェノベンズロン、酢酸フェニル水銀、ピクロラム、ピコリナフェン、ピノキサデン
 、ピペロホス、亜ヒ酸カリウム、アジ化カリウム、シアン化カリウム、プレチラクロル、
 プリミスルフロ、プロシアジン、プロジアミン、プロフルアゾール、プロフルラリン、
 プロホキシジム、プログリナジン、プロメトン、プロメトリン、プロバクロル、プロバニ
 ル、プロパキサホップ、プロパジン、プロファミ、プロピソクロル、プロボキシカルバゾ
 ン、プロピリスルフロ、プロピザミド、プロスルファミリン、プロスルホカルブ、プロス
 ルフロ、プロキサン、プリナクロル、ピダノン、ピラクロニル、ピラフルフェン、ピラ
 スルホトール、ピラゾリネート、ピラゾスルフロ、ピラゾキシフェン、ピリベンゾキシ
 ム、ピリブチカルブ、ピリクロル、ピリダホール、ピリデート、ピリフタリド、ピリミノ
 バック、ピリミスルファン、ピリチオバック、ピロキサスルホン、ピロキシスラム、キン
 クロラック、キンメラック、キノクラミン、キノナミド、キザロホップ、キザロホップ -
 P、ロダタニル、リムスルフロ、サフルフェナシル、S - メトラクロル、セブチラジン
 、セクブメトン、セトキシジム、シズロン、シマジン、シメトン、シメトリン、S M A、
 亜ヒ酸ナトリウム、アジ化ナトリウム、塩素酸ナトリウム、スルコトリオン、スルファレ
 ート、スルフェントラゾン、スルホメツロン、スルホスルフロ、硫酸、スルグリカピン
 、スウェップ、T C A、テブタム、テブチウロン、テフリルトリオン、テンボトリオン、
 テブラロキシジム、テルバシル、テルブカルブ、テルブクロル、テルブメトン、テルブチ
 ラジン、テルブトリン、テトラフルロン、テニルクロル、チアザフルロン、チアゾピル、

10

20

30

40

50

チジアジミン、チジアズロン、チエンカルバゾンメチル、チフェンスルフロン、チオベンカルブ、チアフェナシル (tiafenacil)、チオカルバジル、チオクロリム、トルピラレート (tolpyralate)、トプラメゾン、トラルコキシジム、トリアファモン、トリ - アレート、トリアスルフロン、トリアジフラム、トリベヌロン、トリカンバ、トリクロピル、トリジファン、トリエタジン、トリフロキシスルフロン、トリフルジモキサジン (trifludimoxazin)、トリフルラリン、トリフルスルフロン、トリホップ、トリホプシム、トリヒドロキシトリアジン、トリメツロン、トリプロピンダン、トリタック (tritac) トリトスルフロン、ベルノレートおよびキシラクロルが含まれるが、これらに限定されない。

【 0 0 4 5 】

本開示の別の実施形態は、真菌の攻撃を防除または予防する方法である。この方法は、殺真菌有効量の1つ以上の式Iの化合物を、土壌、植物、根、葉または真菌が存在する場所もしくは発生が予防される場所へ施用する（例えば、穀物またはブドウの木へ施用することを含む）。化合物は、低い植物毒性を示しながら、殺真菌レベルで多様な植物を処理することに適している。化合物は、保護剤および/または根絶剤様式の両方において有用でありうる。

10

【 0 0 4 6 】

化合物は、特に農業用途において有意な殺真菌効果を有することが見いだされている。化合物のうちの多くのは、農作物および園芸植物への使用に特に有効である。

【 0 0 4 7 】

前述の真菌に対する化合物の効能が、殺真菌剤としての化合物の一般的な有用性を確立することを、当業者は理解する。

20

【 0 0 4 8 】

化合物は、真菌病原体に対して広範囲な活性を有する。例示的な病原体には、コムギ葉枯病 (チモセプトリアトリチシ (Zymoseptoria tritici))、コムギ褐色さび病 (wheat brown rust) (プッシニアトリチシナ (Puccinia triticina))、コムギ紋さび病 (wheat stripe rust) (プッシニアストリイホルミス (Puccinia striiformis))、リンゴそうか病 (ベンツリアイナエクアリス (Venturia inaequalis))、ブドウうどんこ病 (ウンシヌラネカトル (Uncinula necator))、オオムギ雲形病 (リンコスポリウムセカリス (Rhynchosporium secalis))、イネのいもち病 (ピリクラリア・オリゼ (Pyricularia oryzae))、ダイズのさび病 (ファコプソラパキリジ (Phakopsora pachyrhizi))、コムギの包えい枯病 (レプトスファエリアノドルム (Leptosphaeria nodorum))、コムギのうどんこ病 (ブルメリアグラミニス分化型トリチチ (Blumeria graminis f. sp. tritici))、オオムギのうどんこ病 (ブルメリアグラミニス分化型ホルデイ (Blumeria graminis f. sp. hordei))、ウリ科植物のうどんこ病 (エリシフェシコラセアルム (Erysiphe cichoracearum))、ウリ科植物の炭疽病 (コレトトリクムラゲナリウム (Colletotrichum lagenarium))、カエンサイの葉斑病 (セルコスボラベチコラ (Cercospora beticola))、トマトの夏疫病 (アルテルナリアソラニ (Alternaria solani)) およびオオムギの斑点病 (コクリオボルスサチプス (Cochliobolus sativus)) の病原菌 (causing agent) が含まれうるが、これらに限定されない。施用される活性材料の正確な量は、施用される特定の活性材料のみならず、望まれる特定の作用、防除される真菌の種およびその成長段階、ならびに化合物を接触させる植物または他の産物の部分によっても左右される。したがって、全ての化合物およびそれを含有する製剤は、同様の濃度においてまたは同じ真菌の種に対して等しく有効ではないことがある。

30

40

【 0 0 4 9 】

化合物は、病気抑制的でありかつ植物学的に許容される量での植物への使用に有効である。用語「病気抑制的でありかつ植物学的に許容される量」は、防除が望ましい植物の病気を死滅または抑制するが、植物に対して有意な毒性がない化合物の量を指す。この量は、一般に約 0.1 ~ 約 1000 ppm (百万分率) であり、1 ~ 500 ppm が好ましい。必要とされる化合物の正確な濃度は、防除される真菌病、用いられる製剤の種類、施用方法、特定の植物の種、気候条件などによって変わる。適切な施用率は、典型的には約 0

50

． 1 0 ~ 約 4 ポンド / エーカー (1 平方メートルあたり約 0 . 0 1 ~ 0 . 4 5 グラム、 g / m ²) の範囲である。

【 0 0 5 0 】

本明細書において提示される任意の範囲または所望の値は、探求される効果を失うことなく拡大または変更することができ、このことは、本明細書の教示を理解する当業者には明白である。

【 0 0 5 1 】

式 I の化合物は、周知の化学的手順を使用して作製することができる。本開示に特定の記述されていない中間体は、市販されているまたは化学文献に開示されている経路により作製することができるまたは標準的な手順を利用して市販の出発材料から容易に合成

10

【 0 0 5 2 】

一般スキーム

以下のスキームは、式 I のピコリンアミド化合物を生成する手法を例示する。以下の記載および例は、例示の目的で提供され、置換基または置換パターンに関して限定するものとして解釈されるべきではない。

【 0 0 5 3 】

R_g が最初に定義されたとおりである式 1 . 2 の化合物は、スキーム 1、工程 a に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、式 1 . 1 の化合物を、トルエンなどの溶媒中において、トリフェニルビスマス (V) アセテートおよび酢酸銅 (I I) の存在下、N - シクロヘキシル - N - メチルシクロヘキサンアミンなどの塩基により約 2 3 ~ 4 0 の温度で処理して、R_g が予め定義されたとおりである式 1 . 2 の化合物をもたらすことができる。あるいは、R_g が最初に定義されたとおりである式 1 . 2 の化合物は、スキーム 1、工程 b に示されている方法によって調製することができる。b に示されているように、式 1 . 1 の化合物を、ジクロロメタンなどの溶媒中において、過酢酸などの酸化剤および酢酸銅 (I I) などの触媒の存在下、トリス (4 - フルオロ - 2 - メチルフェニル) ビスマタンなどのトリアリ - ルビスマス (I I I) 試薬 (Synthetic Commun. 1996, 26 (24), 4569-4575 に提示されている方法に従って調製した) により約 2 3 ~ 4 0 の温度で処理して、R_g が予め定義されたとおりである式 1 . 2 の化合物をもたらすことができる。R_g が最初に定義されたとおりである式 1 . 3 の化合物は、スキーム 1、工程 c に示されている方法によって調製することができる。c に示されているように、式 1 . 1 の化合物を、THF などの溶媒中において、(E) - t e r t - ブチル (4 , 4 , 4 - トリフルオロブタ - 2 - エン - 1 - イル) カーボネートなどの炭酸アリルの存在下、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) (P d ₂ (d b a) ₃) などの触媒およびジフェニルホスフィノフェロセン (d p p f) などのリガンドにより約 2 3 ~ 8 0 の温度で処理して、R_g が予め定義されたとおりである式 1 . 3 の化合物をもたらすことができる。R_g が最初に定義されたとおりである式 1 . 4 の化合物は、スキーム 1、工程 d に示されている方法によって調製することができる。d に示されているように、式 1 . 1 の化合物を、ジクロロメタン (D C M) などの溶媒中において、酸化銀 (I) およびヨウ化カリウムの存在下、(プロモメチル) ベンゼンにより約 2 3 ~ 還流の温度で処理して、式 1 . 4 の化合物をもたらすことができる。

20

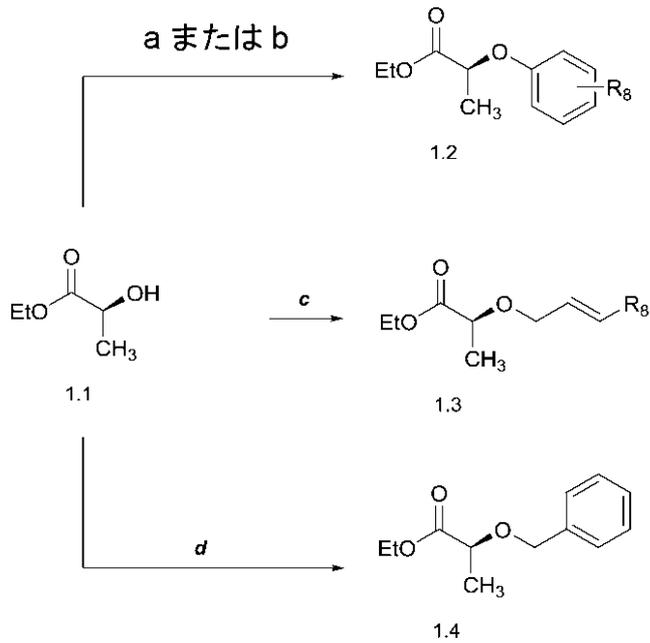
30

40

【 0 0 5 4 】

【化3】

スキーム1



10

20

【0055】

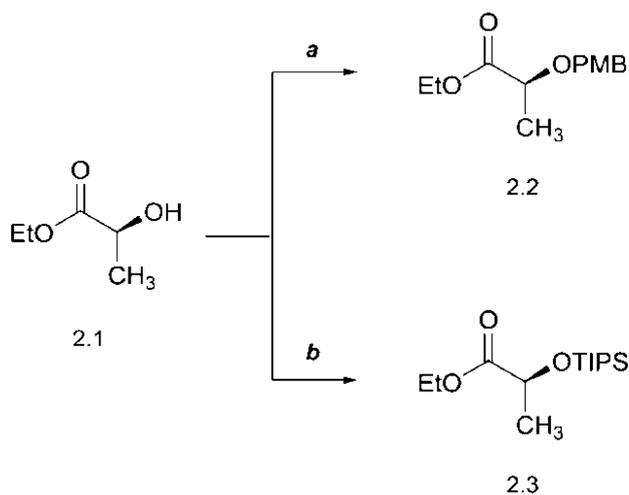
式2.2の化合物は、スキーム2、工程aに示されている方法によって調製することができる。aに示されているように、式2.1の化合物を、DCMなどの溶媒中において、カンファースルホン酸(CSA)の存在下、4-メトキシベンジル2,2,2-トリクロロアセトイミデートにより約23の温度で処理して、式2.2の化合物をもたらすことができる。式2.3の化合物は、スキーム2、工程bに示されている方法によって調製することができる。bに示されているように、式2.3の化合物を、ジクロロメタン(DCM)などの溶媒中において、イミダゾールなどの塩基の存在下、塩化トリイソプロピルシリルにより約0の温度で処理して、式2.3の化合物をもたらすことができる。

30

【0056】

【化4】

スキーム2



40

50

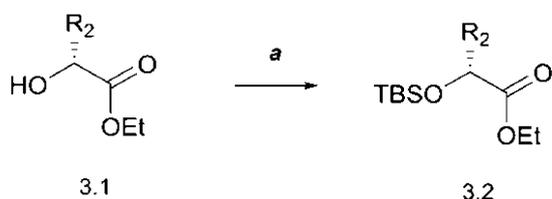
【 0 0 5 7 】

R₂ が予め定義されたとおりである式 3 . 2 の化合物は、スキーム 3、工程 a に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、式 3 . 1 の化合物を、ジメチルホルムアミド (DMF) などの溶媒中において、イミダゾールなどの塩基の存在下、tert - ブチルジメチルシリルクロリドにより約 23 の温度で処理して、R₂ が予め定義されたとおりである式 3 . 2 の化合物をもたらすことができる。

【 0 0 5 8 】

【化 5】

スキーム 3



10

【 0 0 5 9 】

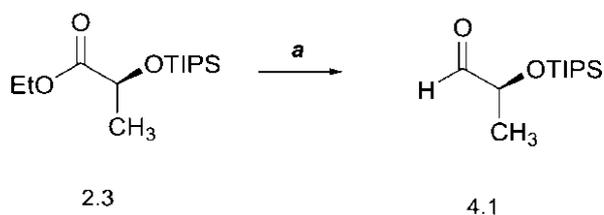
式 4 . 1 の化合物は、スキーム 4、工程 a に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、式 2 . 3 の化合物を、DCM などの溶媒中の水素化ジイソブチルアルミニウム (DIBAL) などの還元剤により約 - 78 の温度で処理して、式 4 . 1 の化合物をもたらすことができる。

20

【 0 0 6 0 】

【化 6】

スキーム 4



30

【 0 0 6 1 】

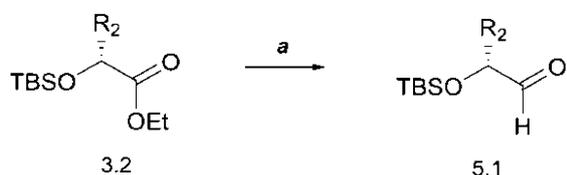
R₂ が予め定義されたとおりである式 5 . 1 の化合物は、スキーム 5、工程 a に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、式 3 . 2 の化合物を、DCM などの溶媒中の水素化ジイソブチルアルミニウム (DIBAL) などの還元剤により約 - 78 の温度で処理して、R₂ が予め定義されたとおりである式 5 . 1 の化合物をもたらすことができる。

40

【 0 0 6 2 】

【化 7】

スキーム 5



50

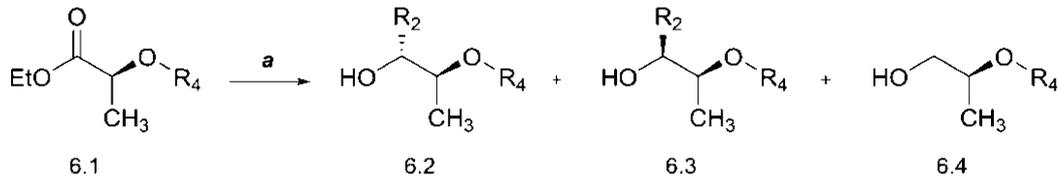
【 0 0 6 3 】

R₂ および R₄ が予め定義されたとおりである式 6 . 2 の化合物は、スキーム 4、工程 a に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、R₄ が予め定義されたとおりである式 6 . 1 の化合物を、THF などの溶媒中の R₂ - Mg Br などの金属求核剤および水素化ホウ素リチウムなどの還元剤により約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、R₂ および R₄ が予め定義されたとおりである式 6 . 2 の化合物をもたらすことができる。

【 0 0 6 4 】

【化 8】

スキーム 6



10

【 0 0 6 5 】

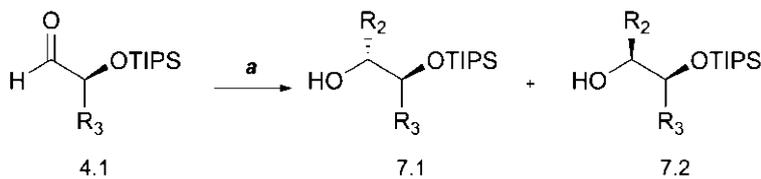
R₂ および R₃ が予め定義されたとおりである式 7 . 1 の化合物は、スキーム 7、工程 a に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、R₃ が予め定義されたとおりである式 4 . 1 の化合物を、ジエチルエーテルなどの溶媒中の R₂ - Mg Br などの金属求核剤により約 - 78 ~ 周囲温度の温度で処理して、R₂ および R₃ が予め定義されたとおりである式 7 . 1 の化合物をもたらすことができる。

20

【 0 0 6 6 】

【化 9】

スキーム 7



30

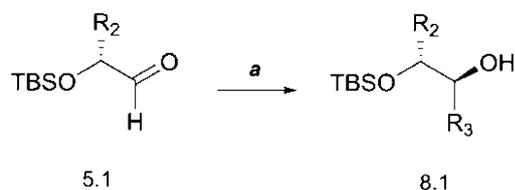
【 0 0 6 7 】

R₂ および R₃ が予め定義されたとおりである式 8 . 1 の化合物は、スキーム 5、工程 a に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、R₂ が予め定義されたとおりである式 5 . 1 の化合物を、ジエチルエーテルなどの溶媒中の R₃ - Mg Br などの金属求核剤により約 - 78 ~ 周囲温度の温度で処理して、R₂ および R₃ が予め定義されたとおりである式 8 . 1 の化合物をもたらすことができる。

【 0 0 6 8 】

【化 10】

スキーム 8



40

【 0 0 6 9 】

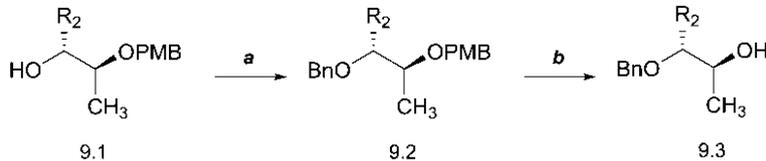
50

R_2 が予め定義されたとおりである式 9 . 3 の化合物は、スキーム 9、工程 a ~ b に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、式 9 . 1 の化合物を、DMF などの溶媒中の水素化ナトリウムおよび (プロモメチル) ベンゼンなどの塩基により約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、式 9 . 2 の化合物をもたらすことができる。b に示されているように、 R_2 が予め定義されたとおりである式 9 . 2 の化合物を、アセトニトリルなどの溶媒中の硝酸第二セリウムアンモニウムにより約 0 の温度で処理して、 R_2 が予め定義されたとおりである式 9 . 3 の化合物をもたらすことができる。

【 0 0 7 0 】

【 化 1 1 】

スキーム 9



10

【 0 0 7 1 】

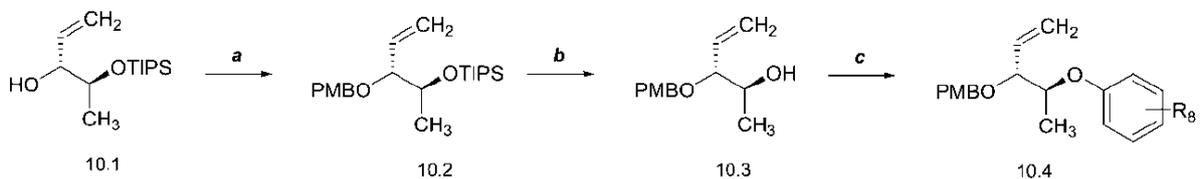
R_8 が予め定義されたとおりである式 10 . 4 の化合物は、スキーム 10、工程 a ~ c に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、式 10 . 1 の化合物を、DMF などの溶媒中の水素化ナトリウムおよび 4 - メトキシベンジルプロミドなどの塩基により約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、式 10 . 2 の化合物をもたらすことができる。b に示されているように、式 10 . 2 の化合物を、THF などの溶媒中のフッ化テトラブチルアンモニウムにより約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、式 10 . 3 の化合物をもたらすことができる。c に示されているように、式 10 . 3 の化合物を、トルエンなどの溶媒中において、トリフェニルビスマス (V) アセテートおよび酢酸銅 (II) の存在下、N - シクロヘキシル - N - メチルシクロヘキサミンなどの塩基により約 23 ~ 40 の温度で処理して、 R_8 が予め定義されたとおりである式 10 . 4 の化合物をもたらすことができる。

20

【 0 0 7 2 】

【 化 1 2 】

スキーム 10



30

【 0 0 7 3 】

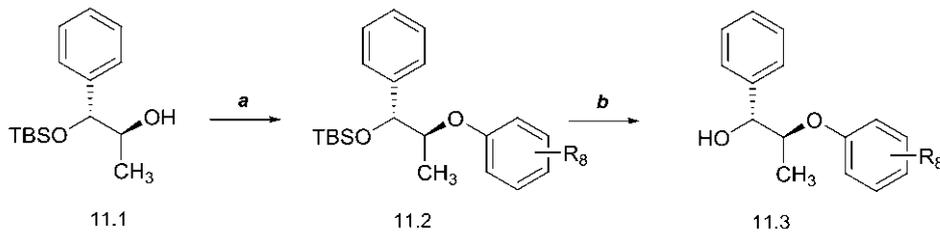
R_8 が予め定義されたとおりである式 11 . 3 の化合物は、スキーム 11、工程 a ~ b に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、式 11 . 1 の化合物を、DMF などの溶媒中において、1, 2, 4 - トリフルオロベンゼンの存在下、カリウム tert - ブトキシドなどの塩基により約 23 ~ 60 の温度で処理して、 R_8 が予め定義されたとおりである式 11 . 2 の化合物をもたらすことができる。b に示されているように、式 11 . 2 の化合物を、THF などの溶媒中のフッ化テトラブチルアンモニウムにより約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、 R_8 が予め定義されたとおりである式 11 . 3 の化合物をもたらすことができる。

40

【 0 0 7 4 】

【化13】

スキーム11



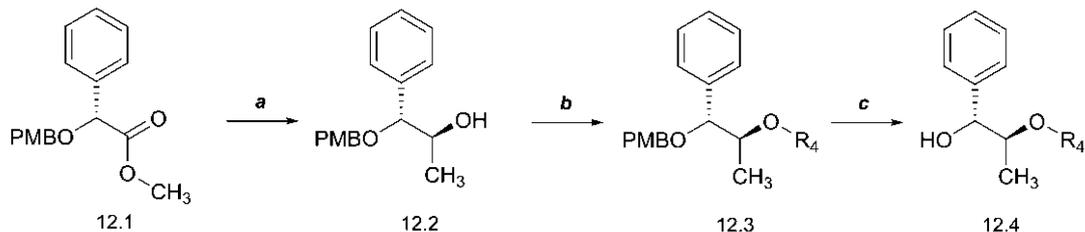
【0075】

R_4 が予め定義されたとおりである式12.4の化合物は、スキーム12、工程a~cに示されている方法によって調製することができる。aに示されているように、式12.1の化合物を、ジエチルエーテルなどの溶媒中の水素化ホウ素リチウムなどの塩基およびメチルリチウムなどのメチル化試薬により約-78~周囲温度の温度で処理して、式12.2の化合物をもたらすことができる。bに示されているように、式12.2の化合物を、THFなどの溶媒中の水素化ナトリウムなどの塩基、ヨウ化テトラブチルアンモニウム(TBAI)などの触媒および R_4 が予め定義されたとおりである R_4 -Brなどの臭化アルキルにより約23~還流温度の温度で処理して、式12.3の化合物をもたらすことができる。cに示されているように、式12.3の化合物を、DCMなどの溶媒中の2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-1,4-ベンゾキノン(DDQ)などの酸化剤により約0~周囲温度の温度で処理して、式12.4の化合物をもたらすことができる。

【0076】

【化14】

スキーム12



【0077】

R_8 が予め定義されたとおりである式13.2の化合物は、スキーム13、工程a~bに示されている方法によって調製することができる。aに示されているように、 R_2 が予め定義されたとおりである式9.3の化合物を、DMFなどの溶媒中において、1,2,4-トリフルオロベンゼンの存在下、カリウムtert-ブトキシドなどの塩基により約23~60の温度で処理して、 R_2 および R_8 が予め定義されたとおりである式13.1の化合物をもたらすことができる。bに示されているように、 R_2 および R_8 が予め定義されたとおりである式13.1の化合物を、1:2のシクロヘキセン:エタノールの溶媒混合物中のパラジウム担持炭などの水素化触媒に約周囲温度~約70の温度で処理して、 R_2 および R_8 が予め定義されたとおりである式13.2の化合物をもたらすことができる。

【0078】

10

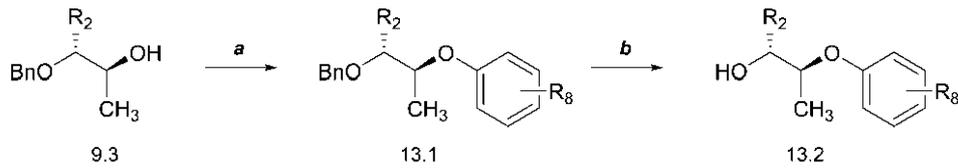
20

30

40

【化 15】

スキーム 13



【0079】

R_4 および R_8 が予め定義されたとおりである式 14.7 の化合物は、スキーム 14、
 工程 a ~ f に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、
 R_4 が予め定義されたとおりである式 14.1 の化合物を、約 1 : 32 のメタノール :
 ジクロロメタン ~ 1 : 3 のメタノール : ジクロロメタンの溶媒混合物中において、重炭酸
 ナトリウムなどの塩基、続いて水素化ナトリウムなどの水素化物源の存在下、オゾンガス
 などの酸化剤により約 -78 ~ 周囲温度の温度で処理して、 R_4 が予め定義されたと
 おりである式 14.2 の化合物をもたらすことができる。b に示されているように、 R_4 が
 予め定義されたとおりである式 14.2 の化合物を、ジクロロメタンなどの溶媒中のテ
 トラフルオロホウ酸トリメチルオキシニウムなどのメチル化剤および N_1 , N_1 , N_8 , N
 8 - テトラメチルナフタレン - 1, 8 - ジアミンなどのプロトンスカベンジャーにより約
 23 の温度で処理して、 R_4 が予め定義されたとおりである式 14.3 の化合物をもた
 らすことができる。あるいは、c に示されているように、 R_4 が予め定義されたと
 おりである式 14.2 の化合物を、ジメチルホルムアミドなどの溶媒中において、水素化ナトリ
 ウムなどの塩基およびヨウ化テトラブチルアンモニウムなどの触媒の存在下、臭化アリル
 などのアルル化試薬により約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、 R_4 および R_{10} が
 予め定義されたとおりである式 14.4 の化合物をもたらすことができる。あるいは、d に
 示されているように、 R_4 が予め定義されたとおりである式 14.2 の化合物を、ジメチル
 ホルムアミドなどの溶媒中において、水素化ナトリウムなどの塩基およびヨウ化テトラ
 ブチルアンモニウムなどの触媒の存在下、臭化ベンジルなどのアルキル化試薬により約 0
 ~ 周囲温度の温度で処理して、 R_4 および R_{10} が予め定義されたとおりである式 14.
 5 の化合物をもたらすことができる。あるいは、e に示されているように、式 14.2 の
 化合物を、トルエンなどの溶媒中において、トリフェニルビスマス(V)アセテートおよ
 び酢酸銅(II)の存在下、N - シクロヘキシル - N - メチルシクロヘキサミンなど
 の塩基により約 23 ~ 40 の温度で処理して、 R_4 および R_{10} が予め定義された
 とおりである式 14.6 の化合物をもたらすことができる。f に示されているように、 R_4
 および R_{10} が予め定義されたとおりである式 14.3、14.4、14.5 および 14.
 6 の化合物を、DCMなどの溶媒中の 2, 3 - ジクロロ - 5, 6 - ジシアノ - 1, 4 -
 ベンゾキノン(DDQ)などの酸化剤により約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、 R_4 お
 よび R_8 が予め定義されたとおりである式 14.7 の化合物をもたらすことができる。

【0080】

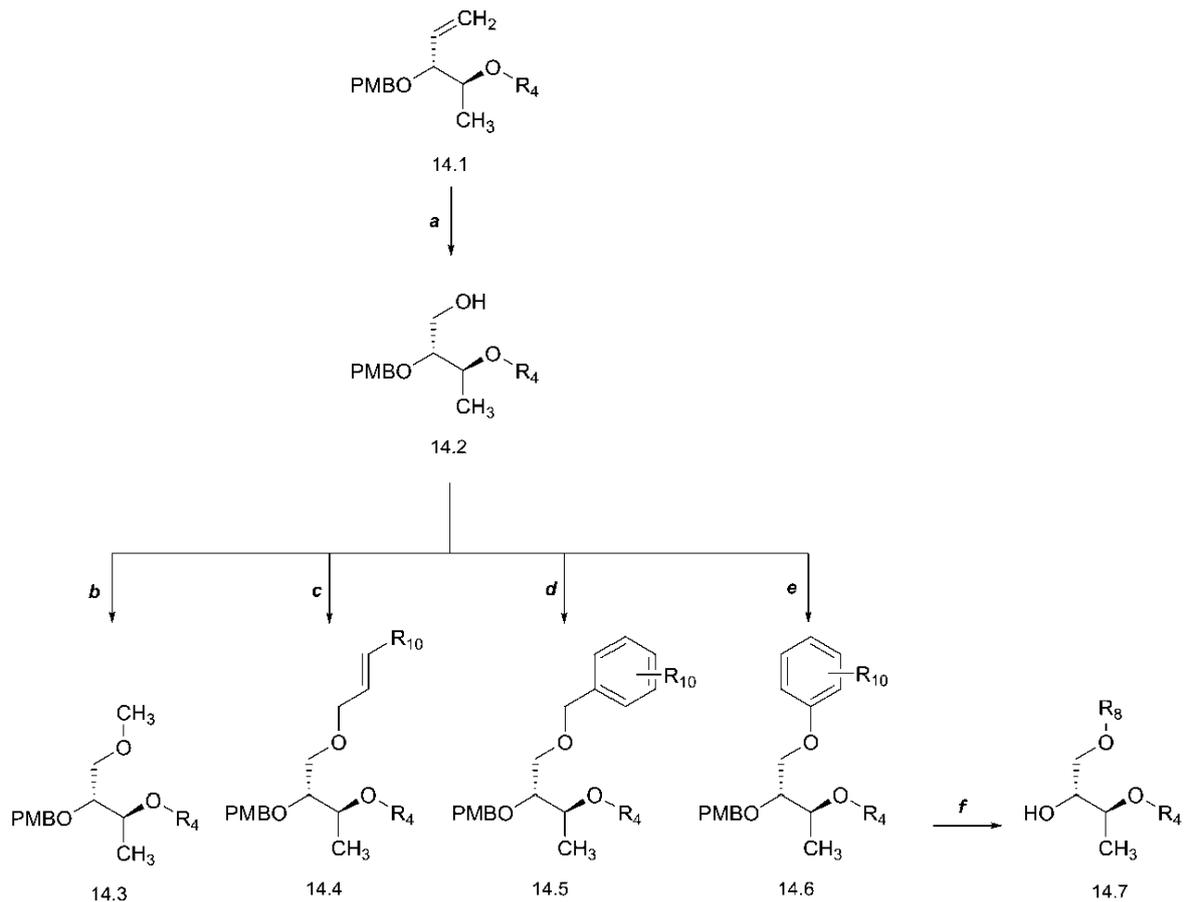
10

20

30

【化 1 6】

スキーム 14



10

20

【 0 0 8 1】

R_4 が予め定義されたとおりである式 15.3 の化合物は、スキーム 15、工程 a ~ c に示されている方法によって調製することができる。a に示されているように、 R_4 が予め定義されたとおりである式 14.1 の化合物を、1 : 10 のメタノール : ジクロロメタンなどの溶媒混合物中において、重炭酸ナトリウムなどの塩基、続いてジメチルスルフィドなどの還元剤の存在下、オゾンガスなどの酸化剤により約 -78 の温度で処理して、 R_4 が予め定義されたとおりである式 15.1 の化合物をもたらすことができる。b に示されているように、 R_4 が予め定義されたとおりである式 15.1 の化合物を、ジクロロメタンなどの溶媒中において、メタノールなどの触媒の存在下、Deoxofluor (登録商標) などのフッ素化剤により約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、 R_4 が予め定義されたとおりである式 15.2 の化合物をもたらすことができる。c に示されているように、 R_4 が予め定義されたとおりである式 15.2 の化合物を、DCM などの溶媒中の 2,3-ジクロロ-5,6-ジシアノ-1,4-ベンゾキノン (DDQ) などの酸化剤により約 0 ~ 周囲温度の温度で処理して、 R_4 が予め定義されたとおりである式 15.3 の化合物をもたらすことができる。

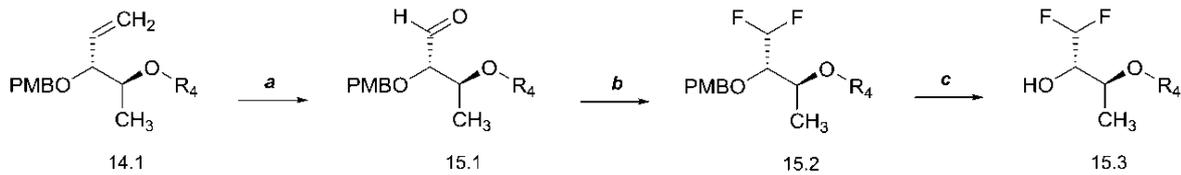
30

40

【 0 0 8 2】

【化17】

スキーム15



【0083】

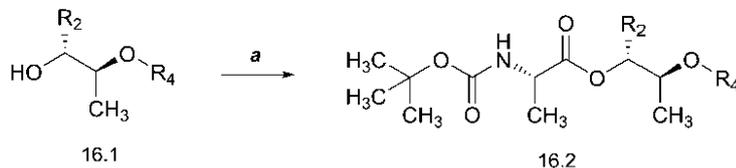
R_2 および R_4 が予め定義されたとおりである式16.2の化合物は、スキーム16、
 工程aに示されている方法によって調製することができる。aに示されているように、
 R_2 および R_4 が予め定義されたとおりである式16.1の化合物を、DCMなどの溶媒中
 において、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド(EDCI)
)などのペプチドカップリング試薬およびジメチルアミノピリジン(DMAP)などの触
 媒の存在下、(tert-ブトキシカルボニル)-L-アラニンにより約0 ~ 周囲温度
 の温度で処理して、 R_2 および R_4 が予め定義されたとおりである式16.2の化合物を
 もたらすことができる。

10

【0084】

【化18】

スキーム16



20

【0085】

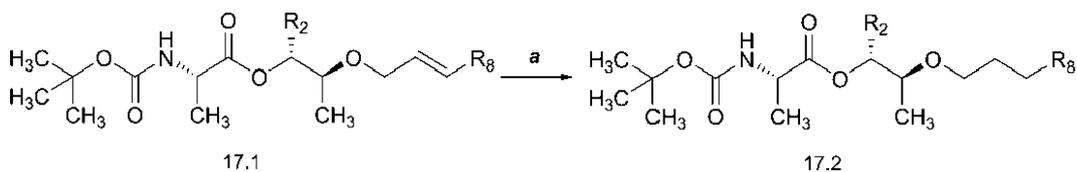
R_2 および R_8 が予め定義されたとおりである式17.2の化合物は、スキーム17、
 工程aに示されている方法によって調製することができる。aに示されているように、
 R_2 および R_8 が予め定義されたとおりである式17.1の化合物を、酢酸エチルなどの溶
 媒中において、水素雰囲気下、パラジウム担持炭などの水素化触媒により約周囲温度の温
 度で処理して、 R_2 および R_8 が予め定義されたとおりである式17.2の化合物を
 もたらすことができる。

30

【0086】

【化19】

スキーム17



40

【0087】

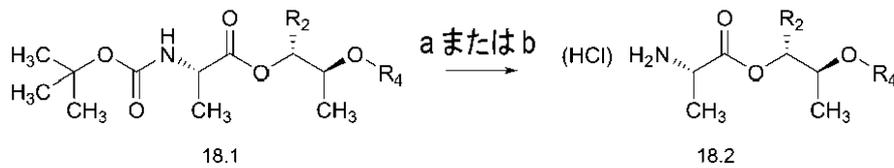
R_2 および R_4 が予め定義されたとおりである式18.2の化合物は、スキーム18、
 工程aに示されている方法によって調製することができる。aに示されているように、
 R_2 および R_4 が予め定義されたとおりである式18.1の化合物を、DCMなどの溶媒中
 の、ジオキサン中4M HClまたはトリフルオロ酢酸(TFA)などの酸により約周囲
 温度の温度で処理して、 R_2 および R_4 が予め定義されたとおりである式18.2の化
 合物をもちたらすことができる。

【0088】

50

【化20】

スキーム18



【0089】

R_2 、 R_4 および R_6 が予め定義されたとおりである式19.2の化合物は、スキーム19、工程aに示されている方法によって調製することができる。aに示されているように、 R_2 および R_4 が予め定義されたとおりである式18.2の化合物を、DCMのようなハロゲン化溶媒中において、ジイソプロピルエチルアミン(DIPEA)などの塩基およびベンゾトリアゾール-1-イル-オキシトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(PyBOP)などのペプチドカップリング試薬の存在下、 R_6 が最初に定義されたとおりである式19.1の化合物により約周囲温度の温度で処理して、 R_2 、 R_4 および R_6 が予め定義されたとおりである式19.2の化合物をもたらすことができる。

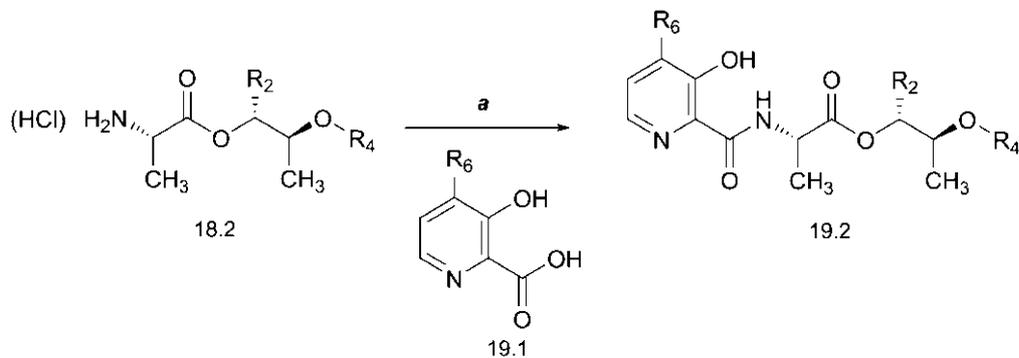
10

【0090】

【化21】

20

スキーム19



30

【0091】

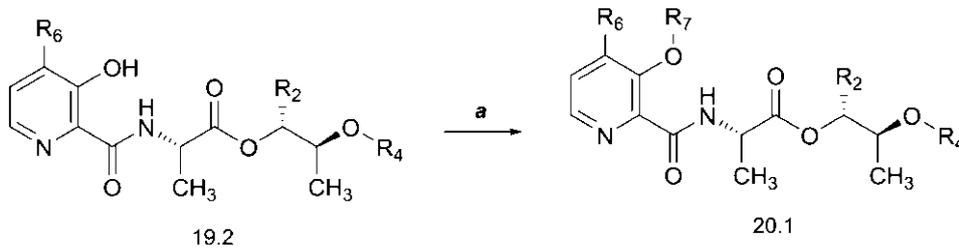
R_2 、 R_4 、 R_6 、および R_7 が予め定義されたとおりである式20.1の化合物は、スキーム20、工程aに示されている方法によって調製することができる。aに示されているように、 R_2 、 R_4 および R_6 が予め定義されたとおりである式19.2の化合物を、アセトンのような溶媒中において、ヨウ化ナトリウム(NaI)などの試薬および炭酸ナトリウム(Na_2CO_3)もしくは炭酸カリウム(K_2CO_3)などのアルカリ炭酸塩の塩基を伴って、もしくは伴わないで、適切なハロゲン化アルキルにより約50の温度で処理することによって、またはDMCなどの非プロトン性溶媒中において、ピリジン、トリエチルアミン(Et_3N)、DMAPもしくはこれらの混合物などのアミン塩基の存在下、ハロゲン化アシルにより約23の温度で処理することによって、 R_2 、 R_4 、 R_6 および R_7 が予め定義されたとおりである式20.1の化合物をもたらすことができる。

40

【0092】

【化22】

スキーム20



10

【実施例】

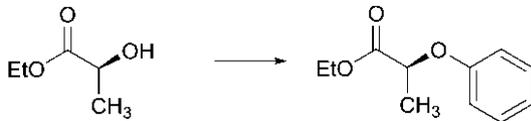
以下の実施例の化学は、2-((tert-ブトキシカルボニル)アミノ)プロパン酸(Boc-Ala-OH)の鏡像異性体、または乳酸エチルの保護(PMBもしくはBn)鏡像異性体のいずれかを使用して実施することができる。

【0093】

実施例1A: エチル(S)-2-フェノキシプロパノエートの調製

【0094】

【化23】



20

【0095】

250 mLの丸底フラスコに、トリフェニルビスマス(V)アセテート(9.22 g、16.51 mmol)および酢酸銅(II)(0.231 g、1.270 mmol)を投入し、N₂ガスでパージした。次に無水トルエン(85 mL)を加え、続いて(S)-エチル2-ヒドロキシプロパノエート(1.456 mL、12.70 mmol)およびN-シクロヘキシル-N-メチルシクロヘキサミン(3.13 mL、14.60 mmol)を加えた。得られた青色/緑色の反応を40℃に加熱し、96時間(h)攪拌した。反応を室温(rt)に冷却し、Celite(登録商標)のプラグで濾過した。フィルターケーキをDCMで洗浄し、次に濃縮して暗黄色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル(SiO₂)、ヘキサン中0-10%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(2.43 g、98%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 7.31-7.23 (m, 2H), 6.96 (tt, J = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.92-6.83 (m, 2H), 4.74 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 4.21 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.61 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, CDCl₃) 172.24, 157.64, 129.51, 121.55, 115.16, 72.66, 61.23, 18.57, 14.12; IR (薄膜) 2986, 1753, 1733, 1494, 1239, 1134, 752 cm⁻¹。

30

【0096】

実施例1B: (S)-エチル2-((トリイソプロピルシリル)オキシ)プロパノエートの調製

40

【0097】

【化24】



【0098】

500 mLの丸底フラスコ中において、(S)-エチル2-ヒドロキシプロパノエート

50

(9.71 mL、85 mmol) およびイミダゾール(13.83 g、203 mmol) を、N₂ 下でDCM(220 mL)に溶解し、氷/水浴で0℃に冷却した。次にクロロトリイソプロピルシラン(21.74 mL、102 mmol)を、シリンジにより30分間(min)かけて加えた。反応混合物を、rtに温め、一晚攪拌した。18h後、TLCは出発材料が消費されたことを示した。反応混合物を分液漏斗に注ぎ、H₂O(100 mL)、NaHCO₃飽和水溶液(100 mL)、ブライン(100 mL)、1M HCl(100 mL)、最後にブライン(100 mL)で洗浄した。有機層を相分離器に通し、濃縮して、透明な無色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル(SiO₂)、ヘキサン中0-10%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(21.68 g、93%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 4.41 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 4.18 (qd, J = 7.1, 2.7 Hz, 2H), 1.43 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.28 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 1.17-0.97 (m, 21H); ¹³C NMR(101 MHz, CDCl₃) 174.23, 68.55, 60.66, 21.80, 17.85, 14.22, 12.16.

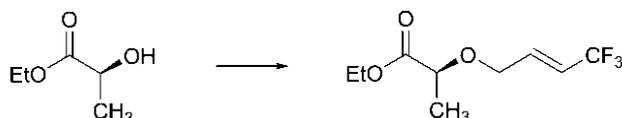
10

【0099】

実施例1C：エチル(S,E)-2-((4,4,4-トリフルオロブタ-2-エン-1-イル)オキシ)プロパノエートの調製

【0100】

【化25】



20

【0101】

エチル(S)-2-ヒドロキシプロパノエート(0.971 mL、8.47 mmol)を無水THF(42.3 mL)に溶解した。Pd₂(dba)₃(0.194 g、0.212 mmol)およびdppf(0.235 g、0.423 mmol)を加え、混合物を加熱環流した。次に(E)-tert-ブチル(4,4,4-トリフルオロブタ-2-エン-1-イル)カーボネート(2.87 g、12.70 mmol)を加え、反応が完了するまでTLCでモニターした。反応をrtに冷却し、注意深く濃縮して、油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル(SiO₂)、ヘキサン中0-10%のMTBE)により精製して、標記化合物(1.59 g、79%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 6.47-6.37 (m, 1H), 6.03-5.91 (m, 1H), 4.34-4.16 (m, 3H), 4.11-3.97 (m, 2H), 1.45 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.29 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ¹³C NMR(126 MHz, CDCl₃) 172.67, 135.95 (q, J = 6.4 Hz), 123.01 (q, J = 269.2 Hz), 118.98 (q, J = 34.1 Hz), 75.01, 67.71, 61.08, 18.53, 14.20; IR(薄膜) 2988, 1742, 1686, 1302, 1264, 1202, 1112, 1087, 1018, 959 cm⁻¹.

30

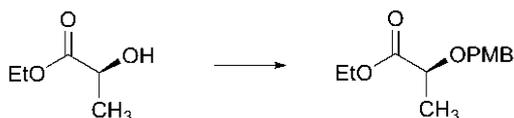
【0102】

実施例1D：メチルエチル(S)-2-((4-メトキシベンジル)オキシ)プロパノエートの調製

40

【0103】

【化26】



【0104】

500 mLの丸底フラスコ中において、(S)-エチル2-ヒドロキシプロパノエート(10.15 mL、89 mmol)の溶液をDCM(89 mL)により調製した。この溶液に、4-メトキシベンジル2,2,2-トリクロロアセトイミデート(28.9 g、1

50

0.2 mmol)、続いてカンファースルホン酸(2.065 g、8.89 mmol)を加え、得られた橙色/褐色の反応をrtで72 h 攪拌した。ヘキサン(100 mL)を加え反応混合物を、30 min 攪拌した。沈殿した固体を濾過し、濾液を濃縮して、油状物を得た。油状物を200 mLのDCM/ヘキサン(1:1)で再び希釈した。混合物をrtで30 min 攪拌した。固体を濾過し、濾液をNaHCO₃飽和水溶液(100 mL)、続いてブライン(100 mL)で洗浄した。有機層をNa₂SO₄で乾燥し、濾過し、濃縮して、褐色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル(SiO₂)、ヘキサン中0-10%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(11.96 g、56%)を淡黄色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 7.34-7.24 (m, 2H), 6.91-6.84 (m, 2H), 4.62 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 4.39 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 4.21 (qd, J = 7.1, 2.4 Hz, 2H), 4.03 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 1.41 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 1.29 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, CDCl₃) 173.41, 159.37, 129.68, 113.83, 73.74, 71.66, 60.84, 55.31, 18.76, 14.28; IR (薄膜) 2984, 1730, 1513, 1247, 1198, 1031, 822 cm⁻¹。

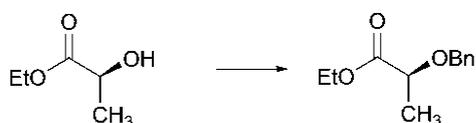
10

【0105】

実施例1E: エチル(S)-2-(ベンジルオキシ)プロパノエートの調製

【0106】

【化27】



20

【0107】

500 mLの丸底フラスコ中において、(S)-エチル2-ヒドロキシプロパノエート(11.65 mL、102 mmol)の溶液を無水DCM(203 mL)により調製した。この溶液に、(プロモメチル)ベンゼン(18.12 mL、152 mmol)、続いて酸化銀(I)(24.72 g、107 mmol)およびヨウ化カリウム(1.686 g、10.16 mmol)を加えた。得られた黒色の反応混合物を加熱還流し、一晩攪拌した。24 h後、TLCは出発材料がほぼ完全に消費されたことを示した。反応混合物を、Celite(登録商標)のパッドで濾過し、DCMでフラッシュし、濃縮して、油状物にした。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル(SiO₂)、ヘキサン中0-5%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(11.93 g、56%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 7.48-7.14 (m, 5H), 4.69 (d, J = 11.6 Hz, 1H), 4.45 (d, J = 11.6 Hz, 1H), 4.21 (qd, J = 7.1, 2.6 Hz, 2H), 4.05 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 1.43 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 1.29 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, CDCl₃) 173.27, 137.63, 128.43, 127.98, 127.84, 74.09, 72.00, 60.85, 18.74, 14.27; IR (薄膜) 2984, 1743, 1454, 1196, 1140, 1064, 1024, 736, 697 cm⁻¹。

30

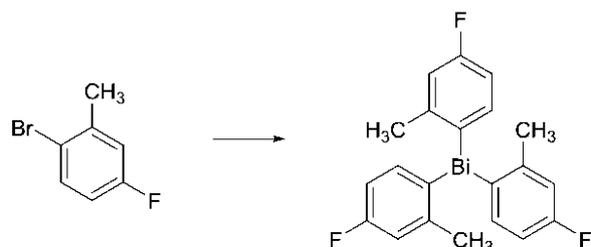
40

【0108】

実施例1F、工程1: トリス(4-フルオロ-2-メチルフェニル)ビスムタンの調製

【0109】

【化28】



【0110】

250 mL の丸底フラスコ中において、1-ブロモ-4-フルオロ-2-メチルベンゼン(5.24 mL、42.3 mmol)の溶液をTHF(171 mL)により調製し、ドライアイス/アセトン浴により-78 に冷却した。約10 min後、ブチルリチウム(ヘキサン中2.5 M、17.8 mL、44.4 mmol)をシリンジにより滴加し、得られた透明な無色の反応を1時間撹拌した。1時間後、トリクロロビスマタン(4.30 g、13.63 mmol)を、THF(71 mL)中の溶液として、シリンジにより加え、反応を-78 で1時間撹拌し、次にrtに温め、一晩撹拌した。18時間後、反応を濃縮し、残った残渣をトルエン(200 mL)で抽出し、黄色を帯びた白色の固体を濾過により除去した。次に濾液を濃縮乾固して、標記化合物(7.25 g、99%)をオフホワイトの固体として得て、それを更に精製することなく次の工程に直接使用した。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 7.40 (dd, J = 8.2, 6.7 Hz, 3H), 7.04 (dd, J = 10.3, 2.7 Hz, 3H), 6.78 (td, J = 8.6, 2.7 Hz, 3H), 2.41 (s, 9H); ¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃) -113.91.

10

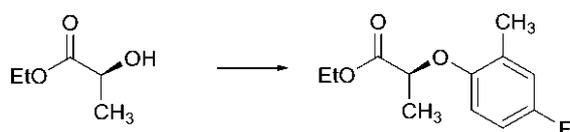
20

【0111】

実施例1F、工程2：エチル(S)-2-(4-フルオロ-2-メチルフェノキシ)プロパノエートの調製

【0112】

【化29】



30

【0113】

トリス(4-フルオロ-2-メチルフェニル)ビスマタン(3.41 g、6.35 mmol)の溶液をDCM(21.16 mL)により室温で調製し、次に過酢酸(1.225 mL、7.20 mmol)をシリンジにより5 minかけてゆっくりと加えた。発泡が観察され、反応は薄橙色になった。得られた反応をrtで30 min撹拌した。30 min後、エチル(S)-2-ヒドロキシプロパノート(0.485 mL、4.23 mmol)および酢酸銅(II)(0.154 g、0.847 mmol)を加え、フラスコに還流冷却器を取り付け、不透明な青色/緑色の反応混合物を45 に加熱し、一晩撹拌した。20 h後、TLCは出発材料の約75%の消費および幾つかの高いR_fスポットへの変換を示した。反応を室温に冷却し、次にDCM(2 x 10 mL)により濾過しながら、セライトのプラグで濾過し、次に濃縮して、油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(シリカゲル(SiO₂)、ヘキサン中0-20%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(318.8 mg、33%)を淡黄色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 6.85 (dd, J = 9.0, 3.1 Hz, 1H), 6.76 (td, J = 8.5, 3.1 Hz, 1H), 6.63 (dd, J = 8.9, 4.6 Hz, 1H), 4.66 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 4.20 (qd, J = 7.1, 1.4 Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.61 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃) -123.28; ¹³C NMR (101 MHz, CDCl₃) 172.18, 157.

40

50

40 (d, $J = 239.0$ Hz), 152.11 (d, $J = 2.3$ Hz), 129.75 (d, $J = 7.7$ Hz), 117.58 (d, $J = 22.8$ Hz), 113.42 (d, $J = 8.5$ Hz), 112.37 (d, $J = 22.8$ Hz), 73.81, 61.19, 18.64, 16.40 (d, $J = 1.3$ Hz), 14.12; IR (薄膜) 3350, 2987, 1750, 1496, 1191, 1134, 718 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) [$\text{C}_{12}\text{H}_{16}\text{FO}_3$] $^+$ の計算値 227.1078、実測値 227.1089。

【0114】

実施例 2 : (S) - 2 - ((トリイソプロピルシリル) オキシ) プロパノールの調製

【0115】

【化30】



10

【0116】

1 L の丸底フラスコ中において、(S) - エチル 2 - ((トリイソプロピルシリル) オキシ) プロパノエート (21.68 g, 79 mmol) を、 N_2 下で DCM (395 mL) に溶解し、ドライアイス/アセトン浴で -78°C に冷却した。水素化ジイソブチルアルミニウム (ヘキサン中 1 M、158 mL、158 mmol) を、シリンジにより 4 h かけて加えた。反応を -78°C で更に 30 min 撹拌した。30 min 後、酢酸エチル (75 mL) を加えて、反応をクエンチし、反応混合物を氷/水浴により 0°C に温めた。酒石酸ナトリウムカリウム飽和水溶液 (約 200 mL) の溶液を加え、反応を一晩激しく撹拌し、氷浴を融解させながら、rt にゆっくりと温めた。18 h 後、二相混合物を分液漏斗に注ぎ、層を分離した。水層を DCM (3 x 150 mL) で抽出した。合わせた有機層を相分離器に通し、濃縮して、透明な無色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (シリカゲル (SiO_2)、ヘキサン中 0-20% の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (15.85 g, 87%) を透明な無色の油状物として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 9.66 (d, $J = 1.7$ Hz, 1H), 4.18 (qd, $J = 6.8, 1.7$ Hz, 1H), 1.31 (d, $J = 6.8$ Hz, 3H), 1.11-1.01 (m, 21H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 204.54, 73.83, 18.95, 17.89, 12.14.

20

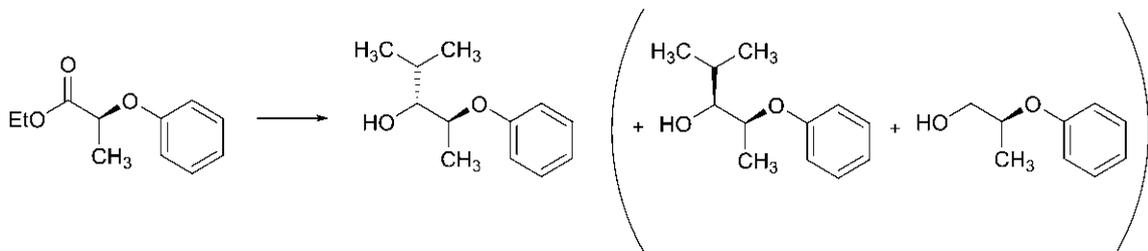
30

【0117】

実施例 3 A : (3R, 4S) - 2 - メチル - 4 - フェノキシペンタン - 3 - オールの調製

【0118】

【化31】



40

【0119】

250 mL のフラスコ中において、イソプロピルマグネシウムブロミド (Et_2O 中 2 M、9.01 mL、18.02 mmol) および水素化ホウ素リチウム (THF 中 2 M、5.86 mL、11.71 mmol) の溶液を、THF (33 mL) により調製した。反応を氷浴により 0°C に冷却した。約 10 min 後、エチル (S) - 2 - フェノキシプロパノエート (1.75 g, 9.01 mmol) を、THF 中の溶液 (9 mL、2 x 1.5 mL の洗浄液を伴う) としてシリンジポンプを介してシリンジにより 3 h かけて滴加した。得られた淡黄色の透明な反応混合物を一晩撹拌し、氷浴を融解させながら rt にゆっくり

50

と温めた。反応を水(100 mL、ガス発生に注意)によりクエンチし、Et₂O(100 mL)で希釈した。層を分離し、水層をEt₂O(3×100 mL)で抽出した。合わせた有機層をMgSO₄で乾燥し、濾過し、濃縮して、油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-30%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(849 mg、49%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 7.34-7.26 (m, 2H), 6.95 (tt, J = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.93-6.87 (m, 2H), 4.48 (qd, J = 6.2, 3.8 Hz, 1H), 3.54 (dt, J = 7.9, 3.4 Hz, 1H), 2.09 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 1.79 (dp, J = 7.9, 6.7 Hz, 1H), 1.30 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.03 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ¹³C NMR(101 MHz, CDCl₃) 157.39, 129.58, 121.08, 116.04, 78.00, 74.79, 29.87, 18.89, 18.71, 13.11; IR(薄膜) 3425, 2955, 1598, 1493, 1240, 1055, 752 cm⁻¹。

また、(3S, 4S)-2-メチル-4-フェノキシペンタン-3-オール(216 mg、1.11 mmol、収率12%)を透明な無色の油状物として単離した。¹H NMR(300 MHz, CDCl₃) 7.34-7.21 (m, 2H), 7.00-6.86 (m, 3H), 4.38 (p, J = 6.1 Hz, 1H), 3.36 (q, J = 5.1 Hz, 1H), 2.35 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 1.87 (pd, J = 6.8, 5.0 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 1.04-0.95 (m, 6H); ¹³C NMR(101 MHz, CDCl₃) 157.73, 129.58, 121.18, 116.15, 79.40, 75.37, 30.07, 20.00, 16.60, 16.04; IR(薄膜) 3434, 2955, 1598, 1494, 1240, 1051, 752 cm⁻¹。

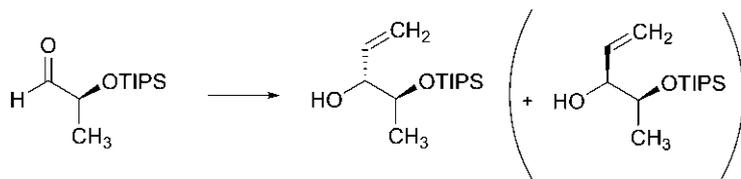
また、(S)-2-フェノキシプロパン-1-オール(44.4 mg、0.292 mmol、収率3.2%)を透明な無色の油状物として単離した。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 7.33-7.25 (m, 2H), 7.00-6.90 (m, 3H), 4.50 (pd, J = 6.3, 3.8 Hz, 1H), 3.81-3.66 (m, 2H), 2.12 (s, 1H), 1.27 (d, J = 6.3 Hz, 3H); ¹³C NMR(101 MHz, CDCl₃) 157.73, 129.58, 121.22, 116.18, 74.77, 66.27, 15.84; IR(薄膜) 3381, 2932, 1598, 1493, 1240, 1051, 752 cm⁻¹。

【0120】

実施例3B:(3R, 4S)-4-((トリイソプロピルシリル)オキシ)ペンタ-1-エン-3-オールの調製

【0121】

【化32】



【0122】

Et₂O(108 mL)中の(S)-2-((トリイソプロピルシリル)オキシ)プロパナール(5.0 g、21.70 mmol)の溶液を、250 mLの丸底フラスコ中において調製し、N₂雰囲気下でドライアイス/アセトン浴により-78℃に冷却した。次にピニルマグネシウムブロミド(THF中1.0 M、23.87 mL、23.87 mmol)をシリンジにより30 minかけて加えた。反応混合物を-78℃で30 min攪拌し、次に2 hかけてrtにゆっくりと温めた。反応をNH₄Clの飽和水溶液(200 mL)に注ぎ、Et₂O(3×100 mL)で抽出した。合わせた有機層をMgSO₄で乾燥し、濾過し、濃縮して、淡黄色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-20%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(4.30 g、77%、d.r.約6:1)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(300 MHz, CDCl₃) 5.80 (ddd, J = 17.0, 10.6, 6.0 Hz, 1H), 5.31 (dt, J = 17.3, 1.7 Hz, 1H), 5.20 (dt, J = 10.6, 1.6 Hz, 1H), 4.16 (dddt, J = 6.4, 4.8, 3.2, 1.8 Hz, 1H), 4.00 (qd, J = 6.4, 3.5 Hz, 1H), 2.45 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 1.12 (d, J =

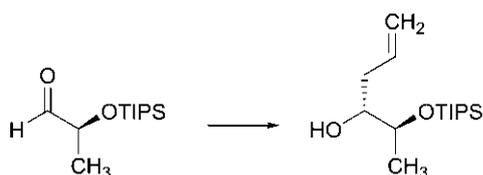
6.4 Hz, 3H), 1.08 (s, 21H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 136.42, 116.31, 71.40, 60.35, 21.00, 18.02, 14.17, 12.38; IR (未希釈) 3483, 2943, 2866, 1463, 676 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) [$\text{C}_{14}\text{H}_{30}\text{NaO}_2\text{Si}$] $^+$ の計算値 281.1907、実測値 281.1920。

【0123】

実施例 3C: (2S, 3R) - 2 - ((トリイソプロピルシリル)オキシ)ヘキサ - 5 - エン - 3 - オールの調製

【0124】

【化33】



10

【0125】

500 mL の丸底フラスコに、(+)-Ipc₂-アリルボラン (ペンタン中 1 M、25.0 mL、25.00 mmol) を N₂ 下で投入し、Et₂O (100 mL) で希釈した。得られた透明な無色の溶液をアセトン/ドライアイス浴により -78 に冷却した。(S)-2-((トリイソプロピルシリル)オキシ)プロパナール (4.61 g、20.01 mmol) を、無水 Et₂O (60 mL) 中の溶液としてシリンジにより 1.5 h かけて加えた。透明な無色の反応を -78 で更に 1.5 h 冷却し、その後、TLC は出発材料が消費されたことを示した。次に MeOH (50 mL) を加え、反応を -78 で 5 min 撹拌した。pH 7 の緩衝液 (70 mL) を加え、反応を氷/水浴により 0 に温めた。次に H₂O₂ (30%、60 mL) を加え、得られた二相反応混合物を 0 で 2.5 h 激しく撹拌し、次に氷を融解させながら室温に温め、30 h 撹拌した。層を分離し、水相を Et₂O (3 × 100 mL) で抽出した。水層を、KI - デンプン試験紙が残留 H₂O₂ の消滅を示すまで、氷上で Na₂S₂O₃ 飽和水溶液により注意深くクエンチした。合わせた有機層を MgSO₄ で乾燥し、濾過し、濃縮して、透明な油状物にした。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO₂、ヘキサン中 0-15% の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (5.00 g、92%) を透明な薄バラ色の油状物として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 5.85 (ddt, J = 17.2, 10.2, 7.0 Hz, 1H), 5.22 - 4.97 (m, 2H), 3.93 (qd, J = 6.2, 3.3 Hz, 1H), 3.70 (ddt, J = 8.3, 5.7, 2.9 Hz, 1H), 2.34 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 2.30 - 2.09 (m, 2H), 1.14 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.12 - 1.03 (m, 21H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 134.91, 117.07, 74.48, 70.77, 36.72, 18.06, 16.59, 12.37; IR (未希釈) 3480, 2943, 2866, 1463, 1067, 881 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) [$\text{C}_{15}\text{H}_{33}\text{O}_2\text{Si}$] $^+$ の計算値 274.2270、実測値 274.2274。

20

30

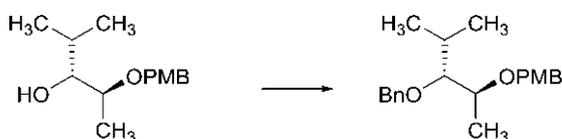
【0126】

実施例 4A: 1 - (((2S, 3R) - 3 - (ベンジルオキシ) - 4 - メチルペンタン - 2 - イル)オキシ)メチル) - 4 - メトキシベンゼンの調製

40

【0127】

【化34】



【0128】

50

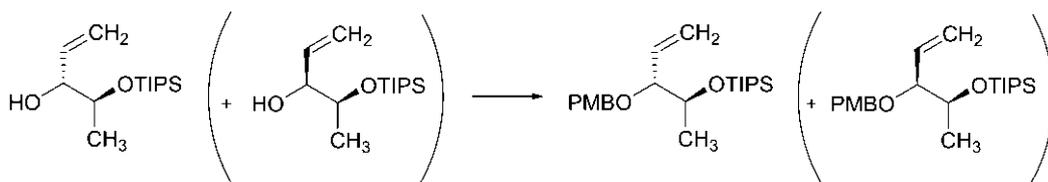
250 mL の丸底フラスコ中において、水素化ナトリウム (0.329 g、13.72 mmol) の懸濁液を N₂ 雰囲気下で DMF (42.7 mL) により調製し、氷/水浴で 0 °C に冷却した。5 min 後、(2S, 3R) - 2 - ((4-メトキシベンジル)オキシ) - 4 - メチルペンタン - 3 - オール (1.868 g、7.84 mmol) を、DMF 中の溶液 (10 mL、2 × 5 mL の洗浄液を伴う) としてシリンジにより加えた。得られた明黄色の反応混合物を r.t. にして、3 h 攪拌した。反応を 0 °C に冷却し、(プロモメチル)ベンゼン (1.617 mL、14.89 mmol) を一度に加え、続いてヨウ化テトラブチルアンモニウム (0.290 g、0.784 mmol) を加えた。反応混合物を 40 °C に温め、一晩攪拌した。反応を 0 °C に冷却し、ジエチルアミン (2.433 mL、23.51 mmol) をシリンジにより 15 秒間かけて加えた。淡黄色の反応を r.t. に温め、1 h 攪拌し、その時点で、反応は透明な黄色の溶液になった。1 h 後、反応を NH₄Cl の飽和水溶液 (200 mL) でクエンチし、Et₂O (3 × 200 mL) で抽出した。合わせた有機層をブライン (200 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥し、濾過し、濃縮して、黄色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO₂、ヘキサン中 0-20% の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (1.73 g、67%) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 7.39-7.29 (m, 4H), 7.29-7.22 (m, 3H), 6.90-6.84 (m, 2H), 4.80 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 4.58 (d, J = 11.3 Hz, 1H), 4.54 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 4.43 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.65 (qd, J = 6.3, 4.5 Hz, 1H), 3.24 (dd, J = 6.2, 4.4 Hz, 1H), 1.88 (dq, J = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.26 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.9 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, CDCl₃) 159.08, 139.27, 131.04, 129.09, 128.21, 127.81, 127.31, 113.77, 86.75, 76.06, 74.59, 70.33, 55.29, 30.11, 20.03, 18.44, 15.04; IR (薄膜) 2959, 2871, 1513, 1247, 1099, 1066, 1036 cm⁻¹。

【0129】

実施例 4B: トリイソプロピル ((2S, 3R) - 3 - ((4-メトキシベンジル)オキシ)ペンタ - 4 - エン - 2 - イル)オキシ)シランの調製

【0130】

【化35】



【0131】

250 mL の丸底フラスコ中において、水素化ナトリウム (1.165 g、29.1 mmol) の懸濁液を N₂ 雰囲気下で DMF (93 mL) により調製し、氷/水浴で 0 °C に冷却した。5 min 後、(3R, 4S) - 4 - ((トリイソプロピルシリル)オキシ)ペンタ - 1 - エン - 3 - オール (4.301 g、16.64 mmol、d.r. 約 6:1) を、DMF 中の溶液 (20 mL、2 × 10 mL の洗浄液を伴う) としてシリンジにより加えた。得られた明黄色の反応混合物を r.t. にして、3 h 攪拌した。反応を 0 °C に冷却し、4-メトキシベンジルプロミド (4.61 mL、31.6 mmol) を一度に加え、続いてヨウ化テトラブチルアンモニウム (0.615 g、1.664 mmol) を加え、その後、反応には、薄橙色への明確な色変化があった。反応混合物を r.t. に温め、一晩攪拌した。20 h 後、TLC は出発材料が消費されたことを示した。反応を 0 °C に冷却し、ジエチルアミン (5.16 mL、49.9 mmol) をシリンジにより 15 秒間かけて加えた。淡黄色の反応を r.t. に温め、1 h 攪拌し、その時点で、反応は透明な黄色の溶液になった。1 h 後、反応を NH₄Cl の飽和水溶液 (150 mL) でクエンチし、Et₂O (3

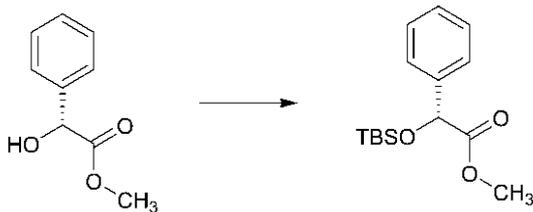
× 150 mL) で抽出した。合わせた有機層をブライン (100 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥し、濾過し、濃縮して、黄色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO₂、石油エーテル中 0-15% の MTBE) により精製して、標記化合物 (4.063 g、65%、d.r. 約 6:1) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 7.34-7.19 (m, 2H), 6.92-6.79 (m, 2H), 5.84 (ddd, J = 17.1, 10.5, 7.4 Hz, 1H), 5.43-5.08 (m, 2H), 4.55 (d, J = 11.5 Hz, 1H), 4.38 (d, J = 11.5 Hz, 1H), 3.98 (qd, J = 6.3, 4.5 Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.63 (ddt, J = 7.5, 4.4, 1.0 Hz, 1H), 1.19 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 1.10-0.98 (m, 21H); ¹³C NMR (101 MHz, CDCl₃) 158.96, 136.47, 131.02, 129.29, 118.19, 113.62, 85.07, 71.35, 70.35, 55.26, 19.87, 18.15, 12.55; IR (未希釈) 2942, 2865, 1513, 1246, 1039, 677 cm⁻¹; HRMS - ESI (m/z) [C₂₂H₃₈NaO₃Si]⁺ の計算値 401.24824、実測値 401.24711。

【0132】

実施例 4C: メチル (R) - 2 - ((tert - ブチルジメチルシリル) オキシ) - 2 - フェニルアセテートの調製

【0133】

【化36】



【0134】

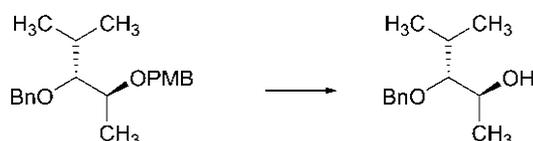
エチル (R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - フェニルアセテート (5.00 g、30.1 mmol)、TBSCl (6.80 g、45.1 mmol) およびイミダゾール (4.10 g、60.2 mmol) の溶液を、DMF (31.7 mL) により調製し、rt で一晩撹拌した。20 h 後、溶液を Et₂O および水で希釈した。有機相をブラインで洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥し、濃縮して、油状物にした。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO₂、ヘキサン中 0-5% の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (7.53 g、85%) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) 7.42-7.31 (m, 2H), 7.28-7.17 (m, 3H), 5.13 (s, 1H), 3.57 (s, 3H), 0.81 (s, 9H), 0.00 (s, 3H), -0.07 (s, 3H); ¹³C NMR (126 MHz, CDCl₃) 172.61, 139.11, 128.33, 128.09, 126.33, 74.39, 52.18, 25.71, 18.35, -5.09, -5.16; IR (薄膜) 2952, 2929, 2886, 2857, 1758, 1737, 1472, 1253, 1207, 1191, 1170, 1125, 861, 836, 778, 725, 696 cm⁻¹; HRMS - ESI (m/z) [C₁₅H₂₅O₃Si]⁺ の計算値 281.1567、実測値 281.1578。

【0135】

実施例 5A: (2S, 3R) - 3 - (ベンジルオキシ) - 4 - メチルペンタン - 2 - オールの調製

【0136】

【化37】



【0137】

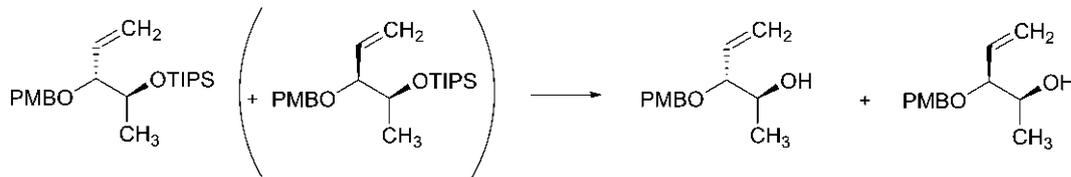
250 mLのフラスコ中において、1 - ((((2 S , 3 R) - 3 - (ベンジルオキシ) - 4 - メチルペンタン - 2 - イル) オキシ) メチル) - 4 - メトキシベンゼン (1 . 7 2 5 5 g 、 5 . 2 5 m m o l) をアセトニトリル (9 6 m L) および H ₂ O (9 . 5 5 m L) に溶解し、氷浴で 0 に冷却した。約 5 m i n 後、硝酸第二セリウムアンモニウム (1 4 . 4 0 g 、 2 6 . 3 m m o l) を加え、橙色の反応混合物を 0 で 3 h 攪拌した。3 h 後、混合物を N a H C O ₃ の飽和水溶液 (1 0 0 m L) でクエンチし、次に D C M (3 × 1 0 0 m L) で抽出した。合わせた有機層を相分離器に注ぎ、濃縮して、透明な無色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (S i O ₂ 、ヘキサン中 0 5 0 % の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (4 0 1 m g 、 3 7 %) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃) 7.39-7.22 (m, 5H), 4.66 (d, J = 0.9 Hz, 2H), 3.93 (qd, J = 6.4, 4.2 Hz, 1H), 3.13 (dd, J = 6.4, 4.2 Hz, 1H), 1.92 (s, 1H), 1.86 (dq, J = 13.5, 6.8 Hz, 1H), 1.20 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 1.03 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.9 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, C D C l ₃) 138.91, 128.40, 127.60, 127.58, 88.50, 74.84, 68.43, 30.07, 19.94, 18.66, 18.08; I R (薄膜) 3 4 0 6 , 2 9 6 2 , 1 4 5 4 , 1 0 9 3 , 1 0 6 3 , 7 3 4 , 6 9 7 c m ⁻¹。

【 0 1 3 8 】

実施例 5 B : (2 S , 3 R) - 3 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) ペンタ - 4 - エン - 2 - オールの調製

【 0 1 3 9 】

【 化 3 8 】



【 0 1 4 0 】

トリイソプロピル ((((2 S , 3 R) - 3 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) ペンタ - 4 - エン - 2 - イル) オキシ) シラン (4 . 0 6 g 、 1 0 . 7 m m o l 、 d . r . 約 6 : 1) の溶液を、250 mLの丸底フラスコ中において、N₂下でTHF (5 3 . 7 m L) により調製し、0 に冷却した。5 m i n 後、T B A F (1 2 . 8 8 m L 、 1 2 . 8 8 m m o l) を 2 m i n かけてシリンジにより滴加した。反応混合物を r t に温め、4 h 攪拌した。反応を N H ₄ C l の飽和水溶液 (1 0 0 m L) でクエンチし、E t ₂ O (3 × 1 0 0 m L) で抽出した。合わせた有機層を M g S O ₄ で乾燥し、濾過し、濃縮して、透明な無色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (S i O ₂ 、ヘキサン中 0 3 0 % の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (1 . 2 7 2 g 、 5 3 %) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃) 7.25 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.88 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 5.82 (ddd, J = 17.4, 10.4, 8.1 Hz, 1H), 5.40 (ddd, J = 10.4, 1.9, 0.8 Hz, 1H), 5.30 (ddd, J = 17.3, 1.9, 0.9 Hz, 1H), 4.57 (d, J = 11.5 Hz, 1H), 4.31 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 3.92-3.78 (m, 4H), 3.71-3.62 (m, 1H), 2.21 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 1.13 (d, J = 6.4 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, C D C l ₃) 159.19, 134.66, 130.34, 129.39, 120.20, 113.80, 83.96, 69.95, 69.27, 55.27, 17.94; I R (薄膜) 3 4 4 7 , 2 9 7 6 , 2 8 6 8 , 1 6 1 2 , 1 5 1 3 , 1 5 4 5 , 1 0 3 3 , 8 1 9 c m ⁻¹; H R M S - E S I (m / z) [C ₁₃ H ₁₈ N a O ₃] ⁺ の計算値 2 4 5 . 1 1 4 8 2 、実測値 2 4 5 . 1 1 3 4 。また、(2 S , 3 S) - 3 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) ペンタ - 4 - エン - 2 - オール (3 2 5 m g 、 1 . 4 6 m m o l 、 収率 1 4 %) を透明な無色の油状物として単離した。¹H NMR (300 MHz, C D C l ₃) 7.31-7.21 (m, 2H), 6.94-6.85 (m, 2H), 5.79-5.62 (m, 1H), 5.45-5.15 (m, 1H), 4.57 (d, J = 11.2 Hz, 1H), 4.28 (d, J = 11.1 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.74-3.64 (m, 1H), 3.50 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 2.83-2.69 (m, 1H), 1.18 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 1

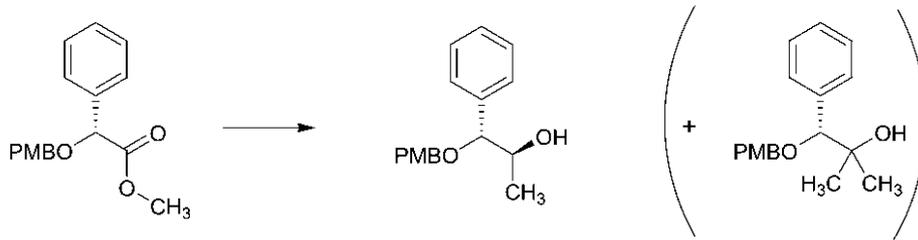
.12 (d, $J = 6.2$ Hz, 3H); IR (薄膜) 3455, 2869, 1513, 1247, 1069, 1034, 820 cm^{-1} 。

【0141】

実施例5C: (1R, 2S) - 1 - ((4-メトキシベンジル)オキシ) - 1 - フェニルプロパン - 2 - オールの調製

【0142】

【化39】



10

【0143】

水素化ホウ素リチウム (THF中2M、3.93 mL、7.86 mmol) およびメチルリチウム (THF中1.6M、3.93 mL、6.29 mmol) の溶液を Et_2O (29.1 mL) により調製し、ドライアイス/アセトン浴により -78 に冷却した。約5 min 後、 Et_2O (9 mL) に溶解したメチル (R) - 2 - ((4-メトキシベンジル)オキシ) - 2 - フェニルアセテート (1.5 g、5.24 mmol) の溶液を、添加漏斗によりゆっくりと加えた。反応を一晩かけて rt にゆっくりと温めた。20 h 後、反応を NH_4Cl の飽和水溶液で注意深くクエンチし、 Et_2O で抽出した。合わせた有機層を Na_2SO_4 で乾燥し、濾過し、濃縮した。粗材料を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO_2 、ヘキサン中0-15%の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (744 mg、50%) を濃密な油状物として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 7.43-7.29 (m, 5H), 7.25-7.18 (m, 2H), 6.90-6.85 (m, 2H), 4.48 (d, $J = 11.3$ Hz, 1H), 4.26 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 4.23 (d, $J = 11.3$ Hz, 1H), 4.01-3.91 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 1.93 (s, 1H), 1.11 (d, $J = 6.4$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, CDCl_3) 159.24, 138.27, 130.20, 129.45, 128.42, 128.02, 127.84, 113.82, 84.63, 70.82, 70.46, 55.28, 18.15; IR (薄膜) 3440, 2867, 2835, 1611, 1512, 1492, 1452, 1301, 1244, 1172, 1134, 1060, 1030, 952, 818, 755, 701 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) [$\text{C}_{17}\text{H}_{20}\text{O}_3\text{Na}$] $^+$ の計算値 295.1305、実測値 295.1300。また、(R) - 1 - ((4-メトキシベンジル)オキシ) - 2 - メチル - 1 - フェニルプロパン - 2 - オール (353 mg、1.17 mmol、収率22%) を濃密な油状物として単離した。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 7.40-7.29 (m, 5H), 7.25-7.19 (m, 2H), 6.93-6.85 (m, 2H), 4.45 (d, $J = 11.2$ Hz, 1H), 4.23-4.15 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 2.53 (s, 1H), 1.16 (s, 3H), 1.09 (s, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, CDCl_3) 159.23, 138.13, 130.19, 129.47, 128.36, 128.03, 127.86, 113.79, 87.70, 72.85, 70.65, 55.28, 26.17, 24.38; IR (薄膜) 3418, 2973, 2933, 2866, 2835, 1611, 1512, 1452, 1370, 1351, 1244, 1170, 1085, 1062, 1028, 819, 742, 702 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) [$\text{C}_{18}\text{H}_{22}\text{O}_3\text{Na}$] $^+$ の計算値 309.1461、実測値 309.1462。

20

30

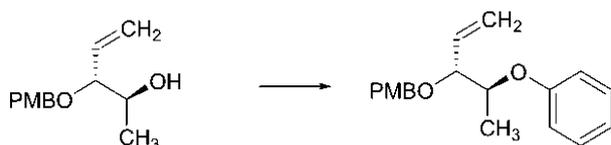
40

【0144】

実施例6A: 1-メトキシ-4-(((3R, 4S)-4-フェノキシペンタ-1-エン-3-イル)オキシ)メチル)ベンゼンの調製

【0145】

【化40】



【0146】

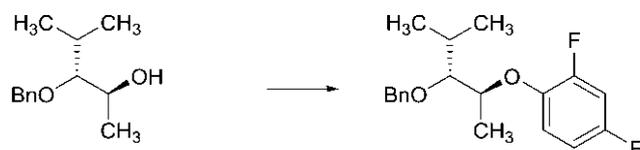
(2S, 3R)-3-(4-メトキシベンジル)オキシ)ペンタ-4-エン-2-オール(1.272g、5.72mmol)、トリフェニルビスマス(V)アセテート(4.15g、7.44mmol)および酢酸銅(II)(0.104g、0.572mmol)の溶液を、N₂雰囲気下で100mLのフラスコ中において無水トルエン(38.1mL)により調製した。次にN-シクロヘキシル-N-メチルシクロヘキサンアミン(1.410mL、6.58mmol)をシリンジにより一度に加えた。得られた青色/緑色の反応を40に加熱して、淡青色/緑色の反応混合物を得た。混合物を温度で96時間攪拌した。反応をrtに冷却し、DCMで洗浄しながらCelite(登録商標)のプラグで濾過し、次に濃縮して、暗黄色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-20%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(1.43g、84%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 7.31-7.20(m, 4H), 6.96-6.81(m, 5H), 5.87(ddd, J = 17.5, 10.0, 7.4 Hz, 1H), 5.35(dt, J = 2.6, 1.7 Hz, 1H), 5.33-5.30(m, 1H), 4.60(d, J = 11.6 Hz, 1H), 4.44-4.35(m, 2H), 3.91(ddt, J = 7.4, 4.7, 1.0 Hz, 1H), 3.79(s, 3H), 1.32(d, J = 6.3 Hz, 3H); ¹³C NMR(126 MHz, CDCl₃) 159.07, 157.93, 135.53, 130.48, 129.40, 129.32, 120.78, 118.99, 116.15, 113.69, 81.88, 76.17, 70.34, 55.25, 15.69; IR(薄膜) 2934, 1598, 1512, 1493, 1242, 1068, 753 cm⁻¹。

【0147】

実施例6B: 1-((2S, 3R)-3-(ベンジルオキシ)-4-メチルペンタン-2-イル)オキシ)-2,4-ジフルオロベンゼンの調製

【0148】

【化41】



【0149】

(2S, 3R)-3-(ベンジルオキシ)-4-メチルペンタン-2-オール(91.5mg、0.439mmol)の溶液を、小さなバイアル中においてDMF(1.76mL)によりrtで調製した。この溶液に、カリウムtert-ブトキシド(71.5mg、0.637mmol)、続いて1,2,4-トリフルオロベンゼン(138μL、1.318mmol)を加えた。混合物を60で72h攪拌した。反応をAcOH(72μL)でクエンチし、次にヘキサン(1.76mL)で希釈した。混合物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-20%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(122.6mg、87%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 7.43-7.37(m, 2H), 7.37-7.31(m, 2H), 7.31-7.25(m, 1H), 7.01(ddd, J = 10.7, 8.9, 5.4 Hz, 1H), 6.68(ddd, J = 9.8, 6.7, 3.0 Hz, 1H), 6.58(dt, J = 8.9, 7.7, 3.1 Hz, 1H), 4.88(d, J = 11.1 Hz, 1H), 4.61(d, J = 11.1 Hz, 1H), 4.51(qd, J = 6.2, 3.8 Hz, 1H), 3.42(dd, J = 6.9, 3.8 Hz, 1H), 1.89(h, J = 6.8 Hz, 1H), 1.38(d, J = 6.3 Hz, 3H), 1.01(d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.99(d, J = 6.8 Hz, 3H); ¹³C NMR(101 MHz, CDCl₃) 158.73(dd, J = 242.0, 2.5 Hz), 149.83

(dd, $J = 241.2, 3.2$ Hz), 146.37 (dd, $J = 12.5, 10.4$ Hz), 138.86, 128.29, 127.99, 127.52, 116.51 (dd, $J = 21.2, 10.3$ Hz), 106.87 (dd, $J = 23.9, 7.0$ Hz), 104.17 (dd, $J = 27.0, 2.1$ Hz), 86.00, 77.45, 74.87, 30.42, 19.66, 18.78, 14.46; ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) -116.80 (d, $J = 15.0$ Hz), -138.81 (d, $J = 15.0$ Hz); IR (薄膜) 2963, 1624, 1510, 1205, 1150, 1099, 698 cm^{-1} ; HRMS-ESI (m/z) [$\text{C}_{19}\text{H}_{26}\text{F}_2\text{NO}_2$] $^+$ の計算値 338.1926、実測値 338.192。

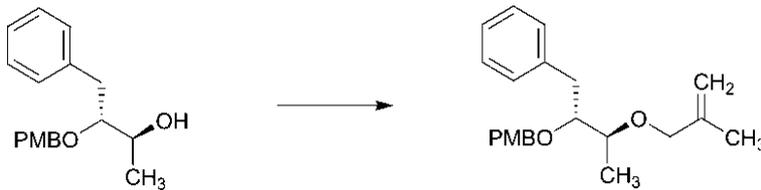
【0150】

実施例 6 C : 1 - メトキシ - 4 - ((((2 R , 3 S) - 3 - ((2 - メチルアリル) オキシ) - 1 - フェニルブタン - 2 - イル) オキシ) メチル) ベンゼンの調製

10

【0151】

【化 4 2】



【0152】

20

(2S, 3R) - 3 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) - 4 - フェニルブタン - 2 - オール (0.145 g, 0.506 mmol) の溶液を、THF (1.688 mL) により調製した。次に、水素化ナトリウム (0.030 g, 0.760 mmol) および TBAI (0.019 g, 0.051 mmol) を加えた。3 - プロモ - 2 - メチルプロパ - 1 - エン (0.153 mL, 1.519 mmol) を一度に加え、反応を還流させた。次に反応を水でクエンチし、 Et_2O (2 x) で抽出し、 Na_2SO_4 で乾燥し、濾過し、濃縮して、油状物にした。粗材料を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO_2 、ヘキサン中 0 - 10 % の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (144.1 mg, 79 %) を透明な無色の油状物として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 7.33-7.18 (m, 5H), 7.12-7.01 (m, 2H), 6.83-6.77 (m, 2H), 5.01-4.92 (m, 1H), 4.89-4.80 (m, 1H), 4.47 (d, $J = 11.0$ Hz, 1H), 4.26 (d, $J = 11.0$ Hz, 1H), 3.94 (d, $J = 12.5$ Hz, 1H), 3.89-3.80 (m, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.63 (dt, $J = 8.5, 4.4$ Hz, 1H), 3.46 (qd, $J = 6.3, 4.3$ Hz, 1H), 2.89 (dd, $J = 13.9, 4.4$ Hz, 1H), 2.79 (dd, $J = 13.9, 8.1$ Hz, 1H), 1.74 (t, $J = 1.1$ Hz, 3H), 1.24 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, CDCl_3) 159.00, 142.65, 139.42, 130.77, 129.57, 129.49, 128.19, 126.01, 113.59, 111.73, 82.70, 76.66, 72.84, 72.64, 55.26, 37.96, 19.68, 15.29; IR (薄膜) 3027, 2932, 1612, 1512, 1495, 1453, 1301, 1246, 1172, 1081, 1035, 898, 820, 743, 699 cm^{-1} ; HRMS-ESI (m/z) [$\text{C}_{22}\text{H}_{29}\text{O}_3$] $^+$ の計算値 341.2111、実測値 341.2095。

30

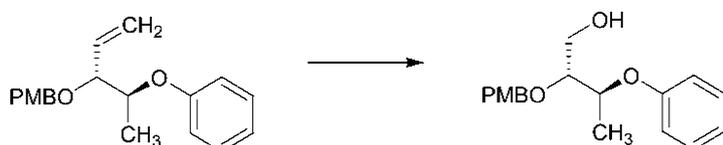
40

【0153】

実施例 7 : (2 R , 3 S) - 2 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) - 3 - フェノキシブタン - 1 - オールの調製

【0154】

【化 4 3】



50

【0155】

100 mL のフラスコ中において、1 - メトキシ - 4 - (((3 R , 4 S) - 4 - フェノキシペンタ - 1 - エン - 3 - イル) オキシ) メチル) ベンゼン (0 . 9 0 8 g , 3 . 0 4 m m o l) および重炭酸ナトリウム (0 . 0 2 6 g , 0 . 3 0 4 m m o l) を、無水 D C M (2 9 . 5 m L) および無水 M e O H (0 . 9 2 8 m L) に溶解した。この溶液に、sudan III 指示薬の 1 % D C M 溶液を 5 滴加え、薄ピンク色の溶液を得た。反応をドライアイス / アセトン浴により - 7 8 に冷却した。約 5 m i n 後、O₃ を、ピンク色が消滅するまで反応中に泡立てた。次に反応を N₂ ガスでパージし、更なる M e O H (9 . 2 8 m L) を加え、続いて固体の水素化ホウ素ナトリウム (0 . 3 4 5 g , 9 . 1 3 m m o l) を一度に加えた。ドライアイス / アセトン浴を取り外すことによって、溶液を r t に温め、反応を一晩撹拌した。18 h 後、T L C は、単一の低い R_f スポットへの変換を示した。反応を H₂ O (5 0 m L) でクエンチし、D C M (3 × 5 0 m L) で抽出した。合わせた有機層を相分離器に通し、濃縮して、無色の油状物を得た。粗油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (S i O₂、ヘキサン中 0 1 0 0 % の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (8 9 3 . 7 m g , 9 7 %) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (300 M H z , C D C l₃) 7.32 - 7.22 (m , 5 H) , 6.99 - 6.84 (m , 5 H) , 4.70 (d , J = 11.2 H z , 1 H) , 4.60 (d , J = 11.2 H z , 1 H) , 4.56 - 4.46 (m , 1 H) , 3.80 (s , 3 H) , 3.76 (d t , J = 6.0 , 4.6 H z , 2 H) , 3.65 (t d , J = 5.0 , 4.4 H z , 1 H) , 1.36 (d , J = 6.3 H z , 3 H) ; ¹³C NMR (75 M H z , C D C l₃) 159.41 , 157.49 , 130.15 , 129.67 , 129.59 , 121.14 , 115.99 , 113.93 , 81.20 , 73.81 , 72.66 , 61.49 , 55.29 , 16.09 ; I R (薄膜) 3 4 2 7 , 2 9 3 4 , 1 6 1 2 , 1 5 8 5 , 1 5 1 2 , 1 4 9 3 , 1 2 4 0 , 1 0 6 7 , 1 0 3 1 , 7 5 2 , 6 9 2 c m⁻¹ ; H R M S - E S I (m / z) [C₁₈H₂₂NaO₄]⁺ の計算値 3 2 5 . 1 4 1 0 、実測値 3 1 5 . 1 3 9 6 。

10

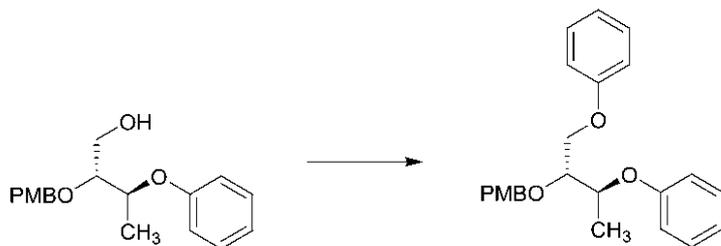
20

【0156】

実施例 8 A : (((2 R , 3 S) - 2 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) ブタン - 1 , 3 - ジイル) ビス (オキシ)) ジベンゼンの調製

【0157】

【化 4 4】



30

【0158】

(2 R , 3 S) - 2 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) - 3 - フェノキシブタン - 1 - オール (1 8 0 m g , 0 . 5 9 5 m m o l) 、トリフェニルピスマス (V) アセテート (4 9 9 m g , 0 . 8 9 3 m m o l) および酢酸銅 (I I) (1 6 . 2 2 m g , 0 . 0 8 9 m m o l) の溶液を、N₂ 雰囲気下で 2 0 m L のバイアル中において無水トルエン (3 . 9 7 m L) により調製した。次に N - シクロヘキシル - N - メチルシクロヘキサミン (1 6 6 μ L , 0 . 7 7 4 m m o l) をシリンジにより一度に加えた。得られた青色 / 緑色の反応を 4 0 に加熱し、淡青色 / 緑色の反応混合物を得て、48 h 撹拌した。48 h 後、T L C は出発材料の消費および単一の高い R_f スポットへの変換を示した。反応を室温に冷却し、D C M を用いて C e l i t e (登録商標) のプラグで濾過し、有機物を濃縮して、暗黄色の油状物を得た。粗油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (S i O₂、ヘキサン中 0 2 0 % の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (2 0 8 . 5 m g , 9 3 %) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 M H z , C D C l₃) 7.33 - 7.20 (m , 6 H) , 6.98 - 6.82 (m , 8 H) , 4.71 (s , 2 H) , 4.68 - 4.60 (m , 1 H) , 4.17 (d d

40

50

, J = 10.0, 4.8 Hz, 1H), 4.10 (dd, J = 10.0, 5.5 Hz, 1H), 3.98 (q, J = 5.1 Hz, 1H), 3.78 (s, 3H), 1.40 (d, J = 6.2 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 159.31, 158.67, 157.61, 130.42, 129.66, 129.53, 129.45, 120.95, 120.92, 115.92, 114.62, 113.80, 78.80, 73.70, 73.03, 67.81, 55.26, 15.52; IR (薄膜) 2933, 1598, 1492, 1237, 1081, 1032, 751, 691 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) $[\text{C}_{24}\text{H}_{26}\text{NaO}_4]^+$ の計算値 401.1723、実測値 401.1725。

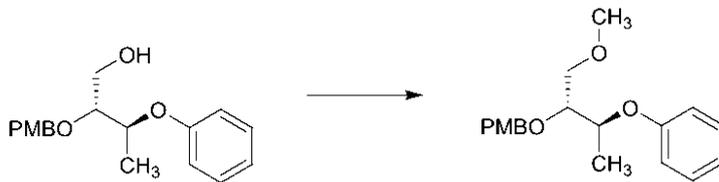
【0159】

実施例 8B: 1 - メトキシ - 4 - ((((2R, 3S) - 1 - メトキシ - 3 - フェノキシブタン - 2 - イル) オキシ) メチル) ベンゼンの調製

10

【0160】

【化45】



【0161】

小さなバイアル中において、(2R, 3S) - 2 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) - 3 - フェノキシブタン - 1 - オール (150 mg、0.496 mmol) を N_2 雰囲気下で DCM (2.48 mL) に溶解した。 $\text{N}_1, \text{N}_1, \text{N}_8, \text{N}_8$ - テトラメチルナフタレン - 1, 8 - ジアミン (319 mg、1.488 mmol) を一度に加え、続いてテトラフルオロオロホウ酸トリメチルオキシニウム (110 mg、0.744 mmol) を加えた。得られた透明な無色の溶液を rt で一晩攪拌した。20 h 後、TLC は出発材料が完全に消費されたことを示した。反応を NaHCO_3 飽和水溶液 (20 mL) で注意深くクエンチし、DCM (3×20 mL) で抽出した。合わせた有機層を 1N HCl (2×20 mL)、続いてブライン (20 mL) で洗浄した。有機層を相分離器により濾過し、濃縮して、淡黄色の油状物を得た。粗油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO_2 、ヘキサン中 0-30% の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (117.5 mg、75%) を淡黄色の油状物として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 7.31 - 7.22 (m, 4H), 6.97 - 6.81 (m, 5H), 4.65 (s, 2H), 4.54 (qd, J = 6.2, 4.9 Hz, 1H), 3.79 (s, 3H), 3.74 (q, J = 5.0 Hz, 1H), 3.56 (dd, J = 10.3, 4.6 Hz, 1H), 3.51 (dd, J = 10.2, 5.3 Hz, 1H), 3.33 (s, 3H), 1.34 (d, J = 6.3 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 159.20, 157.78, 130.71, 129.50, 129.48, 120.79, 115.91, 113.73, 79.30, 73.71, 72.64, 72.32, 59.22, 55.26, 15.44; IR (薄膜) 2894, 1598, 1513, 1493, 1240, 1083, 1034, 752, 692 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) $[\text{C}_{19}\text{H}_{24}\text{NaO}_4]^+$ の計算値 339.1567、実測値 339.1569。

20

30

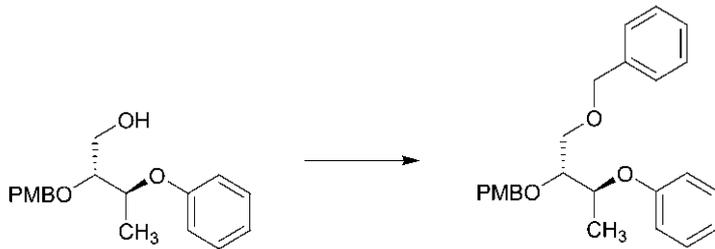
【0162】

実施例 8C: 1 - ((((2R, 3S) - 1 - (ベンジルオキシ) - 3 - フェノキシブタン - 2 - イル) オキシ) メチル) - 4 - メトキシベンゼンの調製

40

【0163】

【化46】



【0164】

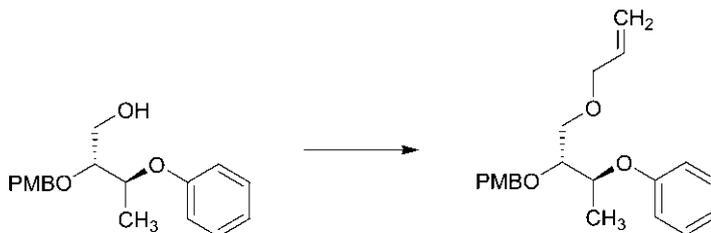
20 mLのバイアル中において、(2R,3S)-2-(4-メトキシベンジル)オキシ)-3-フェノキシブタン-1-オール(145 mg、0.480 mmol)の溶液をDMF(3.84 mL)により調製し、氷水浴により0℃に冷却した。約5 min後、水素化ナトリウム(33.6 mg、0.839 mmol)を加え、得られた反応混合物を2 h 攪拌して、rtにゆっくりと温めた。2 h後、反応を0℃に冷却し、(プロモメチル)ベンゼン(99 μL、0.911 mmol)をシリンジにより一度に加え、続いてヨウ化テトラブチルアンモニウム(17.71 mg、0.048 mmol)を加えた。反応を一晩攪拌し、氷浴を融解させながらrtにゆっくりと温めた。18 h後、TLCは出発材料が完全に消費されたことを示した。反応をNH₄Clの飽和水溶液(20 mL)でクエンチし、Et₂O(3×20 mL)で抽出した。合わせた有機層をブライン(20 mL)で洗浄し、MgSO₄で乾燥し、濾過し、濃縮して、黄色の油状物を得た。粗油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-20%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(148.4 mg、79%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 7.34 - 7.20 (m, 9H), 6.96 - 6.87 (m, 3H), 6.87 - 6.82 (m, 2H), 4.65 (s, 2H), 4.63 - 4.55 (m, 1H), 4.51 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 3.82 - 3.74 (m, 4H), 3.68 - 3.57 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.3 Hz, 3H); ¹³C NMR(101 MHz, CDCl₃) 159.19, 157.76, 138.25, 130.69, 129.51, 129.48, 128.32, 127.58, 127.54, 120.75, 115.86, 113.72, 79.41, 73.65, 73.37, 72.67, 69.77, 55.25, 15.40; IR(薄膜) 3029, 2862, 1597, 1512, 1493, 1240, 1086, 1033, 751, 693 cm⁻¹; HRMS-ESI(m/z) [C₂₅H₂₈NaO₄]⁺の計算値415.1880、実測値415.1876。

【0165】

実施例8D: 1-(((2R,3S)-1-(アリルオキシ)-3-フェノキシブタン-2-イル)オキシ)メチル)-4-メトキシベンゼンの調製

【0166】

【化47】



【0167】

20 mLのバイアル中において、(2R,3S)-2-(4-メトキシベンジル)オキシ)-3-フェノキシブタン-1-オール(145.4 mg、0.481 mmol)の溶液をDMF(3.85 mL)により調製し、氷水浴により0℃に冷却した。約5 min後、水素化ナトリウム(33.7 mg、0.842 mmol)を加え、得られた反応混合物を2 h 攪拌し、その間にrtにゆっくりと温めた。2 h後、反応を0℃に冷却し、臭化

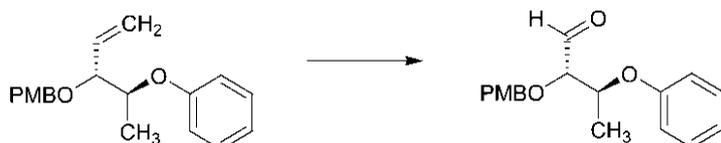
アリル (79 μ L, 0.914 mmol) をシリンジにより一度に加え、続いてヨウ化テトラブチルアンモニウム (17.76 mg, 0.048 mmol) を加えた。反応を一晩攪拌し、氷浴を融解させながら rt にゆっくりと温めた。20 h 後、TLC は出発材料が消費されたことを示した。反応を NH_4Cl の飽和水溶液 (20 mL) でクエンチし、 Et_2O (3 \times 20 mL) で抽出した。合わせた有機層をブライン (20 mL) で洗浄し、 MgSO_4 で乾燥し、濾過し、濃縮して、黄色の油状物を得た。粗油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO_2 、ヘキサン中 0-20% の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (145.4 mg, 88%) を透明な無色の油状物として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 7.31 - 7.20 (m, 4H), 6.96 - 6.82 (m, 5H), 5.87 (ddt, $J = 17.1, 10.8, 5.5$ Hz, 1H), 5.25 (dq, $J = 17.2, 1.7$ Hz, 1H), 5.16 (dq, $J = 10.4, 1.4$ Hz, 1H), 4.66 (s, 2H), 4.56 (qd, $J = 6.2, 4.8$ Hz, 1H), 3.97 (dt, $J = 5.5, 1.5$ Hz, 2H), 3.85 - 3.73 (m, 4H), 3.62 (dd, $J = 10.2, 4.8$ Hz, 1H), 3.56 (dd, $J = 10.2, 5.5$ Hz, 1H), 1.35 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 159.20, 157.78, 134.75, 130.74, 129.52, 129.47, 120.76, 116.81, 115.91, 113.73, 79.35, 73.77, 72.72, 72.30, 69.84, 55.26, 15.37; IR (薄膜) 2865, 1598, 1513, 1493, 1240, 1084, 1034, 752 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) [$\text{C}_{21}\text{H}_{26}\text{NaO}_4$] $^+$ の計算値 365.1723、実測値 365.1731。

【0168】

実施例 9、工程 1: (2S, 3S) - 2 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) - 3 - フェノキシブタナールの調製

【0169】

【化 48】



【0170】

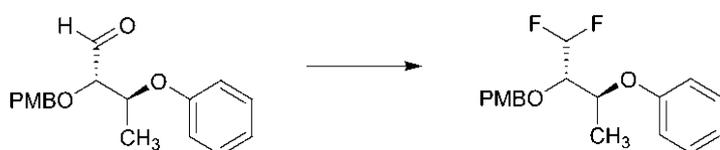
100 mL のフラスコ中において、1 - メトキシ - 4 - ((((3R, 4S) - 4 - フェノキシペンタ - 1 - エン - 3 - イル) オキシ) メチル) ベンゼン (0.500 g, 1.676 mmol) および重炭酸ナトリウム (0.014 g, 0.168 mmol) を、無水 DCM (15.23 mL) および無水 MeOH (1.523 mL) に溶解した。この溶液に、sudan III 指示薬の 1% DCM 溶液を 5 滴加え、薄ピンク色の溶液を得た。反応をドライアイス / アセトン浴により -78 に冷却した。約 5 min 後、 O_3 を、ピンク色が消滅するまで反応中に泡立てた。次に反応を窒素ガスで約 5 min パージし、次にジメチルスルフィド (1.231 mL, 16.76 mmol) をシリンジにより一度に加えた。ドライアイス / アセトン浴を取り外すことによって、得られた溶液を rt に温め、反応を一晩攪拌した。18 h 後、TLC は出発材料の消費および主な低い R_f 生成物への変換を示した。反応を H_2O (50 mL) でクエンチし、DCM (3 \times 50 mL) で抽出した。合わせた有機層を相分離器に通し、濃縮して、無色の油状物を得た。粗油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO_2 、ヘキサン中 0-30% の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (385.2 mg, 77%) を透明な無色の油状物として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 9.69 (d, $J = 1.6$ Hz, 1H), 7.34 - 7.21 (m, 4H), 7.00 - 6.81 (m, 5H), 4.81 - 4.55 (m, 3H), 4.00 (dd, $J = 3.9, 1.7$ Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 1.36 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 202.57, 159.62, 157.03, 129.86, 129.63, 129.20, 121.50, 116.02, 113.97, 84.11, 74.29, 73.09, 55.29, 15.70; IR (薄膜) 2934, 2836, 1731, 1513, 1491, 1232, 1087, 1031, 752 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) [$\text{C}_{18}\text{H}_{24}\text{NaO}_4$] $^+$ の計算値 318.1700、実測値 318.1703。

【0171】

実施例 9、工程 2：1 - ((((2 S , 3 S) - 1 , 1 - ジフルオロ - 3 - フェノキシブタン - 2 - イル) オキシ) メチル) - 4 - メトキシベンゼンの調製

【 0 1 7 2 】

【 化 4 9 】



【 0 1 7 3 】

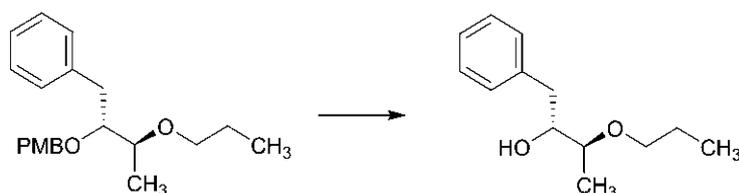
(2 S , 3 S) - 2 - ((4 - メトキシベンジル) オキシ) - 3 - フェノキシブタン - 1 - ール (0 . 3 6 1 g , 1 . 2 0 2 m m o l) の溶液を D C M (1 2 . 0 2 m L) により調製し、氷 / 水浴で 0 に冷却した。約 5 m i n 後、D e o x o f l u o r (トルエン中約 5 0 % 、 2 . 6 6 g , 6 . 0 1 m m o l) を一度に加え、続いて 1 滴の M e O H を加えた。溶液を一晚攪拌し、氷を融解させながら r t にゆっくりと温めた。1 8 h 後、T L C は出発材料が消費されたことを示し、混合物を濃縮して、橙色の油状物を得た。粗油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (S i O ₂ 、ヘキサン中 0 1 0 0 % の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (3 4 2 . 1 m g , 8 8 %) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 M H z , C D C l ₃) 7.32 - 7.23 (m , 4 H) , 7.01 - 6.94 (m , 1 H) , 6.92 - 6.83 (m , 4 H) , 5.91 (t d , J = 55.0 , 3.4 H z , 1 H) , 4.77 (d , J = 11.1 H z , 1 H) , 4.69 (d , J = 11.1 H z , 1 H) , 4.56 (p , J = 6.2 H z , 1 H) , 3.85 - 3.74 (m , 4 H) , 1.37 (d , J = 6.3 H z , 3 H) ; ¹⁹F NMR (376 M H z , C D C l ₃) -127.71 (d d , J = 290.8 , 2.1 H z) , -13 0.30 (d d , J = 290.8 , 4.0 H z) ; I R (薄膜) 2 9 3 7 , 1 5 9 8 , 1 5 1 4 , 1 4 9 4 , 1 2 4 1 , 1 0 7 4 , 1 0 3 5 , 7 5 4 c m ⁻¹ .

【 0 1 7 4 】

実施例 1 0 A : (2 R , 3 S) - 1 - フェニル - 3 - プロポキシブタン - 2 - オールの調製

【 0 1 7 5 】

【 化 5 0 】



【 0 1 7 6 】

D C M (2 4 6 6 μ L) および水 (2 7 4 μ L) 中の 1 - メトキシ - 4 - ((((2 R , 3 S) - 1 - フェニル - 3 - プロポキシブタン - 2 - イル) オキシ) メチル) ベンゼン (9 0 m g , 0 . 2 7 4 m m o l) の磁気的に攪拌された混合物に、D D Q (6 5 . 3 m g , 0 . 2 8 8 m m o l) を加え、反応を氷浴により 0 で攪拌した。反応を、r t に徐々に温め、一晚攪拌した。反応を N a O H (1 N) でクエンチし、D C M (3 x) で抽出した。合わせた有機層を相分離器に通し、次に濃縮した。粗材料をフラッシュカラムクロマトグラフィー (S i O ₂ 、ヘキサン中 0 1 0 % の酢酸エチル) により精製した。生成物は、望ましくない p - アニスアルデヒド副産物と共に共溶出した。材料を D C M (2 m L) で希釈し、P S - T s N H N H ₂ (3 0 0 m g 、固体支持体) を加え、混合物を r t で 1 h 攪拌した。反応を濾過し、濾液を濃縮して、標記化合物 (5 1 . 2 m g , 8 5 %) を黄色の油状物として得た。¹H NMR (400 M H z , C D C l ₃) 7.36-7.28 (m , 2 H) , 7.27-7.1 9 (m , 3 H) , 3.92 (d q , J = 8.3 , 4.0 H z , 1 H) , 3.48 (d t , J = 9.1 , 6.6 H z , 1 H) , 3.42-3.32 (m , 2 H) , 2.80 (d d , J = 13.9 , 4.6 H z , 1 H) , 2.72 (d d , J = 13.9 , 8.7 H z , 1 H) ,

10

20

30

40

50

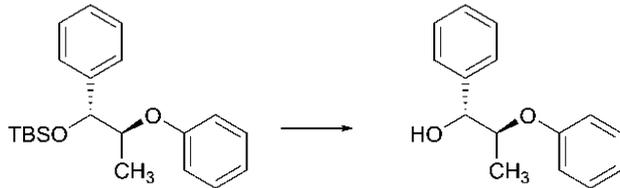
2.01 (d, $J = 3.5$ Hz, 1H), 1.64-1.52 (m, 3H), 1.20 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H), 0.92 (t, $J = 7.4$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (126 MHz, CDCl_3) 138.74, 129.24, 128.49, 126.32, 77.44, 74.26, 70.62, 38.86, 23.30, 13.98, 10.67; IR (薄膜) 3441, 2962, 2933, 2875, 1604, 1495, 1453, 1381, 1330, 1253, 1133, 1091, 1031, 984, 745, 699 cm^{-1} .

【0177】

実施例10B: (1R, 2S) - 2 - フェノキシ - 1 - フェニルプロパン - 1 - オールの調製

【0178】

【化51】



【0179】

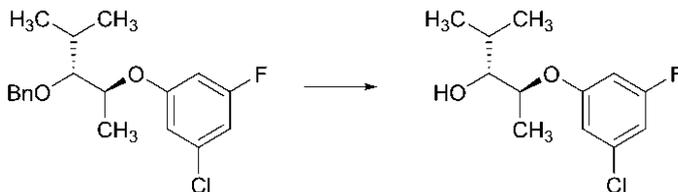
tert - ブチルジメチル ((1R, 2S) - 2 - フェノキシ - 1 - フェニルプロポキシ) シラン (359.8 mg, 1.050 mmol) の溶液を、20 mL のバイアル中において N_2 下で THF (5.25 mL) により調製し、0 に冷却した。5 min 後、TBAF (1.05 mL, 1.050 mmol) をシリンジにより 2 min かけて滴加した。反応混合物を rt に温め、4 h 攪拌した。反応を NH_4Cl の飽和水溶液 (25 mL) でクエンチし、 Et_2O (3 × 25 mL) で抽出した。合わせた有機層を MgSO_4 で乾燥し、濾過し、濃縮して、透明な無色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO_2 、ヘキサン中 0-30% の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (96.0 mg, 40%) を透明な無色の油状物として得た。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 7.40 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 7.34 (t, $J = 7.5$ Hz, 2H), 7.27 (td, $J = 7.1, 2.0$ Hz, 3H), 7.00-6.88 (m, 3H), 5.02 (t, $J = 3.3$ Hz, 1H), 4.55 (qd, $J = 6.3, 3.5$ Hz, 1H), 2.63 (d, $J = 3.0$ Hz, 1H), 1.17 (d, $J = 6.3$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 157.44, 140.15, 129.65, 128.34, 127.64, 126.39, 121.37, 116.31, 77.93, 75.12, 13.01; IR (薄膜) 3443, 2985, 1598, 1493, 1239, 1063, 752, 701 cm^{-1} .

【0180】

実施例10C: 1 - (((2S, 3R) - 3 - (ベンジルオキシ) - 4 - メチルペンタン - 2 - イル) オキシ) - 3 - クロロ - 5 - フルオロベンゼンの調製

【0181】

【化52】



【0182】

小さなバイアル中において、1 - (((2S, 3R) - 3 - (ベンジルオキシ) - 4 - メチルペンタン - 2 - イル) オキシ) - 3 - クロロ - 5 - フルオロベンゼン (160.0 mg, 0.475 mmol) を、エタノール (1.58 mL) およびシクロヘキサン (0.79 mL) に溶解した。この溶液に、パラジウム担持炭 (5 wt%, 50.6 mg, 0.024 mmol) を一度に加え、得られた反応混合物を 70 に加熱し、一晚攪拌した

10

20

30

40

50

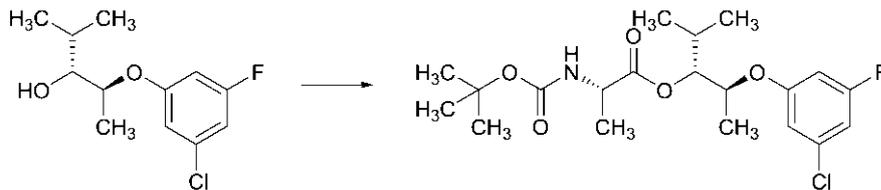
。反応を r t に冷却し、酢酸エチルで溶出しながら C e l i t e (登録商標) のプラグで濾過し、濃縮して、油状物にした。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (S i O ₂、ヘキサン中 0 - 5 0 % のアセトン) により精製して、標記化合物 (1 1 4 . 0 m g、9 7 %) を黄色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃) 6.69 (dp, J = 4.2, 2.0 Hz, 2H), 6.51 (dt, J = 10.5, 2.3 Hz, 1H), 4.40 (qd, J = 6.2, 4.0 Hz, 1H), 3.52 (dd, J = 7.5, 4.0 Hz, 1H), 2.02 (s, 1H), 1.80 (dq, J = 13.7, 6.9 Hz, 1H), 1.30 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 1.01 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.9 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, C D C l ₃) 163.45 (d, J = 248.0 Hz), 159.06 (d, J = 12.1 Hz), 135.54 (d, J = 13.5 Hz), 112.29 (d, J = 3.3 Hz), 108.95 (d, J = 25.2 Hz), 102.10 (d, J = 24.8 Hz), 77.96, 75.72, 29.85, 18.95, 18.38, 13.13; ¹⁹F NMR (376 MHz, C D C l ₃) -109.95; I R (薄膜) 3 4 6 4 , 2 9 6 3 , 1 6 0 6 , 1 4 5 2 , 1 1 4 0 , 1 0 4 4 , 9 1 7 , 8 3 3 c m ⁻¹。

【 0 1 8 3 】

実施例 1 1 : (2 S , 3 R) - 2 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェノキシ) - 4 - メチルペンタン - 3 - イル (t e r t - ブトキシカルボニル) - L - アラニネートの調製

【 0 1 8 4 】

【 化 5 3 】



【 0 1 8 5 】

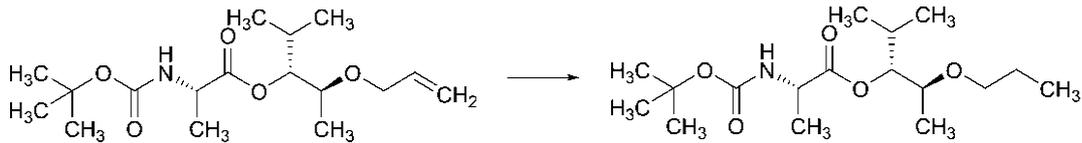
小さなバイアル中において、(2 S , 3 R) - 2 - (3 - クロロ - 5 - フルオロフェノキシ) - 4 - メチルペンタン - 3 - オール (1 1 4 m g、0 . 4 6 2 m m o l)、(t e r t - ブトキシカルボニル) - L - アラニン (1 0 9 m g、0 . 5 7 8 m m o l) および D M A P (5 . 6 5 m g、0 . 0 4 6 m m o l) を、N ₂ 下で D C M (2 . 3 1 m L) に溶解し、氷 / 水浴で 0 に冷却した。約 5 m i n 後、E D C I (1 4 3 m g、0 . 9 2 4 m m o l) を一度に加え、得られた淡黄色の反応を一晩攪拌し、氷を融解させながら r t にゆっくりと温めた。反応を濃縮して、油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (S i O ₂、ヘキサン中 0 - 3 0 % の酢酸エチル) により精製して、標記化合物 (1 7 1 . 0 m g、8 9 %) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃) 6.72-6.63 (m, 2H), 6.49 (dt, J = 10.5, 2.3 Hz, 1H), 5.04 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.00 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 4.45 (p, J = 6.1 Hz, 1H), 4.35 (p, J = 7.5 Hz, 1H), 2.05 (dq, J = 13.5, 6.7 Hz, 1H), 1.46 (s, 9H), 1.43 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, C D C l ₃) 172.97, 163.41 (d, J = 248.0 Hz), 159.01 (d, J = 12.3 Hz), 155.12, 135.49 (d, J = 13.4 Hz), 112.14 (d, J = 3.2 Hz), 109.04 (d, J = 25.3 Hz), 102.09 (d, J = 24.8 Hz), 79.89, 79.28, 73.49, 49.56, 28.78, 28.35, 19.22, 18.65, 17.34, 15.01; ¹⁹F NMR (376 MHz, C D C l ₃) -110.00; I R (薄膜) 3 3 7 3 , 2 9 7 4 , 1 7 1 3 , 1 6 0 5 , 1 1 4 0 , 1 0 6 3 c m ⁻¹; H R M S - E S I (m / z) [C ₂₀ H ₂₉ C I F N N a O ₅] ⁺ の計算値 4 4 0 . 1 6 1 1、実測値 4 4 0 . 1 6 1 1。

【 0 1 8 6 】

実施例 1 2 A : (3 R , 4 S) - 2 - メチル - 4 - プロポキシペンタン - 3 - イル (t e r t - ブトキシカルボニル) - L - アラニネートの調製

【 0 1 8 7 】

【化54】



【0188】

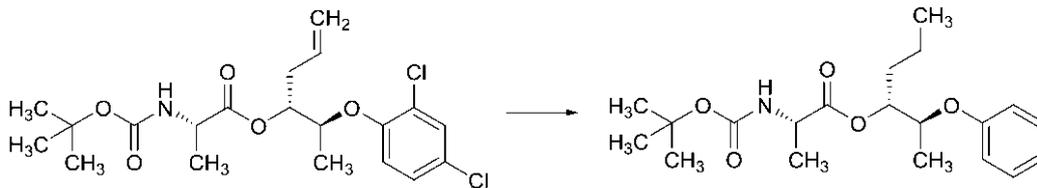
(2*S*, 3*R*)-2-(アリルオキシ)-4-メチルペンタン-3-イル(tert-ブトキシカルボニル)-L-アラニネート(0.1g、0.304mmol)および5%パラジウム担持炭(0.097g、0.046mmol)を含有するバイアルに、N₂下でEtOAc(1.52mL)を加えた。次に雰囲気をバルーンにより水素に交換し、反応を一晩撹拌した。20h後、反応をCelite(登録商標)で濾過し、EtOAcで洗浄した。次に濾液を濃縮し、粗物質をNMRにより分析して、完全な変換を確認した。粗材料を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-20%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(92.2mg、87%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 5.09(d, J = 7.8 Hz, 1H), 4.85(t, J = 5.9 Hz, 1H), 4.39-4.22(m, 1H), 3.49(p, J = 6.2 Hz, 1H), 3.46-3.27(m, 2H), 2.03(h, J = 6.7 Hz, 1H), 1.59-1.48(m, 2H), 1.44(s, 9H), 1.41(d, J = 7.2 Hz, 3H), 1.11(d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.94-0.86(m, 9H); ¹³C NMR(126 MHz, CDCl₃) 172.97, 155.07, 79.86, 79.65, 74.27, 70.63, 49.53, 28.57, 28.33, 23.22, 19.34, 18.98, 17.32, 15.34, 10.66; IR(薄膜) 3359, 2967, 2936, 2877, 1716, 1502, 1455, 1366, 1340, 1248, 1167, 1107, 1066, 1021 cm⁻¹; HRMS-ESI(m/z) [C₁₇H₃₃NO₅Na]⁺の計算値354.2251、実測値354.2251。

【0189】

実施例12B:(2*S*, 3*R*)-2-フェノキシヘキサン-3-イル(tert-ブトキシカルボニル)-L-アラニネートの調製

【0190】

【化55】



【0191】

(*S*)-(2*S*, 3*R*)-2-(2,4-ジクロロフェノキシ)ヘキサ-5-エン-3-イル2-((tert-ブトキシカルボニル)アミノ)プロパノエート(166.7mg、0.386mmol)およびパラジウム(乾燥重量に基づいて炭素の5wt%、82mg、0.039mmol)を含有する20mLのバイアルに、酢酸エチル(3.86mL)を加えた。黒色の反応混合物をバルーンによりH₂ガスでフラッシュした。得られた反応を室温で一晩撹拌した。18h後、TLCおよびUPLCは出発材料が消費されたことを示した。反応を、EtOAc(2×10mL)で溶出しながらセライトのプラグで濾過した。得られた溶液を濃縮して、黄色の油状物を得た。粗材料を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-40%の酢酸エチル)により精製して、標記化合物(108.7mg、77%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 7.33-7.19(m, 2H), 7.00-6.91(m, 1H), 6.91-6.81(m, 2H), 5.09(dt, J = 8.7, 4.2 Hz, 1H), 5.05-4.91(m, 1H), 4.45(qd, J = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 4.29(t, J = 7.6 Hz, 1H), 1.79-1.57(m, 2H), 1.53-1.16(m, 2H), 1.45(s, 9H), 1.36(d,

10

20

30

40

50

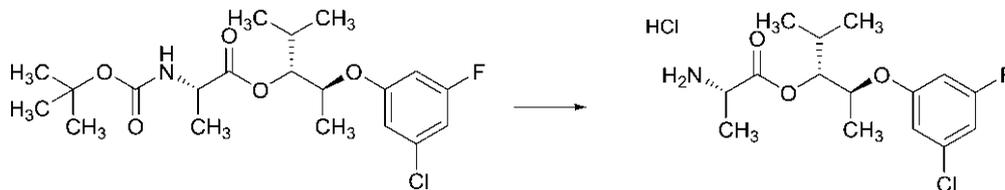
J = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (t, J = 7.4 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) 172.96, 157.80, 155.05, 129.51, 121.19, 116.26, 115.59, 79.71, 76.45, 74.82, 49.49, 31.85, 28.32, 18.66, 15.64, 13.91; IR (薄膜) 3368, 2963, 1712, 1493, 1239, 1163, 1057, 752 cm^{-1} ; HRMS - ESI (m/z) [$\text{C}_{20}\text{H}_{31}\text{NNaO}_5$] $^+$ の計算値 388.2097、実測値 388.2077。

【0192】

実施例13A、工程1：(2S, 3R)-2-(3-クロロ-5-フルオロフェノキシ)-4-メチルペンタン-3-イル-L-アラニネート塩酸塩の調製

【0193】

【化56】



【0194】

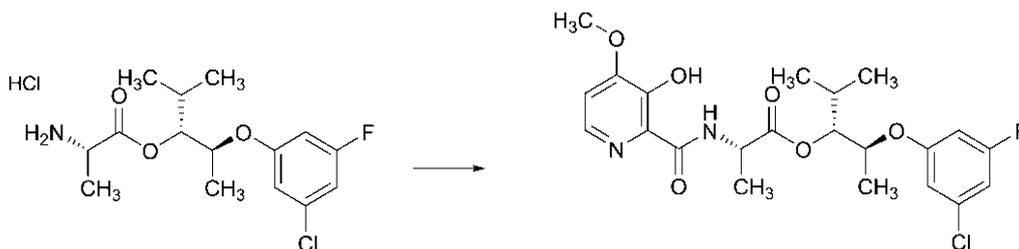
小さなバイアル中において、(2S, 3R)-2-(3-クロロ-5-フルオロフェノキシ)-4-メチルペンタン-3-イル(tert-ブトキシカルボニル)-L-アラニネート(171.0 mg、0.409 mmol)をDCM(2 mL)に溶解した。塩化水素(ジオキサン中4 M、1.534 mL、6.14 mmol)をシリンジにより一度に加えた。得られた透明な無色の反応を室温で3 h 攪拌した。3 h 後、TLCは出発材料の完全な消費およびベースライン生成物への変換を示した。反応を N_2 流下で濃縮し、真空オーブンで乾燥して、標記化合物(145 mg、定量収率)を透明な無色の油状物として得て、これを次の工程に直接使用した。ESI MS m/z 318.2 [(M+H) $^+$]

【0195】

実施例13A、工程2：(2S, 3R)-2-(3-クロロ-5-フルオロフェノキシ)-4-メチルペンタン-3-イル(3-ヒドロキシ-4-メトキシピコリノイル)-L-アラニネートの調製

【0196】

【化57】



【0197】

(2S, 3R)-2-(3-クロロ-5-フルオロフェノキシ)-4-メチルペンタン-3-イル-L-アラニネート塩酸塩(145 mg、0.409 mmol)を含有するバイアルに、3-ヒドロキシ-4-メトキシピコリン酸(90 mg、0.532 mmol)および((1H-ベンゾ[d][1,2,3]トリアゾール-1-イル)オキシ)トリ(ピロリジン-1-イル)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(V)(277 mg、0.532 mmol)を加えた。DCM(8.18 mL)を加え、続いてN-エチル-N-イソプロピルプロパン-2-アミン(428 μL 、2.454 mmol)を45秒間かけ

10

20

30

40

50

て滴加した。10 min 後、大部分の固体が溶解し、得られた淡ピンク色の反応を rt で一晩撹拌した。次に反応を減圧下で濃縮して、橙色の油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー (SiO₂、ヘキサン中 0-50% のアセトン) により精製して、標記化合物 (174.9 mg、2つの工程を合わせて 91%) を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 12.11 (s, 1H), 8.49 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 6.88 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 6.74-6.59 (m, 2H), 6.48 (dt, J = 10.5, 2.3 Hz, 1H), 5.04 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 4.77 (p, J = 7.3 Hz, 1H), 4.47 (p, J = 6.1 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.07 (dq, J = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.61 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, CDCl₃) 171.71, 168.87, 163.40 (d, J = 248.1 Hz), 158.95 (d, J = 12.2 Hz), 155.44, 148.84, 140.54, 135.51 (d, J = 13.5 Hz), 130.46, 112.15 (d, J = 3.2 Hz), 109.55, 109.10 (d, J = 25.2 Hz), 102.06 (d, J = 4.7 Hz), 79.77, 73.50, 56.09, 48.11, 28.76, 19.26, 18.31, 17.30, 15.05; ¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃) -109.89; IR (薄膜) 3370, 2968, 1743, 1605, 1527, 1438, 1139, 730 cm⁻¹; HRMS - ESI (m/z) [C₂₂H₂₇ClFN₂O₆]⁺ の計算値 469.1536、実測値 469.1531。

10

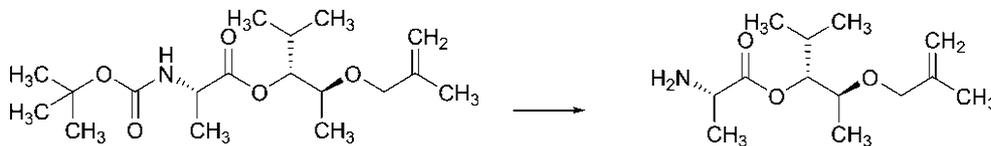
【0198】

実施例 13B、工程 1: (3R, 4S)-2-メチル-4-((2-メチルアリル)オキシ)ペンタン-3-イル-L-アラニネートの調製

【0199】

20

【化58】



【0200】

(3R, 4S)-2-メチル-4-((2-メチルアリル)オキシ)ペンタン-3-イル(tert-ブトキシカルボニル)-L-アラニネート (0.155 g、0.451 mmol) を DCM (2.26 mL) に溶解し、氷浴で 0 に冷却した。5 min 後、TFA (0.522 mL、6.77 mmol) をシリンジにより 30 秒間かけて滴加した。反応を、氷水浴の取り出しにより rt にして、rt で 2 h 撹拌した。2 h 後、TLC は出発材料が消費されたことを示した。反応を DCM で希釈し、NaHCO₃ 飽和水溶液で洗浄した。水層を DCM (3x) で抽出した。合わせた有機層を相分離器に通し、濃縮して、粗標記化合物を濃密な油状物として得て、それを更に精製することなく次の工程に直接使用した。IR (薄膜) 3361, 2969, 1735, 1677, 1456, 1374, 1179, 1126, 1101, 907, 721 cm⁻¹; HRMS - ESI (m/z) [C₁₃H₂₆NO₃]⁺ の計算値 244.1907、実測値 244.1910。

30

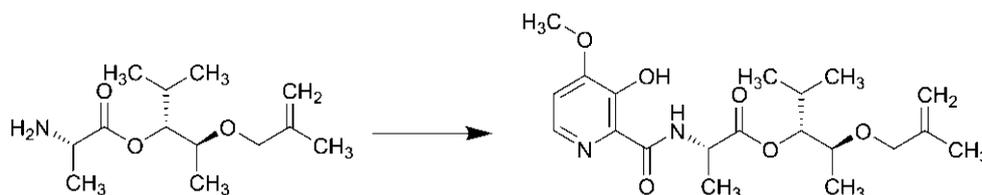
【0201】

実施例 13B、工程 2: (3R, 4S)-2-メチル-4-((2-メチルアリル)オキシ)ペンタン-3-イル(3-ヒドロキシ-4-メトキシピコリノイル)-L-アラニネートの調製

40

【0202】

【化59】



50

【0203】

粗(3R, 4S)-2-メチル-4-((2-メチルアリル)オキシ)ペンタン-3-イル-L-アラニネートを無水DCM(4.4mL)に溶解した。3-ヒドロキシ-4-メトキシピコリン酸(0.084g、0.496mmol)、PyBOP(0.258g、0.496mmol)およびエチル-N-イソプロピルプロパン-2-アミン(0.260mL、1.489mmol)を加えた。次に反応をrtで2h撹拌した。2h後、材料を濃縮して、油状物にした。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-30%のアセトン)により精製して、標記化合物(74.4mg、2つの工程を合わせて42%)を濃密な無色の油状物として得た。¹H NMR(500 MHz, CDCl₃)

12.18 (s, 1H), 8.54 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 4.96-4.91 (m, 2H), 4.88-.83 (m, 1H), 4.80-4.71 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.92 (d, J = 12.4 Hz, 1H), 3.85 (d, J = 12.3 Hz, 1H), 3.62-3.56 (m, 1H), 2.04 (dq, J = 13.4, 6.8 Hz, 1H), 1.72 (t, J = 1.1 Hz, 3H), 1.60-1.57 (m, 3H), 1.14 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 3.5 Hz, 3H), 0.91 (d, J = 3.7 Hz, 3H); ¹³C NMR(126 MHz, CDCl₃) 171.83, 168.69, 155.34, 148.73, 142.32, 140.46, 130.54, 112.11, 109.40, 80.21, 73.54, 72.68, 56.07, 48.13, 28.62, 19.59, 19.34, 18.53, 17.56, 15.09; IR(薄膜) 3370, 2968, 2939, 1739, 1649, 1576, 1527, 1481, 1438, 1366, 1330, 1280, 1263, 1212, 1182, 1150, 1101, 1060, 943, 849, 800 cm⁻¹; ESI MS m/z 395.3 [(M+H)⁺].

10

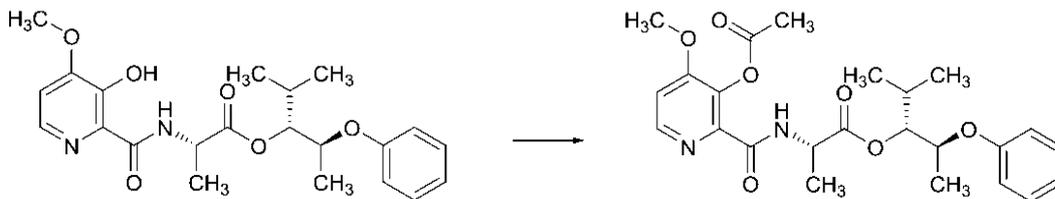
20

【0204】

実施例14A:(3R, 4S)-2-メチル-4-フェノキシペンタン-3-イル(3-アセトキシ-4-メトキシピコリノイル)-L-アラニネートの調製

【0205】

【化60】



30

【0206】

(3R, 4S)-2-メチル-4-フェノキシペンタン-3-イル(3-ヒドロキシ-4-メトキシピコリノイル)-L-アラニネート(83.8mg、0.201mmol)を含有する小さなバイアルに、ピリジン(0.976mL、12.1mmol)、続いて無水酢酸(0.951mL、10.1mmol)をシリンジにより加えた。得られた透明な無色の反応混合物を、rtで1h撹拌した。反応を濃縮し、5mLのトルエンで希釈し、再濃縮して、油状物を得た。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-50%のアセトン)により精製して、標記化合物(78.1mg、85%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 8.57 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.30-7.21 (m, 2H), 7.00 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 6.93 (tt, J = 7.3, 1.0 Hz, 1H), 6.90-6.80 (m, 2H), 5.06 (dd, J = 6.3, 5.3 Hz, 1H), 4.76 (p, J = 7.3 Hz, 1H), 4.50 (p, J = 6.2 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.16-2.09 (m, 1H), 1.56 (d, J = 7.1 Hz, 3H), 1.28 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ¹³C NMR(101 MHz, CDCl₃) 172.24, 168.88, 162.49, 159.50, 157.43, 146.68, 141.58, 137.55, 129.53, 121.09, 115.92, 109.79, 80.11, 72.60, 56.29, 48.28, 28.71, 20.73, 19.37, 18.72, 17.01, 15.52; IR(薄膜) 3383, 2967, 1771, 1677, 1507, 1198, 1174 m⁻¹; HRMS-E SI (m/z) [C₂₄H₃₁N₂O₇]⁺の計算値459.21

40

50

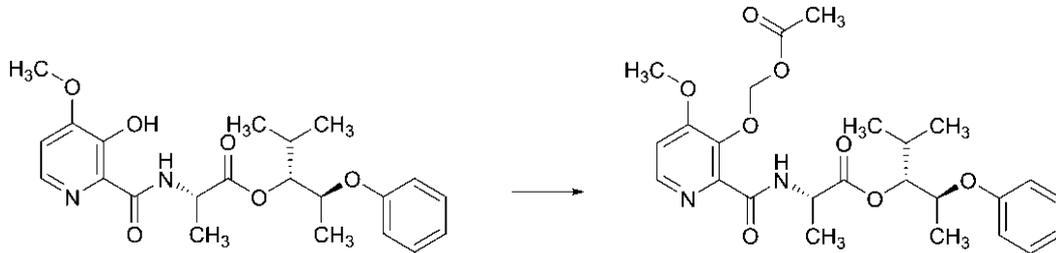
26、実測値459.2096。

【0207】

実施例14B：(3R, 4S)-2-メチル-4-フェノキシペンタン-3-イル(3-(アセトキシメトキシ)-4-メトキシピコリノイル)-L-アラニネートの調製

【0208】

【化61】



10

【0209】

小さなバイアル中において、(S)-(3R, 4S)-2-メチル-4-フェノキシペンタン-3-イル2-(3-ヒドロキシ-4-メトキシピコリンアミド)プロパノエート(81.9 mmol, 0.197 mmol)をアセトン(1.5 mL)に溶解した。この溶液に、炭酸カリウム(54.4 mg, 0.393 mmol)を一度に加え、続いて酢酸プロモメチル(0.039 mL, 0.393 mmol)をシリンジにより一度に加えた。得られた曇った白色の溶液を50 で2 h 攪拌した。2 h 後、TLCは出発材料が完全に消費されたことを示した。次に反応をN₂流下で濃縮して、白色の油状物にした。油状物を、フラッシュカラムクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中0-50%のアセトン)により精製して、標記化合物(77.4 mg, 81%)を透明な無色の油状物として得た。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 8.40 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, J = 5.3 Hz, 1H), 7.31-7.20 (m, 2H), 6.99-6.84 (m, 4H), 5.80-5.71 (m, 2H), 5.07 (dd, J = 6.4, 5.1 Hz, 1H), 4.80 (p, J = 7.2 Hz, 1H), 4.50 (p, J = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.21-2.09 (m, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.58 (d, J = 7.1 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ¹³C NMR (101 MHz, CDCl₃) 172.39, 170.27, 163.07, 160.32, 157.45, 145.73, 144.05, 142.58, 129.56, 121.11, 115.93, 109.61, 89.62, 80.12, 72.63, 56.20, 48.43, 28.72, 20.88, 19.42, 18.69, 16.98, 15.63; IR (薄膜) 3389, 2968, 1753, 1678, 1496, 1239, 1203, 1004 cm⁻¹; HRMS - ESI (m/z) [C₂₅H₃₃N₂O₈]⁺の計算値489.2231、実測値489.2212。

20

30

【0210】

実施例A：殺真菌活性の評価：コムギの葉枯病(ジモセプトリアトリチチ(Zymoseptoria tritici); BayerコードSEPTTR)：

工業銘柄の材料をアセトンに溶解し、次にこれを、110 ppmのトリトンX-100を含有する9容量の水(H₂O)と混合した。殺真菌剤溶液を、自動吹付散布機(automated booth sprayer)を使用してコムギ実生に流出するまで施用した。散布された植物を、全て、更なる取り扱いの前に風乾した。特記しない限りは、全ての殺真菌剤を、前述の方法を使用して全ての標的の病気に対するこれらの活性について評価した。コムギの葉枯病および褐色さび病の活性も、軌道散布施用(track spray application)を使用して評価し、この場合、0.1%のTrycol 5941を散布液剤に含有するEC製剤として、殺真菌剤を製剤化した。

40

【0211】

コムギ植物(品種Yuma)を、温室において50%鉬質土壌/50%無土壌Metroミックス中の種から、第一葉が完全に出現するまで、1ポットあたり7~10個の実生で成長させた。これらの植物には、殺真菌剤処理の前または後のいずれかにおいてジモセプトリアトリチチ(Zymoseptoria tritici)の水性孢子懸濁液を接種した。接種した後、

50

植物を100%の相対湿度で(20で暗霧チャンパーに1日、続いて点灯霧チャンパーに2~3日間)保持して、胞子を発芽させ、葉を感染させた。次に植物を、病気が発症するように、20に設定した温室に移した。病気の症状が未処理の植物の第一葉に完全に発現した時、感染レベルを0~100パーセントの病気重篤度のスケールで評価した。病気防除のパーセントは、処理植物と未処理植物の病気重篤度の比を使用して計算した。

【0212】

実施例B：殺真菌活性の評価：コムギ褐色さび病(ブッシニアトリチシナ(*Puccinia triticina*); BayerコードPUC CRT)：

コムギ植物(品種Yuma)を、温室において50%鉍質土壌/50%無土壌Metroミックス中の種から、第一葉が完全に出現するまで、1ポットあたり7~10個の実生で成長させた。これらの植物には、殺真菌剤処理の前または後のいずれかにおいてブッシニアトリチシナ(*Puccinia triticina*)の水性孢子懸濁液を接種した。接種した後、植物を100%の相対湿度で22の暗霧室に一晚保持して、胞子を発芽させ、葉を感染させた。次に植物を、病気が発症するように、24に設定した温室に移した。殺真菌剤、施用および病気の評価は、実施例Aに記載された手順に従った。

10

【0213】

実施例C：殺真菌活性の評価：コムギ包えい枯病(レプトスファエリアノドルム(*Leptosphaeria nodorum*); BayerコードLEPTNO)：

コムギ植物(品種Yuma)を、温室において50%鉍質土壌/50%無土壌Metroミックス中の種から、第一葉が完全に出現するまで、1ポットあたり7~10個の実生で成長させた。これらの植物には、殺真菌剤処理の24時間後にレプトスファエリアノドルム(*Leptosphaeria nodorum*)の水性孢子懸濁液を接種した。接種した後、植物を100%の相対湿度で(20で暗霧チャンパーに1日、続いて点灯霧チャンパーに2日間)保持して、胞子を発芽させ、葉を感染させた。次に植物を、病気が発症するように、20に設定した温室に移した。殺真菌剤、施用および病気の評価は、実施例Aに記載された手順に従った。

20

【0214】

実施例D：殺真菌活性の評価：リンゴそうか病(ベンツリアイナエクアリス(*Venturia inaequalis*); BayerコードVENTIN)：

リンゴ実生(品種McIntosh)を無土壌Metroミックスにおいて1ポットあたり1個の植物で成長させた。広がっている2個の若葉を上部に有する(植物の下部の旧葉を刈り込んだ)実生を、試験に使用した。植物を、殺真菌剤処理の24時間後にベンツリアイナエクアリス(*Venturia inaequalis*)の孢子懸濁液で接種し、100%の相対湿度の22霧チャンパーに48時間保持し、次に病気が発症するように、20に設定した温室に移した。殺真菌剤、施用および散布葉における病気の評価は、実施例Aに記載された手順に従った。

30

【0215】

実施例E：殺真菌活性の評価：テンサイの葉斑病(セルコスポラベチコラ(*Cercospora beticola*); BayerコードCER CBE)：

テンサイ(品種HH88)を、無土壌Metroミックスで成長させ、試験する前に均一な植物サイズを維持するため、定期的に刈り込んだ。植物には、殺真菌剤処理の24時間後に孢子懸濁液を接種した。接種した植物を22の霧チャンパーに48時間保持し、次に病気の症状が完全に発現するまで、底を通気した透明なプラスチックフードの、24に設定した温室でインキュベートした。殺真菌剤、施用および散布葉における病気の評価は、実施例Aに記載された手順に従った。

40

【0216】

実施例F：殺真菌活性の評価：アジアダイズさび病(ファコプロソラパキリジ(*Phakopsora pachyrhizi*); BayerコードPHAKPA)：

工業銘柄の材料をアセトンに溶解し、次にこれを、0.011%のTween20を含有する9容量のH₂Oと混合した。殺真菌剤溶液を、自動吹付散布機を使用してダイズ実

50

生に流出するまで施用した。散布された植物を、全て、更なる取り扱いの前に風乾した。

【0217】

ダイズ実生（品種Williams 82）を無土壌Metroミックスにおいて1ポットあたり1個の植物で成長させた。2週齢の実生を試験に使用した。植物を、殺真菌剤処理の3日前または1日後のいずれかに接種した。植物を、22 および100%の相対湿度の暗霧室で24時間インキュベートし、次に、病気が発症するように、23 の成長室に移した。病気の重篤度を散布葉において評価した。

【0218】

実施例G：殺真菌活性の評価：オオムギ雲形病（リンコスポリウムセカリス（*Rhynchosporium secalis*）；BayerコードRHYNSE）： 10

オオムギ実生（品種Harrington）を、それぞれ8～12個の植物を有するポットにより無土壌Metroミックスで繁殖させ、第一葉が完全に出現した時に試験に使用した。試験植物には、殺真菌剤処理の24時間後にリンコスポリウムセカリス（*Rhynchosporium secalis*）の水性孢子懸濁液を接種した。接種した後、植物を100%の相対湿度で22 の霧室に48時間保持した。次に植物を、病気が発症するように、20 に設定した温室に移した。殺真菌剤、施用および散布葉における病気の評価は、実施例Aに記載された手順に従った。

【0219】

実施例H：殺真菌活性の評価：イネのいもち病（ピリクラオリザ（*Pyricularia oryzae*）；BayerコードPYRIOR）： 20

イネ実生（品種Japonica）を、それぞれ8～14個の植物を有するポットにより無土壌Metroミックスで繁殖させ、12～14日齢の時に試験に使用した。試験植物には、殺真菌剤処理の24時間後にピリクラオリザ（*Pyricularia oryzae*）の水性孢子懸濁液を接種した。接種した後、植物を100%の相対湿度で22 の霧室に48時間保持して、胞子を発芽させ、葉を感染させた。次に植物を、病気が発症するように、24 に設定した温室に移した。殺真菌剤、施用および散布葉における病気の評価は、実施例Aに記載された手順に従った。

【0220】

実施例I：殺真菌活性の評価：トマトの夏疫病（アルテルナリアソラニ（*Alternaria solani*）；BayerコードALTESO）： 30

トマト植物（品種Outdoor Girl）を、それぞれ1個の植物を有するポットにより無土壌Metroミックスで繁殖させ、12～14日齢の時に使用した。試験植物には、殺真菌剤処理の24時間後にアルテルナリアソラニ（*Alternaria solani*）の水性孢子懸濁液を接種した。接種した後、植物を100%の相対湿度で22 で48時間保持して、胞子を発芽させ、葉を感染させた。次に植物を、病気が発症するように、22 の成長室に移した。殺真菌剤、施用および散布葉における病気の評価は、実施例Aに記載された手順に従った。

【0221】

実施例J：殺真菌活性の評価：キュウリ炭疽病（コレトリクムラゲナリウム（*Colletotrichum lagenarium*）；BayerコードCOLL LA）： 40

キュウリ実生（品種Bush Pickle）を、それぞれ1個の植物を有するポットにより無土壌Metroミックスで繁殖させ、12～14日齢の時に試験に使用した。試験植物には、殺真菌剤処理の24時間後にコレトリクムラゲナリウム（*Colletotrichum lagenarium*）の水性孢子懸濁液を接種した。接種した後、植物を100%の相対湿度で22 の霧室に48時間保持して、胞子を発芽させ、葉を感染させた。次に植物を、病気が発症するように、22 に設定した成長室に移した。殺真菌剤、施用および散布葉における病気の評価は、実施例Aに記載された手順に従った。

【0222】

【表 1 - 1】

表 1. 化合物の構造、調製方法、および外観

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
1		実施例 1B; 実施例 2, 実施例 3C; 実施例 4B; 実施例 5B; 実施例 6B; 実施例 10A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
2		実施例 1B; 実施例 2, 実施例 3C; 実施例 4B; 実施例 5B; 実施例 6B; 実施例 10A; 実施例 11; 実施例 12B.	透明な無色の油状物
3		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
4		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
5		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物

10

20

30

40

【表 1 - 2】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
6		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
7		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
8		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
9		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
10		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
11		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物

【表 1 - 3】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
12		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
13		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
14		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
15		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
16		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物

10

20

30

40

【表 1 - 4】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
17		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物	10
18		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物	20
19		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物	30
20		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物	
21		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物	40

【表 1 - 5】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
22		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
23		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
24		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
25		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
26		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
27		実施例 4C; 実施例 5C; 実施例 6A; 実施例 10B; 実施例 11.	透明な無色の油状物

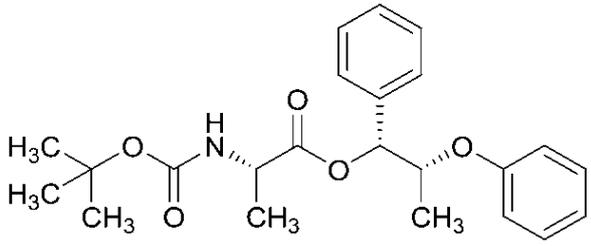
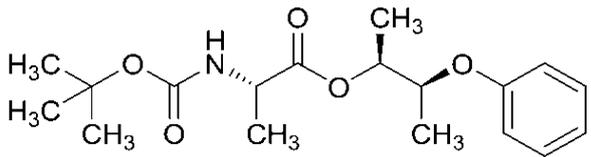
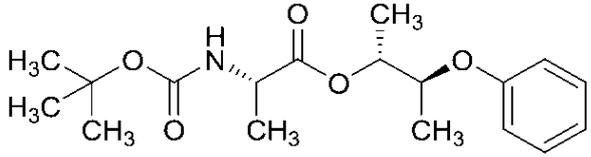
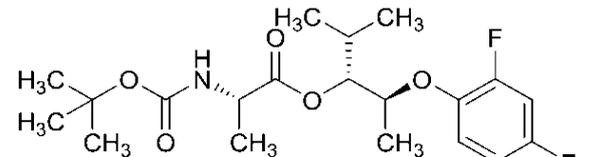
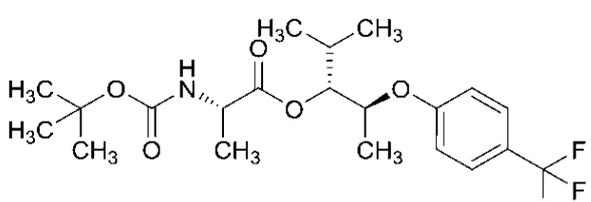
10

20

30

40

【表 1 - 6】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
28		実施例 4C; 実施例 5C; 実施例 6A; 実施例 10B; 実施例 11.	透明な無色の油状物
29		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
30		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
31		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6B; 実施例 10C; 実施例 11.	透明な無色の油状物
32		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6B; 実施例 10C; 実施例 11.	透明な無色の油状物

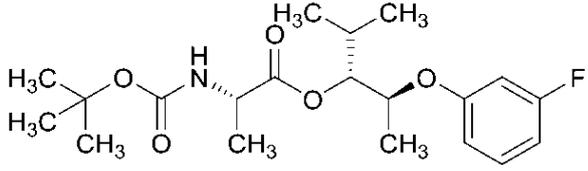
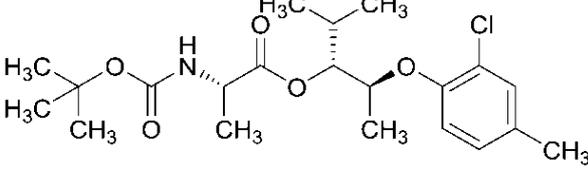
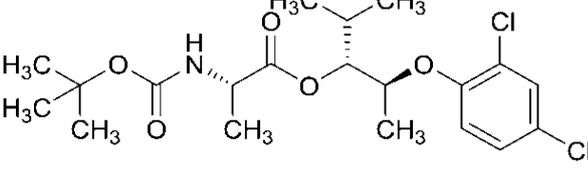
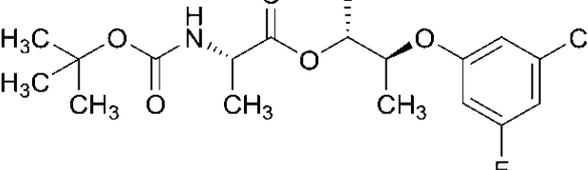
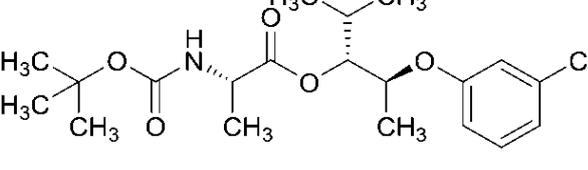
10

20

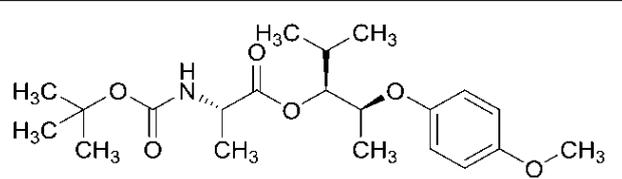
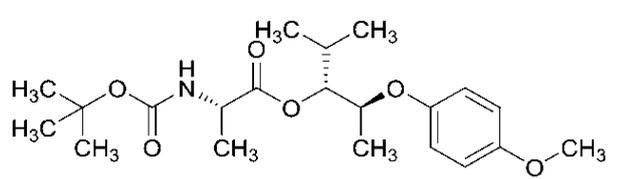
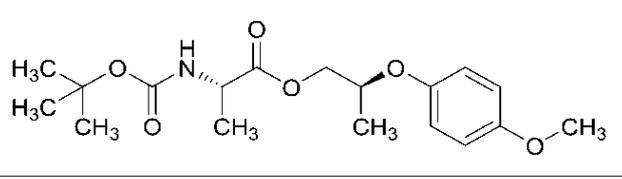
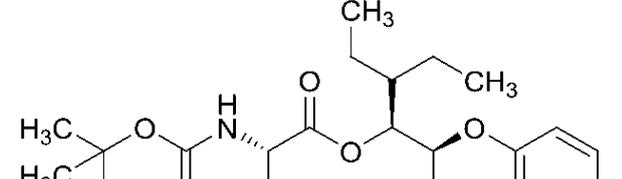
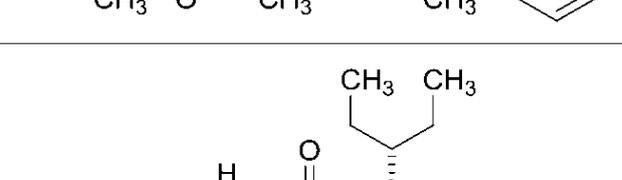
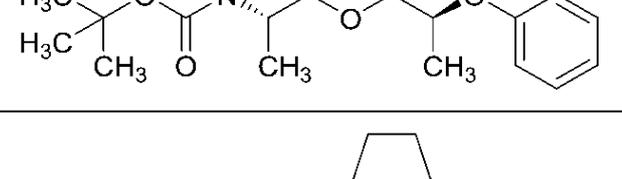
30

40

【表 1 - 7】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
33		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6B; 実施例 10C; 実施例 11.	透明な無色 の油状物
34		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6B; 実施例 10C; 実施例 11.	透明な無色 の油状物
35		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6B; 実施例 10C; 実施例 11.	透明な無色 の油状物
36		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6B; 実施例 10C; 実施例 11.	透明な無色 の油状物
37		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6B; 実施例 10C; 実施例 11.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 8】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
38		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
39		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
40		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
41		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
42		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
43		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物

10

20

30

40

【表 1 - 9】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
44		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
45		実施例 1A; 実施例 3A; 実施例 11.	透明な無色の油状物
46		実施例 1D; 実施例 5C; 実施例 6C; 実施例 10A; 実施例 11.	無色の油状物
47		実施例 1D; 実施例 5C; 実施例 6C; 実施例 10A; 実施例 11.	無色の油状物
48		実施例 1D; 実施例 5C; 実施例 6C; 実施例 10A; 実施例 11.	無色の油状物
49		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11.	無色の油状物

10

20

30

40

【表 1 - 10】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
50		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11.	無色の油状物
51		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11.	無色の油状物
52		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11.	無色の油状物
53		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11.	無色の油状物
54		実施例 1D; 実施例 5C; 実施例 6C; 実施例 10A; 実施例 11; 実施例 12A.	無色の油状物
55		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11; 実施例 12A.	無色の油状物
56		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11; 実施例 12A.	無色の油状物

10

20

30

40

【表 1 - 1 1】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
57		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11; 実施例 12A.	無色の油状物
58		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11; 実施例 12A.	無色の油状物
59		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11.	濃密な油状物
60		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11.	無色の油状物
61		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11; 実施例 12A.	無色の油状物
62		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11; 実施例 12A.	無色の油状物
63		実施例 1C; 実施例 3A; 実施例 11; 実施例 12A.	無色の油状物

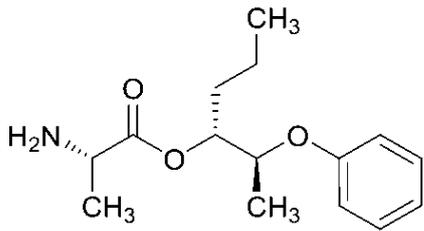
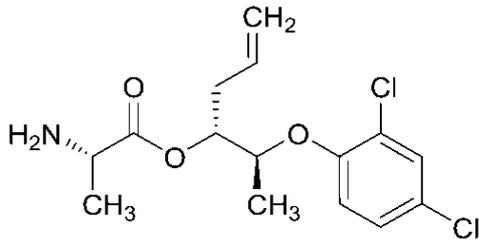
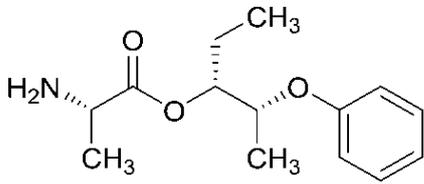
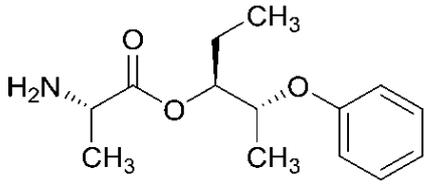
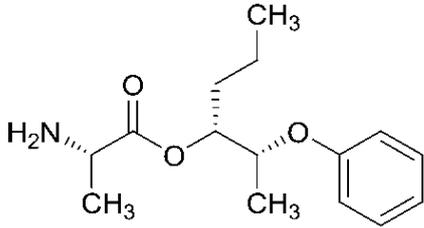
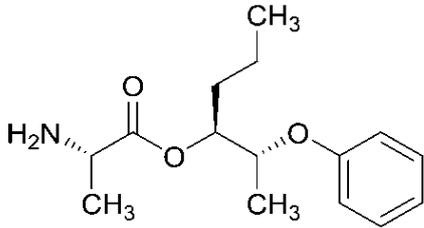
10

20

30

40

【表 1 - 1 2】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
64		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物
65		実施例 13B, 工程 1.	透明な無色 の油状物
66		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物
67		実施例 13A, 工程 1.	淡黄色の油 状物
68		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物
69		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固 体

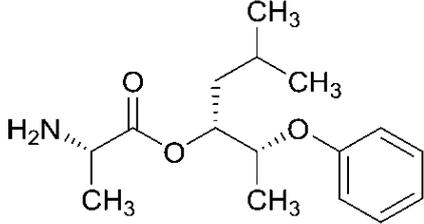
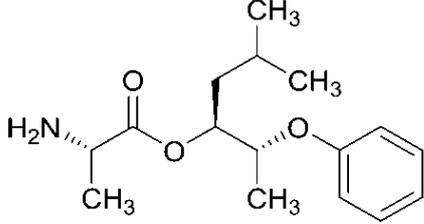
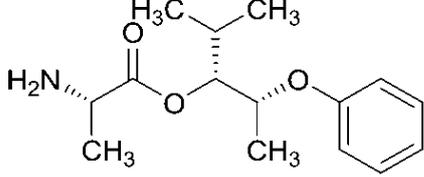
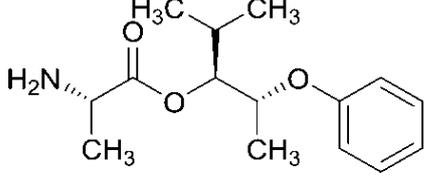
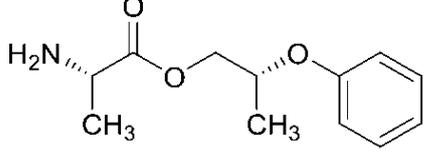
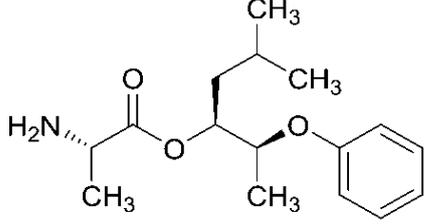
10

20

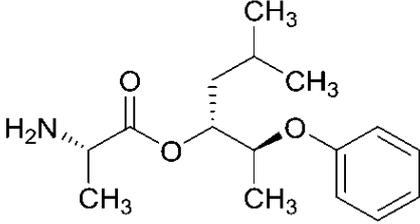
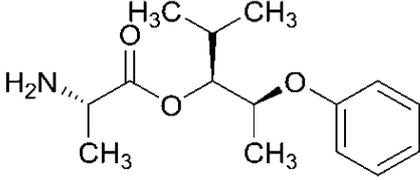
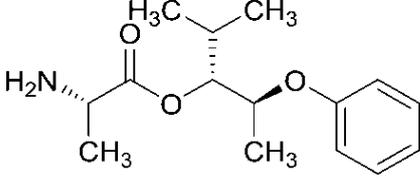
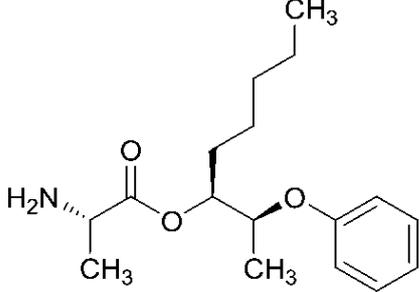
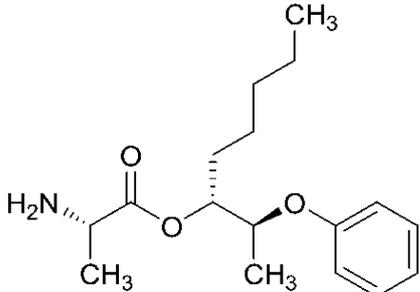
30

40

【表 1 - 1 3】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
70		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物
71		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物
72		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固 体
73		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固 体
74		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固 体
75		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 1 4】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
76		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物
77		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体
78		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体
79		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物
80		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物

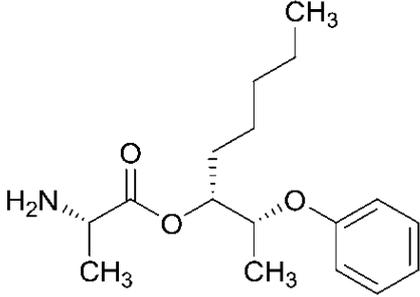
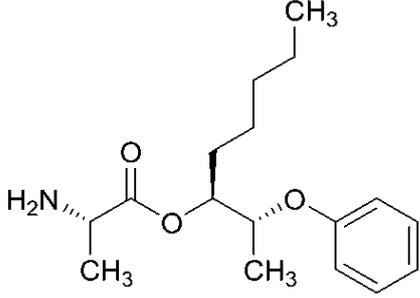
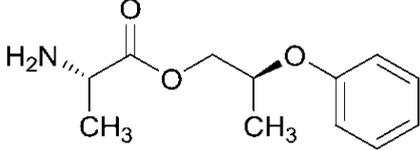
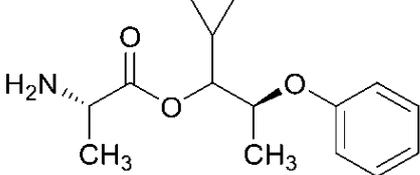
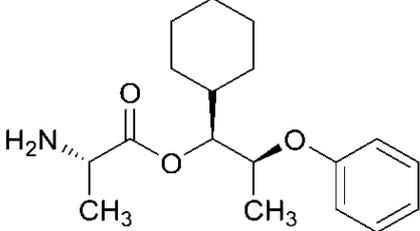
10

20

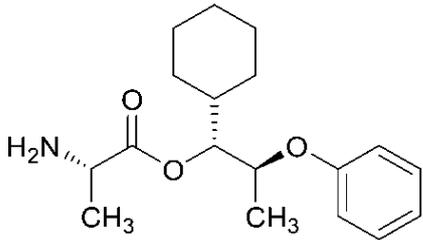
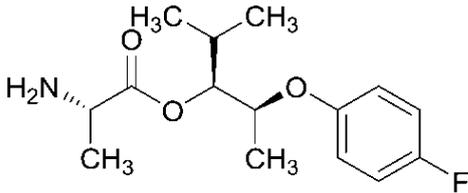
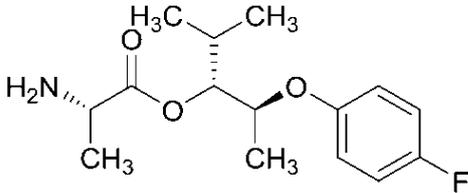
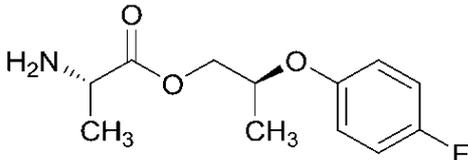
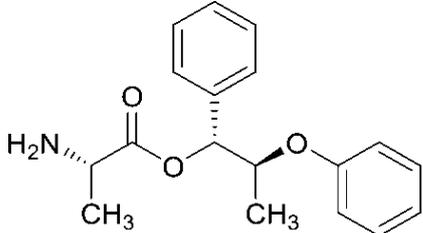
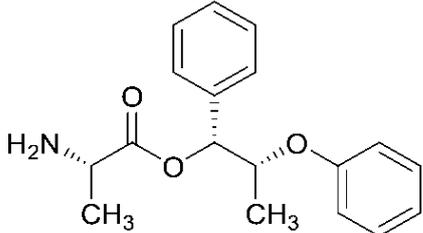
30

40

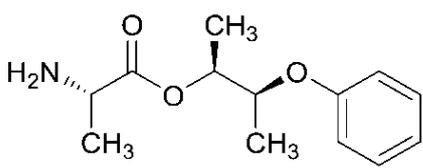
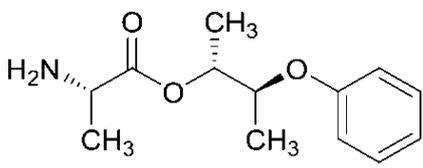
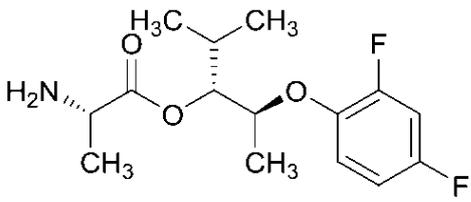
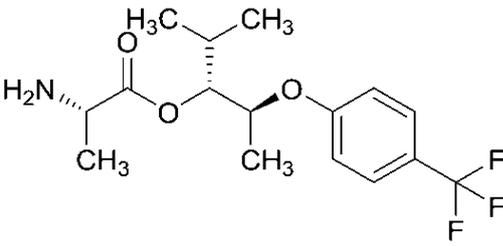
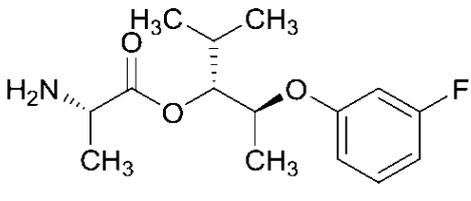
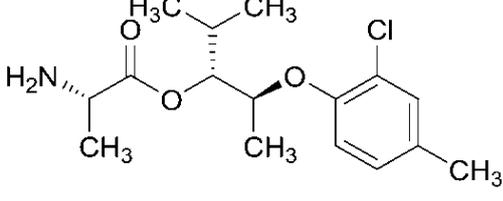
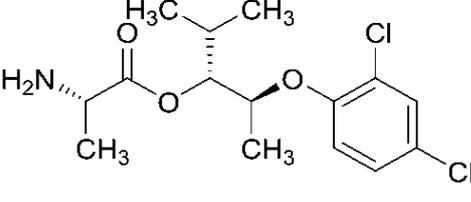
【表 1 - 15】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
81		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体	10
82		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体	20
83		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体	
84		実施例 13A, 工程 1.	淡黄色の油 状物	30
85		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固 体	40

【表 1 - 1 6】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
86		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体
87		実施例 13A, 工程 1.	淡黄色の油状物
88		実施例 13A, 工程 1.	淡黄色の油状物
89		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
90		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
91		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物

【表 1 - 17】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
92		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
93		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
94		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
95		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
96		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
97		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
98		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物

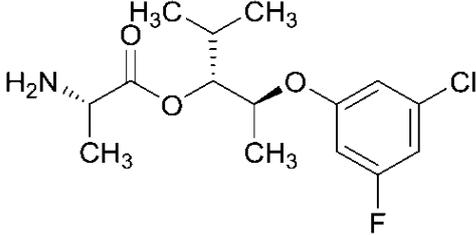
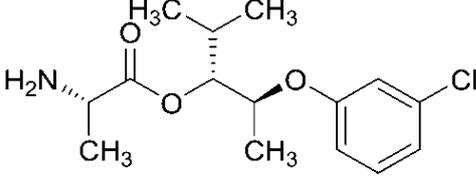
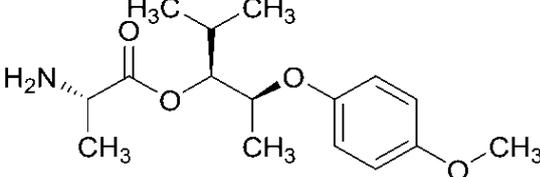
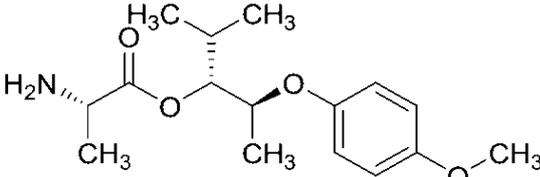
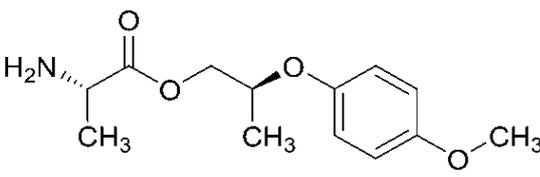
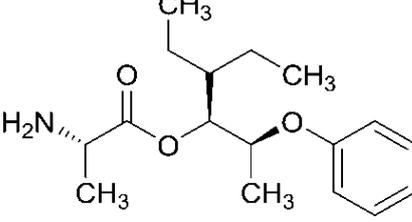
10

20

30

40

【表 1 - 1 8】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
99		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色 の油状物
100		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固 体
101		実施例 13A, 工程 1.	白色の粉末 状の固体
102		実施例 13A, 工程 1.	白色の粉末 状の固体
103		実施例 13A, 工程 1.	白色の粉末 状の固体
104		実施例 13A, 工程 1.	淡黄色の油 状物

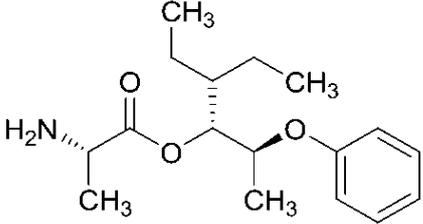
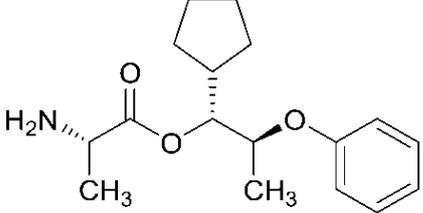
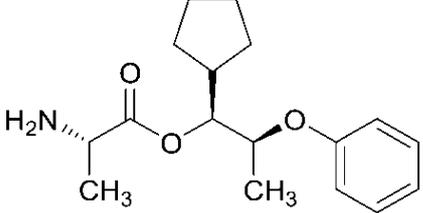
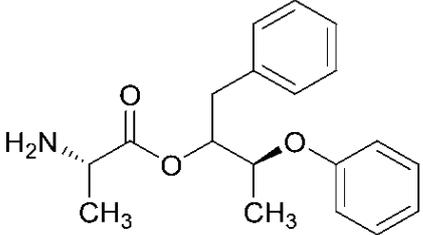
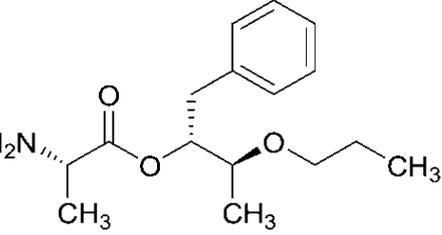
10

20

30

40

【表 1 - 19】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
105		実施例 13A, 工程 1.	淡黄色の油 状物
106		実施例 13A, 工程 1.	淡黄色の油 状物
107		実施例 13A, 工程 1.	淡黄色の油 状物
108		実施例 13A, 工程 1.	黄色の液体
109		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状 物

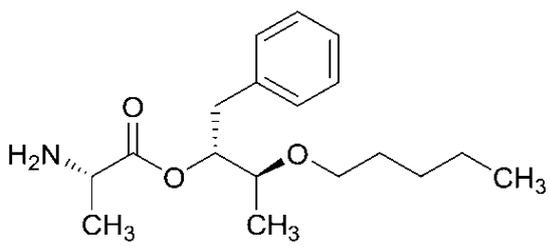
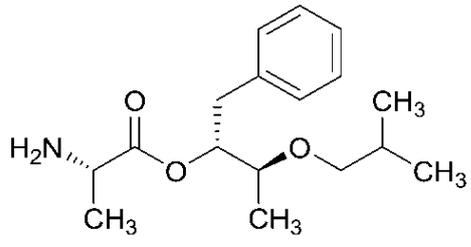
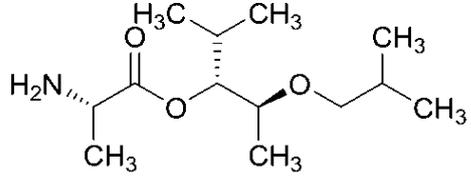
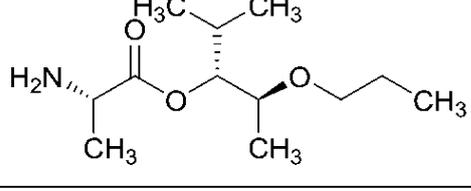
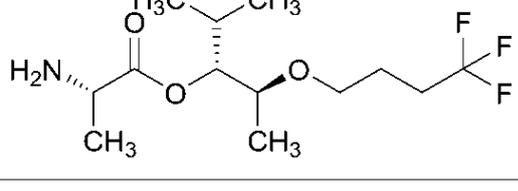
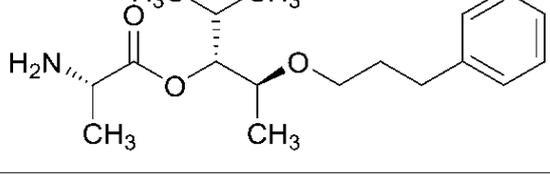
10

20

30

40

【表 1 - 2 0】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
110		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
111		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
112		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体
113		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
114		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体
115		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物

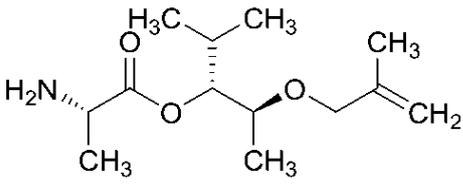
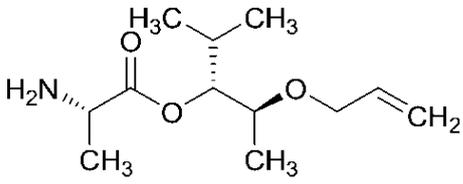
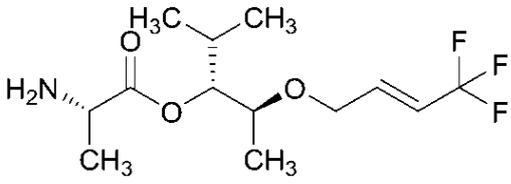
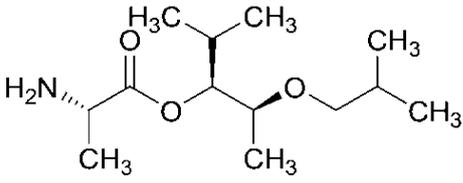
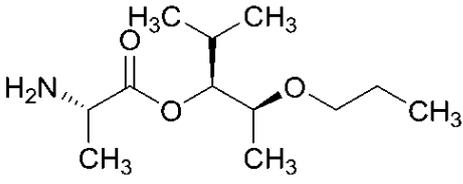
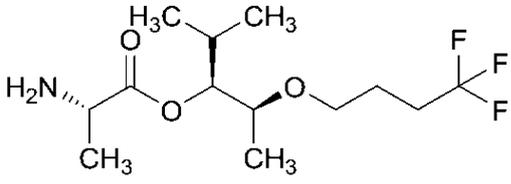
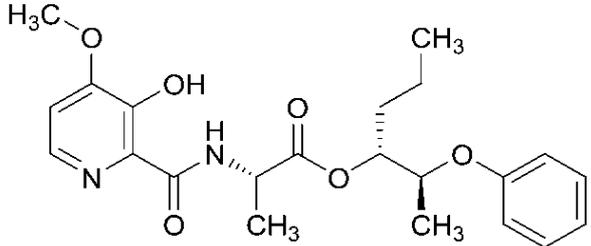
10

20

30

40

【表 1 - 2 1】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
116		実施例 13B, 工程 1.	濃密な油状物
117		実施例 13B, 工程 1.	濃密な油状物
118		実施例 13B, 工程 1.	濃密な油状物
119		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体
120		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体
121		実施例 13A, 工程 1.	白色の固体
122		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物

10

20

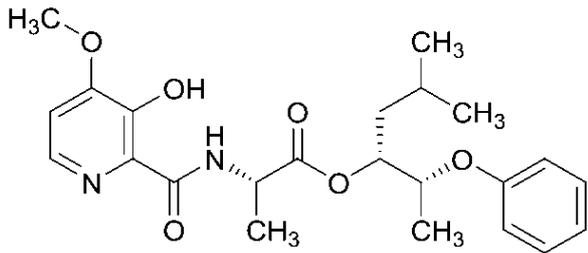
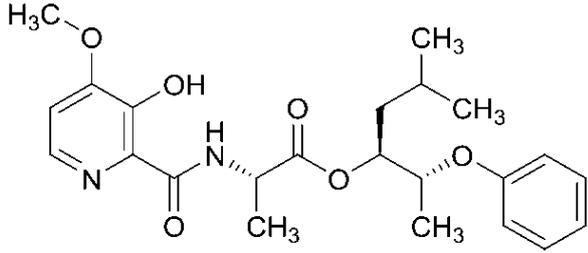
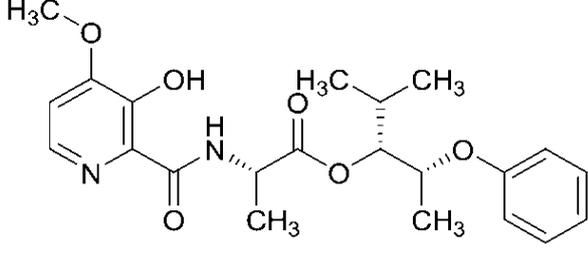
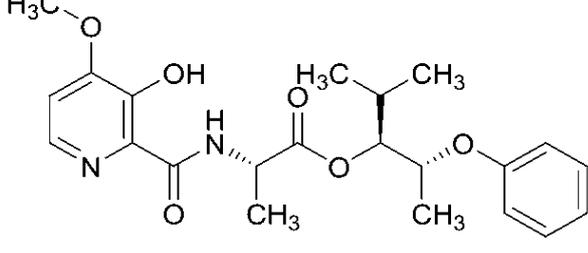
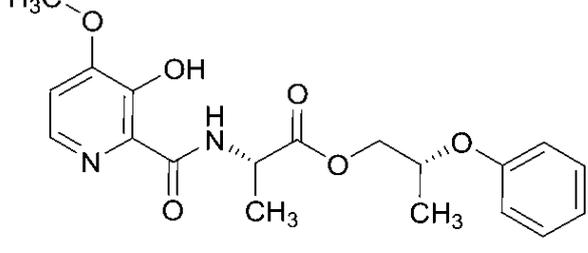
30

40

【表 1 - 2 2】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
123		実施例 13B, 工程 2.	透明な無色 の油状物
124		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
125		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
126		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
127		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 2 3】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
128		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
129		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
130		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
131		実施例 13A, 工程 2.	白色の粉末 状の固体
132		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

10

20

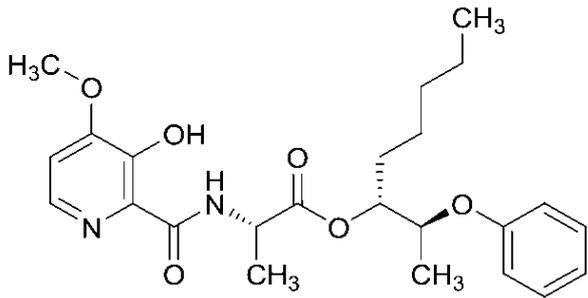
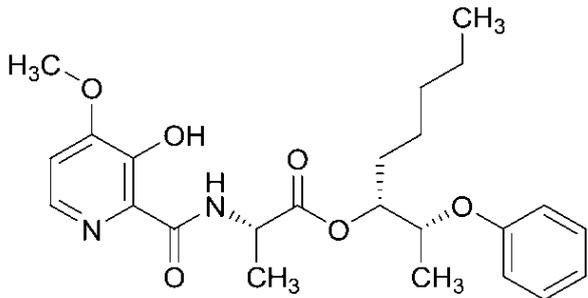
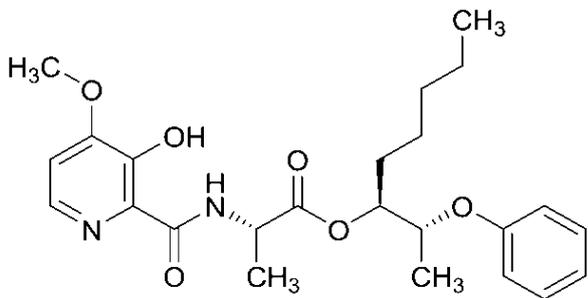
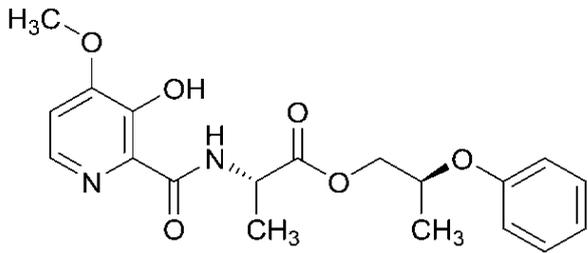
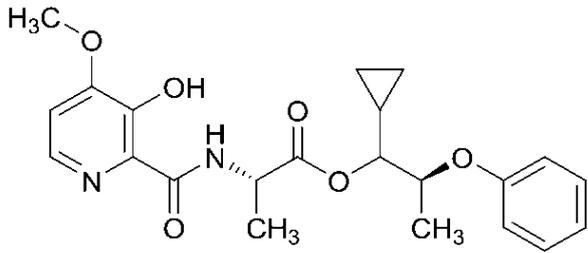
30

40

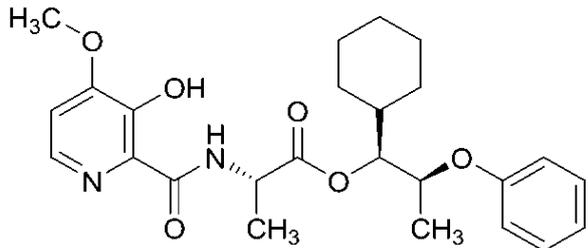
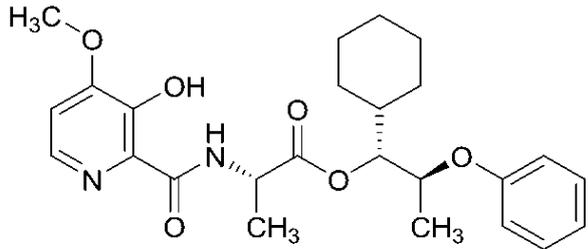
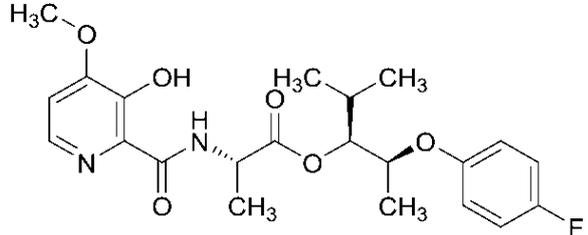
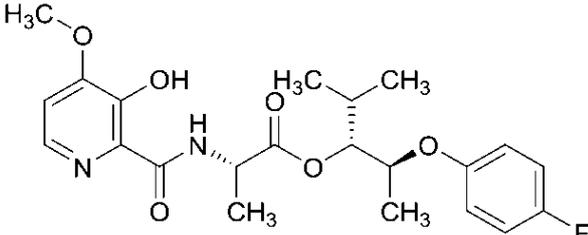
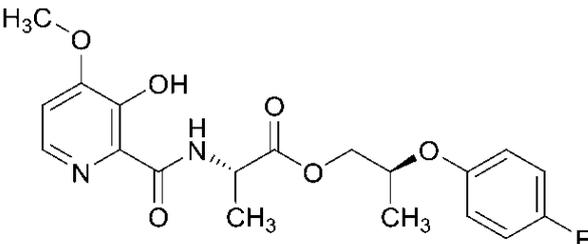
【表 1 - 2 4】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
133		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
134		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
135		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
136		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
137		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 2 5】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
138		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
139		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
140		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
141		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
142		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 2 6】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
143		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
144		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
145		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
146		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
147		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

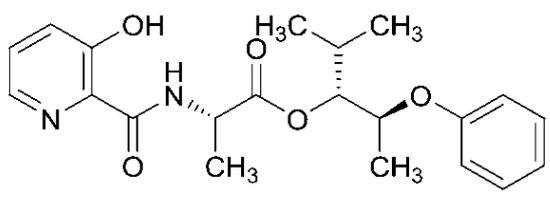
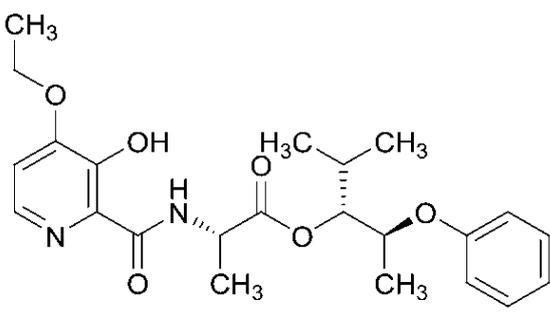
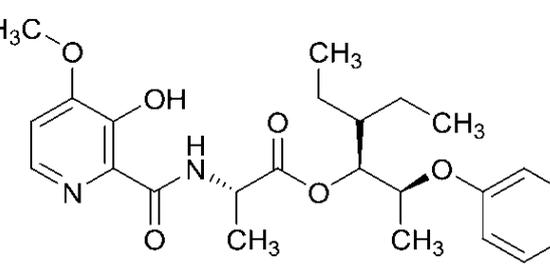
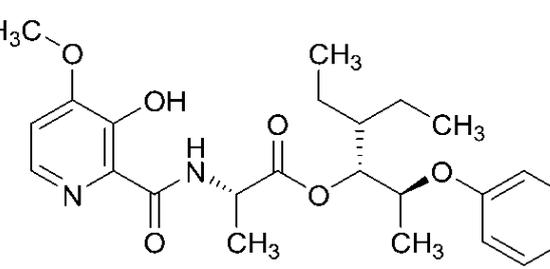
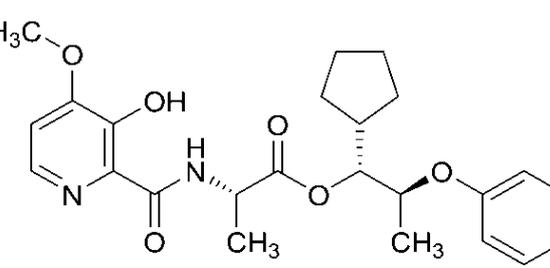
10

20

30

40

【表 1 - 27】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
148		実施例 13A, 工程 2.	淡黄色の油状物
149		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物
153		実施例 13A, 工程 2.	橙褐色の液体
154		実施例 13A, 工程 2.	黄色の液体
155		実施例 13A, 工程 2.	黄橙色の液体

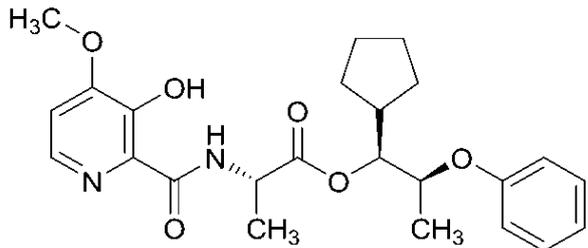
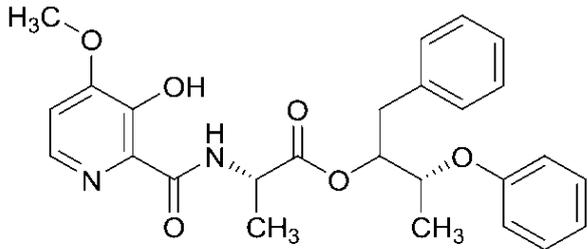
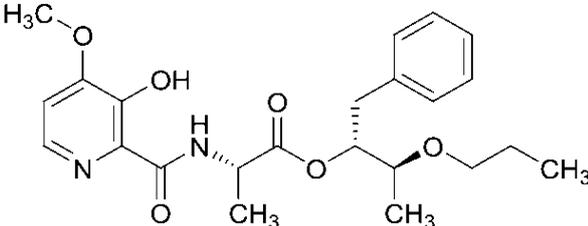
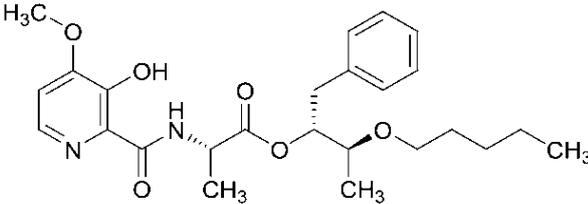
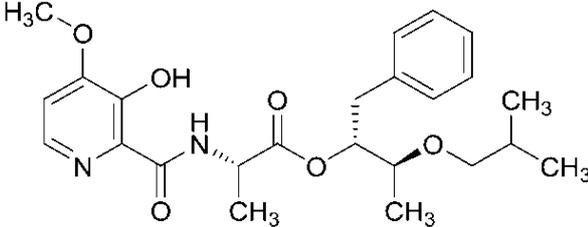
10

20

30

40

【表 1 - 2 8】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
156		実施例 13A, 工程 2.	暗緑色の液体
157		実施例 13A, 工程 2.	橙色の液体
158		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
159		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
160		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物

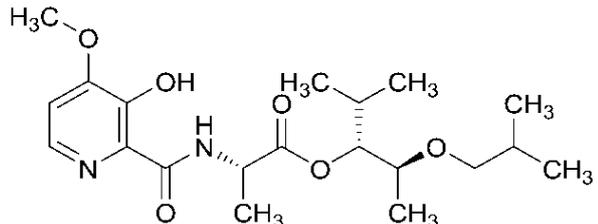
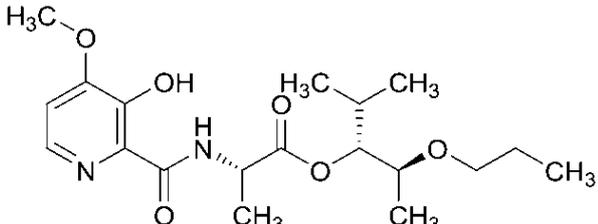
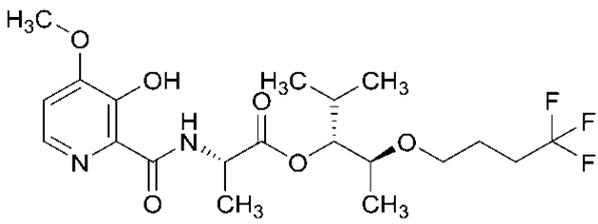
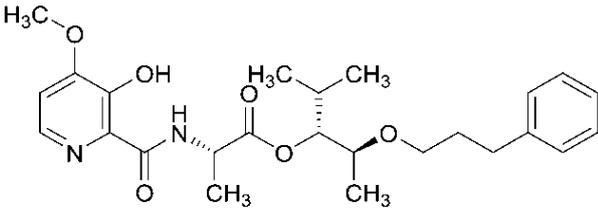
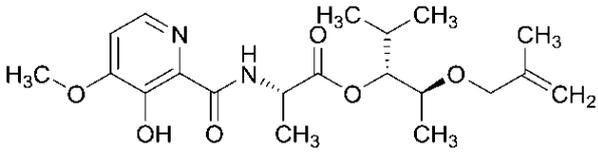
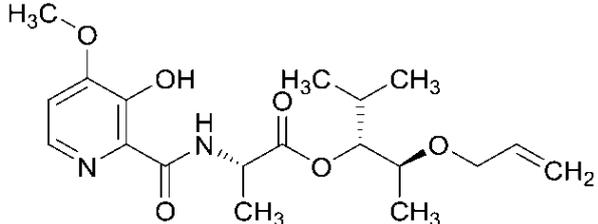
10

20

30

40

【表 1 - 2 9】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
161		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状 物
162		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状 物
163		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状 物
164		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状 物
165		実施例 13B, 工程 2.	濃密な油状 物
166		実施例 13B, 工程 2.	濃密な油状 物

【表 1 - 3 0】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
167		実施例 13B, 工程 2.	濃密な油状物
168		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
169		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
170		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
171		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物
172		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物

10

20

30

40

【表 1 - 3 1】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
173		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
174		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
175		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
176		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
177		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 3 2】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
178		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
179		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
180		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
181		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
182		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 3 3】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
183		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
184		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
185		実施例 14A.	淡黄色の油 状物
186		実施例 14B.	淡黄色の油 状物

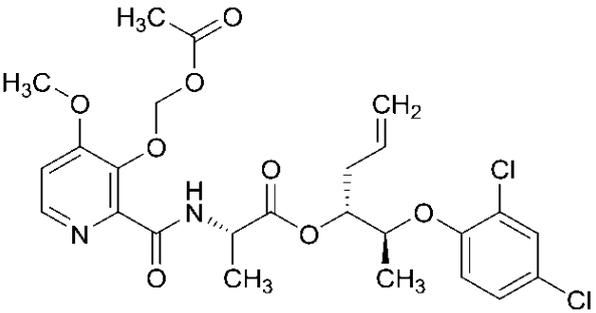
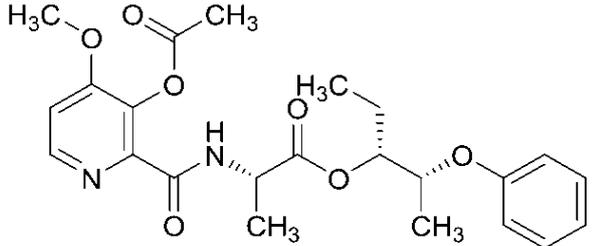
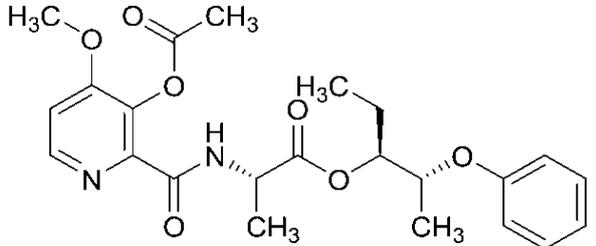
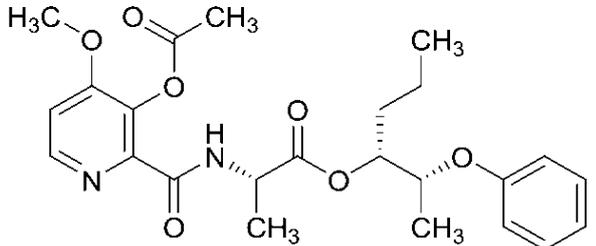
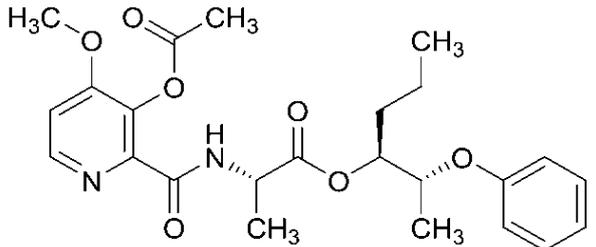
10

20

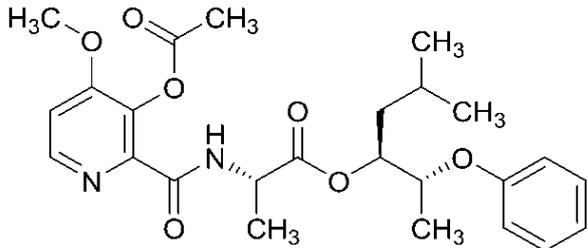
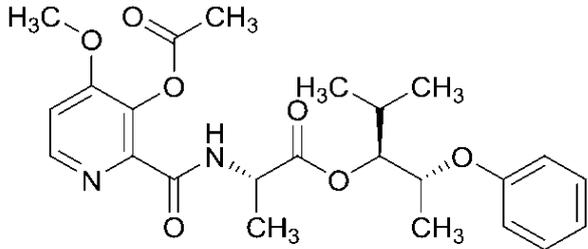
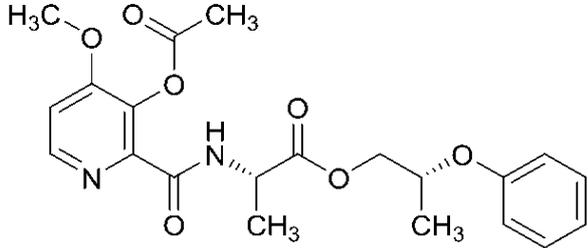
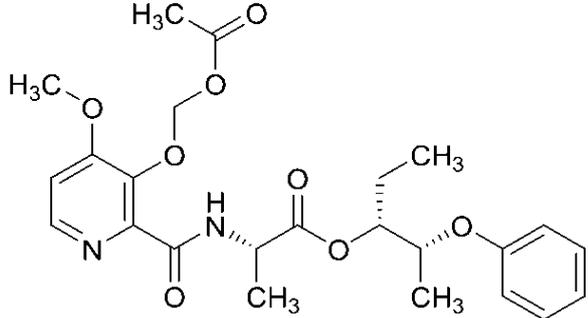
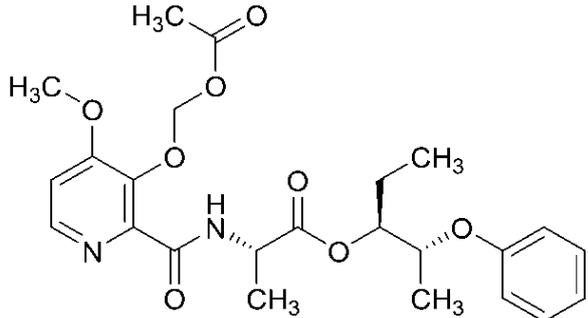
30

40

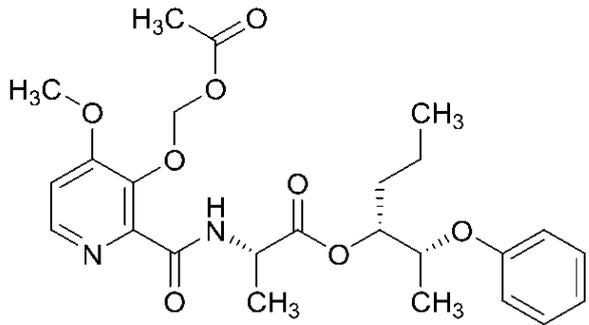
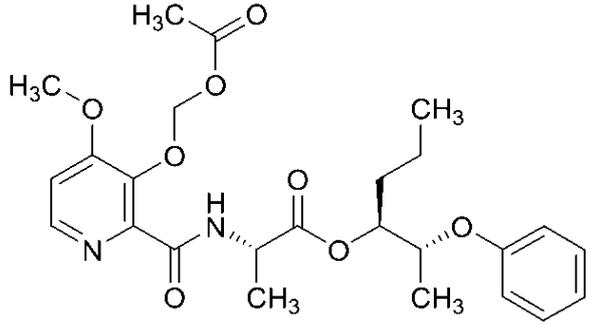
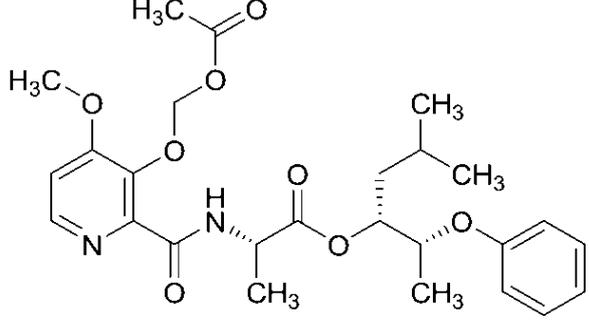
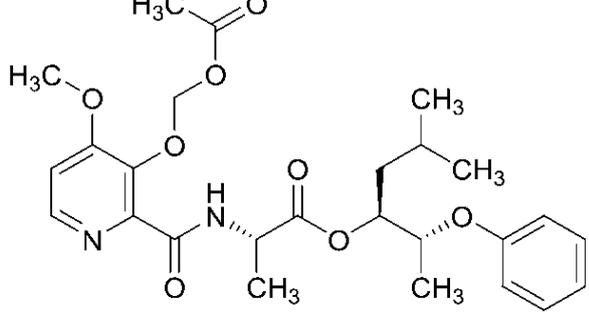
【表 1 - 3 4】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
187		実施例 14B.	淡黄色の油状物
188		実施例 14A.	透明な無色の油状物
189		実施例 14A.	淡黄色の油状物
190		実施例 14A.	淡黄色の油状物
191		実施例 14A.	淡黄色の油状物

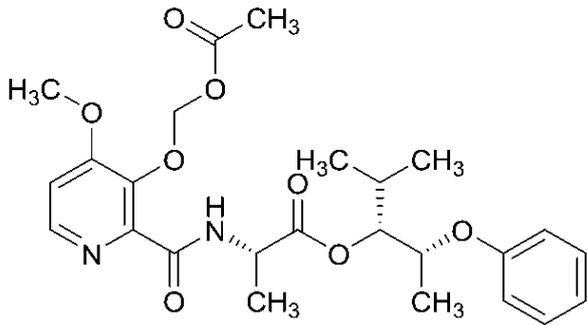
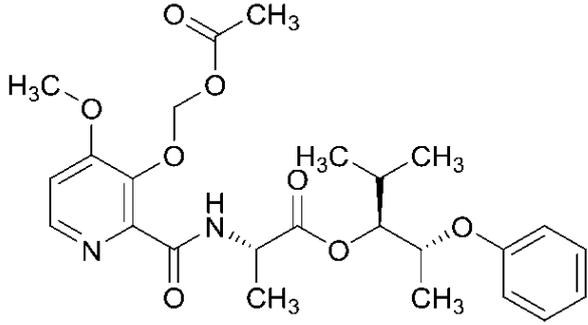
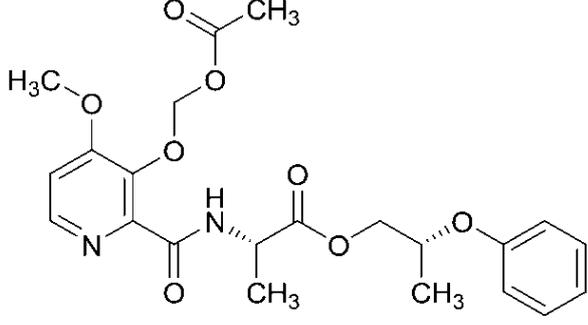
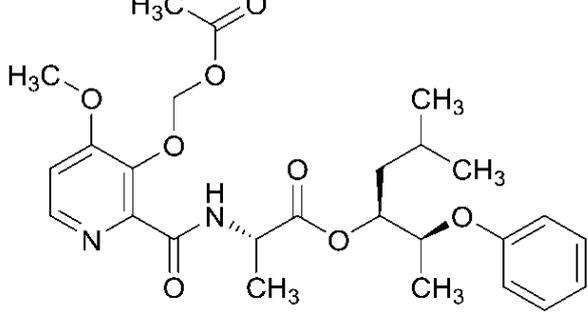
【表 1 - 3 5】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
192		実施例 14A.	透明な無色の油状物
193		実施例 14A.	淡黄色の油状物
194		実施例 14A.	淡黄色の油状物
195		実施例 14B.	透明な無色の油状物
196		実施例 14B.	淡黄色の油状物

【表 1 - 3 6】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
197		実施例 14B.	透明な無色の油状物	10
198		実施例 14B.	淡黄色の油状物	20
199		実施例 14B.	透明な無色の油状物	30
200		実施例 14B.	淡黄色の油状物	40

【表 1 - 3 7】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
201		実施例 14B.	透明な無色の油状物	10
202		実施例 14B.	透明な無色の油状物	20
203		実施例 14B.	淡黄色の油状物	30
204		実施例 14B.	透明な無色の油状物	40

【表 1 - 3 8】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
205		実施例 14B.	淡黄色の油状物
206		実施例 14B.	透明な無色の油状物
207		実施例 14B.	透明な無色の油状物
208		実施例 14B.	透明な無色の油状物

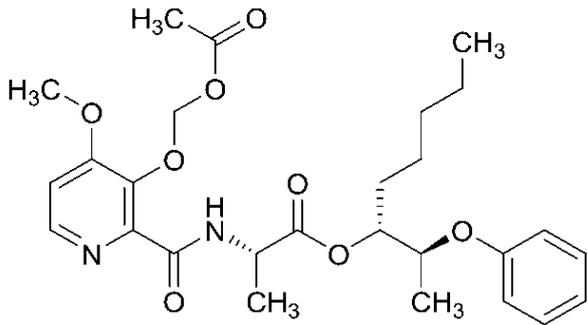
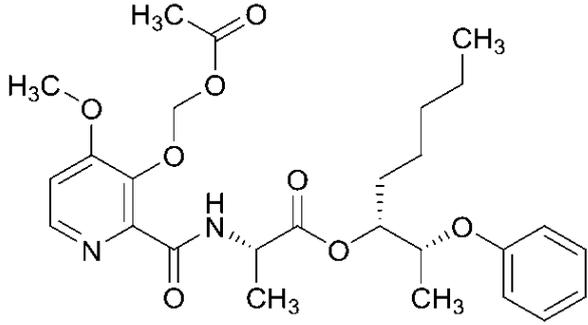
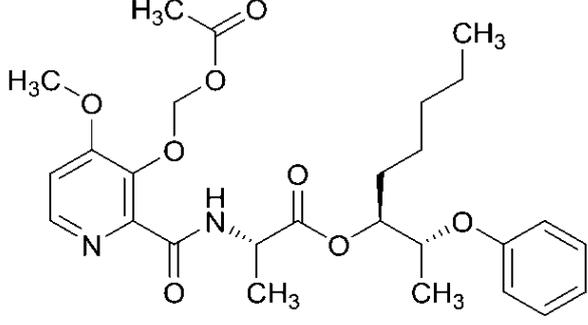
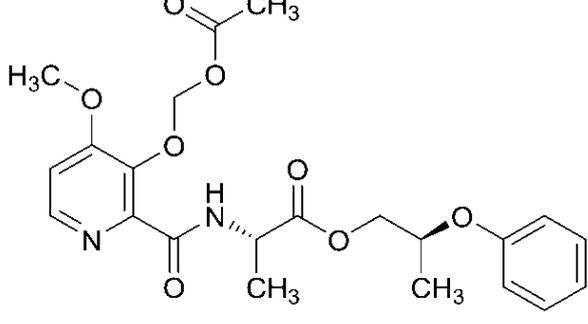
10

20

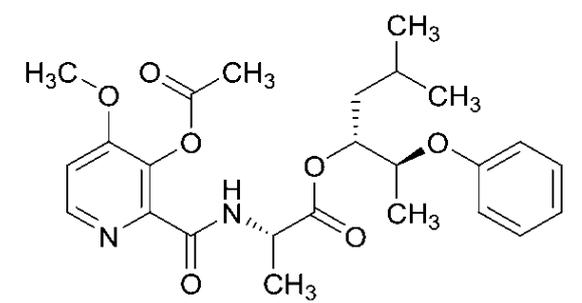
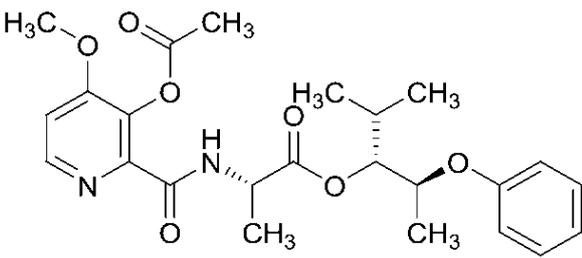
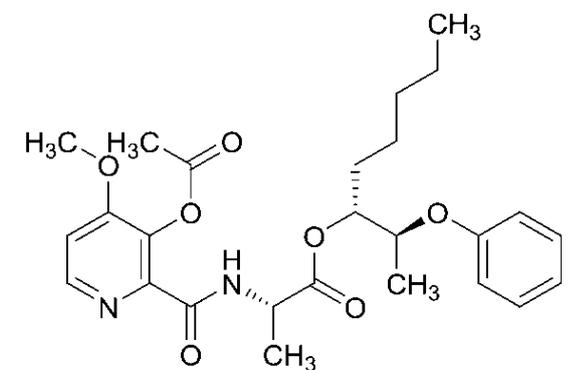
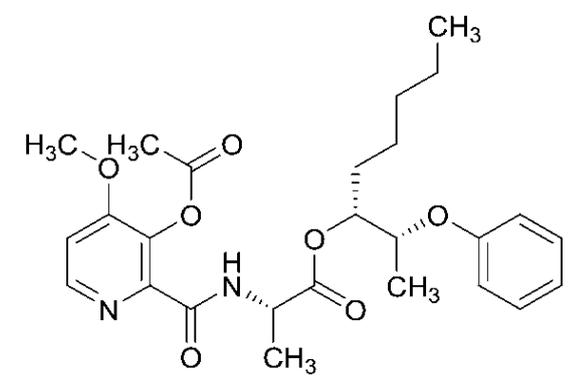
30

40

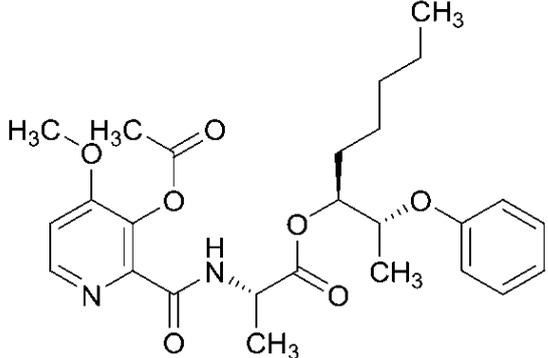
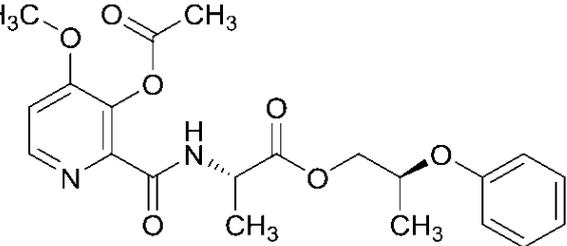
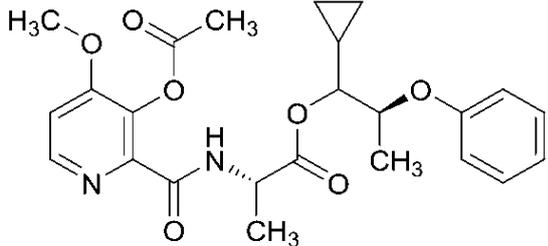
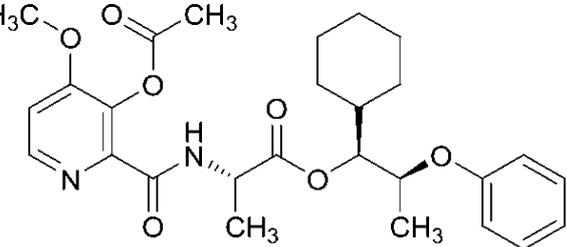
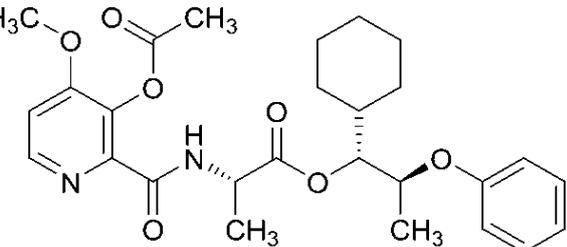
【表 1 - 3 9】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
209		実施例 14B.	透明な無色の油状物	10
210		実施例 14B.	透明な無色の油状物	20
211		実施例 14B.	透明な無色の油状物	30
212		実施例 14B.	透明な無色の油状物	40

【表 1 - 4 0】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
213		実施例 14A.	透明な無色の油状物
214		実施例 14A.	透明な無色の油状物
215		実施例 14A.	透明な無色の油状物
216		実施例 14A.	透明な無色の油状物

【表 1 - 4 1】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
217		実施例 14A.	透明な無色の油状物
218		実施例 14A.	透明な無色の油状物
219		実施例 14A.	透明な無色の油状物
220		実施例 14A.	透明な無色の油状物
221		実施例 14A.	透明な無色の油状物

10

20

30

40

【表 1 - 4 2】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
222		実施例 14A.	透明な無色の油状物
223		実施例 14A.	透明な無色の油状物
224		実施例 14B.	透明な無色の油状物
225		実施例 14B.	透明な無色の油状物

10

20

30

40

【表 1 - 4 3】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
226		実施例 14B.	透明な無色の油状物
227		実施例 14B.	透明な無色の油状物
228		実施例 14B.	透明な無色の油状物
229		実施例 14B.	透明な無色の油状物

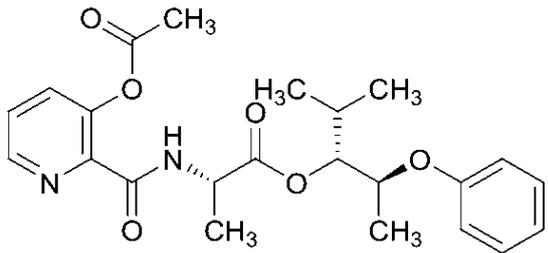
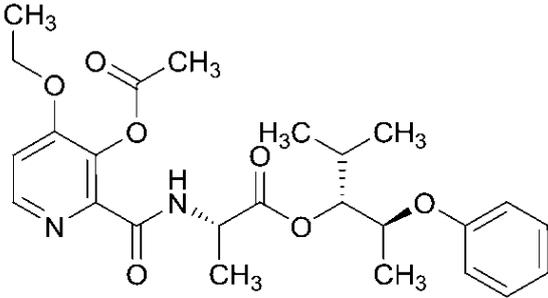
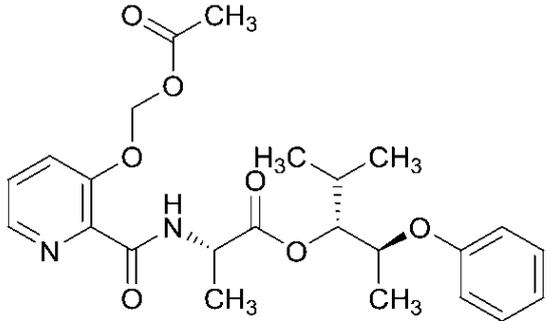
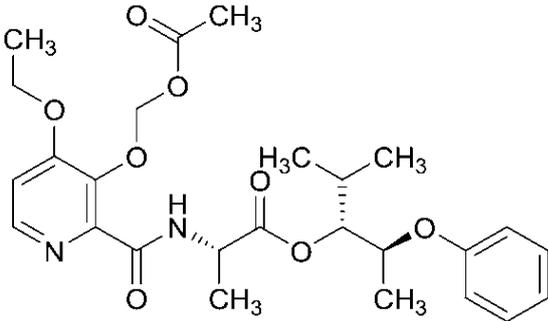
10

20

30

40

【表 1 - 4 4】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
230		実施例 14A.	透明な無色の油状物
231		実施例 14A.	透明な無色の油状物
233		実施例 14B.	透明な無色の油状物
234		実施例 14B.	透明な無色の油状物

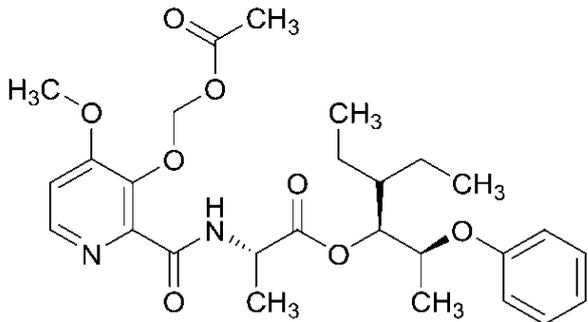
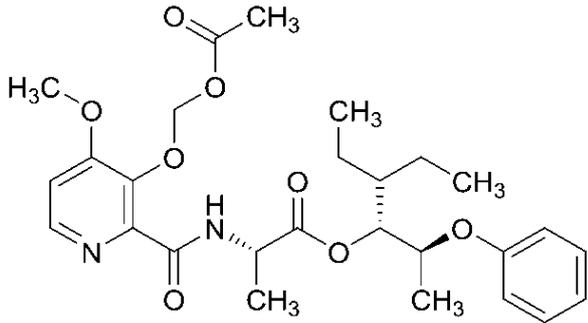
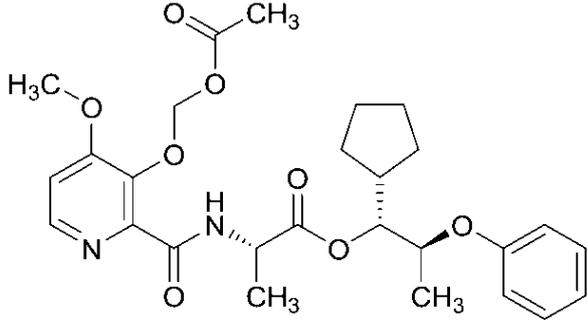
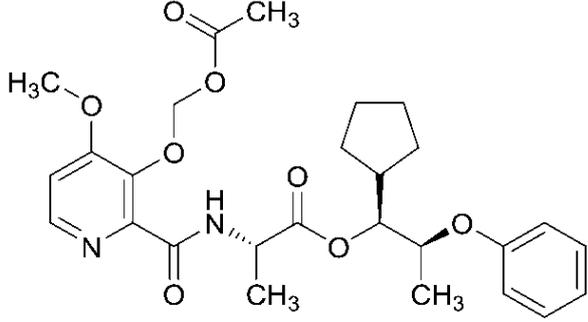
10

20

30

40

【表 1 - 4 5】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
236		実施例 14B.	曇った黄色の液体
237		実施例 14B.	曇った黄色の液体
238		実施例 14B.	黄色の液体
239		実施例 14B.	黄橙色の液体

【表 1 - 4 6】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
240		実施例 14B.	黄色の液体
241		実施例 14A.	油状物
242		実施例 14A.	油状物
243		実施例 14B.	濃密な油状物
244		実施例 14B.	濃密な油状物

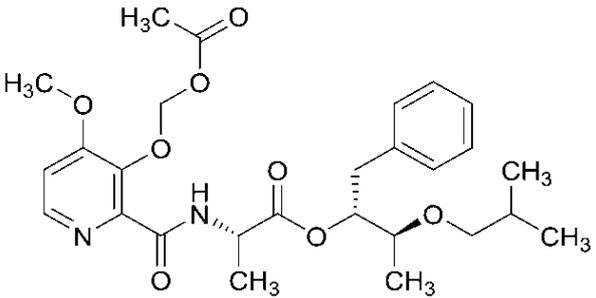
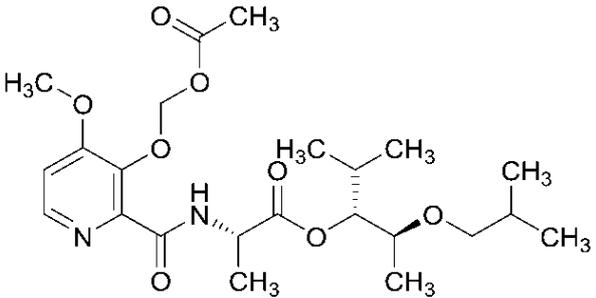
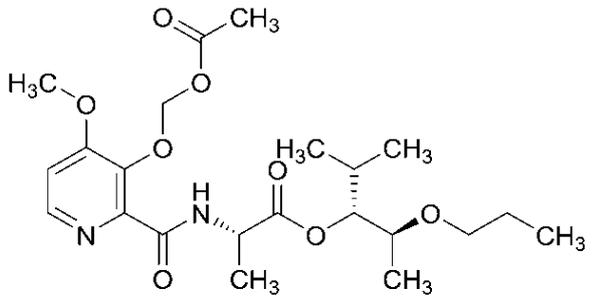
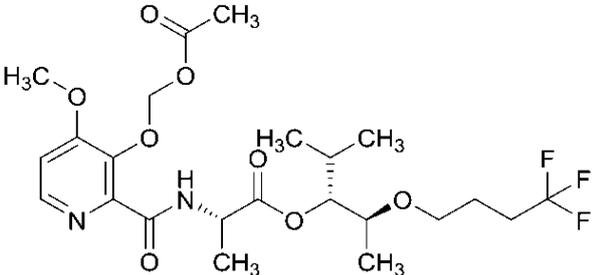
10

20

30

40

【表 1 - 4 7】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
245		実施例 14B.	濃密な油状物
246		実施例 14B.	濃密な油状物
247		実施例 14B.	濃密な油状物
248		実施例 14B.	濃密な油状物

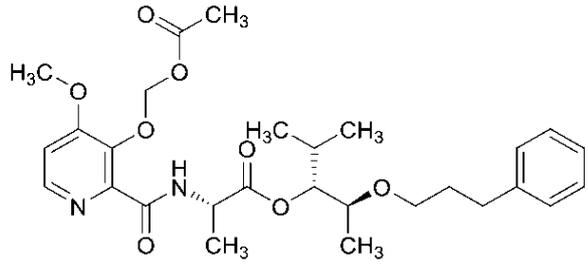
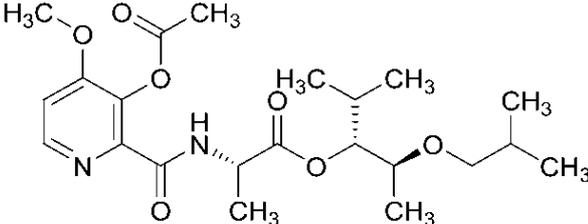
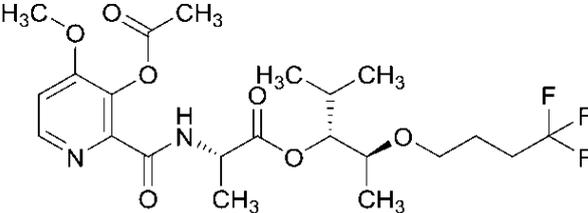
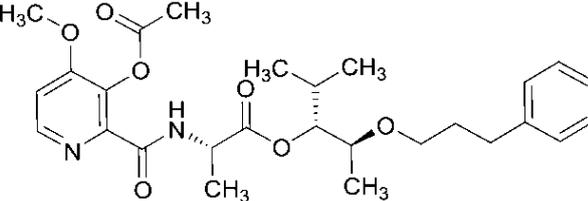
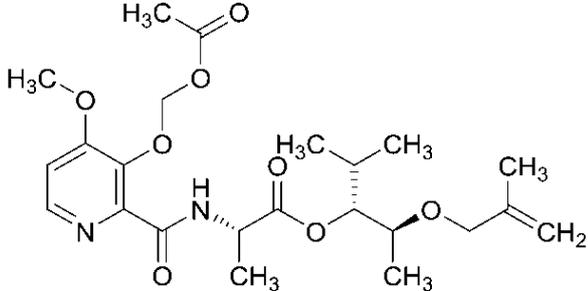
10

20

30

40

【表 1 - 4 8】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
249		実施例 14B.	濃密な油状物
250		実施例 14A.	白色の泡状物
251		実施例 14A.	濃密な油状物
252		実施例 14A.	濃密な油状物
253		実施例 14B.	濃密な油状物

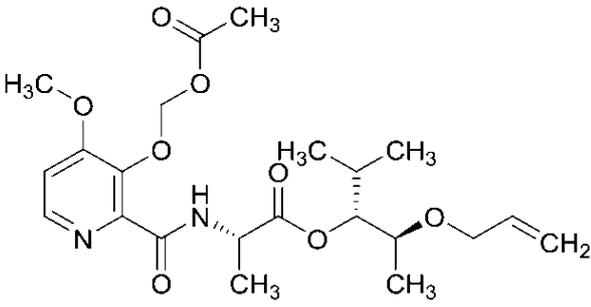
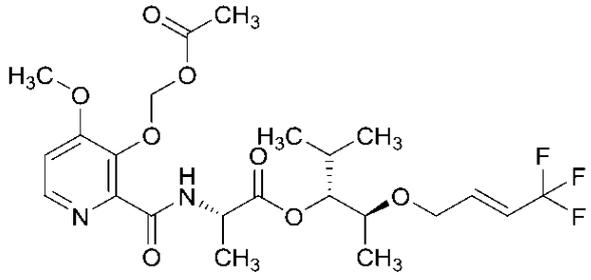
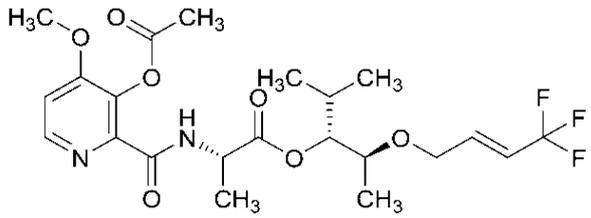
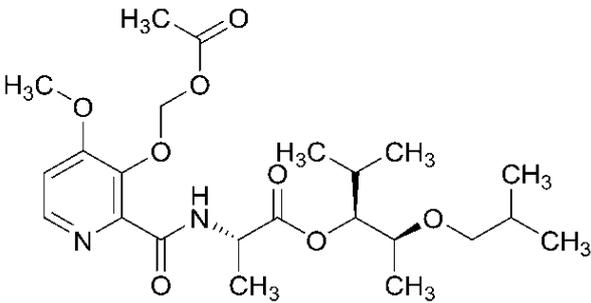
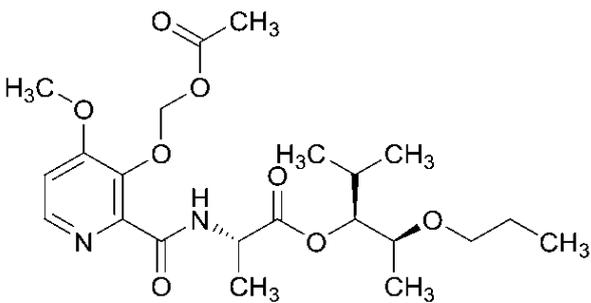
10

20

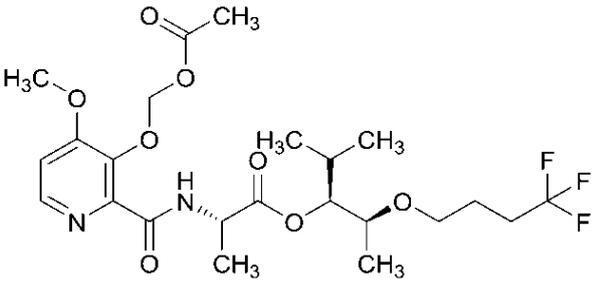
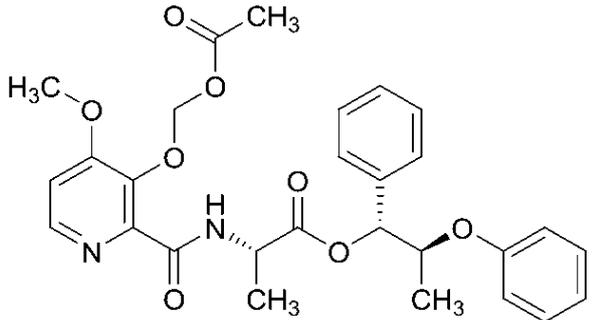
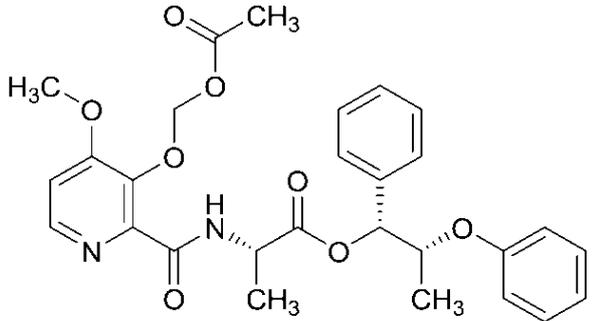
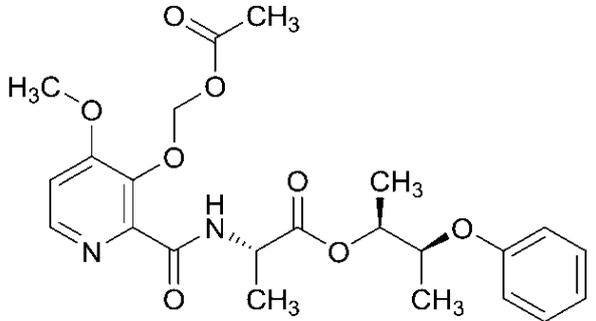
30

40

【表 1 - 4 9】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
254		実施例 14B.	濃密な油状物
255		実施例 14B.	濃密な油状物
256		実施例 14A.	濃密な油状物
257		実施例 14B.	濃密な油状物
258		実施例 14B.	濃密な油状物

【表 1 - 5 0】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
259		実施例 14B.	濃密な油状物
260		実施例 14B.	透明な無色の油状物
261		実施例 14B.	透明な無色の油状物
262		実施例 14B.	透明な無色の油状物

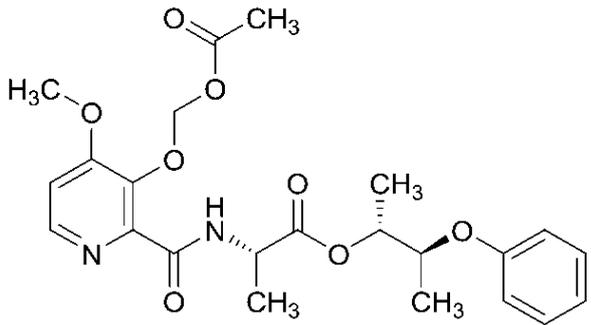
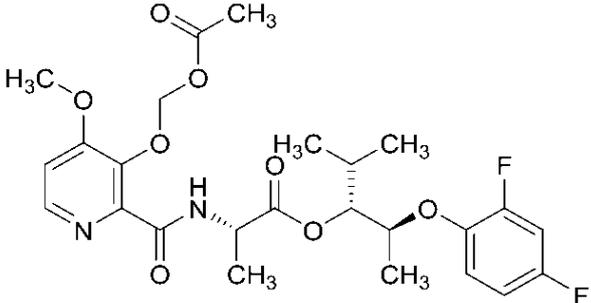
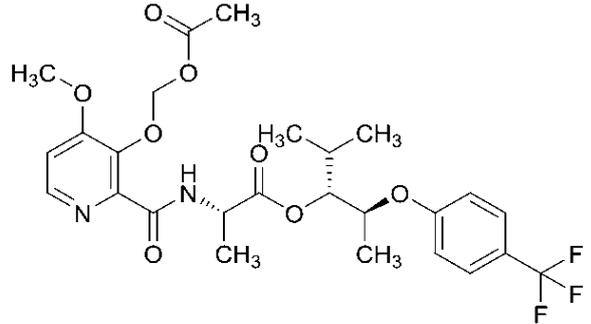
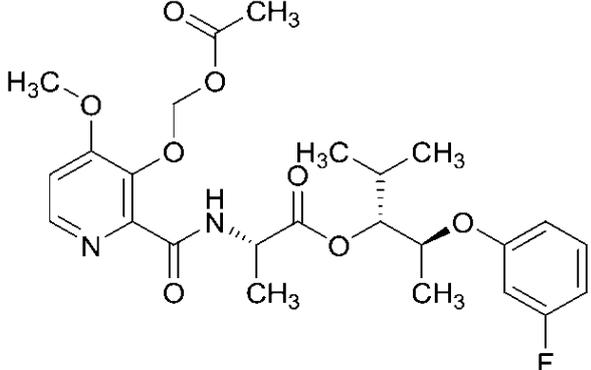
10

20

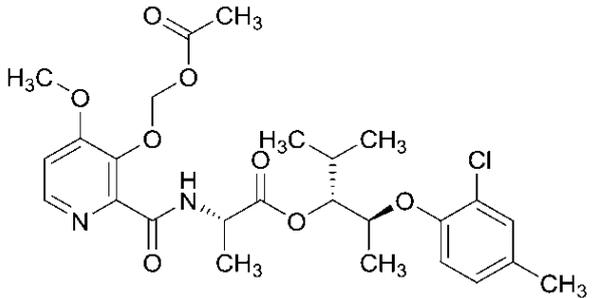
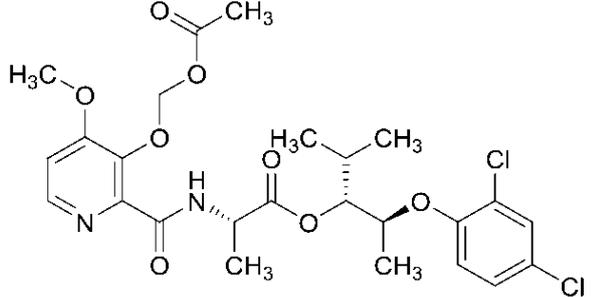
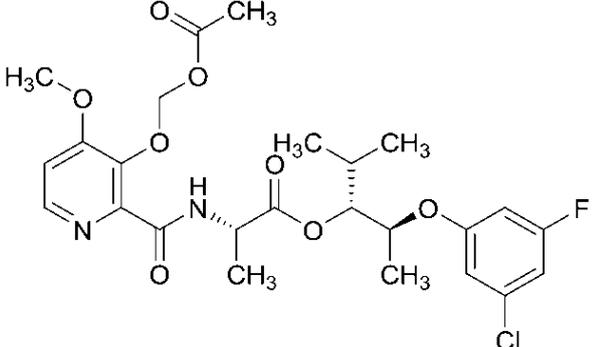
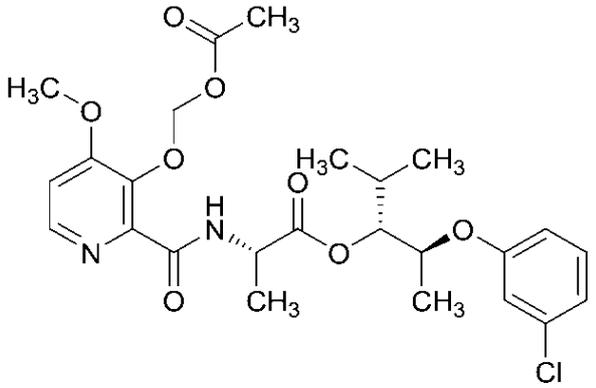
30

40

【表 1 - 5 1】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
263		実施例 14B.	透明な無色の油状物
264		実施例 14B.	透明な無色の油状物
265		実施例 14B.	透明な無色の油状物
266		実施例 14B.	透明な無色の油状物

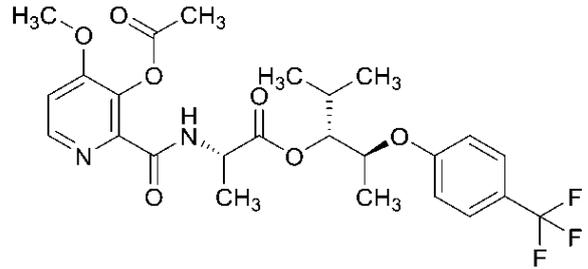
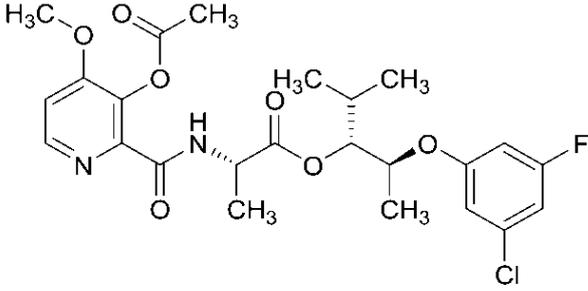
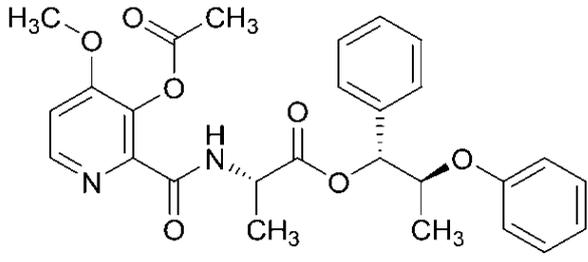
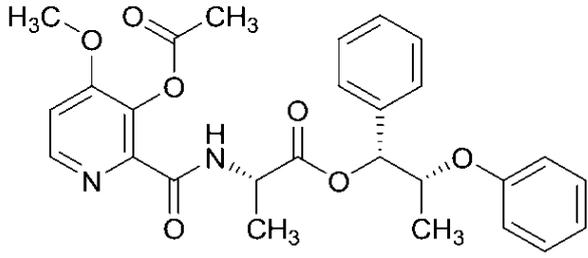
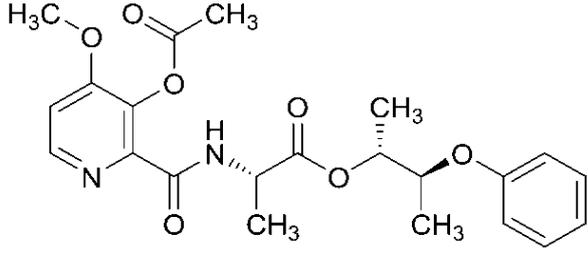
【表 1 - 5 2】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
267		実施例 14B.	透明な無色の油状物	10
268		実施例 14B.	透明な無色の油状物	20
269		実施例 14B.	透明な無色の油状物	30
270		実施例 14B.	透明な無色の油状物	40

【表 1 - 5 3】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
271		実施例 14B.	透明な無色の油状物
272		実施例 14B.	淡黄色の油状物
273		実施例 14B.	淡黄色の油状物
274		実施例 14A.	透明な無色の油状物

【表 1 - 5 4】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
275		実施例 14A.	透明な無色の油状物
276		実施例 14A.	透明な無色の油状物
277		実施例 14A.	透明な無色の油状物
278		実施例 14A.	透明な無色の油状物
279		実施例 14A.	透明な無色の油状物

【表 1 - 5 5】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
280		実施例 14A.	透明な無色の油状物
281		実施例 14A.	透明な無色の油状物
282		実施例 14A.	淡黄色の油状物
283		実施例 14A.	透明な無色の油状物
285		実施例 1D; 実施例 5C; 実施例 6A; 実施例 10A; 実施例 11.	透明な無色の油状物

【表 1 - 5 6】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
286		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 10A; 実施例 11.	透明な無色 の油状物
287		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 10A; 実施例 11.	透明な無色 の油状物
288		実施例 1F, 工程 1-2; 実 施例 3A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物
289		実施例 1F, 工程 1-2; 実 施例 3A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物
290		実施例 1F, 工程 1-2; 実 施例 3A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物
291		実施例 1F, 工程 1-2; 実 施例 3A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 5 7】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
292		実施例 1F, 工程 1-2; 実 施例 3A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物
293		実施例 1F, 工程 1-2; 実 施例 3A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物
294		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 10A; 実施例 11; 実施例 12B.	透明な無色 の油状物
295		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 10A; 実施例 11; 実施例 12B.	透明な無色 の油状物

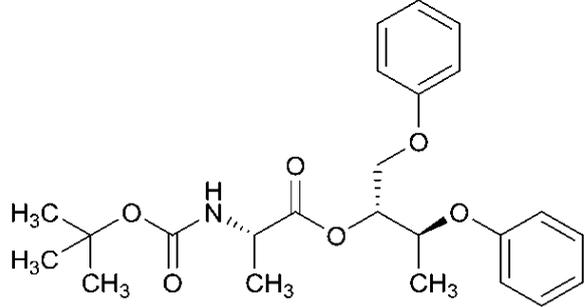
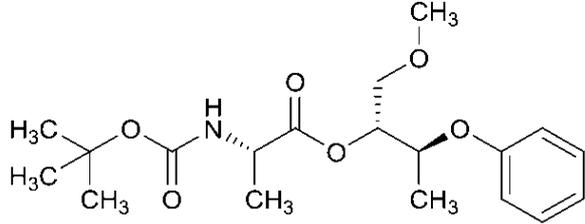
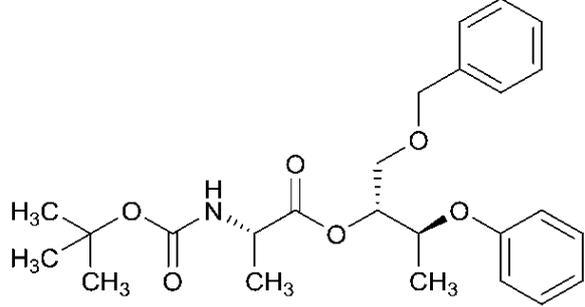
10

20

30

40

【表 1 - 5 8】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
296		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 7; 実 施例 8A; 実 施例 10A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物
297		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 7; 実 施例 8B; 実 施例 10A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物
298		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 7; 実 施例 8C; 実 施例 10A; 実 施例 11.	透明な無色 の油状物

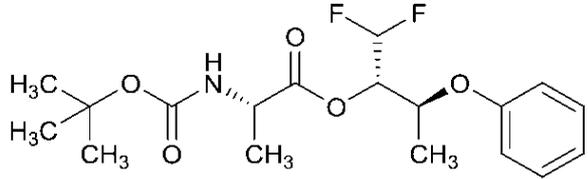
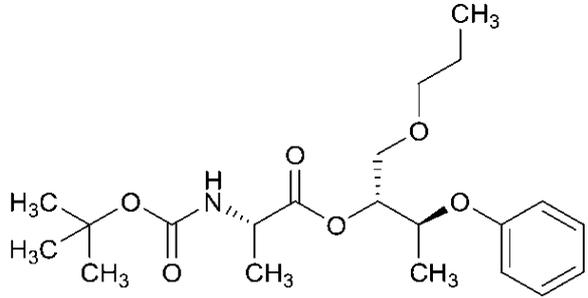
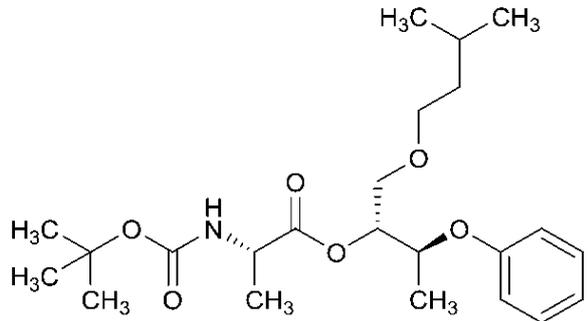
10

20

30

40

【表 1 - 5 9】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
299		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 9, 工程 1-2; 実施例 10A; 実施例 11.	透明な無色 の油状物
300		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 7; 実施 例 8D; 実施 例 10A; 実 施例 11; 実 施例 12B.	透明な無色 の油状物
301		実施例 1B; 実施例 2; 実 施例 3B; 実 施例 4B; 実 施例 5B; 実 施例 6A; 実 施例 7; 実施 例 8D; 実施 例 10A; 実 施例 11; 実 施例 12B.	透明な無色 の油状物

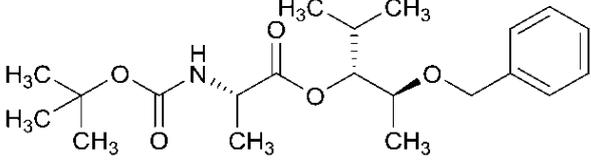
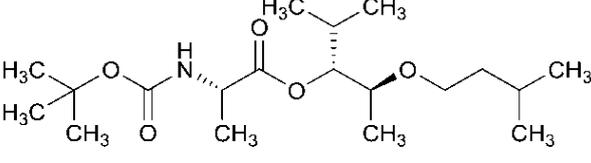
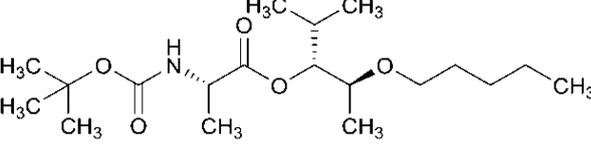
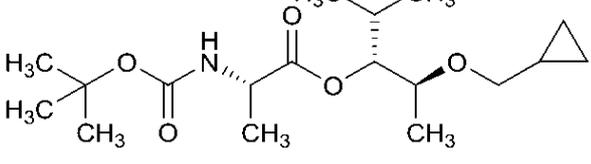
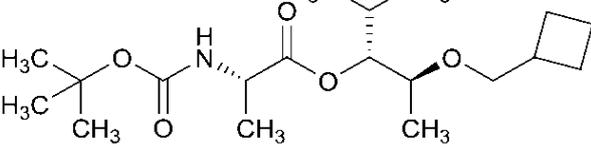
10

20

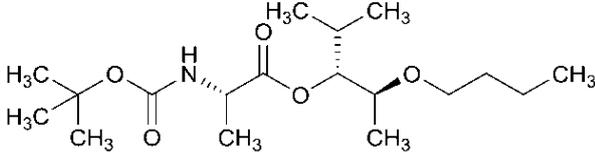
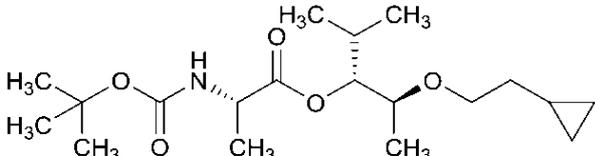
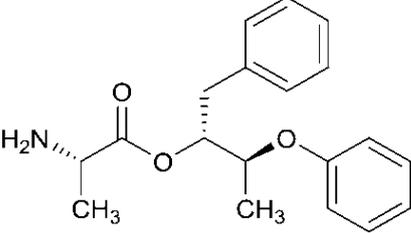
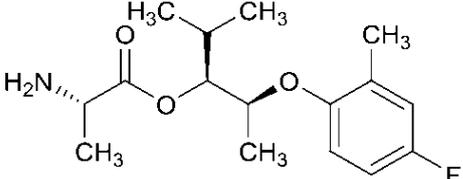
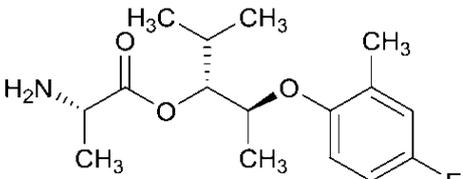
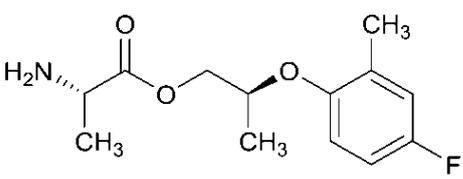
30

40

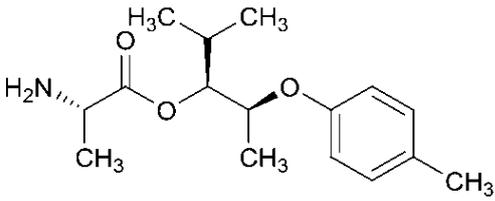
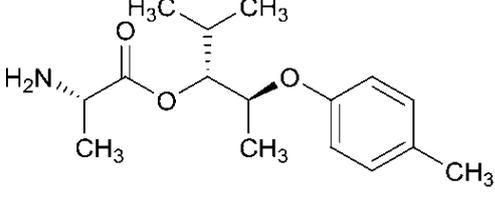
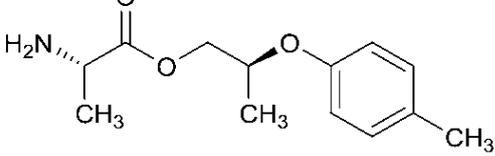
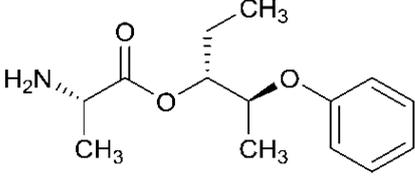
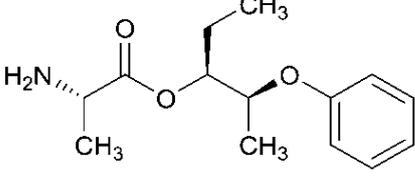
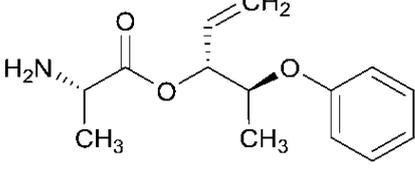
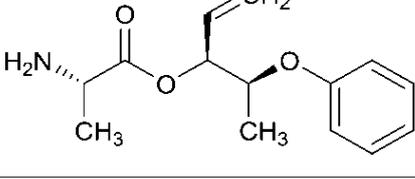
【表 1 - 6 0】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
302		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6C; 実施例 10C; 実施例 11.	無色の油状物
303		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6C; 実施例 10C; 実施例 11.	無色の油状物
304		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6C; 実施例 10C; 実施例 11.	無色の油状物
305		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6C; 実施例 10C; 実施例 11.	無色の油状物
306		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6C; 実施例 10C; 実施例 11.	無色の油状物

【表 1 - 6 1】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
307		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6C; 実施例 10C; 実施例 11.	無色の油状物
308		実施例 1D; 実施例 3A; 実施例 4A; 実施例 5A; 実施例 6C; 実施例 10C; 実施例 11.	無色の油状物
309		実施例 13A, 工程 1.	オフホワイトの半固体
310		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
311		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
312		実施例 13A, 工程 1.	白色の綿毛状の半固体

【表 1 - 6 2】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
313		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
314		実施例 13A, 工程 1.	白色の綿毛状の半固体
315		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
316		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
317		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
318		実施例 13B, 工程 1.	淡黄色の油状物
319		実施例 13B, 工程 1.	淡黄色の油状物

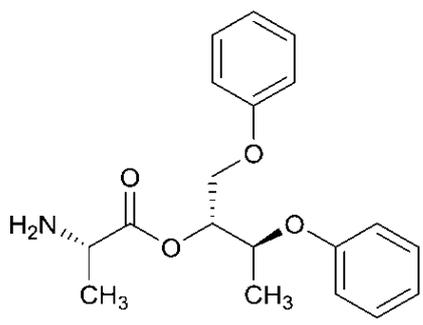
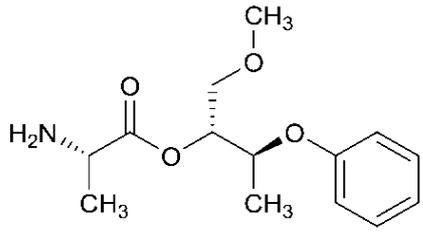
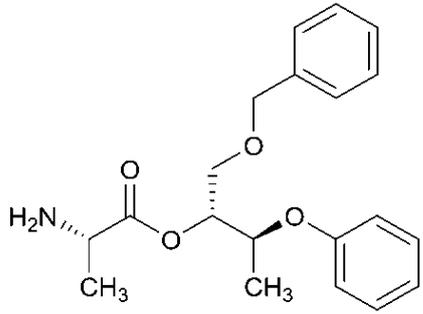
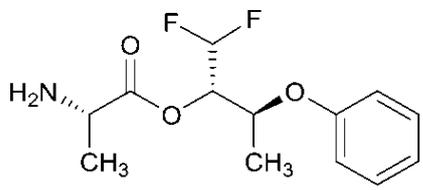
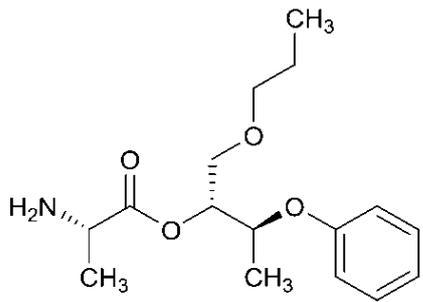
10

20

30

40

【表 1 - 6 3】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
320		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
321		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
322		実施例 13A, 工程 1.	黄色の油状物
323		実施例 13A, 工程 1.	白色の半固体
324		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物

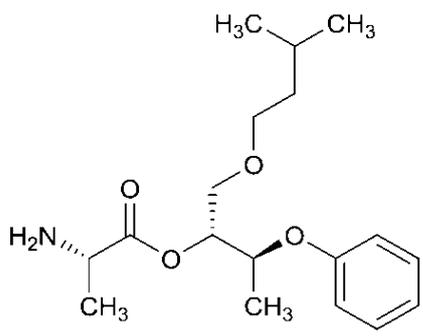
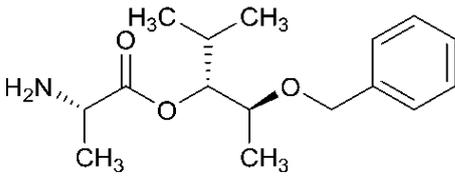
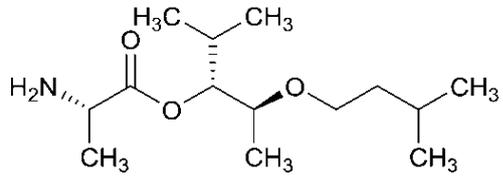
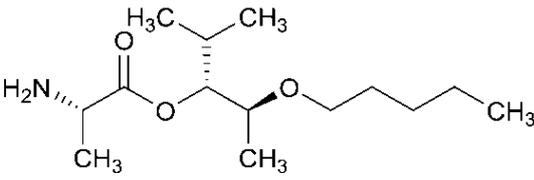
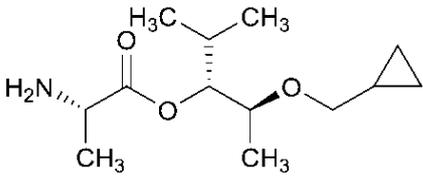
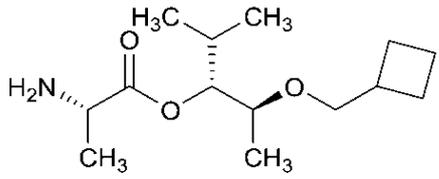
10

20

30

40

【表 1 - 6 4】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
325		実施例 13A, 工程 1.	透明な無色の油状物
326		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
327		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
328		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
329		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
330		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物

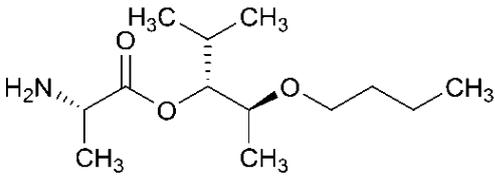
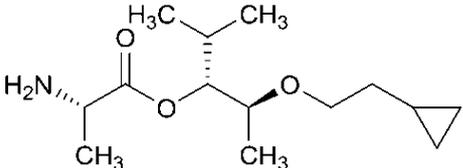
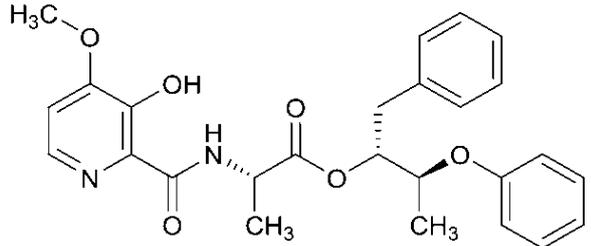
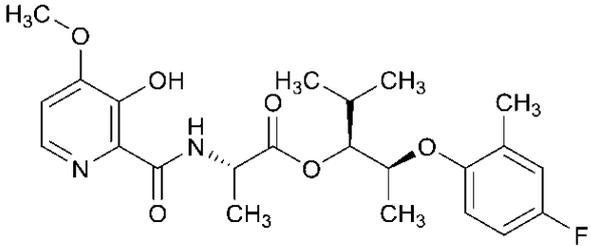
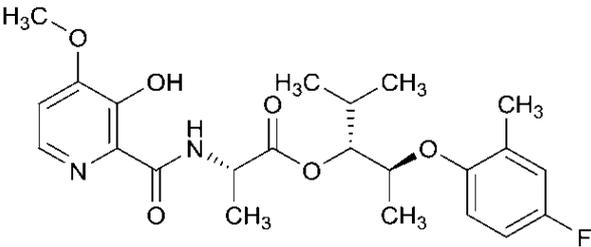
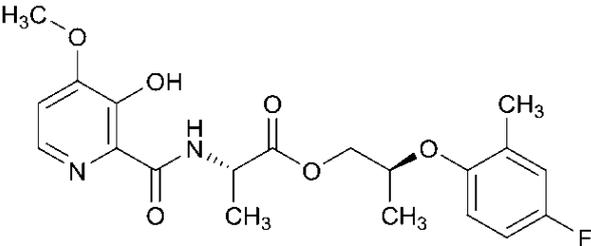
10

20

30

40

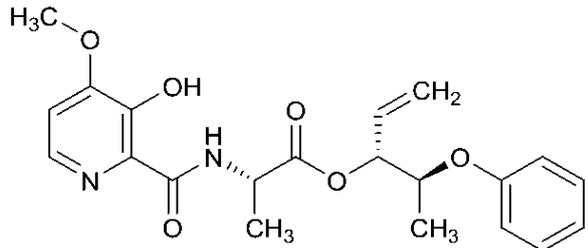
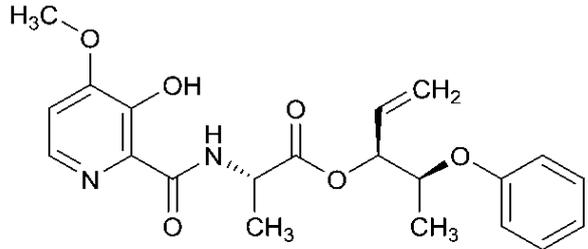
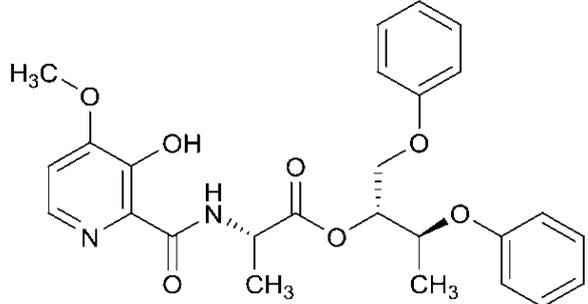
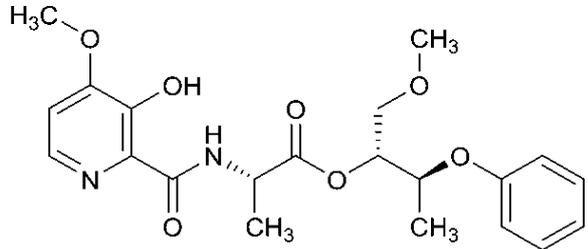
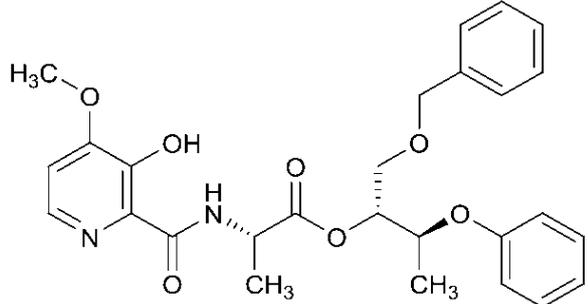
【表 1 - 6 5】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
331		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
332		実施例 13A, 工程 1.	濃密な油状物
333		実施例 13A, 工程 2.	淡黄色の油状物
334		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物
335		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物
336		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物

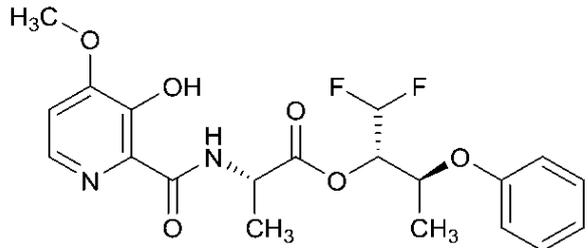
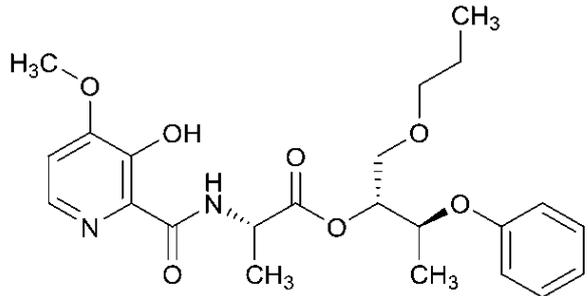
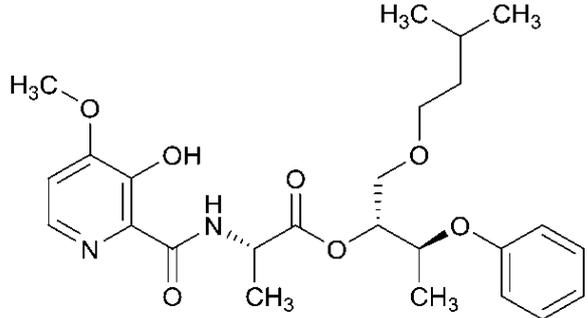
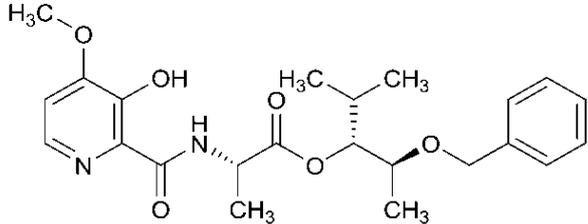
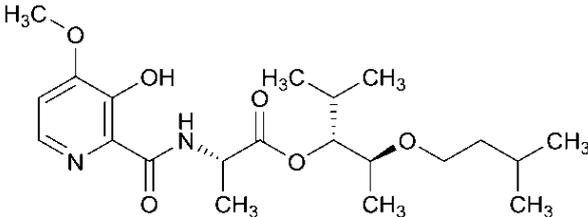
【表 1 - 6 6】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
337		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
338		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
339		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
340		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
341		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

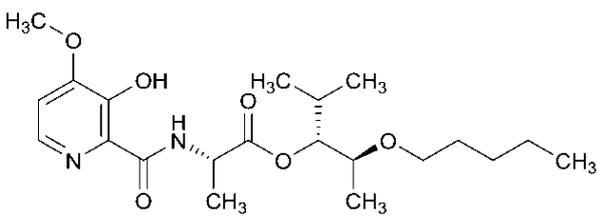
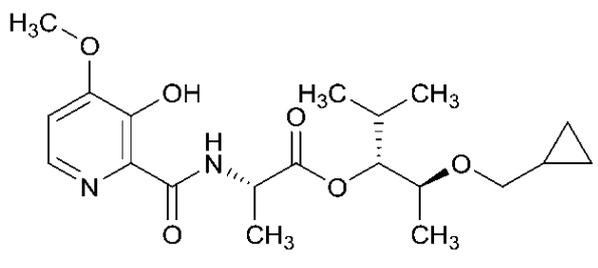
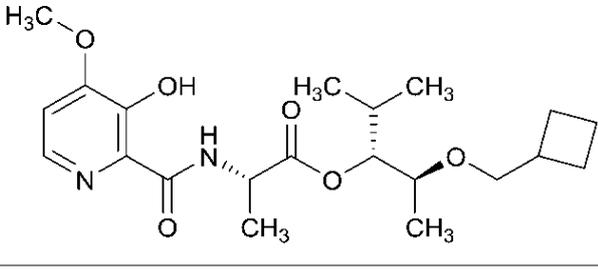
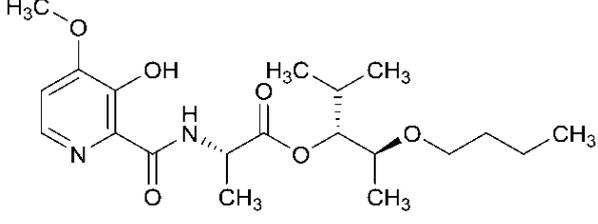
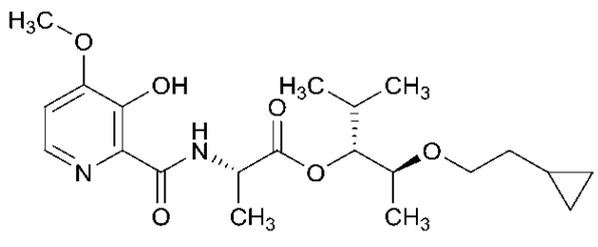
【表 1 - 6 7】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
342		実施例 13B, 工程 2.	透明な無色 の油状物
343		実施例 13B, 工程 2.	透明な無色 の油状物
344		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
345		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物
346		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色 の油状物

【表 1 - 6 8】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
347		実施例 13A, 工程 2.	白色の半固体
348		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物
349		実施例 13A, 工程 2.	透明な無色の油状物
350		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
351		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物

【表 1 - 6 9】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
352		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
353		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
354		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
355		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物
356		実施例 13A, 工程 2.	濃密な油状物

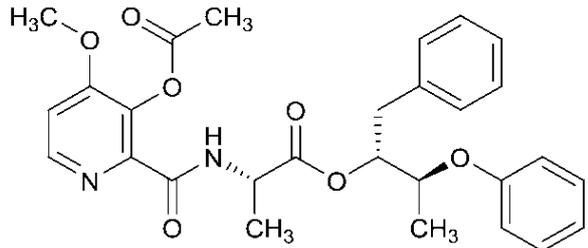
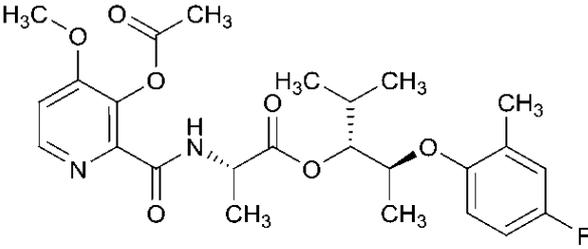
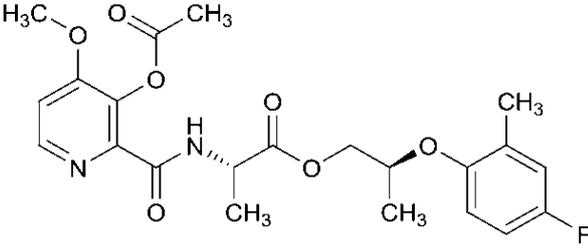
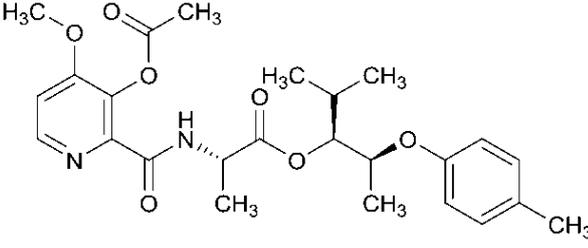
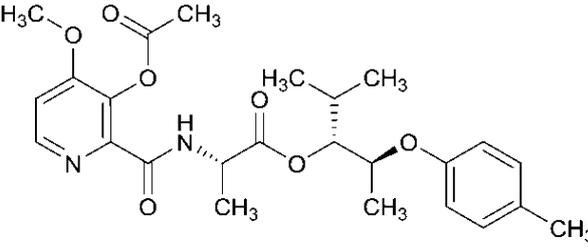
10

20

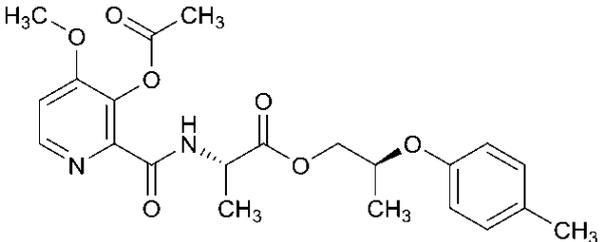
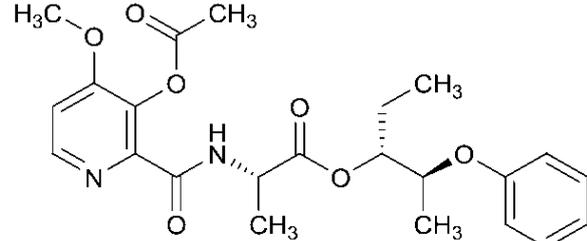
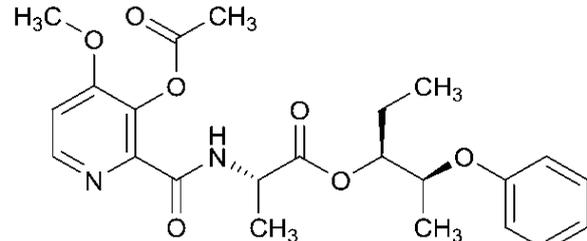
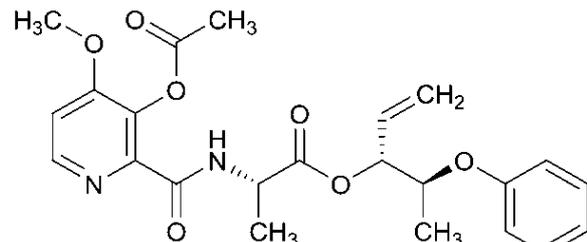
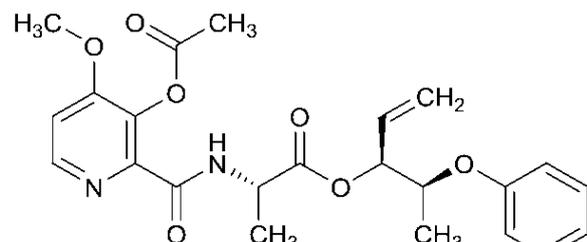
30

40

【表 1 - 7 0】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
357		実施例 14A.	透明な無色の油状物
358		実施例 14A.	透明な無色の油状物
359		実施例 14A.	透明な無色の油状物
360		実施例 14A.	透明な無色の油状物
361		実施例 14A.	淡黄色の油状物

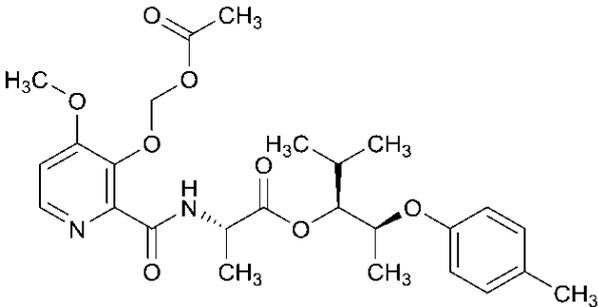
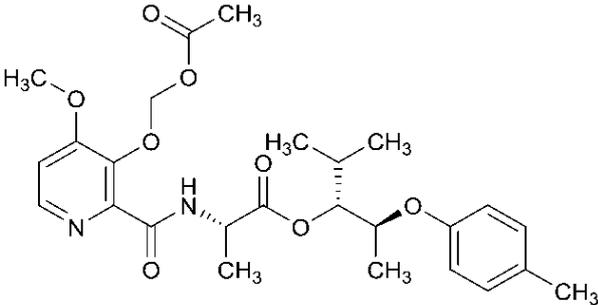
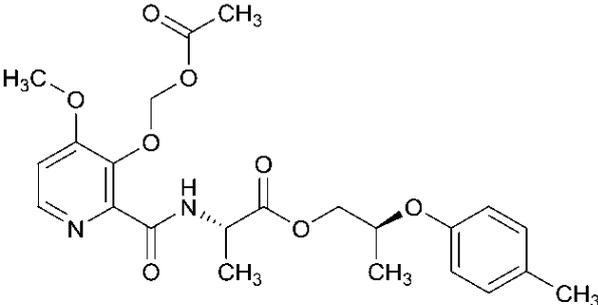
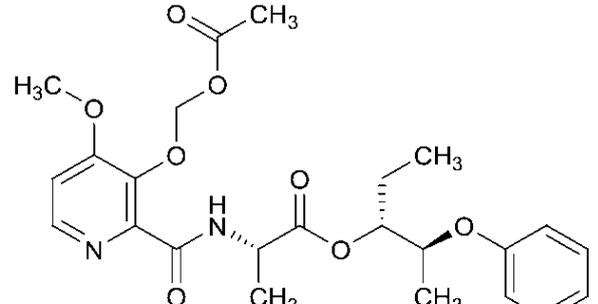
【表 1 - 7 1】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
362		実施例 14A.	淡黄色の油状物
363		実施例 14A.	透明な無色の油状物
364		実施例 14A.	透明な無色の油状物
365		実施例 14A.	透明な無色の油状物
366		実施例 14A.	透明な無色の油状物

【表 1 - 7 2】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
367		実施例 14B.	淡黄色の油状物	10
368		実施例 14B.	透明な無色の油状物	20
369		実施例 14B.	透明な無色の油状物	30
370		実施例 14B.	淡黄色の油状物	40

【表 1 - 7 3】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
371		実施例 14B.	透明な無色の油状物
372		実施例 14B.	淡黄色の油状物
373		実施例 14B.	淡黄色の油状物
374		実施例 14B.	淡黄色の油状物

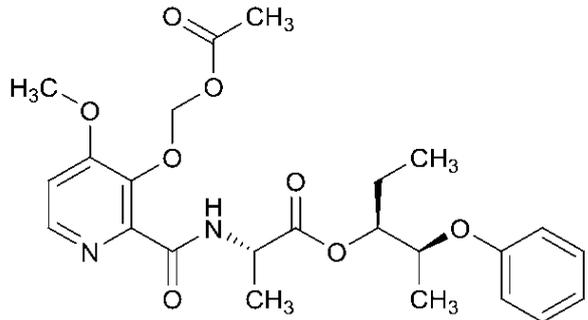
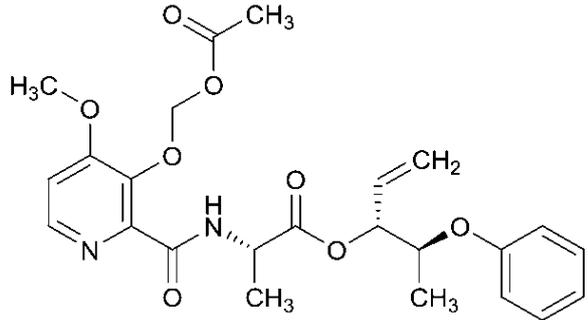
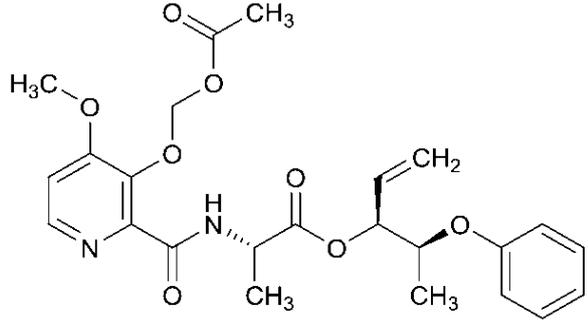
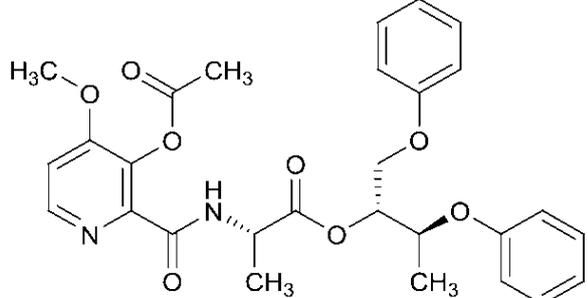
10

20

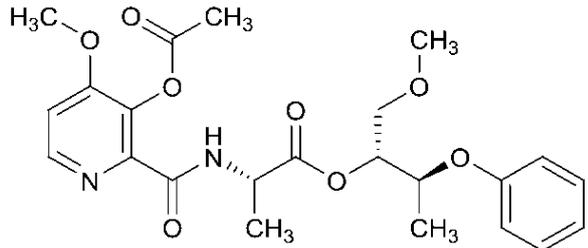
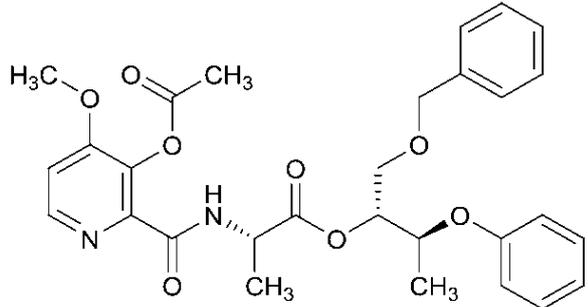
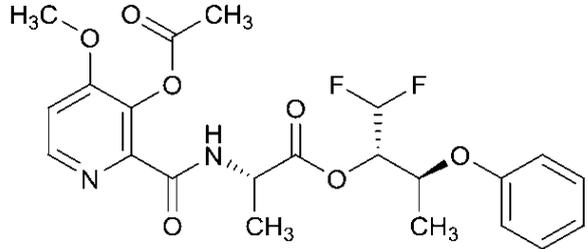
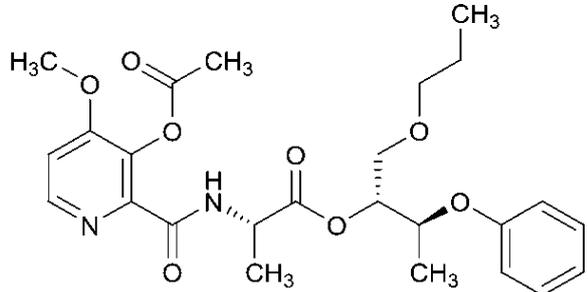
30

40

【表 1 - 7 4】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
375		実施例 14B.	透明な無色の油状物	10
376		実施例 14B.	淡黄色の油状物	20
377		実施例 14B.	透明な無色の油状物	30
378		実施例 14A.	淡黄色の油状物	40

【表 1 - 7 5】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
379		実施例 14A.	淡黄色の油状物
380		実施例 14A.	透明な無色の油状物
381		実施例 14A.	透明な無色の油状物
382		実施例 14A.	透明な無色の油状物

10

20

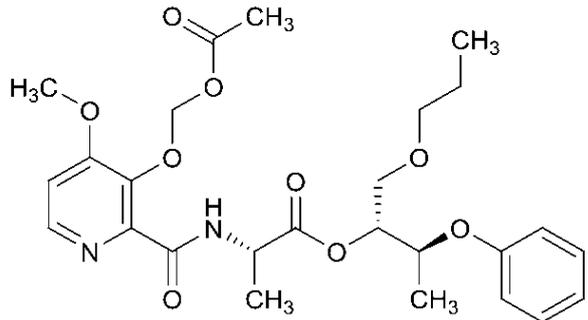
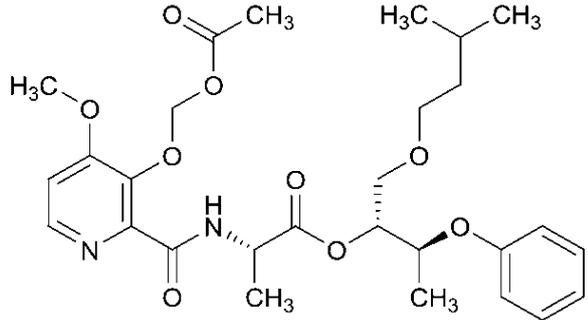
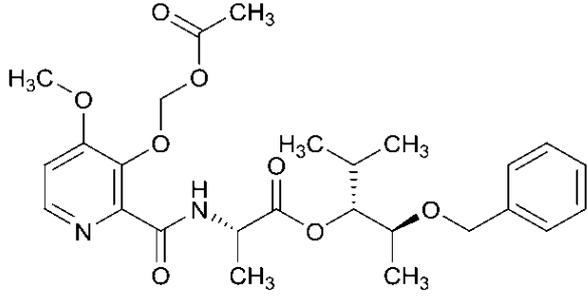
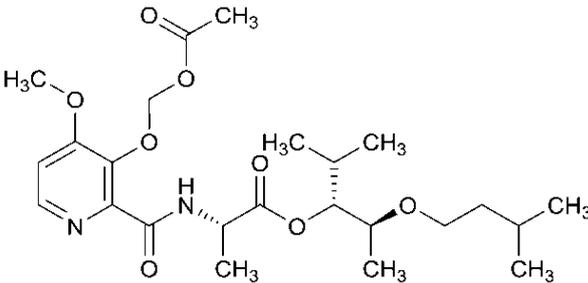
30

40

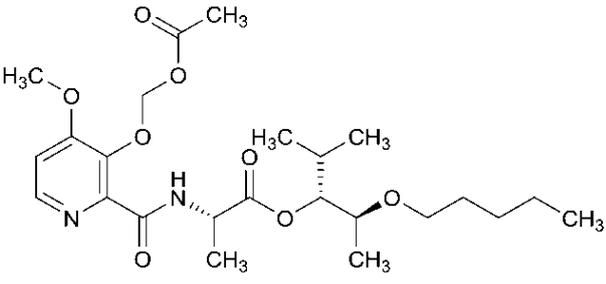
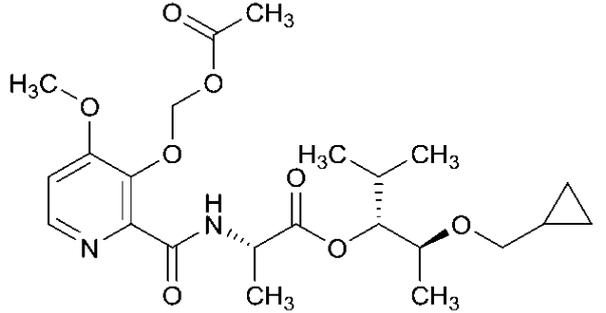
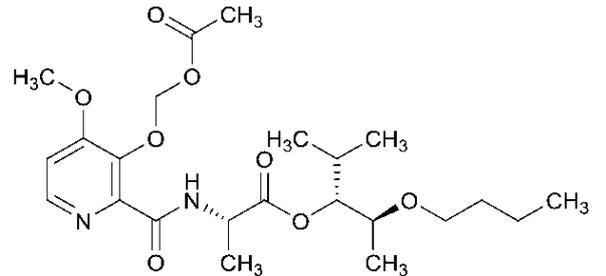
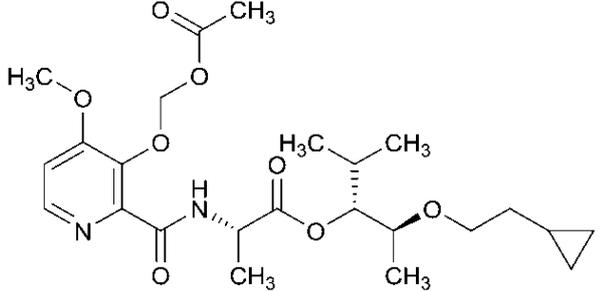
【表 1 - 7 6】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
383		実施例 14B.	淡黄色の油状物
384		実施例 14B.	透明な無色の油状物
385		実施例 14B.	透明な無色の油状物
386		実施例 14B.	透明な無色の油状物

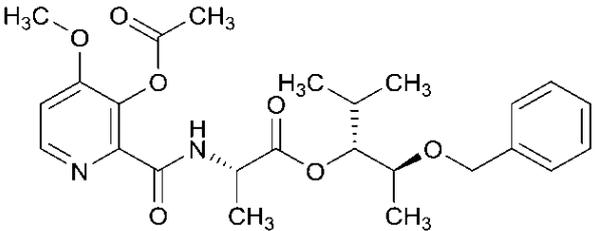
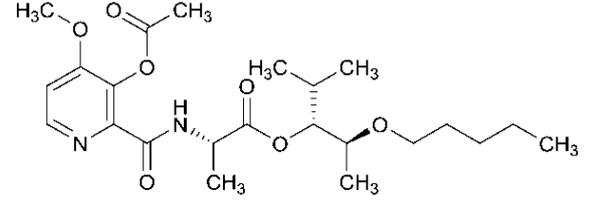
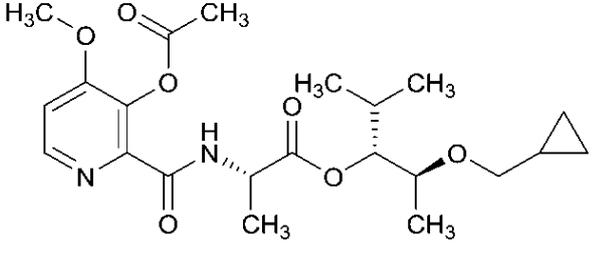
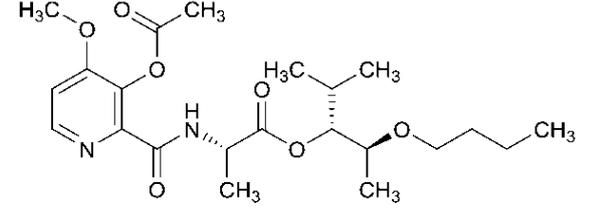
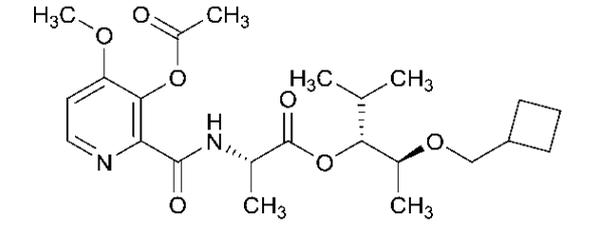
【表 1 - 77】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
387		実施例 14B.	透明な無色の油状物	10
388		実施例 14B.	透明な無色の油状物	20
389		実施例 14B.	濃密な油状物	30
390		実施例 14B.	濃密な油状物	40

【表 1 - 7 8】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観	
391		実施例 14B.	濃密な油状物	10
392		実施例 14B.	濃密な油状物	20
393		実施例 14B.	濃密な油状物	30
394		実施例 14B.	濃密な油状物	40

【表 1 - 7 9】

*Cmpd. No.	構造	調製準拠元	外観
395		実施例 14A.	濃密な油状物
396		実施例 14A.	濃密な油状物
397		実施例 14A.	濃密な油状物
398		実施例 14A.	濃密な油状物
399		実施例 14A.	濃密な油状物

*Cmpd. No. - 化合物番号

10

20

30

40

【表 2 - 1】

表 2. 分析データ

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
1	(薄膜) 3372, 2979, 1742, 1707, 1477, 1247, 1160, 1058	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₂₇ Cl ₂ NNaO ₅ の 計算値 454.1158; 実測値 454.1162	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.36 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 7.16 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.5 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 5.75 (ddt, <i>J</i> = 17.2, 10.1, 7.1 Hz, 1H), 5.24 – 4.93 (m, 4H), 4.46 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 4.29 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 2.54 (t, <i>J</i> = 6.8 Hz, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.36 (d, <i>J</i> = 3.8 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 2.9 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.80, 155.06, 152.09, 133.00, 130.19, 127.60, 126.55, 125.29, 118.43, 116.99, 79.77, 76.39, 75.20, 49.38, 34.22, 28.32, 18.57, 15.60.
2	(薄膜) 3368, 2963, 1712, 1493, 1239, 1163, 1057, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₁ NNaO ₅ の計 算値 388.2097; 実 測値 388.2077	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.33 – 7.19 (m, 2H), 7.00 – 6.91 (m, 1H), 6.91 – 6.81 (m, 2H), 5.09 (dt, <i>J</i> = 8.7, 4.2 Hz, 1H), 5.05 – 4.91 (m, 1H), 4.45 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 4.29 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 1.79 – 1.57 (m, 2H), 1.53 – 1.16 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.36 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.96, 157.80, 155.05, 129.51, 121.19, 116.26, 115.59, 79.71, 76.45, 74.82, 49.49, 31.85, 28.32, 18.66, 15.64, 13.91.

【表 2 - 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
3	(薄膜) 3362, 2976, 1712, 1493, 1238, 1162, 1066, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₂₉ NNaO ₅ の計 算値 374.1938; 実 測値 374.1936	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.33 – 7.22 (m, 2H), 6.99 – 6.90 (m, 3H), 5.10 – 4.92 (m, 2H), 4.55 – 4.44 (m, 1H), 4.37 – 4.21 (m, 1H), 1.86 – 1.57 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.37 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.92 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.16, 157.94, 155.03, 129.54, 121.09, 115.83, 79.69, 77.54, 73.54, 49.47, 28.34, 22.45, 18.78, 15.47, 9.75.
4	(薄膜) 3363, 2976, 1712, 1493, 1240, 1163, 1057, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₂₉ NNaO ₅ の計 算値 374.1938; 実 測値 374.1927	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.30 – 7.21 (m, 2H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.88 – 6.81 (m, 2H), 5.17 – 4.99 (m, 2H), 4.44 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 4.34 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 1.79 – 1.68 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.37 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.08, 157.66, 155.04, 129.53, 121.18, 116.07, 79.72, 77.59, 74.33, 49.40, 28.34, 23.21, 18.81, 15.21, 9.86.

10

20

30

40

【表 2 - 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
5	(薄膜) 3363, 2963, 1713, 1493, 1240, 1163, 1057, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₁ NNaO ₅ の計 算値 388.2094; 実 測値 388.2083	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.21 (m, 2H), 6.98 – 6.90 (m, 3H), 5.18 – 5.06 (m, 1H), 5.01 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.47 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.9 Hz, 1H), 4.38 – 4.19 (m, 1H), 1.73 – 1.61 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.42 – 1.23 (m, 8H), 0.91 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.11, 157.91, 155.02, 129.54, 121.09, 115.83, 79.70, 75.94, 73.68, 49.46, 31.39, 28.34, 18.74, 18.62, 15.42, 13.90.
6	(薄膜) 3362, 2963, 1713, 1494, 1242, 1164, 1066, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₁ NNaO ₅ の計 算値 388.2094; 実 測値 388.2093	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.18 (m, 2H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.89 – 6.80 (m, 2H), 5.21 – 5.04 (m, 2H), 4.43 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 4.33 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.78 – 1.56 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.41 – 1.22 (m, 8H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.05, 157.67, 155.02, 129.52, 121.18, 116.09, 79.71, 76.10, 74.70, 49.40, 32.16, 28.33, 18.84, 18.72, 15.15, 13.91.

10

20

30

40

【表 2 - 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
7	(薄膜) 3361, 2960, 1714, 1494, 1240, 1163, 1067, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₃ NNaO ₅ の計 算値 402.2251; 実 測値 402.2233	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.22 (m, 2H), 6.99 – 6.90 (m, 3H), 5.21 (ddd, <i>J</i> = 10.2, 4.8, 3.0 Hz, 1H), 5.00 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.51 – 4.41 (m, 1H), 4.37 – 4.22 (m, 1H), 1.68 (ddd, <i>J</i> = 14.1, 10.1, 4.4 Hz, 1H), 1.59 (dddd, <i>J</i> = 13.1, 10.9, 6.5, 4.5 Hz, 1H), 1.50 – 1.40 (m, 10H), 1.36 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 0.87 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.09, 157.84, 154.99, 129.54, 121.11, 115.85, 79.72, 74.32, 73.86, 49.45, 38.15, 28.34, 24.50, 23.50, 21.68, 18.72, 15.36.
8	(薄膜) 3361, 2960, 1714, 1494, 1241, 1165, 1054, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₃ NNaO ₅ の計 算値 402.2251; 実 測値 402.2242	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.30 – 7.19 (m, 2H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.89 – 6.81 (m, 2H), 5.22 (dt, <i>J</i> = 10.0, 3.4 Hz, 1H), 5.10 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.41 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.8 Hz, 1H), 4.32 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.77 – 1.57 (m, 2H), 1.49 – 1.40 (m, 10H), 1.40 – 1.32 (m, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (dd, <i>J</i> = 7.9, 6.4 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.04, 157.70, 155.02, 129.52, 121.18, 116.10, 79.69, 75.12, 74.70, 49.39, 38.92, 28.33, 24.48, 23.47, 21.79, 18.87, 15.07.

【表 2 - 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
9	(薄膜) 3372, 2976, 1714, 1494, 1240, 1164, 1041, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₁ NNaO ₅ の計 算値 388.2094; 実 測値 388.2092	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.23 (m, 2H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.91 – 6.86 (m, 2H), 5.01 – 4.91 (m, 1H), 4.52 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.30 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 2.19 – 2.06 (m, <i>J</i> = 6.1, 5.6 Hz, 1H), 1.49 – 1.41 (m, 10H), 1.37 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (dd, <i>J</i> = 6.8, 1.9 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.09, 158.01, 154.98, 129.53, 121.05, 115.79, 80.97, 79.63, 73.27, 49.50, 28.65, 28.36, 19.43, 18.80, 17.35, 16.15.
10	(薄膜) 3362, 2975, 1713, 1493, 1240, 1163, 1054, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₁ NNaO ₅ の計 算値 388.2094; 実 測値 388.2093	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.21 (m, 2H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.2 Hz, 1H), 6.87 – 6.80 (m, 2H), 5.13 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 5.03 (dd, <i>J</i> = 6.7, 5.2 Hz, 1H), 4.57 – 4.48 (m, 1H), 4.37 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 2.10 – 1.97 (m, 1H), 1.54 – 1.39 (m, 12H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (dd, <i>J</i> = 18.1, 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.03, 157.37, 155.08, 129.54, 121.11, 115.85, 79.75, 72.63, 49.42, 28.94, 28.34, 19.11, 18.89, 17.79, 14.86.

10

20

30

40

【表 2 - 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
11	(薄膜) 3363, 2978, 1711, 1494, 1241, 1162, 1067, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₇ H ₂₅ NNaO ₅ の計 算値 346.1625; 実 測値 346.1630	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.35 – 7.20 (m, 2H), 7.00 – 6.87 (m, 3H), 5.11 – 4.90 (m, 1H), 4.67 – 4.55 (m, 1H), 4.28 (h, <i>J</i> = 7.3, 6.7 Hz, 3H), 1.43 (s, 9H), 1.34 (dd, <i>J</i> = 6.8, 3.4 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.16, 157.68, 155.04, 129.55, 121.33, 116.14, 79.81, 71.59, 67.48, 49.24, 28.32, 18.57, 16.84.
12	(薄膜) 3346, 2964, 1716, 1495, 1243, 1166, 1095, 752	ESIMS <i>m/z</i> 402.2 ([M+Na] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.22 (m, 2H), 6.97 – 6.86 (m, 3H), 5.22 (ddd, <i>J</i> = 10.0, 5.1, 3.1 Hz, 1H), 5.08 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.48 – 4.37 (m, 1H), 4.37 – 4.23 (m, 1H), 1.74 – 1.55 (m, 2H), 1.51 – 1.38 (m, 10H), 1.31 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H), 0.88 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.17, 157.69, 129.54, 121.06, 115.73, 79.76, 74.44, 73.93, 49.42, 38.37, 28.34, 24.44, 23.49, 21.77, 18.82, 15.41.

10

20

30

40

【表 2 - 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
13	(薄膜) 3363, 2963, 1716, 1494, 1241, 1165, 1067, 753	ESIMS <i>m/z</i> 402.2 ([M+Na] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.33 – 7.20 (m, 2H), 6.99 – 6.91 (m, 1H), 6.91 – 6.85 (m, 2H), 5.16 (ddd, <i>J</i> = 10.2, 4.1, 2.9 Hz, 1H), 4.97 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 4.44 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.0 Hz, 1H), 4.36 – 4.20 (m, 1H), 1.73 (ddd, <i>J</i> = 14.2, 10.1, 4.3 Hz, 1H), 1.68 – 1.53 (m, 1H), 1.53 – 1.40 (m, 10H), 1.35 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.92 (dd, <i>J</i> = 8.9, 6.6 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.95, 157.88, 155.04, 129.51, 121.22, 116.34, 79.70, 75.29, 75.07, 49.50, 38.63, 28.33, 24.45, 23.55, 21.62, 18.59, 15.58.
14	(薄膜) 3374, 2975, 1716, 1495, 1243, 1168, 1070, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₁ NNaO ₅ の計 算値 388.2094; 実 測値 388.2106	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.20 (m, 2H), 6.92 (td, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.84 (m, 2H), 5.08 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 4.95 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.52 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.43 – 4.24 (m, 1H), 2.12 (h, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.29 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (dd, <i>J</i> = 6.9, 2.7 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.37, 157.76, 155.03, 129.53, 120.95, 115.61, 80.86, 73.02, 49.42, 28.60, 28.35, 19.44, 18.83, 17.22, 15.95.

10

20

30

40

【表 2 - 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
15	(薄膜) 3375, 2975, 1714, 1494, 1241, 1166, 1068, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₁ NNaO ₅ の計 算値 388.2094; 実 測値 388.2060	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.30 – 7.23 (m, 2H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.83 (m, 2H), 5.12 – 4.99 (m, 2H), 4.50 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.36 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 2.15 – 2.06 (m, 1H), 1.45 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.95 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.93, 157.44, 155.09, 129.54, 121.12, 115.92, 79.89, 79.77, 72.62, 49.55, 28.72, 28.35, 19.35, 18.86, 17.08, 15.50.
16	(薄膜) 3356, 2931, 1716, 1495, 1243, 1166, 1068, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₂ H ₃₅ NNaO ₅ の計 算値 416.2407; 実 測値 416.2403	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.21 (m, 2H), 6.98 – 6.87 (m, 3H), 5.16 – 5.00 (m, 2H), 4.49 – 4.39 (m, 1H), 4.32 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 1.78 – 1.55 (m, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.35 – 1.21 (m, 11H), 0.90 – 0.83 (m, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.23, 157.76, 155.03, 129.54, 121.03, 115.71, 79.74, 76.28, 73.71, 49.41, 31.61, 29.47, 28.34, 24.90, 22.44, 18.82, 15.47, 13.96.

10

20

30

40

【表 2 - 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
17	(薄膜) 3363, 2931, 1716, 1494, 1242, 1167, 1067, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₂ H ₃₅ NNaO ₅ の計 算値 416.2407; 実 測値 416.2409	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.22 (m, 2H), 6.98 – 6.91 (m, 1H), 6.91 – 6.85 (m, 2H), 5.08 (td, <i>J</i> = 6.4, 4.5 Hz, 1H), 5.01 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H), 4.44 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 4.30 (dd, <i>J</i> = 11.2, 4.2 Hz, 1H), 1.70 (q, <i>J</i> = 7.0, 6.0 Hz, 2H), 1.45 (s, 10H), 1.37 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35 – 1.19 (m, 8H), 0.92 – 0.81 (m, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.95, 157.83, 155.04, 129.52, 121.21, 116.30, 79.70, 76.71, 74.86, 49.50, 31.57, 29.75, 28.34, 25.02, 22.44, 18.71, 15.64, 13.95.
18	(薄膜) 3377, 2963, 1717, 1495, 1242, 1166, 1068, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₂ H ₃₅ NNaO ₅ の計 算値 416.2407; 実 測値 416.2401	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.22 (m, 2H), 6.97 – 6.90 (m, 3H), 5.10 (dt, <i>J</i> = 9.0, 4.7 Hz, 1H), 5.01 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.47 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.9 Hz, 1H), 4.37 – 4.21 (m, 1H), 1.77 – 1.55 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.37 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34 – 1.17 (m, 9H), 0.92 – 0.80 (m, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.12, 157.91, 154.99, 129.54, 121.10, 115.86, 79.71, 76.21, 73.70, 49.42, 31.56, 29.20, 28.35, 24.96, 22.43, 18.81, 15.43, 13.93.

10

20

30

40

【表 2 - 1 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
19	(薄膜) 3364, 2931, 1716, 1494, 1243, 1166, 1068, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₂ H ₃₅ NNaO ₅ の計 算値 416.2407; 実 測値 416.2416	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.21 (m, 2H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.78 (m, 2H), 5.12 (dq, <i>J</i> = 10.5, 6.2, 5.3 Hz, 2H), 4.42 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 4.33 (p, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 1.76 – 1.60 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.41 – 1.34 (m, 4H), 1.29 (m, 8H), 0.93 – 0.82 (m, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.07, 157.68, 155.04, 129.52, 121.18, 116.10, 79.71, 76.33, 74.69, 49.42, 31.62, 30.05, 28.34, 25.08, 22.46, 18.84, 15.13, 13.97.
20	(薄膜) 3373, 2979, 1714, 1495, 1243, 1166, 1069, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₇ H ₂₅ NNaO ₅ の計 算値 346.1625; 実 測値 346.1620	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.34 – 7.22 (m, 2H), 7.01 – 6.83 (m, 3H), 5.06 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.62 (pd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 4.45 – 4.23 (m, 2H), 4.17 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.2 Hz, 1H), 1.43 (s, 9H), 1.33 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 3.6 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.20, 157.72, 155.08, 129.55, 121.31, 116.13, 79.80, 71.66, 67.57, 49.26, 28.32, 18.52, 16.75.
21	(薄膜) 3369, 2979, 1713, 1493, 1241, 1164	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₂₉ NNaO ₅ の計 算値 386.1938; 実 測値 386.1933	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.22 (m, 3H), 6.98 – 6.86 (m, 3H), 4.99 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 4.57 (qt, <i>J</i> = 5.8, 2.8 Hz, 1H), 4.47 (dd, <i>J</i> = 9.2, 3.6 Hz, 1H), 4.30 (dd, <i>J</i> = 10.9, 4.1 Hz, 1H), 1.44 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 11H), 1.40 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.36 (dd, <i>J</i> = 6.7, 2.5 Hz, 3H), 0.40 (dd, <i>J</i> = 4.9, 2.0 Hz, 2H).

【表 2 - 1 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
22	(薄膜) 3361, 2929, 1714, 1494, 1242, 1166	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₃ H ₃₅ NNaO ₅ の計 算値 428.2407; 実 測値 428.2386	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.21 (m, 2H), 6.93 (td, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.83 (m, 2H), 5.11 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.95 (dd, <i>J</i> = 6.4, 5.1 Hz, 1H), 4.64 – 4.49 (m, 1H), 4.35 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 1.88 – 1.56 (m, 6H), 1.44 (s, 10H), 1.31 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.22 – 0.98 (m, 4H).	10
23	(薄膜) 3368, 2928, 1713, 1493, 1240, 1164	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₃ H ₃₅ NNaO ₅ の計 算値 428.2407; 実 測値 428.2402	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.30 – 7.22 (m, 2H), 6.97 – 6.82 (m, 3H), 5.08 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H), 5.04 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 4.37 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 1.81 – 1.58 (m, 6H), 1.45 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (dd, <i>J</i> = 6.2, 1.6 Hz, 3H), 1.27 – 0.98 (m, 5H).	20
24	(薄膜) 3381, 2977, 1714, 1505, 1208, 1167	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₀ FNNaO ₅ の 計算値 406.2000; 実測値 406.2001	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.00 – 6.91 (m, 2H), 6.86 – 6.79 (m, 2H), 5.07 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.93 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.41 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 2.11 (dq, <i>J</i> = 13.3, 6.6 Hz, 1H), 1.44 (s, 10H), 1.30 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.95 (dd, <i>J</i> = 6.8, 5.3 Hz, 6H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 123.45 .	30

40

【表 2 - 1 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
25	(薄膜) 3371, 2975, 1712, 1504, 1207, 1165	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₀ FNNaO ₅ の 計算値 406.2000; 実測値 406.2000	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 6.99 – 6.92 (m, 2H), 6.85 – 6.79 (m, 2H), 5.08 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 5.00 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.39 (h, <i>J</i> = 7.1, 6.6 Hz, 2H), 2.08 (td, <i>J</i> = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 1.45 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 0.95 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 123.19.	10
26	(薄膜) 3369, 2980, 1712, 1504, 1207, 1164	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₇ H ₂₄ FNNaO ₅ の 計算値 364.1531; 実測値 364.1530	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.00 – 6.92 (m, 2H), 6.91 – 6.83 (m, 2H), 5.02 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 4.52 (pd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 4.34 (dd, <i>J</i> = 11.5, 6.6 Hz, 2H), 4.17 (dd, <i>J</i> = 11.5, 4.1 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.33 (dd, <i>J</i> = 9.1, 6.8 Hz, 6H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 122.87 .	20
27	(薄膜) 3358, 2979, 1712, 1494, 1240, 1162, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ NNaO ₅ の計 算値 422.1938; 実 測値 422.1936	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.43 – 7.20 (m, 7H), 6.98 – 6.90 (m, 1H), 6.90 – 6.83 (m, 2H), 5.94 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 1H), 4.99 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 4.66 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 4.41 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.36 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.13, 157.73, 155.06, 136.69, 129.51, 128.31, 128.23, 127.14, 121.40, 116.45, 79.81, 77.96, 76.09, 49.31, 28.34, 18.47, 15.34.	30 40

【表 2 - 1 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
28	(薄膜) 3355, 2978, 1713, 1494, 1240, 1163, 1066, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ NNaO ₅ の計 算値 422.1938; 実 測値 422.1941	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.45 – 7.14 (m, 7H), 6.96 (ddd, <i>J</i> = 8.9, 7.2, 1.6 Hz, 3H), 5.93 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 4.91 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 4.68 (p, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 4.31 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 1.43 (s, 9H), 1.30 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.19, 158.12, 154.98, 136.55, 129.57, 128.54, 128.48, 127.39, 121.30, 116.14, 79.69, 78.86, 75.51, 49.25, 28.33, 18.50, 16.25.	10
29	(薄膜) 3358, 2982, 1715, 1494, 1243, 1166, 1068	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₈ H ₂₇ NNaO ₅ の計 算値 360.1781; 実 測値 360.1768	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.23 (m, 2H), 6.98 – 6.88 (m, 3H), 5.21 – 5.11 (m, 1H), 5.05 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 4.42 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.36 – 4.21 (m, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.30 (app t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 6H), 1.28 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.92, 157.80, 155.07, 129.55, 121.09, 115.78, 79.77, 74.55, 72.87, 49.39, 28.35, 18.74, 15.35, 15.26.	20 30
30	(薄膜) 3365, 2981, 1715, 1494, 1242, 1166	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₂₇ NNaO ₅ の計 算値 360.1781; 実 測値 360.1763	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.23 (m, 2H), 6.95 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.93 – 6.85 (m, 2H), 5.06 (qd, <i>J</i> = 6.5, 4.2 Hz, 1H), 4.96 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.44 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 4.39 – 4.17 (m, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.35 – 1.28 (m, 9H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.64, 157.95, 155.06, 129.53, 121.27, 116.40, 79.76, 75.47, 73.66, 49.41, 28.34, 18.54, 15.81, 15.01.	40

【表 2 - 1 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
31	(薄膜) 3363, 2976, 1712, 1510, 1164, 1067	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₂₉ F ₂ NNaO ₅ の 計算値 424.1906; 実測値 424.1906	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.00 (ddd, <i>J</i> = 10.6, 8.9, 5.3 Hz, 1H), 6.70 (ddd, <i>J</i> = 9.7, 6.6, 3.0 Hz, 1H), 6.61 (ddt, <i>J</i> = 8.8, 7.5, 3.1 Hz, 1H), 5.05 (q, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H), 4.47 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 4.36 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 2.16 – 2.00 (m, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.52 – 1.40 (m, 12H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 116.82 (d, <i>J</i> = 15.2 Hz), -138.26 (d, <i>J</i> = 15.1 Hz).	10 20
32	(薄膜) 3367, 2977, 1712, 1325, 1252, 1162, 1111, 1066	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₀ F ₃ NNaO ₅ の 計算値 456.1968; 実測値 456.1968	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.53 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H), 6.93 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H), 5.11 – 4.99 (m, 2H), 4.57 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 4.36 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 2.08 (dq, <i>J</i> = 13.1, 6.6 Hz, 1H), 1.46 (s, 9H), 1.44 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 61.58 .	30
33	(薄膜) 3373, 2974, 1712, 1489, 1163, 1133, 1067	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₀ FNNaO ₅ の 計算値 406.2000; 実測値 406.1997	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.20 (td, <i>J</i> = 8.2, 6.8 Hz, 1H), 6.69 – 6.53 (m, 3H), 5.14 – 4.97 (m, 2H), 4.47 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 4.36 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 2.08 (dq, <i>J</i> = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 1.45 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 111.58 .	40

【表 2 - 1 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
34	(薄膜) 3359, 2975, 1714, 1497, 1250, 1165, 1060	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₂ CINNaO ₅ の 計算値 436.1861; 実測値 436.1861	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.17 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 6.97 (dd, <i>J</i> = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 6.82 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H), 5.16 – 5.05 (m, 1H), 4.47 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 4.43 – 4.31 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 2.12 (dt, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.68 – 1.55 (m, 1H), 1.49 – 1.41 (m, 12H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H).	10
35	(薄膜) 3367, 2975, 1710, 1478, 1163, 1059	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₂₉ Cl ₂ NNaO ₅ の 計算値 456.1315; 実測値 456.1316	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.35 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H), 7.16 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.6 Hz, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 5.16 – 4.99 (m, 2H), 4.49 (p, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 4.38 (q, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 2.11 (h, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 1.47 – 1.41 (m, 12H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.92, 155.10, 151.85, 130.31, 127.54, 126.37, 125.23, 116.24, 79.78, 79.35, 74.75, 49.54, 28.76, 28.35, 19.26, 18.80, 17.49, 15.01.	20 30

40

【表 2 - 1 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
36	(薄膜) 3373, 2974, 1713, 1605, 1140, 1063	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₂₉ ClFNNaO ₅ の計算値 440.1611; 実測値 440.1611	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 6.72 – 6.63 (m, 2H), 6.49 (dt, <i>J</i> = 10.5, 2.3 Hz, 1H), 5.04 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 5.00 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.45 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 4.35 (p, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 2.05 (dq, <i>J</i> = 13.5, 6.7 Hz, 1H), 1.46 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.97, 163.41 (d, <i>J</i> = 248.0 Hz), 159.01 (d, <i>J</i> = 12.3 Hz), 155.12, 135.49 (d, <i>J</i> = 13.4 Hz), 112.14 (d, <i>J</i> = 3.2 Hz), 109.04 (d, <i>J</i> = 25.3 Hz), 102.09 (d, <i>J</i> = 24.8 Hz), 79.89, 79.28, 73.49, 49.56, 28.78, 28.35, 19.22, 18.65, 17.34, 15.01. ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 110.00 .
37	(薄膜) 3370, 2974, 1713, 1477, 1163, 1068	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₀ H ₃₀ ClNNaO ₅ の 計算値 422.1705; 実測値 422.1705	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.18 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.96 – 6.90 (m, 1H), 6.90 – 6.83 (m, 1H), 6.75 (dd, <i>J</i> = 8.4, 2.4 Hz, 1H), 5.05 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 5.01 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 4.52 – 4.43 (m, 1H), 4.35 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 2.08 (dq, <i>J</i> = 13.3, 6.8 Hz, 1H), 1.45 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H).

10

20

30

40

【表 2 - 17】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
38	(薄膜) 3345, 2974, 1714, 1506, 1228, 1166	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₃ NNaO ₆ の計 算値 418.2200; 実 測値 418.2202	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 6.82 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 4H), 5.10 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 4.92 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.37 (dt, <i>J</i> = 13.5, 6.7 Hz, 2H), 3.76 (d, <i>J</i> = 1.5 Hz, 3H), 2.12 (h, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.32 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.22 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (dd, <i>J</i> = 9.1, 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.37, 155.04, 154.13, 151.79, 117.12, 114.71, 80.97, 79.69, 74.19, 55.70, 49.43, 28.60, 28.35, 19.45, 18.91, 17.29, 15.99.
39	(薄膜) 3360, 2974, 1713, 1506, 1228, 1164	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₃ NNaO ₆ の計 算値 418.2200; 実 測値 418.2199	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 6.81 (s, 4H), 5.11 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 5.00 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.36 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 2H), 3.76 (s, 3H), 2.11 (h, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 1.45 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.93 (dd, <i>J</i> = 10.5, 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.93, 155.09, 154.28, 151.51, 117.53, 114.73, 79.91, 79.73, 73.98, 55.68, 49.58, 28.73, 28.35, 19.36, 18.85, 17.15, 15.54.

10

20

30

40

【表 2 - 1 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
40	(薄膜) 3361, 2978, 1713, 1506, 1228, 1165	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₂₇ NNaO ₆ の計 算値 376.1731; 実 測値 376.1732	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 6.90 – 6.77 (m, 4H), 5.04 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 4.47 (pd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 4.33 (dd, <i>J</i> = 11.6, 6.5 Hz, 2H), 4.16 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.1 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.35 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.23, 155.08, 154.47, 151.72, 117.85, 114.73, 79.84, 73.06, 67.62, 55.70, 49.29, 28.34, 18.61, 16.85.
41	(薄膜) 3427, 3367, 2974, 2937, 2878, 1716, 1495, 1243.07, 1167	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₂ H ₃₅ NNaO ₅ の計 算値 416.2407; 実 測値 416.2377	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.36 – 7.18 (m, 3H), 6.92 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.89 – 6.84 (m, 2H), 5.19 (dd, <i>J</i> = 6.4, 4.7 Hz, 1H), 5.09 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 4.55 (h, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 4.39 – 4.21 (m, 1H), 1.58 (s, 1H), 1.43 (s, 11H), 1.25 (dd, <i>J</i> = 13.1, 6.7 Hz, 7H), 0.92 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 6H).

10

20

30

40

【表 2 - 1 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
42	(薄膜) 3364, 2966, 2934, 2877, 1713, 1494, 1240, 1164	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₂ H ₃₅ NNaO ₅ の計 算値 416.2384; 実 測値 416.2407	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.22 (m, 3H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.82 (m, 2H), 5.21 (dd, <i>J</i> = 6.6, 4.5 Hz, 1H), 5.08 (qd, <i>J</i> = 5.8, 3.9, 2.8 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.33 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 1.70 – 1.60 (m, 1H), 1.54 (ddt, <i>J</i> = 14.0, 7.5, 4.0 Hz, 1H), 1.45 (s, 11H), 1.33 – 1.17 (m, 5H), 0.94 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 0.86 (q, <i>J</i> = 8.1, 7.5 Hz, 4H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.93, 157.46, 155.07, 129.59, 121.19, 116.01, 79.74, 72.63, 49.62, 41.50, 28.30, 22.29, 21.16, 18.63, 15.88, 11.43.
43		ESIMS <i>m/z</i> 403.6 ([M+Na] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.42 – 7.13 (m, 2H), 7.07 – 6.63 (m, 3H), 5.27 – 4.98 (m, 2H), 4.62 – 4.15 (m, 2H), 1.86 – 1.08 (m, 23H), 1.02 – 0.73 (m, 1H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 210.88, 172.86, 157.48, 155.05, 129.50, 121.10, 116.08, 78.73, 74.19, 40.83, 29.05, 28.33, 25.46, 24.94, 18.89, 15.00.

10

20

30

40

【表 2 - 2 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
44		ESIMS <i>m/z</i> 392.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.40 – 7.16 (m, 3H), 7.04 – 6.81 (m, 4H), 5.27 – 4.97 (m, 2H), 4.47 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.5 Hz, 1H), 4.39 – 4.29 (m, 1H), 1.81 – 1.47 (m, 5H), 1.44 (s, 10H), 1.34 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 – 1.23 (m, 4H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 173.33, 157.73, 129.54, 120.93, 115.59, 100.47, 99.99, 79.74, 79.61, 73.63, 49.46, 40.21, 29.11, 28.34, 25.27, 25.03, 18.90, 15.97.
45		ESIMS <i>m/z</i> 414.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.23 (dddt, <i>J</i> = 17.1, 10.5, 8.0, 4.5 Hz, 6H), 6.98 – 6.80 (m, 3H), 5.43 – 5.17 (m, 1H), 5.02 (dd, <i>J</i> = 23.9, 7.9 Hz, 1H), 4.56 – 4.02 (m, 2H), 3.21 – 2.75 (m, 2H), 1.43 (d, <i>J</i> = 4.1 Hz, 9H), 1.40 – 1.04 (m, 7H).
46	(薄膜) 3355, 2977, 2933, 1714, 1497, 1454, 1366, 1248, 1164, 1068, 699	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₂ H ₃₃ NO ₅ Na の計 算値 414.2251; 実 測値 414.2253	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.22 (m, 2H), 7.22 – 7.15 (m, 3H), 5.26 – 5.16 (m, 1H), 5.03 – 4.85 (m, 3H), 4.27 – 4.13 (m, 1H), 3.98 – 3.86 (m, 2H), 3.62 – 3.51 (m, 1H), 3.02 (dd, <i>J</i> = 14.2, 4.2 Hz, 1H), 2.89 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.5 Hz, 1H), 1.75 (t, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.42 (s, 9H), 1.21 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.09 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).

10

20

30

40

【表 2 - 2 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
47	(薄膜) 3354, 2975, 2934, 2876, 1715, 1497, 1454, 1366, 1165, 1105, 1069, 1021	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₃ NO ₅ Na の計 算値 402.2251; 実 測値 402.2252	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.30 – 7.22 (m, 2H), 7.19 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 5.24 – 5.10 (m, 1H), 4.94 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.28 – 4.13 (m, 1H), 3.55 – 3.36 (m, 3H), 3.03 (dd, <i>J</i> = 14.4, 4.1 Hz, 1H), 2.87 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.4 Hz, 1H), 1.66 – 1.50 (m, 2H), 1.42 (s, 9H), 1.19 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.08 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H).
48	(薄膜) 3364, 2958, 2932, 2871, 1714, 1497, 1454, 1365, 1343, 1306, 1248, 1164, 1104, 1068, 1021, 699	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₃ H ₃₇ NO ₅ Na の計 算値 430.2564; 実 測値 430.2564	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.34 – 7.23 (m, 2H), 7.21 – 7.15 (m, 3H), 5.25 – 5.14 (m, 1H), 4.94 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.32 – 4.10 (m, 1H), 3.58 – 3.38 (m, 3H), 3.03 (dd, <i>J</i> = 14.2, 4.1 Hz, 1H), 2.87 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.4 Hz, 1H), 1.6 - 1.5 (m, 2H), 1.42 (s, 9H), 1.33 (h, <i>J</i> = 3.6 Hz, 4H), 1.19 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.09 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.95 – 0.85 (m, 3H).

10

20

30

40

【表 2 - 2 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
49	(薄膜) 3363, 2975, 2935, 1714, 1499, 1451, 1366, 1248, 1165, 1068, 1022, 898	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₃ NO ₅ Na の計 算値 361.2697; 実 測値 361.2609	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 5.11 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 4.94 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz, 1H), 4.85 (s, 1H), 4.75 (dd, <i>J</i> = 6.6, 5.0 Hz, 1H), 4.43 – 4.27 (m, 1H), 3.95 (d, <i>J</i> = 12.2 Hz, 1H), 3.77 (d, <i>J</i> = 12.3 Hz, 1H), 3.61 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 2.06 (h, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.72 (s, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.16 – 1.09 (m, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.88 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 173.27, 155.03, 142.29, 111.93, 81.59, 79.65, 74.11, 72.89, 49.39, 28.42, 28.34, 19.68, 19.38, 18.94, 17.53, 15.59 .
50	(薄膜) 3363, 2974, 2935, 1714, 1500, 1453, 1366, 1340, 1248, 1166, 1103, 1066, 898	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₃ NO ₅ Na の計 算値 361.2697; 実 測値 361.2676	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 5.10 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.99 – 4.92 (m, 1H), 4.91 – 4.83 (m, 2H), 4.42 – 4.27 (m, 1H), 3.92 (d, <i>J</i> = 12.3 Hz, 1H), 3.84 (d, <i>J</i> = 12.5 Hz, 1H), 3.62 – 3.51 (m, 1H), 2.02 (h, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.72 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 3.8 Hz, 3H), 0.89 (d, <i>J</i> = 4.0 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.98, 155.05, 142.36, 112.07, 79.75, 79.66, 73.61, 72.64, 49.52, 28.64, 28.33, 19.60, 19.33, 18.98, 17.51, 15.09 .

【表 2 - 2 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
51	(薄膜) 3357, 2975, 2936, 2877, 1715, 1502, 1454, 1366, 1248, 1166, 1092, 1065, 1021, 924	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₇ H ₃₁ NO ₅ Na の計 算値 352.2094; 実 測値 352.2094	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 5.87 (ddt, <i>J</i> = 17.3, 10.8, 5.5 Hz, 1H), 5.25 (dq, <i>J</i> = 17.3, 1.7 Hz, 1H), 5.19 – 5.02 (m, 2H), 4.87 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.40 – 4.26 (m, 1H), 4.06 – 3.93 (m, 2H), 3.63 – 3.53 (m, 1H), 2.02 (h, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.13 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 4H), 0.90 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 4H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.98, 155.04, 134.92, 116.76, 79.68, 73.60, 69.62, 49.53, 28.62, 28.33, 19.31, 18.96, 17.52, 15.17 .
52	(薄膜) 3372, 2977, 1714, 1503, 1456, 1367, 1308, 1263, 1168, 1122, 1067, 960	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₀ F ₃ NO ₅ Na の 計算値 420.1968; 実測値 420.1968	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 6.38 (dt, <i>J</i> = 14.4, 4.2, 2.1 Hz, 1H), 5.96 – 5.77 (m, 1H), 5.04 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.88 (dd, <i>J</i> = 6.7, 4.9 Hz, 1H), 4.41 – 4.25 (m, 1H), 4.16 – 4.04 (m, 2H), 3.61 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.8 Hz, 1H), 1.98 (h, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 173.02, 155.05, 136.65 (q, <i>J</i> = 6.3 Hz), 126.63 – 119.78 (m), 118.38 (q, <i>J</i> = 34.7, 34.1 Hz), 79.77, 79.28, 74.98, 66.43, 49.51, 28.69, 28.30, 19.21, 18.84, 17.85, 14.82 .

【表 2 - 2 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
53	(薄膜) 3359, 2973, 2934, 1712, 1496, 1449, 1366, 1339, 1208, 1164, 1103, 1064, 966, 743, 692	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₃ H ₃₅ NO ₅ Na の計 算値 428.2407; 実 測値 428.2410	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.43 – 7.36 (m, 2H), 7.35 – 7.27 (m, 2H), 7.25 (d, <i>J</i> = 11.6 Hz, 1H), 6.58 (dd, <i>J</i> = 16.0, 1.5 Hz, 1H), 6.25 (dt, <i>J</i> = 15.9, 6.0 Hz, 1H), 5.09 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.91 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.43 – 4.28 (m, 1H), 4.24 – 4.10 (m, 2H), 3.65 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 2.10 – 1.98 (m, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 – 0.79 (m, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 173.01, 155.05, 136.72, 132.19, 128.52, 127.62, 126.48, 126.23, 79.67, 73.59, 69.29, 49.55, 28.65, 28.33, 19.33, 18.97, 17.55, 15.26 .
54	(薄膜) 3372, 2975, 2872, 1715, 1497, 1454, 1365, 1343, 1248, 1164, 1107, 1068, 1029, 699	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₂ H ₃₅ NO ₅ Na の計 算値 416.2407; 実 測値 416.2409	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.29 – 7.23 (m, 2H), 7.22 – 7.15 (m, 3H), 5.26 – 5.13 (m, 1H), 4.93 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 4.27 – 4.10 (m, 1H), 3.53 – 3.43 (m, 1H), 3.34 – 3.15 (m, 2H), 3.04 (dd, <i>J</i> = 14.3, 4.1 Hz, 1H), 2.87 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.4 Hz, 1H), 1.82 (dp, <i>J</i> = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 1.42 (s, 9H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.08 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 3H), 0.90 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.68, 154.96, 137.45, 129.33, 128.30, 126.45, 79.64, 76.34, 49.26, 36.17, 28.79, 28.31, 19.44, 19.39, 18.54, 15.88 .

【表 2 - 2 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
55	(薄膜) 3359, 2965, 2875, 1716, 1504, 1455, 1366, 1339, 1296, 1248, 1168, 1102, 1066, 1023	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₅ NO ₅ Na の計 算値 368.2407; 実 測値 368.2404	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 5.08 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 4.85 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.38 – 4.26 (m, 1H), 3.47 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.24 (dd, <i>J</i> = 8.6, 6.3 Hz, 1H), 3.13 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.7 Hz, 1H), 2.04 (dq, <i>J</i> = 13.2, 6.6 Hz, 1H), 1.77 (dp, <i>J</i> = 13.2, 6.6 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.92 – 0.81 (m, 12H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.96, 155.07, 79.99, 79.65, 75.89, 74.45, 49.52, 28.76, 28.53, 28.33, 19.43, 19.38, 18.98, 17.21, 15.27 .
56	(薄膜) 3359, 2967, 2936, 2877, 1716, 1502, 1455, 1366, 1340, 1248, 1167, 1107, 1066, 1021	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₇ H ₃₃ NO ₅ Na の計 算値 354.2251; 実 測値 354.2251	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 5.09 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.85 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 4.39 – 4.22 (m, 1H), 3.49 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.46 – 3.27 (m, 2H), 2.03 (h, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 1.59 – 1.48 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.94 – 0.86 (m, 9H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.97, 155.07, 79.86, 79.65, 74.27, 70.63, 49.53, 28.57, 28.33, 23.22, 19.34, 18.98, 17.32, 15.34, 10.66 .

【表 2 - 2 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
57	(薄膜) 2973, 2880, 1715, 1505, 1367, 1252, 1233, 1167, 1103, 1067, 1030	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₂ F ₃ NO ₅ Na の 計算値 422.2125; 実測値 422.2125	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 5.05 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 4.84 (dd, <i>J</i> = 6.4, 5.2 Hz, 1H), 4.33 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 3.57 – 3.40 (m, 3H), 2.26 – 2.05 (m, 2H), 1.97 (h, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 1.84 – 1.70 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.90 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 173.02, 155.06, 130.91 – 123.48 (m), 79.73, 79.48, 74.68, 66.91, 49.49, 30.75 (q, <i>J</i> = 28.7 Hz), 28.65, 28.30, 22.73 (q, <i>J</i> = 3.0 Hz), 19.25, 18.88, 17.67, 14.96 .
58	(薄膜) 3359, 2972, 2934, 2876, 1714, 1496, 1453, 1366, 1247, 1165, 1103, 1064, 1021, 699	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₃ H ₃₇ NO ₅ Na の計 算値 430.2564; 実 測値 430.2567	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.39 – 7.22 (m, 2H), 7.22 – 7.12 (m, 3H), 5.09 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.86 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.34 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.58 – 3.34 (m, 3H), 2.66 (td, <i>J</i> = 7.4, 2.1 Hz, 2H), 2.03 (h, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 1.84 (tt, <i>J</i> = 7.6, 6.3 Hz, 2H), 1.49 – 1.38 (m, 12H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 4.0 Hz, 3H), 0.89 (d, <i>J</i> = 4.1 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.98, 155.05, 142.04, 128.45, 128.29, 125.72, 79.88, 79.67, 74.41, 68.02, 49.54, 32.37, 31.61, 28.60, 28.32, 19.35, 18.98, 17.42, 15.27 .

10

20

30

40

【表 2 - 2 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
59	(薄膜) 3358, 2976, 2935, 2876, 1714, 1500, 1452, 1366, 1248, 1167, 1067, 918, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₇ H ₃₁ NO ₅ Na の計 算値 352.2094; 実 測値 352.2096	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 5.96 – 5.80 (m, 1H), 5.25 (dq, <i>J</i> = 17.2, 1.7 Hz, 1H), 5.21 – 5.09 (m, 2H), 4.74 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.41 – 4.30 (m, 1H), 4.11 – 4.05 (m, 1H), 3.87 (ddt, <i>J</i> = 12.7, 5.8, 1.5 Hz, 1H), 3.61 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 2.04 (h, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.88 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 173.31, 155.04, 134.94, 116.73, 81.47, 79.65, 73.98, 69.87, 49.37, 28.40, 28.34, 19.41, 19.00, 17.33, 15.63 .
60	(薄膜) 3351, 2977, 2937, 1713, 1506, 1455, 1368, 1309, 1262, 1167, 1119, 910, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₀ F ₃ NO ₅ Na の 計算値 420.1968; 実測値 420.1969	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 6.39 (ddq, <i>J</i> = 15.7, 3.9, 1.9 Hz, 1H), 5.96 – 5.83 (m, 1H), 5.07 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.78 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.40 – 4.30 (m, 1H), 4.26 – 4.16 (m, 1H), 4.02 – 3.90 (m, 1H), 3.62 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 2.03 (h, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.38 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.89 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H).

【表 2 - 2 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
61	(薄膜) 3370, 2974, 2874, 1717, 1500, 1454, 1366, 1249, 1210, 1168, 1068, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₅ NO ₅ Na の計 算値 368.2407; 実 測値 368.2409	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 5.12 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 4.72 (dd, <i>J</i> = 6.7, 5.1 Hz, 1H), 4.41 – 4.31 (m, 1H), 3.56 – 3.49 (m, 1H), 3.29 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.4 Hz, 1H), 3.02 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.8 Hz, 1H), 2.06 (h, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 1.79 (dp, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.09 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 – 0.84 (m, 12H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 173.20, 155.02, 81.72, 79.63, 75.95, 74.53, 49.40, 28.79, 28.34, 19.50, 19.45, 19.36, 19.03, 17.57, 15.52 .	10 20
62	(薄膜) 3370, 2972, 1733, 1506, 1451, 1366, 1168, 1092, 1068, 1023, 911, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₇ H ₃₃ NO ₅ Na の計 算値 354.2251; 実 測値 354.2251	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 5.12 (s, 1H), 4.72 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.43 – 4.25 (m, 1H), 3.60 – 3.44 (m, 2H), 3.23 (dt, <i>J</i> = 8.9, 6.8 Hz, 1H), 2.11 – 1.97 (m, 1H), 1.61 – 1.48 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.10 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.92 – 0.85 (m, 6H).	30
63	(薄膜) 3358, 2978, 1735, 1506, 1452, 1368, 1252, 1167, 1067, 912, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₂ F ₃ NO ₅ Na の 計算値 422.2125; 実測値 422.2126	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 5.08 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 4.72 (dd, <i>J</i> = 6.5, 5.2 Hz, 1H), 4.43 – 4.31 (m, 1H), 3.56 (h, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 3.33 (dt, <i>J</i> = 9.1, 6.1 Hz, 1H), 2.23 – 2.08 (m, 2H), 2.02 (dq, <i>J</i> = 13.3, 6.5 Hz, 1H), 1.85 – 1.73 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.10 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.88 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H).	40

【表 2 - 2 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
64		ESIMS <i>m/z</i> 266.5 ([M+H] ⁺)	
65		ESIMS <i>m/z</i> 332.4 ([M+H] ⁺)	
66	(薄膜) 2971, 1743, 1598, 1493, 1230, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₄ H ₂₂ NO ₃ の計算値 252.1594; 実測値 252.1586	¹ H NMR (500 MHz, メタノール- <i>d</i> ₄) δ 7.27 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.99 – 6.89 (m, 3H), 5.11 (ddd, <i>J</i> = 9.3, 5.5, 4.2 Hz, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.94 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.84 (ddp, <i>J</i> = 15.2, 7.7, 3.7 Hz, 1H), 1.74 (ddd, <i>J</i> = 14.0, 8.6, 7.1 Hz, 1H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.96 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H) (NH プロトンは認められず).
67	(薄膜) 3391, 2974, 1745, 1493, 1233, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₄ H ₂₂ NO ₃ の計算値 252.1594; 実測値 252.1585	¹ H NMR (500 MHz, メタノール- <i>d</i> ₄) δ 7.26 (dd, <i>J</i> = 8.4, 7.1 Hz, 2H), 6.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 6.90 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 5.18 (dt, <i>J</i> = 8.5, 4.0 Hz, 1H), 4.60 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.3 Hz, 1H), 4.13 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.85 – 1.68 (m, 2H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.98 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H) (NH プロトンは認められず).

10

20

30

40

【表 2 - 3 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
68	(薄膜) 2959, 1743, 1598, 1493, 1229, 1110, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₅ H ₂₄ NO ₃ の計算 値 266.1751; 実測 値 266.1742	¹ H NMR (500 MHz, メタノー ル-d ₄) δ 7.27 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 6.93 (dd, <i>J</i> = 7.9, 6.2 Hz, 3H), 5.20 (dt, <i>J</i> = 7.8, 5.3 Hz, 1H), 4.58 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.94 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.74 (q, <i>J</i> = 8.3, 7.6 Hz, 2H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.47 – 1.31 (m, 2H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H) (NH プロトンは認めら れず).
69	(薄膜) 2872, 1755, 1497, 1214, 1114, 747	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₅ H ₂₄ NO ₃ の計算 値 266.1751; 実測 値 266.1738	¹ H NMR (500 MHz, メタノー ル-d ₄) δ 7.26 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.93 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 2H), 5.28 (dt, <i>J</i> = 8.4, 3.8 Hz, 1H), 4.59 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.2 Hz, 1H), 4.11 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.79 – 1.63 (m, 2H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.50 – 1.34 (m, 2H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.97 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H) (NH プロトンは 認められず).
70	(薄膜) 2958, 1742, 1598, 1494, 1229, 1118, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₆ H ₂₆ NO ₃ の計算 値 280.1907; 実測 値 280.1901	¹ H NMR (500 MHz, メタノー ル-d ₄) δ 7.27 (dd, <i>J</i> = 8.6, 7.1 Hz, 2H), 6.94 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 3H), 5.28 (ddd, <i>J</i> = 9.7, 5.2, 3.1 Hz, 1H), 4.56 (p, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 3.92 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.74 (ddd, <i>J</i> = 14.3, 10.0, 4.3 Hz, 1H), 1.67 – 1.55 (m, 1H), 1.55 – 1.46 (m, 4H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (dd, <i>J</i> = 22.5, 6.5 Hz, 6H) (NH プロトンは認められず).

10

20

30

40

【表 2 - 3 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
71	(薄膜) 2958, 1746, 1598, 1509, 1494, 1230, 1117, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₆ H ₂₆ NO ₃ の計算 値 280.1907; 実測 値 280.1899	¹ H NMR (500 MHz, メタノー ル-d ₄) δ 7.26 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 5.37 (dt, <i>J</i> = 10.1, 3.2 Hz, 1H), 4.57 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.0 Hz, 1H), 4.11 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.78 – 1.60 (m, 2H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.50 – 1.44 (m, 1H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.96 (見 かけ上 t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 6H) (NH プ ロトンは認められず).
72	(薄膜) 2968, 1744, 1611, 1474, 1320, 1236, 1113, 1068	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₅ H ₂₄ NO ₃ の計算 値 266.1751; 実測 値 266.1740	¹ H NMR (500 MHz, メタノー ル-d ₄) δ 7.27 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 6.92 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 3H), 5.03 (t, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 4.67 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.87 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 2.17 (dq, <i>J</i> = 13.2, 6.8 Hz, 1H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.98 (dd, <i>J</i> = 12.2, 6.8 Hz, 6H) (NH プロトン は認められず).
73	(薄膜) 2965, 2878, 1748, 1598, 1493, 1229, 1114, 751	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₅ H ₂₄ NO ₃ の計算 値 266.1751; 実測 値 266.1751	¹ H NMR (500 MHz, メタノー ル-d ₄) δ 7.26 (t, <i>J</i> = 7.7 Hz, 2H), 6.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 6.89 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 2H), 5.08 (dd, <i>J</i> = 8.0, 4.1 Hz, 1H), 4.75 – 4.65 (m, 1H), 4.18 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 2.03 (h, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 1.62 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.03 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H) (NH プロトンは 認められず).

10

20

30

40

【表 2 - 3 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
74	(薄膜) 2931, 1747, 1597, 1494, 1229, 1117, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₂ H ₁₈ NO ₃ の計算 値 224.1281; 実測 値 224.1270	¹ H NMR (500 MHz, メタノー ル-d ₄) δ 7.27 (t, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.94 (dd, <i>J</i> = 8.0, 6.3 Hz, 3H), 4.74 (pd, <i>J</i> = 6.4, 3.4 Hz, 1H), 4.43 (dd, <i>J</i> = 11.6, 3.5 Hz, 1H), 4.35 (dd, <i>J</i> = 11.6, 6.4 Hz, 1H), 4.05 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 1.48 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H) (NH プロトンは認めら れず).
75		ESIMS <i>m/z</i> 280.2 ([M+H] ⁺)	
76		ESIMS <i>m/z</i> 280.2 ([M+H] ⁺)	
77		ESIMS <i>m/z</i> 266.2 ([M+H] ⁺)	
78		ESIMS <i>m/z</i> 266.3 ([M+H] ⁺)	
79		ESIMS <i>m/z</i> 294.2 ([M+H] ⁺)	
80		ESIMS <i>m/z</i> 294.2 ([M+H] ⁺)	
81		ESIMS <i>m/z</i> 294.2 ([M+H] ⁺)	
82		ESIMS <i>m/z</i> 294.2 ([M+H] ⁺)	

【表 2 - 3 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
83		ESIMS <i>m/z</i> 224.1 ([M+H] ⁺)	
84		ESIMS <i>m/z</i> 264.2 ([M+H] ⁺)	10
85		ESIMS <i>m/z</i> 306.3 ([M+H] ⁺)	
86		ESIMS <i>m/z</i> 306.3 ([M+H] ⁺)	20
87		ESIMS <i>m/z</i> 284.2 ([M+H] ⁺)	
88		ESIMS <i>m/z</i> 284.2 ([M+H] ⁺)	
89		ESIMS <i>m/z</i> 242.2 ([M+H] ⁺)	30
90		ESIMS <i>m/z</i> 300.2 ([M+H] ⁺)	
91		ESIMS <i>m/z</i> 300.2 ([M+H] ⁺)	40
92		ESIMS <i>m/z</i> 238.2 ([M+H] ⁺)	

【表 2 - 3 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
93		ESIMS <i>m/z</i> 238.2 ([M+H] ⁺)	
94		ESIMS <i>m/z</i> 302.2 ([M+H] ⁺)	10
95		ESIMS <i>m/z</i> 334.2 ([M+H] ⁺)	
96		ESIMS <i>m/z</i> 284.2 ([M+H] ⁺)	20
97		ESIMS <i>m/z</i> 314.2 ([M+H] ⁺)	
98		ESIMS <i>m/z</i> 334.1 ([M+H] ⁺)	
99		ESIMS <i>m/z</i> 318.2 ([M+H] ⁺)	30
100		ESIMS <i>m/z</i> 300.2 ([M+H] ⁺)	
101		ESIMS <i>m/z</i> 296.2 ([M+H] ⁺)	40
102		ESIMS <i>m/z</i> 296.2 ([M+H] ⁺)	

【表 2 - 3 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
103		ESIMS <i>m/z</i> 254.2 ([M+H] ⁺)	
104		ESIMS <i>m/z</i> 294.3 ([M+H] ⁺)	
105		ESIMS <i>m/z</i> 294.2 ([M+H] ⁺)	
106		ESIMS <i>m/z</i> 292.2([M+H] ⁺)	
107		ESIMS <i>m/z</i> 292.2 ([M+H] ⁺)	
108		ESIMS <i>m/z</i> 314.2 ([M+H] ⁺)	
109	(薄膜) 3392, 2961, 2933, 2875, 1743, 1602, 1496, 1454, 1377, 132/8, 1233, 1198, 1114, 1077, 993, 743, 699	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₆ H ₂₆ NO ₃ の計算 値 280.1907; 実測 値 280.1904	

10

20

30

40

【表 2 - 3 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
110	(薄膜) 3396, 2930, 2859, 1744, 1603, 1496, 1455, 1377, 1328, 1234, 1199, 1115, 993, 744, 700	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₈ H ₃₀ NO ₃ の計算 値 308.2220; 実測 値 308.2221	10
111	(薄膜) 3401, 2954, 2871, 1743, 1603, 1496, 1455, 1375, 1233, 1198, 1114, 1076, 1030, 996, 743, 699	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₇ H ₂₈ NO ₃ の計算 値 294.2064; 実測 値 294.2060	20
112	(薄膜) 3406, 2962, 2874, 1746, 1598, 1510, 1465, 1378, 1237, 1208, 1118, 1102	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₃ H ₂₈ NO ₃ の計算 値 246.2064; 実測 値 246.2062	30
113	(薄膜) 2959, 2873, 1749, 1590, 1509, 1462, 1385, 1231, 1212, 1115, 1100, 1012	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₂ H ₂₆ NO ₃ の計算 値 232.1907; 実測 値 232.1904	40

【表 2 - 3 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
114	(薄膜) 2961, 2868, 1747, 1589, 1510, 1453, 1392, 1334, 1229, 1210, 1156, 1137, 1116, 1104, 1027, 1001, 661	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₃ H ₂₅ F ₃ NO ₃ の計 算値 300.1781; 実 測値 300.1793	10
115	(薄膜) 3398, 2835, 2874, 1743, 1602, 1496, 1454, 1375, 1330, 1236, 1208, 1102, 915, 746, 698	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₈ H ₃₀ NO ₃ の計 算値 308.2220; 実測 値 308.2221	20
116	(薄膜) 3361, 2969, 1735, 1677, 1456, 1374, 1179, 1126, 1101, 907, 721	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₃ H ₂₆ NO ₃ の計 算値 244.1907; 実測 値 244.1910	30
117	(薄膜) 3376, 2968, 2937, 2876, 1732, 1456, 1370, 1182, 1138, 1064, 920, 737	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₂ H ₂₄ NO ₃ の計 算値 230.1751; 実測 値 230.1738	40

【表 2 - 3 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
118	(薄膜) 3379, 2972, 2879, 1733, 1686, 1458, 1379, 1308, 1263, 1186, 1111, 960, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₃ H ₂₃ F ₃ NO ₃ の計 算値 298.1625; 実 測値 298.1616	10
119	(薄膜) 2955, 2871, 1739, 1586, 1462, 1374, 1334, 1240, 1217, 1119, 1085, 1067, 1028, 917, 904, 748	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₃ H ₂₈ NO ₃ の計 算値 246.2064; 実測 値 246.2060	20
120	(薄膜) 3401, 2960, 2875, 1739, 1460, 1375, 1337, 1240, 1219, 1119, 1087, 1068, 907, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₂ H ₂₆ NO ₃ の計 算値 232.1907; 実測 値 232.1905	30
121	(薄膜) 2971, 2880, 1737, 1586, 1463, 1375, 1247, 1222, 1148, 1137, 1120, 1084, 1030, 912, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₃ H ₂₅ F ₃ NO ₃ の計 算値 300.1781; 実 測値 300.1782	40

【表 2 - 3 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
122	(薄膜) 3369, 2961, 1738, 1649, 1527, 1240, 1058, 730	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 417.2020; 実測 値 417.2000	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.34 – 7.17 (m, 2H), 7.02 – 6.81 (m, 4H), 5.14 (dt, <i>J</i> = 8.6, 4.1 Hz, 1H), 4.70 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.47 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.85 – 1.60 (m, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.51 – 1.21 (m, 5H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H).
123	(薄膜) 3366, 2981, 1741, 1527, 1477, 1262, 1150, 1058, 800, 731	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₅ Cl ₂ N ₂ O ₆ の計 算値 483.1084; 実 測値 483.1091	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 12.10 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 8.44 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.35 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 7.16 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.6 Hz, 1H), 6.93 – 6.85 (m, 2H), 5.76 (ddt, <i>J</i> = 17.2, 10.1, 7.0 Hz, 1H), 5.19 (ddd, <i>J</i> = 7.2, 5.7, 4.1 Hz, 1H), 5.15 – 5.03 (m, 2H), 4.67 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.49 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.56 (ddt, <i>J</i> = 7.1, 5.6, 1.4 Hz, 2H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H).

10

20

30

40

【表 2 - 4 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
124	(薄膜) 3368, 2973, 1739, 1649, 1528, 1240, 1062, 800, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₇ N ₂ O ₆ の計算 値 403.1864; 実測 値 403.1850	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.14 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.00 (dd, <i>J</i> = 5.2, 1.0 Hz, 1H), 7.34 – 7.20 (m, 2H), 6.98 – 6.90 (m, 3H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.09 (ddd, <i>J</i> = 9.1, 5.2, 4.0 Hz, 1H), 4.70 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.95 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 3H), 1.80 (dq, <i>J</i> = 14.9, 7.4, 3.8 Hz, 1H), 1.70 (ddd, <i>J</i> = 13.9, 8.7, 7.0 Hz, 1H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (dd, <i>J</i> = 6.4, 1.0 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.09, 168.71, 157.83, 155.36, 148.76, 140.48, 130.49, 129.54, 121.09, 115.78, 109.44, 77.96, 73.49, 56.08, 48.04, 22.46, 18.36, 15.52, 9.74.
125	(薄膜) 3371, 2974, 1742, 1529, 1241, 801, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₇ N ₂ O ₆ の計算 値 403.1864; 実測 値 403.1852	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.32 – 7.20 (m, 2H), 6.93 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.0 Hz, 1H), 6.89 – 6.79 (m, 3H), 5.12 (td, <i>J</i> = 6.5, 4.2 Hz, 1H), 4.74 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 4.47 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.76 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 1.55 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.96 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.99, 168.74, 157.58, 155.35, 148.74, 140.47, 130.47, 129.53, 121.19, 116.01, 109.43, 77.98, 74.28, 56.07, 48.03, 23.13, 18.41, 15.13, 9.92.

【表 2 - 4 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
126	(薄膜) 3370, 2961, 1739, 1649, 1528, 1240, 1059, 800, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 417.2020; 実測 値 417.2009	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.14 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.44 – 7.15 (m, 2H), 6.96 – 6.90 (m, 3H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 5.21 – 5.14 (m, 1H), 4.69 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 1.73 – 1.66 (m, 2H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.45 – 1.31 (m, 2H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.06, 168.71, 157.80, 155.36, 148.76, 140.48, 130.49, 129.54, 121.10, 115.79, 109.43, 76.38, 73.63, 56.08, 48.02, 31.37, 18.62, 18.34, 15.48, 13.90.
127	(薄膜) 3371, 2961, 1740, 1649, 1528, 1241, 1056, 800, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 417.2020; 実測 値 417.2009	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.26 (d, <i>J</i> = 3.7 Hz, 2H), 6.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 6.89 – 6.81 (m, 3H), 5.20 (dt, <i>J</i> = 8.9, 3.9 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 4.51 – 4.41 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.74 (dtd, <i>J</i> = 14.6, 9.6, 5.1 Hz, 1H), 1.70 – 1.59 (m, 1H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.49 – 1.33 (m, 2H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.96, 168.73, 157.60, 155.35, 148.74, 140.47, 130.48, 129.53, 121.18, 116.03, 109.42, 76.48, 74.63, 56.07, 48.02, 32.06, 18.77, 18.42, 15.07, 13.92.

【表 2 - 4 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
128	(薄膜) 3370, 2957, 1738, 1649, 1528, 1241, 1062, 800, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₁ N ₂ O ₆ の計算 値 431.2177; 実測 値 431.2166	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.26 (s, 2H), 6.93 (dd, <i>J</i> = 7.9, 4.9 Hz, 3H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 5.25 (ddd, <i>J</i> = 10.0, 4.8, 3.0 Hz, 1H), 4.68 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.47 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 1.70 (ddd, <i>J</i> = 14.2, 10.1, 4.5 Hz, 1H), 1.66 – 1.57 (m, 1H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (ddd, <i>J</i> = 13.5, 9.3, 2.9 Hz, 1H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.90 (dd, <i>J</i> = 17.8, 6.5 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.04, 168.71, 157.74, 155.37, 148.76, 140.48, 130.48, 129.54, 121.12, 115.81, 109.44, 74.81, 73.82, 56.08, 48.02, 38.16, 24.56, 23.49, 21.67, 18.29, 15.43.
129	(薄膜) 3370, 2958, 1740, 1649, 1528, 1240, 1152, 800, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₁ N ₂ O ₆ の計算 値 431.2177; 実測 値 431.2159	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.14 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (dd, <i>J</i> = 5.2, 1.2 Hz, 1H), 7.30 – 7.20 (m, 2H), 6.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 6.90 – 6.82 (m, 3H), 5.28 (dt, <i>J</i> = 10.1, 3.5 Hz, 1H), 4.72 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.43 (dt, <i>J</i> = 9.8, 5.1 Hz, 1H), 3.94 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 3H), 1.74 (ddd, <i>J</i> = 14.2, 9.9, 4.6 Hz, 1H), 1.70 – 1.60 (m, 1H), 1.52 (dd, <i>J</i> = 7.2, 1.2 Hz, 3H), 1.48 – 1.39 (m, 1H), 1.32 (dd, <i>J</i> = 6.3, 1.2 Hz, 3H), 0.98 – 0.88 (m, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.94, 168.71, 157.63, 155.34, 148.74, 140.46, 130.49, 129.52, 121.18, 116.03, 109.41, 75.07, 75.04, 56.07, 48.02, 38.80, 24.51, 23.45, 21.82, 18.42, 15.00.

【表 2 - 4 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
130	(薄膜) 3371, 2968, 1740, 1650, 1529, 1241, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 417.2020; 実測 値 417.2006	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.17 (s, 1H), 8.45 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.00 (dd, <i>J</i> = 5.2, 1.0 Hz, 1H), 7.32 – 7.21 (m, 2H), 6.93 (td, <i>J</i> = 7.4, 1.2 Hz, 1H), 6.91 – 6.85 (m, 3H), 5.00 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.68 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.13 (h, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (dd, <i>J</i> = 13.2, 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.00, 168.68, 157.94, 155.35, 148.74, 140.44, 130.53, 129.52, 121.05, 115.73, 109.40, 81.36, 73.22, 56.07, 48.07, 28.62, 19.48, 18.36, 17.08, 16.20.
131	(薄膜) 3370, 2967, 1742, 1649, 1527, 1263, 1050, 800, 731	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 417.2020; 実測 値 417.2008	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (dd, <i>J</i> = 5.2, 1.0 Hz, 1H), 7.34 – 7.20 (m, 2H), 6.94 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.86 (t, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 5.08 (dd, <i>J</i> = 6.9, 5.0 Hz, 1H), 4.79 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.58 – 4.49 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.06 (h, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.62 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 0.99 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.89, 168.75, 157.31, 155.36, 148.75, 140.49, 130.50, 129.56, 121.14, 115.82, 109.44, 80.16, 72.58, 56.07, 48.00, 28.95, 19.10, 18.57, 17.93, 14.72.

【表 2 - 4 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
132	(薄膜) 3365, 2981, 1742, 1648, 1527, 1481, 1239, 799, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₉ H ₂₃ N ₂ O ₆ の計算 値 375.1551; 実測 値 375.1553	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.07 (s, 1H), 8.43 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (dd, <i>J</i> = 5.2, 1.1 Hz, 1H), 7.31 – 7.18 (m, 2H), 6.94 (td, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.92 – 6.88 (m, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.68 – 4.59 (m, 1H), 4.39 – 4.26 (m, 2H), 3.95 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.51 (dd, <i>J</i> = 7.2, 1.1 Hz, 3H), 1.36 (dd, <i>J</i> = 6.3, 1.1 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.02, 168.75, 157.59, 155.37, 148.75, 140.48, 130.39, 129.55, 121.33, 116.08, 109.46, 71.54, 67.74, 56.08, 47.85, 18.18, 16.78.
133	(薄膜) 3363, 2959, 1739, 1650, 1529, 1482, 1242, 1063, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₁ N ₂ O ₆ の計算 値 431.2177; 実測 値 431.2157	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.34 – 7.19 (m, 2H), 6.97 – 6.88 (m, 3H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.27 (ddd, <i>J</i> = 10.0, 5.3, 3.1 Hz, 1H), 4.72 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.50 – 4.39 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.75 – 1.55 (m, 2H), 1.51 – 1.41 (m, 4H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H), 0.89 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.01, 168.76, 157.65, 155.40, 148.81, 140.48, 130.54, 129.54, 121.10, 115.75, 109.47, 74.92, 73.95, 56.07, 48.05, 38.39, 24.50, 23.47, 21.81, 18.38, 15.45.

【表 2 - 4 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
134	(薄膜) 3363, 2960, 1740, 1650, 1530, 1482, 1241, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₁ N ₂ O ₆ の計算 値 431.2177; 実測 値 431.2159	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.32 – 7.20 (m, 2H), 6.98 – 6.82 (m, 4H), 5.21 (ddd, <i>J</i> = 10.2, 4.0, 3.0 Hz, 1H), 4.68 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.47 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.9 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 1.76 (ddd, <i>J</i> = 14.3, 10.2, 4.4 Hz, 1H), 1.70 – 1.57 (m, 1H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 (ddd, <i>J</i> = 14.1, 9.5, 3.1 Hz, 1H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.93 (dd, <i>J</i> = 6.6, 3.0 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.87, 168.80, 157.80, 155.37, 148.78, 140.47, 130.48, 129.51, 121.26, 116.32, 109.49, 75.56, 75.21, 56.06, 48.15, 38.52, 24.56, 23.50, 21.66, 18.15, 15.51.
135	(薄膜) 3363, 2969, 1742, 1650, 1529, 1482, 1242, 1042, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 417.2020; 実測 値 417.2018	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.14 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 7.31 – 7.19 (m, 2H), 6.97 – 6.84 (m, 4H), 5.01 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.74 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.54 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.20 – 2.06 (m, 1H), 1.45 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.18, 168.74, 157.72, 155.37, 148.78, 140.45, 130.57, 129.52, 120.99, 115.64, 109.45, 81.23, 73.09, 56.06, 48.02, 28.61, 19.51, 18.41, 17.07, 15.99.

【表 2 - 4 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
136	(薄膜) 3370, 2968, 1743, 1650, 1529, 1241, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 417.2020; 実測 値 417.2038	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.16 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.30 – 7.21 (m, 2H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.84 (m, 3H), 5.08 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.52 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 2.18 – 2.07 (m, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.72, 168.83, 157.40, 155.38, 148.79, 140.50, 130.49, 129.55, 121.16, 115.92, 109.51, 80.35, 72.63, 56.06, 48.17, 28.71, 19.36, 18.43, 17.11, 15.47.
137	(薄膜) 3361, 2932, 1741, 1651, 1530, 1242	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₃ N ₂ O ₆ の計算 値 445.2333; 実測 値 445.2334	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.33 – 7.17 (m, 2H), 6.96 – 6.84 (m, 4H), 5.16 (ddd, <i>J</i> = 8.5, 5.4, 4.3 Hz, 1H), 4.71 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.47 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.75 – 1.60 (m, 2H), 1.48 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.43 – 1.17 (m, 9H), 0.92 – 0.82 (m, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.07, 168.77, 157.73, 155.39, 148.81, 140.47, 130.53, 129.54, 121.06, 115.73, 109.46, 76.75, 73.77, 56.07, 48.07, 31.60, 29.51, 24.90, 22.44, 18.33, 15.53, 13.94.

【表 2 - 4 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
138	(薄膜) 3370, 2934, 1741, 1650, 1529, 1242, 1060, 801, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₃ N ₂ O ₆ の計算 値 445.2333; 実測 値 445.2325	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.33 – 7.18 (m, 2H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.91 – 6.82 (m, 3H), 5.12 (dt, <i>J</i> = 8.6, 4.4 Hz, 1H), 4.70 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.47 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 1.82 – 1.62 (m, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.44 – 1.18 (m, 9H), 0.93 – 0.79 (m, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.85, 168.80, 157.78, 155.39, 148.81, 140.47, 130.51, 129.52, 121.26, 116.29, 109.49, 77.17, 74.78, 56.06, 48.15, 31.54, 29.61, 25.04, 22.44, 18.23, 15.59, 13.92.
139	(薄膜) 3362, 2934, 1741, 1650, 1529, 1481, 1242, 1063, 801, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₃ N ₂ O ₆ の計算 値 445.2333; 実測 値 445.2323	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.14 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.30 – 7.21 (m, 2H), 6.93 (ddt, <i>J</i> = 7.3, 4.4, 1.3 Hz, 3H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.15 (dt, <i>J</i> = 8.1, 5.0 Hz, 1H), 4.68 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.54 – 4.43 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.69 (qt, <i>J</i> = 8.7, 4.6 Hz, 2H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.41 – 1.14 (m, 9H), 0.93 – 0.77 (m, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.01, 168.74, 157.86, 155.40, 148.81, 140.47, 130.53, 129.54, 121.12, 115.85, 109.47, 76.66, 73.71, 56.08, 48.07, 31.53, 29.24, 24.94, 22.42, 18.31, 15.51, 13.91.

【表 2 - 4 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マスペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
140	(薄膜) 3362, 2933, 1742, 1650, 1529, 1482, 1242, 800, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₃ N ₂ O ₆ の計算 値 445.2333; 実測 値 445.2331	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.35 – 7.16 (m, 2H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.89 – 6.81 (m, 3H), 5.18 (dt, <i>J</i> = 8.6, 4.2 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.45 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.9 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 1.69 (dddd, <i>J</i> = 19.8, 10.0, 7.7, 4.2 Hz, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.48 – 1.19 (m, 9H), 0.93 – 0.81 (m, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.94, 168.79, 157.65, 155.37, 148.78, 140.47, 130.50, 129.52, 121.20, 116.09, 109.48, 76.74, 74.69, 56.05, 48.09, 31.60, 29.96, 25.11, 22.44, 18.33, 15.08, 13.95.
141	(薄膜) 3363, 2979, 1744, 1649, 1530, 1241, 800, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₉ H ₂₃ N ₂ O ₆ の計算 値 375.1551; 実測 値 375.1549	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.09 (s, 1H), 8.45 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.33 – 7.20 (m, 2H), 6.98 – 6.88 (m, 3H), 6.85 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.77 – 4.58 (m, 2H), 4.41 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.8 Hz, 1H), 4.23 (dd, <i>J</i> = 11.5, 4.1 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 1.50 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.02, 168.81, 157.69, 155.38, 148.77, 140.49, 130.40, 129.54, 121.34, 116.14, 109.52, 71.68, 67.86, 56.06, 47.88, 18.12, 16.71.

【表 2 - 4 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
142	(薄膜) 3369, 2982, 1738, 1649, 1528, 1482, 1241	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₇ N ₂ O ₆ の計算 値 415.1864; 実測 値 415.1839	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.17 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.32 - 7.19 (m, 2H), 7.01 - 6.84 (m, 4H), 4.74 - 4.65 (m, 1H), 4.59 (pd, <i>J</i> = 6.3, 3.8 Hz, 1H), 4.51 (dd, <i>J</i> = 9.3, 3.5 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.24 - 1.16 (m, 1H), 0.67 (tdd, <i>J</i> = 8.4, 3.1, 1.7 Hz, 1H), 0.57 - 0.49 (m, 1H), 0.42 (ddd, <i>J</i> = 4.8, 3.0, 1.7 Hz, 2H).	10
143	(薄膜) 3368, 2931, 1741, 1529, 1494, 1242	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₆ の計算 値 457.2333; 実測 値 457.2321	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.16 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.52 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.30 - 7.20 (m, 2H), 6.92 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.89 - 6.80 (m, 3H), 5.00 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.80 - 4.70 (m, 1H), 4.62 - 4.53 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.88 - 1.61 (m, 7H), 1.47 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.25 - 1.02 (m, 4H).	20
144	(薄膜) 3369, 2928, 1741, 1528, 1481, 1240, 729	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₆ の計算 値 457.2333; 実測 値 457.2308	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.17 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.33 - 7.13 (m, 2H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.90 - 6.80 (m, 3H), 5.08 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.85 - 4.71 (m, 1H), 4.55 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.84 - 1.64 (m, 7H), 1.62 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.27 - 1.01 (m, 4H).	30 40

【表 2 - 5 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
145	(薄膜) 2976, 1741, 1653, 1505, 1208	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₈ FN ₂ O ₆ の計 算値 435.1926; 実 測値 435.1923	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.97 – 6.89 (m, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.85 – 6.78 (m, 2H), 4.99 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.80 – 4.70 (m, 1H), 4.43 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.17 – 2.07 (m, 1H), 1.48 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.97 (dd, <i>J</i> = 6.8, 3.3 Hz, 6H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 123.38 .
146	(薄膜) 3369, 2970, 1744, 1651, 1504, 1206	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₈ FN ₂ O ₆ の計 算値 435.1926; 実 測値 435.1922	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.52 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.02 – 6.90 (m, 2H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.85 – 6.77 (m, 2H), 5.05 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.83 – 4.73 (m, 1H), 4.42 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.10 (pd, <i>J</i> = 6.9, 5.8 Hz, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 123.09 .

10

20

30

40

【表 2 - 5 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
147	(薄膜) 3366, 2986, 1745, 1649, 1530, 1504, 1205	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₉ H ₂₂ FN ₂ O ₆ の計 算値 393.1456; 実 測値 393.1448	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.06 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.42 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.98 – 6.89 (m, 2H), 6.89 – 6.83 (m, 3H), 4.79 – 4.66 (m, 1H), 4.54 (pd, <i>J</i> = 6.4, 3.9 Hz, 1H), 4.38 (dd, <i>J</i> = 11.5, 6.8 Hz, 1H), 4.23 (dd, <i>J</i> = 11.5, 3.9 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.00, 168.83, 157.59 (d, <i>J</i> = 239.3 Hz), 155.41, 153.78 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), 148.79, 140.49, 130.37, 117.57 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz), 115.90 (d, <i>J</i> = 23.1 Hz), 109.52, 72.87, 67.82, 56.08, 47.89, 18.09, 16.66. ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 122.83 .
148	(薄膜) 3371, 2966, 1744, 1651, 1531, 1240, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₇ N ₂ O ₅ の計 算値 387.1914; 実測 値 387.1901	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 11.90 (s, 1H), 8.52 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.08 (dd, <i>J</i> = 4.3, 1.5 Hz, 1H), 7.39 – 7.19 (m, 4H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.83 (m, 2H), 5.08 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.79 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.52 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 2.14 (pd, <i>J</i> = 6.9, 5.5 Hz, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.76, 168.49, 157.85, 157.41, 139.72, 131.21, 129.56, 128.78, 126.04, 121.18, 115.93, 80.39, 72.64, 48.15, 28.71, 19.37, 18.48, 17.11, 15.48.

【表 2 - 5 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
155	(薄膜) 3369, 2948, 2870, 2157, 1741, 1523, 1481, 1240	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₆ の計算 値 443.2177; 実測 値 443.2150.	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.52 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.40 – 7.13 (m, 2H), 7.04 – 6.78 (m, 4H), 5.19 (dd, <i>J</i> = 7.6, 4.4 Hz, 1H), 4.98 – 4.59 (m, 1H), 4.48 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.50 – 2.11 (m, 1H), 1.84 – 1.43 (m, 8H), 1.43 – 1.17 (m, 6H).
156	(薄膜) 3371, 2944, 2870, 2364, 1740, 1528, 1241	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₆ の計算 値 443.2177; 実測 値 443.2147.	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.00 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.39 – 7.16 (m, 3H), 7.03 – 6.77 (m, 5H), 5.12 (dd, <i>J</i> = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 4.74 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.55 – 4.44 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.34 (h, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H), 1.74 (dd, <i>J</i> = 8.0, 4.2 Hz, 1H), 1.67 – 1.53 (m, 3H), 1.50 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.47 – 1.16 (m, 5H).
157	(薄膜) 3369, 2938, 1741, 1481, 1240, 730, 1454	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 465.2020; 実測 値 465.2002.	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.39 (dd, <i>J</i> = 18.9, 7.8 Hz, 1H), 8.05 – 7.90 (m, 1H), 7.34 – 7.09 (m, 7H), 7.02 – 6.75 (m, 4H), 5.42 – 5.25 (m, 1H), 4.77 – 4.39 (m, 2H), 3.91 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 2H), 3.18 – 2.90 (m, 2H), 2.02 – 1.81 (m, 1H), 1.40 (dd, <i>J</i> = 25.5, 6.7 Hz, 3H), 1.32 – 1.21 (m, 3H).

10

20

30

40

【表 2 - 5 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
158	(薄膜) 3372, 2965, 2936, 2875, 1739, 1649, 1576, 1527, 1496, 1480, 1453, 1438, 1330, 1280, 1263, 1242, 1183, 1144, 1159, 1101, 953, 800, 700	ESIMS <i>m/z</i> 431.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.14 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.37 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.28 – 7.16 (m, 5H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.23 (dt, <i>J</i> = 9.7, 4.2 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.54 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 3.49 – 3.39 (m, 2H), 3.04 (dd, <i>J</i> = 14.3, 4.1 Hz, 1H), 2.90 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.6 Hz, 1H), 1.64 – 1.51 (m, 2H), 1.26 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.20 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.57, 168.59, 155.34, 148.73, 140.43, 137.33, 130.48, 129.31, 128.33, 126.51, 109.40, 77.83, 75.86, 71.26, 56.07, 47.92, 35.94, 23.24, 18.05, 16.02, 10.66 .
159	(薄膜) 3370, 2933, 2870, 1739, 1649, 1576, 1527, 1496, 1480, 1453, 1438, 1329, 1280, 1263, 1242, 1183, 1061, 953, 800, 700	ESIMS <i>m/z</i> 459.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.14 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.37 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.26 – 7.15 (m, 5H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.22 (dt, <i>J</i> = 9.5, 4.2 Hz, 1H), 4.66 – 4.56 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.57 – 3.41 (m, 3H), 3.04 (dd, <i>J</i> = 14.4, 4.1 Hz, 1H), 2.90 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.6 Hz, 1H), 1.60 – 1.51 (m, 2H), 1.37 – 1.29 (m, 4H), 1.26 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.20 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.93 – 0.86 (m, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.57, 168.59, 155.34, 148.73, 140.42, 137.34, 130.48, 129.31, 128.33, 126.51, 109.40, 77.82, 75.87, 69.66, 56.07, 47.91, 35.95, 29.73, 28.36, 22.52, 18.06, 16.02, 14.05 .

【表 2 - 5 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
162	(薄膜) 3368, 2964, 2937, 2876, 1739, 1649, 1576, 1527, 1481, 1452, 1438, 1331, 1280, 1263, 1242, 1212, 1098, 1061, 943, 801	ESIMS <i>m/z</i> 383.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.81 – 4.68 (m, 1H), 3.51 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.47 – 3.31 (m, 2H), 2.14 – 1.96 (m, 1H), 1.62 – 1.47 (m, 5H), 1.13 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 3H), 0.94 – 0.85 (m, 12H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.82, 168.70, 155.34, 148.73, 140.46, 130.54, 109.40, 80.34, 74.24, 70.69, 56.07, 48.14, 28.55, 23.21, 19.36, 18.53, 17.35, 15.34, 10.66 .
163	(薄膜) 3371, 2968, 2878, 1740, 1650, 1576, 1528, 1481, 1452, 1439, 1382, 1333, 1280, 1252, 1146, 1061, 1029, 948, 849, 801	ESIMS <i>m/z</i> 451.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.89 (dd, <i>J</i> = 6.5, 5.2 Hz, 1H), 4.75 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.59 – 3.42 (m, 3H), 2.23 – 1.90 (m, 3H), 1.76 (dt, <i>J</i> = 15.8, 6.1 Hz, 2H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.85, 168.74, 155.36, 148.75, 140.48, 130.48, 127.29 (q, <i>J</i> = 276.0 Hz), 109.43, 79.96, 74.67, 66.96, 56.07, 48.07, 30.71 (q, <i>J</i> = 28.9 Hz), 28.62, 22.72 (q, <i>J</i> = 3.1 Hz), 19.25, 18.43, 17.69, 14.96 .

【表 2 - 5 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
164	(薄膜) 3369, 2965, 2938, 2875, 1739, 1649, 1602, 1576, 1527, 1496, 1480, 1452, 1332, 1280, 1263, 1242, 1212, 1183, 1101, 1061, 943, 801, 746, 699	ESIMS <i>m/z</i> 459.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 12.17 (s, 1H), 8.55 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.28 – 7.22 (m, 2H), 7.19 – 7.12 (m, 3H), 6.85 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.91 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.58 – 3.35 (m, 3H), 2.65 (td, <i>J</i> = 7.4, 2.5 Hz, 2H), 2.05 (dq, <i>J</i> = 13.5, 6.7 Hz, 1H), 1.83 (ddd, <i>J</i> = 14.0, 7.7, 6.2 Hz, 2H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.13 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.86, 168.70, 155.33, 148.73, 142.02, 140.46, 130.52, 128.43, 128.26, 125.68, 109.40, 80.35, 74.38, 68.05, 56.06, 48.13, 32.36, 31.60, 28.58, 19.35, 18.55, 17.49, 15.23 .
165	(薄膜) 3370, 2968, 2939, 1739, 1649, 1576, 1527, 1481, 1438, 1366, 1330, 1280, 1263, 1212, 1182, 1150, 1101, 1060, 943, 849, 800	ESIMS <i>m/z</i> 395.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.96 – 4.91 (m, 2H), 4.88 – 4.83 (m, 1H), 4.80 – 4.71 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.92 (d, <i>J</i> = 12.4 Hz, 1H), 3.85 (d, <i>J</i> = 12.3 Hz, 1H), 3.62 – 3.56 (m, 1H), 2.04 (dq, <i>J</i> = 13.4, 6.8 Hz, 1H), 1.72 (t, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.60 – 1.57 (m, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 3.5 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 3.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.83, 168.69, 155.34, 148.73, 142.32, 140.46, 130.54, 112.11, 109.40, 80.21, 73.54, 72.68, 56.07, 48.13, 28.62, 19.59, 19.34, 18.53, 17.56, 15.09 .

【表 2 - 5 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
166	(薄膜) 3367, 2967, 2876, 1739, 1648, 1576, 1527, 1480, 1452, 1438, 1329, 1279, 1262, 1242, 1212, 1183, 1150, 1094, 1061, 942, 849, 800	ESIMS <i>m/z</i> 381.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (s, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.87 (ddt, <i>J</i> = 17.2, 10.4, 5.5 Hz, 1H), 5.25 (dq, <i>J</i> = 17.2, 1.6 Hz, 1H), 5.14 (dq, <i>J</i> = 10.4, 1.5 Hz, 1H), 4.92 (dd, <i>J</i> = 6.1, 5.5 Hz, 1H), 4.75 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.05 – 3.95 (m, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.65 – 3.56 (m, 1H), 2.03 (dq, <i>J</i> = 13.5, 6.8 Hz, 1H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.84, 168.70, 155.34, 148.74, 140.47, 134.87, 130.53, 116.83, 109.41, 80.16, 73.54, 69.66, 56.07, 48.14, 28.61, 19.31, 18.51, 17.56, 15.16 .

10

20

30

40

【表 2 - 5 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
167	(薄膜) 3370, 2969, 1740, 1649, 1576, 1528, 1481, 1455, 1439, 1307, 1262, 1242, 1213, 1108, 1061, 954, 849, 801, 732	ESIMS <i>m/z</i> 449.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.38 (dt, <i>J</i> = 15.7, 4.0, 2.1 Hz, 1H), 5.88 (dq, <i>J</i> = 15.4, 6.6, 2.2 Hz, 1H), 4.92 (dd, <i>J</i> = 6.7, 4.9 Hz, 1H), 4.80 – 4.72 (m, 1H), 4.14 – 4.07 (m, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.63 (qd, <i>J</i> = 6.2, 4.8 Hz, 1H), 2.04 – 1.96 (m, 1H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.85, 168.75, 155.37, 148.75, 140.49, 139.14, 136.59 (q, <i>J</i> = 6.4 Hz), 130.45, 123.09 (q, <i>J</i> = 269.1 Hz), 118.41 (q, <i>J</i> = 33.9 Hz), 109.44, 108.37, 79.77, 74.96, 66.47, 56.07, 48.08, 28.66, 19.22, 18.39, 17.85, 14.84 .
168	(薄膜) 3370, 2962, 2873, 1739, 1650, 1576, 1528, 1481, 1451, 1366, 1280, 1264, 1243, 1213, 1184, 1152, 1119, 1093, 1067, 944, 912, 801, 734	ESIMS <i>m/z</i> 397.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.19 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.83 – 4.74 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.54 (qd, <i>J</i> = 6.3, 5.0 Hz, 1H), 3.28 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.4 Hz, 1H), 3.03 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.7 Hz, 1H), 2.07 (h, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 1.78 (dp, <i>J</i> = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.10 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.89 (s, 1H), 0.87 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.86 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.05, 168.66, 155.33, 148.73, 140.44, 130.56, 109.38, 82.13, 75.92, 74.47, 56.06, 48.03, 28.80, 28.46, 19.45, 18.60, 17.56, 15.55 .

【表 2 - 6 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
169	(薄膜) 3370, 2965, 2936, 2876, 1738, 1649, 1576, 1527, 1481, 1451, 1367, 1332, 1280, 1263, 1242, 1213, 1184, 1116, 1091, 944, 801, 734	ESIMS <i>m/z</i> 383.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.19 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.84 – 4.74 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.55 (td, <i>J</i> = 6.5, 5.4 Hz, 1H), 3.49 (dt, <i>J</i> = 8.9, 6.6 Hz, 1H), 3.24 (dt, <i>J</i> = 8.9, 6.7 Hz, 1H), 2.06 (dq, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.61 – 1.50 (m, 5H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.93 – 0.85 (m, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.12, 168.67, 155.34, 148.73, 140.45, 130.57, 109.38, 82.03, 74.47, 70.76, 56.06, 48.00, 28.44, 23.26, 19.46, 18.60, 17.39, 15.66 .
170	(薄膜) 3370, 2971, 2880, 1739, 1651, 1576, 1529, 1481, 1454, 1439, 1309, 1281, 1262, 1151, 1063, 1030, 911, 801, 733	ESIMS <i>m/z</i> 451.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.16 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.80 – 4.74 (m, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.61 – 3.52 (m, 2H), 3.33 (dt, <i>J</i> = 9.1, 6.0 Hz, 1H), 2.20 – 2.08 (m, 2H), 2.04 (h, <i>J</i> = 6.7 Hz, 1H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.89 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.04, 168.74, 155.36, 148.75, 140.49, 139.14, 130.49, 127.26 (q, <i>J</i> = 276.0 Hz), 109.44, 81.79, 74.64, 66.88, 56.07, 48.02, 30.73 (q, <i>J</i> = 28.6 Hz), 28.50, 22.81 (d, <i>J</i> = 3.0 Hz), 19.38, 18.50, 17.47, 15.50 .

【表 2 - 6 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
171	(薄膜) 3366, 2983, 1744, 1648, 1528, 1481, 1240, 1150, 731	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₂₇ N ₂ O ₆ の計算 値 451.1864; 実測 値 451.1860	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.41 – 7.27 (m, 5H), 7.24 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.9 Hz, 2H), 6.93 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.82 (m, 3H), 5.98 (d, <i>J</i> = 4.3 Hz, 1H), 4.81 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.68 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.02, 168.84, 157.67, 155.39, 148.79, 140.49, 136.50, 130.47, 129.51, 128.36, 128.34, 127.17, 121.43, 116.42, 109.51, 78.38, 76.00, 56.07, 47.92, 18.05, 15.31.
172	(薄膜) 3368, 2982, 1743, 1649, 1528, 1480, 1239, 1149, 730	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₂₇ N ₂ O ₆ の計算 値 451.1864; 実測 値 451.1860	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.11 (s, 1H), 8.43 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.42 – 7.29 (m, 5H), 7.30 – 7.21 (m, 2H), 6.96 – 6.90 (m, 3H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.96 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 4.75 – 4.64 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 1.44 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.14, 168.71, 158.07, 155.38, 148.78, 140.44, 136.44, 130.52, 129.55, 128.68, 128.56, 127.42, 121.31, 116.13, 109.47, 79.40, 75.55, 56.07, 47.87, 18.01, 16.29.

10

20

30

40

【表 2 - 6 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
173	(薄膜) 3369, 2981, 1738, 1648, 1453, 1240, 732	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₀ H ₂₅ N ₂ O ₆ の計算 値 389.1707; 実測 値 389.1697	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.11 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.31 – 7.21 (m, 2H), 6.94 – 6.88 (m, 3H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.20 (p, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 4.69 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.45 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.46 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H).
174	(薄膜) 3369, 2981, 1738, 1649, 1453, 1239, 753, 730	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₀ H ₂₅ N ₂ O ₆ の計算 値 389.1707; 実測 値 389.1693	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.46 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.34 – 7.19 (m, 2H), 6.99 – 6.84 (m, 4H), 5.11 (qd, <i>J</i> = 6.4, 4.0 Hz, 1H), 4.67 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.46 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.0 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 1.51 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.36 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.57, 168.79, 157.86, 155.39, 148.79, 140.48, 130.50, 129.52, 121.31, 116.38, 109.50, 75.42, 74.06, 56.07, 48.02, 18.12, 15.71, 15.00.

10

20

30

40

【表 2 - 6 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
175	(薄膜) 3371, 2968, 1742, 1528, 1148, 728	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₇ F ₂ N ₂ O ₆ の計 算値 453.1832; 実 測値 453.1830	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.00 (ddd, <i>J</i> = 10.6, 9.0, 5.3 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.70 (ddd, <i>J</i> = 9.7, 6.6, 3.0 Hz, 1H), 6.61 (ddt, <i>J</i> = 8.9, 7.6, 3.2 Hz, 1H), 5.09 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.10 (dq, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 116.78 (d, <i>J</i> = 15.2 Hz), -138.19 (d, <i>J</i> = 14.7 Hz).
176	(薄膜) 3370, 2969, 1743, 1528, 1324, 1252, 1158, 1109, 1064	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₈ F ₃ N ₂ O ₆ の計 算値 485.1894; 実 測値 485.1890	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 6.92 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 6.88 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.08 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.10 (dq, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.99 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 61.57 .

10

20

30

40

【表 2 - 6 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
177	(薄膜) 3370, 2968, 1742, 1482, 1262, 1132, 731	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₈ FN ₂ O ₆ の計 算値 435.1926; 実 測値 435.1924	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.20 (td, <i>J</i> = 8.3, 6.9 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.72 – 6.61 (m, 2H), 6.58 (dt, <i>J</i> = 10.9, 2.4 Hz, 1H), 5.06 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.10 (dq, <i>J</i> = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 111.51 .
178	(薄膜) 3367, 2967, 1740, 1650, 1496, 1243, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₀ ClN ₂ O ₆ の計 算値 465.1787; 実 測値 465.1783	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.16 (s, 1H), 8.55 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.15 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 7.10 – 6.92 (m, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.85 – 6.73 (m, 1H), 5.12 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.80 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.48 (h, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.21 – 2.09 (m, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.73, 168.79, 155.39, 150.74, 148.80, 140.48, 131.94, 131.01, 130.57, 128.03, 124.15, 115.98, 109.47, 80.19, 74.52, 56.07, 48.16, 28.74, 20.31, 19.33, 18.44, 17.46, 15.16.

【表 2 - 6 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
179	(薄膜) 3369, 2968, 1742, 1649, 1478, 1262, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₇ Cl ₂ N ₂ O ₆ の計 算値 485.1241; 実 測値 485.1237	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.34 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 7.15 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.6 Hz, 1H), 6.92 – 6.83 (m, 2H), 5.11 (dd, <i>J</i> = 6.3, 5.2 Hz, 1H), 4.80 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.56 – 4.46 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.11 (dt, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.72, 168.81, 155.40, 151.81, 148.80, 140.51, 130.49, 130.31, 127.53, 126.42, 125.25, 116.28, 109.51, 79.83, 74.77, 56.08, 48.11, 28.75, 19.28, 18.37, 17.56, 14.96.

10

20

30

40

【表 2 - 6 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
181	(薄膜) 3369, 2967, 1742, 1649, 1527, 1479, 1241, 731	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₈ ClN ₂ O ₆ の計 算値 451.1630; 実 測値 451.1624	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.13 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.17 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.97 – 6.71 (m, 4H), 5.06 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.54 – 4.45 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.11 (ddd, <i>J</i> = 13.8, 7.0, 5.7 Hz, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.72, 168.84, 158.15, 155.42, 148.82, 140.52, 134.95, 130.49, 130.34, 121.35, 116.26, 114.16, 109.52, 80.08, 73.08, 56.08, 48.14, 28.74, 19.31, 18.37, 17.22, 15.25.
182	(薄膜) 3370, 2968, 1740, 1649, 1505, 1227, 1039, 732	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₁ N ₂ O ₇ の計 算値 447.2126; 実測 値 447.2120	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.85 – 6.76 (m, 4H), 4.98 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 4.40 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 2.17 – 2.07 (m, 1H), 1.49 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.97 (app t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.15, 168.73, 155.38, 154.14, 151.75, 148.79, 140.43, 130.58, 117.15, 114.68, 109.44, 81.34, 74.28, 56.06, 55.68, 48.05, 28.60, 19.53, 18.50, 17.11, 16.03.

【表 2 - 6 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
185	(薄膜) 3377, 2982, 1770, 1675, 1477, 1196, 1059, 907, 732	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₂₇ Cl ₂ N ₂ O ₇ の計 算値 525.1190; 実 測値 525.1203	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.49 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.32 (dd, <i>J</i> = 5.5, 0.7 Hz, 1H), 7.35 (dd, <i>J</i> = 2.6, 0.7 Hz, 1H), 7.16 (ddd, <i>J</i> = 8.8, 2.6, 0.7 Hz, 1H), 7.01 (dd, <i>J</i> = 5.5, 0.7 Hz, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 5.84 – 5.67 (m, 1H), 5.23 – 4.99 (m, 3H), 4.74 – 4.59 (m, 1H), 4.53 – 4.40 (m, 1H), 3.91 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 3H), 2.55 (t, <i>J</i> = 6.8 Hz, 2H), 2.39 (d, <i>J</i> = 0.7 Hz, 3H), 1.48 (dd, <i>J</i> = 7.2, 0.7 Hz, 3H), 1.34 (dd, <i>J</i> = 6.4, 0.7 Hz, 3H).	10
186	(薄膜) 3376, 2961, 1742, 1676, 1494, 1201, 968, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計 算値 489.2231; 実 測値 489.2238	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.36 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.21 (m, 2H), 6.98 – 6.92 (m, 2H), 6.92 – 6.85 (m, 2H), 5.75 (d, <i>J</i> = 1.5 Hz, 2H), 5.13 (dt, <i>J</i> = 8.7, 4.4 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.46 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.5 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.81 – 1.60 (m, 2H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.40 (ddtd, <i>J</i> = 13.8, 9.3, 6.8, 2.1 Hz, 2H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H).	20 30
187	(薄膜) 3376, 2984, 1746, 1676, 1478, 1201, 1003, 971	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₂₉ Cl ₂ N ₂ O ₈ の計 算値 555.1295; 実 測値 555.1310	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.32 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 7.35 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H), 7.17 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.6 Hz, 1H), 7.00 – 6.86 (m, 2H), 5.86 – 5.66 (m, 3H), 5.18 (td, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 5.15 – 5.04 (m, 2H), 4.69 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.55 – 4.41 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.62 – 2.51 (m, 2H), 2.07 (s, 3H), 1.49 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H).	40

【表 2 - 7 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
188	(薄膜) 3343, 2881, 1771, 1599, 1160, 1037, 756	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ N ₂ O ₇ の計算 値 445.1969; 実測 値 445.1957	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.51 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.34 – 7.18 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.97 – 6.87 (m, 3H), 5.07 (ddd, <i>J</i> = 9.0, 5.0, 4.0 Hz, 1H), 4.70 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.56 – 4.44 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.89 – 1.61 (m, 2H), 1.49 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.92 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.61, 168.89, 162.41, 159.49, 157.88, 146.66, 141.63, 137.55, 129.53, 121.05, 115.87, 109.75, 77.57, 73.42, 56.28, 48.13, 22.27, 20.74, 18.63, 15.35, 9.79.
189	(薄膜) 3376, 2975, 1770, 1673, 1494, 1173, 1057, 906, 729	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ N ₂ O ₇ の計算 値 445.1969; 実測 値 445.1961	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.30 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.31 – 7.17 (m, 2H), 6.98 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.92 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.89 – 6.82 (m, 2H), 5.09 (ddd, <i>J</i> = 7.1, 5.8, 4.4 Hz, 1H), 4.82 – 4.65 (m, 1H), 4.45 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 3.88 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.74 (qd, <i>J</i> = 7.8, 6.2 Hz, 2H), 1.50 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.49, 168.89, 162.45, 159.48, 157.68, 146.66, 141.62, 137.54, 129.52, 121.15, 116.10, 109.74, 77.79, 74.36, 56.28, 48.11, 23.23, 20.75, 18.71, 15.25, 9.85.

【表 2 - 7 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
190	(薄膜) 3384, 2961, 1771, 1676, 1506, 1174, 1059, 730	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₇ の計算 値 459.2126; 実測 値 459.2123	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.52 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 7.35 – 7.18 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.97 – 6.88 (m, 3H), 5.20 – 5.08 (m, 1H), 4.69 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.49 (qd, <i>J</i> = 6.4, 4.9 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.74 – 1.61 (m, 2H), 1.49 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.46 – 1.30 (m, 2H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.91 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.57, 168.88, 162.40, 159.49, 157.85, 146.66, 141.61, 137.55, 129.54, 121.06, 115.87, 109.75, 75.96, 73.54, 56.29, 48.11, 31.18, 20.74, 18.67, 18.61, 15.30, 13.91.
191	(薄膜) 3381, 2961, 1770, 1676, 1506, 1173, 1057, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₇ の計算 値 459.2126; 実測 値 459.2121	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.17 (m, 2H), 6.99 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.93 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.89 – 6.78 (m, 2H), 5.17 (dt, <i>J</i> = 8.6, 4.2 Hz, 1H), 4.81 – 4.65 (m, 1H), 4.44 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.2 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.81 – 1.56 (m, 2H), 1.49 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.45 – 1.33 (m, 2H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.46, 168.89, 162.42, 159.47, 157.69, 146.65, 141.61, 137.53, 129.51, 121.15, 116.12, 109.73, 76.30, 74.73, 56.28, 48.10, 32.21, 20.74, 18.72, 18.72, 15.19, 13.93.

【表 2 - 7 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
192	(薄膜) 3378, 2958, 1771, 1677, 1506, 1198, 1062, 754	ESIMS <i>m/z</i> 473.4 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.30 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.33 – 7.15 (m, 2H), 6.98 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.96 – 6.89 (m, 1H), 6.89 – 6.82 (m, 2H), 5.26 (dt, <i>J</i> = 9.9, 3.4 Hz, 1H), 4.81 – 4.61 (m, 1H), 4.42 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.8 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.79 – 1.56 (m, 2H), 1.47 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.44 – 1.35 (m, 1H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (dd, <i>J</i> = 6.5, 4.7 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.45, 168.89, 162.40, 159.47, 157.72, 146.66, 141.61, 137.53, 129.51, 121.15, 116.13, 109.73, 75.17, 74.90, 56.28, 48.09, 38.98, 24.48, 23.48, 21.86, 20.74, 18.73, 15.09.
193	(薄膜) 3379, 2968, 1770, 1676, 1506, 1197, 1174, 1061, 907, 730	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₇ の計算 値 459.2126; 実測 値 459.2111	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.58 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.34 – 7.18 (m, 2H), 6.99 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.93 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.81 (m, 2H), 5.07 (dd, <i>J</i> = 6.5, 5.3 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.60 – 4.46 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.06 (h, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.57 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.94 (dd, <i>J</i> = 15.8, 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.37, 168.90, 162.47, 159.48, 157.40, 146.67, 141.61, 137.54, 129.54, 121.08, 115.87, 109.75, 79.96, 72.63, 56.28, 48.14, 28.92, 20.75, 19.16, 18.82, 17.69, 14.94.

【表 2 - 7 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
194	(薄膜) 3377, 2983, 1769, 1675, 1507, 1173, 1063, 906, 730	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₅ N ₂ O ₇ の計算 値 417.1656; 実測 値 417.1663	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.48 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 8.29 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.31 – 7.16 (m, 2H), 7.05 – 6.81 (m, 4H), 4.79 – 4.67 (m, 1H), 4.61 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.7 Hz, 1H), 4.29 (qd, <i>J</i> = 11.4, 5.4 Hz, 2H), 3.89 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.46 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.53, 168.88, 162.49, 159.49, 157.68, 146.63, 141.52, 137.56, 129.53, 121.30, 116.19, 109.78, 71.62, 67.56, 56.29, 47.90, 20.75, 18.44, 16.88.
195	(薄膜) 3381, 2976, 2939, 1742, 1676, 1496, 1202, 1004, 968	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₈ の計算 値 475.2075; 実測 値 475.2079	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.33 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.31 – 7.21 (m, 2H), 7.00 – 6.88 (m, 4H), 5.81 – 5.69 (m, 2H), 5.07 (ddd, <i>J</i> = 8.9, 5.0, 3.9 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.51 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.9 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.88 – 1.62 (m, 2H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.72, 170.25, 163.00, 160.30, 157.89, 145.72, 144.02, 142.62, 129.53, 121.07, 115.88, 109.57, 89.59, 77.56, 73.46, 56.19, 48.30, 22.29, 20.86, 18.55, 15.36, 9.81.

10

20

30

40

【表 2 - 7 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
196	(薄膜) 3382, 2976, 1748, 1676, 1494, 1202, 1004, 967	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₈ の計算 値 475.2075; 実測 値 475.2077	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 7.31 – 7.20 (m, 2H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.6 Hz, 2H), 6.89 – 6.83 (m, 2H), 5.74 (d, <i>J</i> = 1.5 Hz, 2H), 5.10 (td, <i>J</i> = 6.5, 4.3 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.46 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.75 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 2H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.96 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.60, 170.25, 163.03, 160.28, 157.67, 145.71, 144.00, 142.60, 129.52, 121.16, 116.10, 109.57, 89.59, 77.75, 74.38, 56.18, 48.28, 23.22, 20.86, 18.59, 15.21, 9.89.
197	(薄膜) 3376, 2960, 1753, 1677, 1497, 1236, 1202, 1004, 969	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計算 値 489.2231; 実測 値 489.2240	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.33 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.20 (m, 2H), 7.00 – 6.89 (m, 4H), 5.74 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 2H), 5.20 – 5.12 (m, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.50 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.9 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.75 – 1.61 (m, 2H), 1.51 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.48 – 1.31 (m, 2H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.91 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.68, 170.25, 163.00, 160.30, 157.86, 145.71, 144.04, 142.60, 129.53, 121.07, 115.89, 109.57, 89.60, 75.95, 73.58, 56.19, 48.28, 31.21, 20.86, 18.69, 18.53, 15.31, 13.91.

【表 2 - 7 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
202	(薄膜) 3382, 2968, 1748, 1676, 1494, 1237, 1201, 1043, 1003, 969	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計算 値 489.2231; 実測 値 489.2234	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.39 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 7.32 – 7.21 (m, 2H), 6.99 – 6.89 (m, 2H), 6.89 – 6.82 (m, 2H), 5.75 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 2H), 5.07 (dd, <i>J</i> = 6.7, 5.2 Hz, 1H), 4.81 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.59 – 4.49 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.13 – 1.99 (m, 4H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.50, 170.25, 163.05, 160.28, 157.40, 145.72, 143.99, 142.63, 129.55, 121.10, 115.88, 109.57, 89.58, 79.93, 72.69, 56.18, 48.27, 28.97, 20.86, 19.15, 18.72, 17.83, 14.87.
203	(薄膜) 3376, 2984, 1748, 1675, 1497, 1236, 1201, 1003, 969	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₇ N ₂ O ₈ の計算 値 447.1762; 実測 値 447.1779	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.30 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.25 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.20 (m, 2H), 6.99 – 6.88 (m, 4H), 5.73 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 2H), 4.74 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.63 (pd, <i>J</i> = 6.2, 4.6 Hz, 1H), 4.39 – 4.22 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.48 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.64, 170.26, 163.06, 160.31, 157.68, 145.69, 144.07, 142.45, 129.53, 121.30, 116.17, 109.61, 89.58, 71.63, 67.54, 56.19, 48.12, 20.86, 18.32, 16.87.

【表 2 - 7 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
206	(薄膜) 3388, 2969, 1752, 1678, 1496, 1241, 1203, 1042, 1004, 970	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計算 値 489.2231; 実測 値 489.2228	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.31 – 7.21 (m, 2H), 6.98 – 6.84 (m, 4H), 5.80 – 5.70 (m, 2H), 5.00 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.20 – 2.08 (m, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.83, 170.25, 162.99, 160.27, 157.77, 145.71, 143.98, 142.66, 129.51, 120.94, 115.66, 109.53, 89.59, 80.93, 73.13, 56.18, 48.26, 28.61, 20.87, 19.51, 18.62, 17.17, 15.97.
207	(薄膜) 3389, 2968, 1753, 1678, 1496, 1239, 1203, 1004	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計算 値 489.2231; 実測 値 489.2212	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.40 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 7.31 – 7.20 (m, 2H), 6.99 – 6.84 (m, 4H), 5.80 – 5.71 (m, 2H), 5.07 (dd, <i>J</i> = 6.4, 5.1 Hz, 1H), 4.80 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.21 – 2.09 (m, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.39, 170.27, 163.07, 160.32, 157.45, 145.73, 144.05, 142.58, 129.56, 121.11, 115.93, 109.61, 89.62, 80.12, 72.63, 56.20, 48.43, 28.72, 20.88, 19.42, 18.69, 16.98, 15.63.

【表 2 - 8 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
212	(薄膜) 3375, 2985, 1750, 1676, 1498, 1237, 1201, 1003, 970	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₇ N ₂ O ₈ の計算 値 447.1762; 実測 値 447.1751	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.32 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.22 (m, 2H), 7.00 – 6.88 (m, 4H), 5.74 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 2H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.64 (pd, <i>J</i> = 6.4, 4.2 Hz, 1H), 4.40 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.6 Hz, 1H), 4.20 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.47 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.67, 170.26, 163.07, 160.32, 157.72, 145.70, 144.07, 142.43, 129.54, 121.30, 116.17, 109.62, 89.58, 71.71, 67.67, 56.19, 48.13, 20.86, 18.30, 16.79.
213	(薄膜) 3380, 2958, 1772, 1679, 1507, 1200, 1275	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₇ の計算 値 473.2282; 実測 値 473.2267	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.54 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.29 – 7.20 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.91 – 6.85 (m, 2H), 5.20 (ddd, <i>J</i> = 10.1, 4.2, 3.0 Hz, 1H), 4.69 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.44 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.09 (s, 1H), 1.73 (ddd, <i>J</i> = 14.2, 10.1, 4.4 Hz, 1H), 1.52 – 1.40 (m, 4H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.93 (dd, <i>J</i> = 6.6, 3.6 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.37, 168.90, 162.44, 159.50, 157.80, 149.25, 146.65, 141.59, 137.55, 129.51, 121.19, 116.32, 109.77, 75.27, 56.29, 48.21, 38.77, 24.53, 23.54, 21.69, 20.74, 18.50, 15.53.

【表 2 - 8 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
214	(薄膜) 3383, 2967, 1771, 1677, 1507, 1198, 1174	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₇ の計算 値 459.2126; 実測 値 459.2096	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.30 – 7.21 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.0 Hz, 1H), 6.90 – 6.80 (m, 2H), 5.06 (dd, <i>J</i> = 6.3, 5.3 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.16 – 2.09 (m, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.24, 168.88, 162.49, 159.50, 157.43, 146.68, 141.58, 137.55, 129.53, 121.09, 115.92, 109.79, 80.11, 72.60, 56.29, 48.28, 28.71, 20.73, 19.37, 18.72, 17.01, 15.52.	10 20
215	(薄膜) 3385, 2933, 1772, 1679, 1508, 1200, 1175	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₅ N ₂ O ₇ の計算 値 487.2439; 実測 値 487.2430	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.54 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.29 – 7.22 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.93 (tt, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.91 – 6.85 (m, 2H), 5.14 – 5.08 (m, 1H), 4.71 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.44 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.71 (q, <i>J</i> = 8.1, 7.5 Hz, 2H), 1.50 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.28 (dd, <i>J</i> = 11.2, 7.1 Hz, 9H), 0.87 (q, <i>J</i> = 6.2, 4.9 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.36, 168.90, 162.44, 159.49, 157.76, 146.66, 141.60, 137.54, 129.51, 121.18, 116.27, 109.76, 76.89, 74.80, 56.28, 48.19, 31.57, 29.82, 25.01, 22.44, 20.74, 18.58, 15.60, 13.94.	30 40

【表 2 - 8 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
218	(薄膜) 3373, 2982, 1771, 1745, 1678, 1510, 1201, 1176	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₅ N ₂ O ₇ の計算 値 417.1656; 実測 値 417.1655	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.49 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.21 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.97 – 6.90 (m, 3H), 4.78 – 4.67 (m, 1H), 4.63 (pd, <i>J</i> = 6.4, 4.3 Hz, 1H), 4.40 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.6 Hz, 1H), 4.19 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.4 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.45 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.55, 168.86, 162.50, 159.49, 157.72, 146.65, 141.51, 137.55, 129.54, 121.30, 116.17, 109.80, 71.68, 67.66, 56.29, 47.91, 20.74, 18.42, 16.81.
219	(薄膜) 3380, 2985, 1770, 1677, 1507, 1199, 1174	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₂₉ N ₂ O ₇ の計算 値 457.1969; 実測 値 457.1951	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.53 (s, 1H), 8.35 – 8.28 (m, 1H), 7.26 (ddd, <i>J</i> = 8.6, 6.2, 2.6 Hz, 2H), 6.99 (dd, <i>J</i> = 5.5, 1.1 Hz, 1H), 6.96 – 6.85 (m, 3H), 4.76 – 4.66 (m, 1H), 4.57 (dq, <i>J</i> = 6.8, 5.3, 4.7, 2.4 Hz, 1H), 4.51 (ddd, <i>J</i> = 9.0, 3.6, 1.1 Hz, 1H), 3.90 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 2.40 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 3H), 1.50 (dd, <i>J</i> = 7.2, 1.2 Hz, 3H), 1.39 (dd, <i>J</i> = 6.4, 1.1 Hz, 3H), 1.38 – 1.35 (m, 1H), 1.23 – 1.14 (m, 1H), 0.70 – 0.59 (m, 1H), 0.58 – 0.35 (m, 2H).

【表 2 - 8 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
220	(薄膜) 3385, 2932, 1771, 1678, 1507, 1200, 1174	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₇ H ₃₅ N ₂ O ₇ の計算 値 499.2439; 実測 値 499.2425	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.58 (s, 1H), 8.33 (dd, <i>J</i> = 5.4, 1.1 Hz, 1H), 7.30 – 7.19 (m, 3H), 6.99 (dd, <i>J</i> = 5.5, 1.1 Hz, 1H), 6.96 – 6.90 (m, 1H), 6.88 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 4.99 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.79 – 4.71 (m, 1H), 4.56 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.90 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 2.39 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.88 – 1.59 (m, 7H), 1.41 (dd, <i>J</i> = 7.1, 1.2 Hz, 3H), 1.26 (dd, <i>J</i> = 6.4, 1.2 Hz, 3H), 1.24 – 1.02 (m, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.71, 168.93, 162.36, 159.43, 157.71, 146.67, 141.56, 137.48, 129.50, 120.91, 115.68, 109.71, 80.41, 72.45, 56.27, 48.05, 38.09, 29.53, 27.54, 26.13, 26.01, 25.87, 20.75, 18.80, 15.90.
221	(薄膜) 3379, 2929, 1771, 1678, 1507, 1199, 1174	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₇ H ₃₅ N ₂ O ₇ の計算 値 499.2439; 実測 値 499.2432	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.58 (s, 1H), 8.32 (dd, <i>J</i> = 5.4, 1.1 Hz, 1H), 7.31 – 7.20 (m, 3H), 7.04 – 6.97 (m, 1H), 6.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 5.07 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.54 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 2.40 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.84 – 1.59 (m, 6H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.27 – 1.03 (m, 4H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.15, 168.93, 162.42, 159.46, 157.40, 146.66, 141.52, 137.51, 129.51, 121.05, 115.98, 109.76, 79.46, 72.14, 56.28, 48.23, 38.40, 29.69, 27.43, 26.22, 26.09, 25.85, 20.76, 18.77, 15.23.

【表 2 - 8 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
222	(薄膜) 3385, 2970, 1771, 1678, 1504, 1201	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₀ FN ₂ O ₇ の計 算値 477.2032; 実 測値 477.2026	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.56 (s, 1H), 8.32 (dd, <i>J</i> = 5.5, 1.0 Hz, 1H), 7.00 (dd, <i>J</i> = 5.5, 1.1 Hz, 1H), 6.98 – 6.89 (m, 2H), 6.87 – 6.76 (m, 2H), 5.03 (td, <i>J</i> = 5.8, 1.0 Hz, 1H), 4.80 – 4.71 (m, 1H), 4.40 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (d, <i>J</i> = 1.0 Hz, 3H), 2.39 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 3H), 2.09 (dq, <i>J</i> = 13.3, 6.4 Hz, 1H), 1.56 (dd, <i>J</i> = 7.2, 1.0 Hz, 3H), 1.26 (dd, <i>J</i> = 6.2, 1.1 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (dd, <i>J</i> = 6.8, 1.0 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.26, 168.92, 162.47, 159.48, 157.45 (d, <i>J</i> = 238.9 Hz), 153.47 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), 146.68, 141.48, 137.52, 117.31 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz), 115.90 (d, <i>J</i> = 23.1 Hz), 109.79, 79.85, 73.74, 56.29, 48.21, 28.71, 20.75, 19.32, 18.71, 17.20, 15.29. ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ - 123.25 (tt, <i>J</i> = 8.4, 4.3 Hz).

10

20

30

40

【表 2 - 9 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
227	(薄膜) 3389, 2971, 1747, 1677, 1504, 1203	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₂ FN ₂ O ₈ の計 算値 507.2137; 実 測値 507.2126	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.36 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.94 (dd, <i>J</i> = 9.9, 7.0 Hz, 3H), 6.82 (dd, <i>J</i> = 9.1, 4.3 Hz, 2H), 5.74 (d, <i>J</i> = 4.7 Hz, 2H), 4.98 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.43 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.15 – 2.04 (m, 2H), 1.67 – 1.58 (m, 2H), 1.44 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (dd, <i>J</i> = 6.9, 3.0 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.76, 170.29, 162.97, 160.26, 157.33 (d, <i>J</i> = 238.8 Hz), 153.79 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), 145.71, 143.99, 142.51, 116.91 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz), 115.88 (d, <i>J</i> = 22.9 Hz), 109.54, 89.56, 80.78, 74.21, 56.18, 48.23, 28.56, 20.88, 19.49, 18.62, 17.10, 15.86. ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ - 123.48 (tt, <i>J</i> = 8.2, 4.4 Hz).

10

20

30

40

【表 2 - 9 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
228	(薄膜) 3379, 2971, 1746, 1675, 1503, 1201, 968	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₂ FN ₂ O ₈ の計 算値 507.2137; 実 測値 507.2133	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.39 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (dd, <i>J</i> = 5.4, 1.1 Hz, 1H), 7.02 – 6.89 (m, 3H), 6.82 (ddd, <i>J</i> = 9.0, 4.3, 1.1 Hz, 2H), 5.80 – 5.67 (m, 2H), 5.04 (td, <i>J</i> = 5.8, 1.1 Hz, 1H), 4.79 (pd, <i>J</i> = 7.2, 1.1 Hz, 1H), 4.46 – 4.36 (m, 1H), 3.91 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 2.12 (dt, <i>J</i> = 13.2, 6.7 Hz, 1H), 2.07 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.58 (dd, <i>J</i> = 7.2, 1.1 Hz, 3H), 1.28 (dd, <i>J</i> = 6.2, 1.1 Hz, 3H), 0.96 (dd, <i>J</i> = 6.9, 1.1 Hz, 3H), 0.92 (dd, <i>J</i> = 6.8, 1.1 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.39, 170.30, 163.05, 160.29, 157.45 (d, <i>J</i> = 238.9 Hz), 153.48 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), 145.72, 144.04, 142.45, 117.29 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz), 115.91 (d, <i>J</i> = 23.0 Hz), 109.59, 89.59, 79.86, 73.75, 56.19, 48.37, 28.70, 20.88, 19.36, 18.64, 17.12, 15.40. ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ - 123.24 (tt, <i>J</i> = 8.6, 4.4 Hz).

10

20

30

40

【表 2 - 9 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
229	(薄膜) 3377, 2985, 1746, 1674, 1503, 1200, 829	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₆ FN ₂ O ₈ の計 算値 465.1668; 実 測値 465.1667	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.30 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.26 (dd, <i>J</i> = 5.4, 1.1 Hz, 1H), 6.99 – 6.91 (m, 3H), 6.87 (ddd, <i>J</i> = 9.2, 4.3, 1.1 Hz, 2H), 5.77 – 5.69 (m, 2H), 4.73 (pd, <i>J</i> = 7.2, 1.1 Hz, 1H), 4.53 (tt, <i>J</i> = 9.8, 3.1 Hz, 1H), 4.36 (ddd, <i>J</i> = 11.5, 6.8, 1.1 Hz, 1H), 4.20 (ddd, <i>J</i> = 11.4, 4.1, 1.1 Hz, 1H), 3.91 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 2.07 (d, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.48 (dd, <i>J</i> = 7.2, 1.1 Hz, 3H), 1.32 (dd, <i>J</i> = 6.3, 1.1 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.65, 170.30, 163.07, 160.31, 157.56 (d, <i>J</i> = 239.1 Hz), 153.78 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), 145.70, 144.08, 142.28, 117.57 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz), 115.89 (d, <i>J</i> = 23.0 Hz), 109.62, 89.55, 72.87, 67.59, 56.20, 48.10, 20.87, 18.26, 16.72. ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ - 122.94 (tt, <i>J</i> = 8.5, 4.4 Hz).

10

20

30

40

【表 2 - 9 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
230	(薄膜) 3388, 2967, 1677, 1494, 1193, 911, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 429.2020; 実測 値 429.1992	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.47 (dd, <i>J</i> = 3.8, 2.2 Hz, 1H), 7.54 – 7.45 (m, 2H), 7.33 – 7.20 (m, 2H), 6.94 (td, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.83 (m, 2H), 5.07 (dd, <i>J</i> = 6.2, 5.3 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.20 – 2.06 (m, 1H), 1.57 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.22, 169.48, 162.43, 157.44, 147.46, 145.49, 141.20, 132.96, 129.54, 127.42, 121.11, 115.94, 80.18, 72.64, 48.29, 28.73, 21.04, 19.39, 18.74, 17.04, 15.53.
231	(薄膜) 2979, 1678, 1507, 1201, 911, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₇ の計算 値 473.2282; 実測 値 473.2275	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.29 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.31 – 7.21 (m, 2H), 7.00 – 6.90 (m, 2H), 6.90 – 6.83 (m, 2H), 5.06 (dd, <i>J</i> = 6.2, 5.3 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.13 (q, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.12 (qd, <i>J</i> = 6.9, 5.3 Hz, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.44 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.26, 168.85, 162.55, 158.84, 157.45, 146.57, 141.67, 137.66, 129.53, 121.08, 115.94, 110.42, 80.10, 72.63, 64.98, 48.27, 28.72, 20.68, 19.38, 18.76, 17.01, 15.55, 14.28.

【表 2 - 9 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
233	(薄膜) 3393, 2969, 1744, 1676, 1494, 1200, 1007, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₇ の計算 値 459.2126; 実測 値 459.2114	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.41 – 8.30 (m, 2H), 7.53 (dd, <i>J</i> = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.42 (dd, <i>J</i> = 8.4, 4.5 Hz, 1H), 7.32 – 7.20 (m, 2H), 6.94 (td, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.91 – 6.82 (m, 2H), 5.87 – 5.79 (m, 2H), 5.08 (dd, <i>J</i> = 6.4, 5.1 Hz, 1H), 4.84 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.51 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 2.21 – 2.12 (m, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.45, 169.67, 163.05, 157.44, 153.38, 143.31, 140.47, 129.55, 127.77, 127.09, 121.11, 115.92, 87.50, 80.17, 72.63, 48.43, 28.72, 20.86, 19.42, 18.73, 16.97, 15.65.
234	(薄膜) 3379, 2979, 1751, 1676, 1495, 1200, 969, 737	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₅ N ₂ O ₈ の計算 値 503.2388; 実測 値 503.2379	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.25 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 7.34 – 7.20 (m, 2H), 6.93 (dd, <i>J</i> = 10.1, 6.4 Hz, 2H), 6.90 – 6.82 (m, 2H), 5.76 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 2H), 5.07 (dd, <i>J</i> = 6.4, 5.1 Hz, 1H), 4.80 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.13 (q, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 2.20 – 2.09 (m, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.57 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.48 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.41, 170.18, 163.12, 159.55, 157.45, 145.61, 143.95, 142.71, 129.54, 121.09, 115.92, 110.27, 89.48, 80.10, 72.64, 64.86, 48.43, 28.71, 20.96, 19.41, 18.69, 16.96, 15.65, 14.37.

【表 2 - 9 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
240	(薄膜) 3383, 2985, 1751, 1675, 1495, 1043, 1004, 972 .	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₉ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計算 値 537.2231; 実測 値 537.2220.	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.52 – 8.08 (m, 2H), 7.56 – 7.04 (m, 7H), 7.04 – 6.62 (m, 4H), 5.73 (dd, <i>J</i> = 6.2, 1.8 Hz, 2H), 5.41 – 5.23 (m, 1H), 4.68 (dp, <i>J</i> = 38.3, 7.2 Hz, 1H), 4.47 (dq, <i>J</i> = 8.5, 6.3, 4.5 Hz, 1H), 3.90 (d, <i>J</i> = 3.2 Hz, 3H), 3.17 – 2.93 (m, 2H), 2.05 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz, 3H), 1.51 – 1.21 (m, 6H).	10
241		ESIMS <i>m/z</i> 507.3([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.53 – 8.37 (m, 1H), 8.32 (dd, <i>J</i> = 10.2, 5.5 Hz, 1H), 7.32 – 7.10 (m, 6H), 7.05 – 6.76 (m, 4H), 5.41 – 5.21 (m, 1H), 4.82 – 4.39 (m, 2H), 3.98 – 3.80 (m, 3H), 3.19 – 2.89 (m, 2H), 2.39 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 3H), 1.45 – 1.17 (m, 7H).	20
242		ESIMS <i>m/z</i> 487.4 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.57 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.09 – 6.79 (m, 4H), 5.34 – 5.14 (m, 1H), 4.74 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.67 (ddd, <i>J</i> = 13.3, 7.0, 3.2 Hz, 2H), 1.60 – 1.47 (m, 4H), 1.47 – 1.33 (m, 1H), 1.32 – 1.21 (m, 6H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H), 0.85 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.21, 168.85, 162.44, 159.49, 157.46, 146.63, 141.57, 137.55, 129.52, 121.07, 115.97, 109.75, 72.65, 56.27, 48.25, 41.60, 22.43, 21.24, 20.72, 18.64, 15.91, 11.54, 11.44.	30 40

【表 2 - 9 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
243	(薄膜) 3376, 2968, 2937, 2876, 1743, 1677, 1579, 1503, 1454, 1437, 1341, 1310, 1201, 1151, 1102, 1043, 1004, 970, 830, 701	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₅ N ₂ O ₈ の計算 値 503.2388; 実測 値 503.2382	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.29 – 8.21 (m, 2H), 7.28 – 7.15 (m, 5H), 6.93 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.76 – 5.68 (m, 2H), 5.20 (dt, <i>J</i> = 9.5, 4.3 Hz, 1H), 4.63 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.55 – 3.49 (m, 1H), 3.44 (qt, <i>J</i> = 9.1, 6.6 Hz, 2H), 3.05 (dd, <i>J</i> = 14.4, 4.1 Hz, 1H), 2.91 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.4 Hz, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.62 – 1.53 (m, 2H), 1.22 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.20 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.21, 170.29, 162.88, 160.24, 145.69, 143.96, 142.52, 137.46, 129.36, 128.30, 126.45, 109.51, 89.57, 77.71, 75.94, 71.27, 56.17, 48.16, 35.96, 23.27, 20.88, 18.26, 16.13, 10.69 .
244	(薄膜) 3378, 2933, 2870, 1742, 1677, 1578, 1503, 1454, 1437, 1310, 1200, 1179, 1150, 1101, 1043, 1003, 970, 930, 744, 701	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₈ H ₃₉ N ₂ O ₈ の計算 値 531.2701; 実測 値 531.2696	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.29 – 8.21 (m, 2H), 7.30 – 7.14 (m, 5H), 6.93 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.78 – 5.69 (m, 2H), 5.20 (dt, <i>J</i> = 9.1, 4.3 Hz, 1H), 4.63 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.56 – 3.40 (m, 3H), 3.05 (dd, <i>J</i> = 14.3, 4.0 Hz, 1H), 2.90 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.5 Hz, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.61 – 1.49 (m, 2H), 1.36 – 1.30 (m, 4H), 1.22 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.19 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.93 – 0.87 (m, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.21, 170.29, 162.87, 160.25, 145.68, 143.97, 142.51, 137.46, 129.37, 128.30, 126.45, 109.51, 89.58, 77.70, 75.97, 69.67, 56.17, 48.17, 36.00, 29.76, 28.38, 22.52, 20.88, 18.27, 16.14, 14.06 .

【表 2 - 9 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
245	(薄膜) 3379, 2957, 2872, 1743, 1677, 1579, 1503, 1454, 1437, 1341, 1310, 1236, 1201, 1180, 1150, 1101, 1043, 1004, 970, 830, 746, 701	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₇ H ₃₇ N ₂ O ₈ の計算 値 517.2544; 実測 値 517.2541	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.27 – 8.22 (m, 2H), 7.28 – 7.15 (m, 5H), 6.93 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.77 – 5.70 (m, 2H), 5.20 (dt, <i>J</i> = 9.5, 4.3 Hz, 1H), 4.62 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.51 (qd, <i>J</i> = 6.4, 4.6 Hz, 1H), 3.27 (dd, <i>J</i> = 8.9, 6.4 Hz, 1H), 3.21 (dd, <i>J</i> = 8.9, 6.7 Hz, 1H), 3.06 (dd, <i>J</i> = 14.4, 4.1 Hz, 1H), 2.90 (dd, <i>J</i> = 14.4, 9.5 Hz, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.82 (dp, <i>J</i> = 13.3, 6.6 Hz, 1H), 1.22 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.19 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.97 – 0.80 (m, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.18, 170.29, 162.86, 160.25, 145.68, 143.96, 142.52, 137.49, 129.37, 128.29, 126.44, 109.50, 89.58, 77.75, 76.43, 76.14, 56.17, 48.16, 36.02, 28.81, 20.88, 19.45, 19.39, 18.27, 16.03 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 0 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
246	(薄膜) 3377, 2963, 2874, 1743, 1677, 1579, 1504, 1462, 1339, 1310, 1236, 1202, 1180, 1158, 1100, 1043, 1004, 970, 830	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₇ N ₂ O ₈ の計算 値 469.2544; 実測 値 469.2543	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.41 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.79 – 5.70 (m, 2H), 4.88 (dd, <i>J</i> = 6.3, 5.2 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.48 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.26 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.3 Hz, 1H), 3.12 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.8 Hz, 1H), 2.13 – 2.03 (m, 4H), 1.83 – 1.71 (m, 1H), 1.55 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 4.6 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 4.7 Hz, 3H), 0.88 (d, <i>J</i> = 3.0 Hz, 3H), 0.87 (d, <i>J</i> = 3.1 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.43, 170.31, 162.95, 160.27, 145.70, 144.00, 142.55, 109.51, 89.62, 80.29, 75.92, 74.44, 56.17, 48.39, 28.76, 28.47, 20.89, 19.47, 19.44, 19.38, 18.77, 17.02, 15.46 .
247	(薄膜) 3378, 2964, 2937, 2876, 1741, 1676, 1579, 1504, 1459, 1437, 1338, 1310, 1236, 1201, 1179, 1156, 1100, 1042, 1004, 968, 941, 830	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₃₅ N ₂ O ₈ の計算 値 455.2388; 実測 値 455.2387	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.41 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.81 – 5.70 (m, 2H), 4.88 (dd, <i>J</i> = 6.1, 5.4 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.50 (p, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 3.44 (dt, <i>J</i> = 8.9, 6.5 Hz, 1H), 3.35 (dt, <i>J</i> = 8.9, 6.7 Hz, 1H), 2.11 – 2.03 (m, 4H), 1.57 – 1.49 (m, 5H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 – 0.86 (m, 9H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.45, 170.31, 162.96, 160.27, 145.70, 144.00, 142.56, 109.51, 89.62, 80.18, 74.27, 70.67, 56.17, 48.39, 28.51, 23.23, 20.89, 19.45, 18.77, 17.13, 15.52, 10.67 .

【表 2 - 1 0 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
250	(薄膜) 3381, 2962, 2874, 1772, 1739, 1677, 1590, 1571, 1507, 1455, 1435, 1339, 1310, 1276, 1199, 1174, 1099, 1062, 905, 825, 801	ESIMS <i>m/z</i> 439.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.58 (s, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 4.87 (dd, <i>J</i> = 6.2, 5.4 Hz, 1H), 4.77 – 4.69 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.47 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.25 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.3 Hz, 1H), 3.12 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.8 Hz, 1H), 2.40 (s, 3H), 2.07 (pd, <i>J</i> = 6.9, 5.3 Hz, 1H), 1.77 (dp, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.10 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 – 0.85 (m, 12H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.29, 168.93, 162.36, 159.43, 146.65, 141.58, 137.46, 109.70, 80.27, 75.91, 74.44, 56.27, 48.24, 28.75, 28.47, 20.75, 19.43, 18.84, 17.07, 15.38 .
251	(薄膜) 3386, 2967, 2878, 1772, 1739, 1678, 1591, 1572, 1507, 1481, 1453, 1310, 1232, 1199, 1175, 1151, 1100, 1062, 1029, 905, 828	ESIMS <i>m/z</i> 493.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.56 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 4.86 (dd, <i>J</i> = 6.2, 5.3 Hz, 1H), 4.78 – 4.69 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.55 – 3.42 (m, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.20 – 2.08 (m, 2H), 2.03 – 1.94 (m, 1H), 1.79 – 1.73 (m, 2H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.37, 168.95, 162.40, 159.46, 146.66, 141.52, 137.51, 127.32 (q, <i>J</i> = 276.1 Hz), 109.75, 79.77, 74.72, 66.95, 56.29, 48.19, 30.73 (q, <i>J</i> = 28.9 Hz), 28.59, 22.73 (q, <i>J</i> = 3.1 Hz), 20.74, 19.31, 18.77, 17.57, 15.07 .

【表 2 - 1 0 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
252	(薄膜) 3383, 2965, 2939, 2875, 1771, 1738, 1677, 1571, 1506, 1453, 1435, 1339, 1310, 1198, 1174, 1100, 1061, 1041, 907, 826, 738, 699	ESIMS <i>m/z</i> 501.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.58 (s, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.25 (d, <i>J</i> = 12.0 Hz, 2H), 7.21 – 7.13 (m, 3H), 6.99 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 4.89 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.74 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.53 – 3.37 (m, 3H), 2.71 – 2.60 (m, 2H), 2.39 (d, <i>J</i> = 0.9 Hz, 3H), 2.04 (qd, <i>J</i> = 6.9, 5.7 Hz, 1H), 1.88 – 1.79 (m, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 4.3 Hz, 3H), 0.90 (d, <i>J</i> = 4.6 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.36, 168.96, 162.40, 159.44, 146.67, 142.07, 141.56, 137.48, 128.46, 128.26, 125.67, 109.72, 80.15, 74.42, 68.05, 56.28, 48.25, 32.37, 31.62, 28.56, 20.75, 19.40, 18.83, 17.35, 15.32 .
253	(薄膜) 3380, 2970, 1741, 1676, 1504, 1457, 1437, 1368, 1339, 1310, 1236, 1201, 1180, 1154, 1101, 1042, 1003, 969, 830, 736	ESIMS <i>m/z</i> 467.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.42 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.78 – 5.72 (m, 2H), 4.94 (dq, <i>J</i> = 2.2, 1.1 Hz, 1H), 4.91 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.87 – 4.83 (m, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.96 – 3.90 (m, 4H), 3.84 (d, <i>J</i> = 12.3 Hz, 1H), 3.58 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 2.11 – 2.02 (m, 4H), 1.72 (t, <i>J</i> = 1.1 Hz, 3H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.96 – 0.88 (m, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.46, 170.31, 162.95, 160.27, 145.70, 144.00, 142.55, 142.37, 112.08, 109.52, 89.62, 80.04, 73.63, 72.69, 56.17, 48.39, 28.58, 20.89, 19.60, 19.43, 18.76, 17.34, 15.26 .

【表 2 - 1 0 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
254	(薄膜) 3379, 2968, 1740, 1675, 1579, 1504, 1458, 1437, 1339, 1310, 1201, 1179, 1154, 1099, 1061, 1041, 1003, 968, 940, 830, 737	ESIMS <i>m/z</i> 453.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.41 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.87 (ddt, <i>J</i> = 17.2, 10.4, 5.6 Hz, 1H), 5.79 – 5.71 (m, 2H), 5.25 (dq, <i>J</i> = 17.2, 1.7 Hz, 1H), 5.14 (dq, <i>J</i> = 10.4, 1.4 Hz, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.07 – 3.94 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.60 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 2.09 – 2.01 (m, 4H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 – 0.87 (m, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.47, 170.31, 162.96, 160.27, 145.70, 144.00, 142.56, 134.94, 116.77, 109.52, 89.62, 80.00, 73.60, 69.66, 56.18, 48.39, 28.56, 20.89, 19.41, 18.75, 17.36, 15.33 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 0 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
255	(薄膜) 3380, 2970, 1742, 1676, 1579, 1505, 1457, 1438, 1368, 1308, 1263, 1202, 1108, 1042, 1003, 964, 829, 737	ESIMS <i>m/z</i> 521.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.39 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.95 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.38 (ddq, <i>J</i> = 15.7, 4.0, 2.0 Hz, 1H), 5.88 (dqt, <i>J</i> = 15.3, 6.6, 2.2 Hz, 1H), 5.76 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 5.73 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 4.91 (dd, <i>J</i> = 6.3, 5.1 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.14 – 4.06 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.62 (qd, <i>J</i> = 6.3, 5.1 Hz, 1H), 2.07 (s, 3H), 2.02 (h, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.55 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.49, 170.30, 163.00, 160.29, 145.71, 144.03, 142.45, 136.71 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz), 127.29 – 119.33 (m), 118.35 (q, <i>J</i> = 34.0 Hz), 109.56, 89.60, 79.61, 75.05, 66.51, 56.18, 48.35, 28.62, 20.88, 19.32, 18.64, 17.66, 15.05 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 0 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
256	(薄膜) 3378, 2970, 1771, 1739, 1678, 1507, 1437, 1368, 1308, 1263, 1199, 1175, 1109, 1062, 960, 827	ESIMS <i>m/z</i> 491.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.55 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.37 (ddq, <i>J</i> = 15.7, 4.0, 2.0 Hz, 1H), 5.88 (dqt, <i>J</i> = 15.4, 6.6, 2.2 Hz, 1H), 4.90 (dd, <i>J</i> = 6.5, 5.1 Hz, 1H), 4.78 – 4.69 (m, 1H), 4.13 – 4.07 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.61 (qd, <i>J</i> = 6.3, 5.0 Hz, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.05 – 1.95 (m, 1H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.36, 168.94, 162.42, 159.46, 146.67, 141.49, 137.51, 136.70 (q, <i>J</i> = 6.2 Hz), 126.66 – 119.76 (m), 118.36 (q, <i>J</i> = 33.9 Hz), 109.76, 79.58, 75.04, 66.49, 56.29, 48.19, 28.63, 20.74, 19.29, 18.72, 17.72, 14.98 .
257	(薄膜) 3386, 2960, 2873, 1739, 1676, 1579, 1503, 1460, 1437, 1201, 1179, 1063, 1042, 1003, 967, 941, 830, 736	ESIMS <i>m/z</i> 469.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.40 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.76 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 5.74 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 4.83 – 4.74 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.54 (qd, <i>J</i> = 6.3, 5.0 Hz, 1H), 3.28 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.4 Hz, 1H), 3.04 (dd, <i>J</i> = 8.7, 6.7 Hz, 1H), 2.07 (s, 4H), 1.79 (dt, <i>J</i> = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.91 – 0.84 (m, 9H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.70, 170.30, 162.93, 160.25, 145.72, 143.96, 142.66, 109.49, 89.60, 81.82, 75.93, 74.56, 56.17, 48.27, 28.81, 28.46, 20.89, 19.48, 19.45, 18.78, 17.61, 15.56 .

【表 2 - 1 0 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
258	(薄膜) 2975, 1737, 1675, 1497, 1455, 1202, 1175, 940, 736	ESIMS <i>m/z</i> 455.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.40 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.79 – 5.69 (m, 2H), 4.85 – 4.68 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.60 – 3.53 (m, 1H), 3.49 (dt, <i>J</i> = 9.0, 6.6 Hz, 1H), 3.25 (dt, <i>J</i> = 8.9, 6.8 Hz, 1H), 2.10 – 2.01 (m, 4H), 1.55 (s, 2H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.91 – 0.87 (m, 6H).
259	(薄膜) 2975, 2879, 1737, 1677, 1580, 1502, 1454, 1202, 1150, 1062, 1040, 1003, 969, 831, 736	ESIMS <i>m/z</i> 523.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.38 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.77 – 5.70 (m, 2H), 4.84 – 4.72 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.61 – 3.53 (m, 2H), 3.34 (dt, <i>J</i> = 9.2, 6.1 Hz, 1H), 2.21 – 2.10 (m, 2H), 2.07 (s, 3H), 2.02 (dt, <i>J</i> = 13.5, 6.7 Hz, 1H), 1.83 – 1.72 (m, 2H), 1.55 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.89 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H).
260	(薄膜) 3371, 2983, 1743, 1496, 1200, 1003, 971, 700	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₈ H ₃₁ N ₂ O ₈ の計算 値 523.2075; 実測 値 523.2070	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.36 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.25 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.45 – 7.18 (m, 7H), 6.97 – 6.91 (m, 2H), 6.89 – 6.82 (m, 2H), 5.96 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 1H), 5.80 – 5.71 (m, 2H), 4.85 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.67 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 1.51 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.64, 170.25, 163.07, 160.31, 157.70, 145.68, 144.06, 142.50, 136.76, 129.49, 128.32, 128.25, 127.19, 121.37, 116.45, 109.60, 89.61, 78.19, 76.10, 56.19, 48.15, 20.85, 18.29, 15.40.

【表 2 - 1 0 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
261	(薄膜) 3374, 2984, 1747, 1677, 1496, 1201, 1003, 972	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₈ H ₃₁ N ₂ O ₈ の計算 値 523.2075; 実測 値 523.2066	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.30 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.25 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.43 – 7.30 (m, 5H), 7.30 – 7.21 (m, 2H), 6.99 – 6.90 (m, 4H), 5.96 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 5.78 – 5.67 (m, 2H), 4.72 (dp, <i>J</i> = 22.6, 6.8, 6.4 Hz, 2H), 3.91 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.44 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.77, 170.25, 162.97, 160.29, 158.06, 145.67, 144.03, 142.59, 136.54, 129.54, 128.53, 128.47, 127.43, 121.27, 116.18, 109.56, 89.61, 78.88, 75.46, 56.18, 48.11, 20.85, 18.25, 16.18.	10 20
262	(薄膜) 3373, 2984, 1739, 1675, 1496, 1202, 970	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ N ₂ O ₈ の計算 値 461.1918; 実測 値 461.1913	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.34 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.34 – 7.21 (m, 2H), 7.00 – 6.87 (m, 4H), 5.74 (d, <i>J</i> = 0.8 Hz, 2H), 5.19 (p, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 4.71 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.45 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.41, 170.25, 163.03, 160.31, 157.82, 145.71, 144.03, 142.59, 129.54, 121.07, 115.82, 109.57, 89.60, 74.55, 72.97, 56.18, 48.28, 20.86, 18.47, 15.28, 15.23.	30 40

【表 2 - 1 0 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
263	(薄膜) 3371, 2984, 1739, 1675, 1495, 1202, 1004, 969, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ N ₂ O ₈ の計算 値 461.1918; 実測 値 461.1915	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.32 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.31 – 7.21 (m, 2H), 6.97 – 6.87 (m, 4H), 5.83 – 5.69 (m, 2H), 5.09 (qd, <i>J</i> = 6.4, 4.3 Hz, 1H), 4.70 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.45 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.49 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.35 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H).	10
264	(薄膜) 3381, 2975, 1741, 1676, 1507, 1203, 1150, 970, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₁ F ₂ N ₂ O ₈ の計 算値 525.2043; 実 測値 525.2038	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.39 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 7.06 – 6.92 (m, 2H), 6.71 (ddd, <i>J</i> = 9.7, 6.6, 3.0 Hz, 1H), 6.61 (ddt, <i>J</i> = 8.8, 7.5, 3.1 Hz, 1H), 5.84 – 5.69 (m, 2H), 5.09 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.80 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.47 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.17 – 2.02 (m, 4H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (dd, <i>J</i> = 10.3, 6.8 Hz, 6H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 116.83 (d, <i>J</i> = 15.1 Hz), -138.23 (dd, <i>J</i> = 15.0, 1.3 Hz).	20 30
265	(薄膜) 3388, 2974, 1741, 1676, 1506, 1325, 1161, 1111, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₂ F ₃ N ₂ O ₈ の計 算値 557.2105; 実 測値 557.2103	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 6.94 (dd, <i>J</i> = 10.8, 7.0 Hz, 3H), 5.83 – 5.70 (m, 2H), 5.07 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.80 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.58 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.07 (s, 4H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 61.56 .	40

【表 2 - 1 1 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
267	(薄膜) 3377, 2967, 1751, 1676, 1497, 1201, 1003, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₄ ClN ₂ O ₈ の計 算値 537.1998; 実 測値 537.1993	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.43 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.15 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 7.01 – 6.90 (m, 2H), 6.83 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 5.80 – 5.70 (m, 2H), 5.12 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.81 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.47 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.24 – 2.12 (m, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.38, 170.25, 163.04, 160.31, 150.80, 145.70, 144.04, 142.60, 131.84, 130.98, 128.04, 124.11, 115.94, 109.57, 89.63, 79.96, 74.53, 56.18, 48.42, 28.71, 20.87, 20.30, 19.39, 18.64, 17.25, 15.40.
268	(薄膜) 3375, 2967, 1748, 1676, 1478, 1201, 970, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₁ Cl ₂ N ₂ O ₈ の計 算値 557.1452; 実 測値 557.1447	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.41 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 7.34 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 7.16 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.6 Hz, 1H), 6.95 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 5.81 – 5.70 (m, 2H), 5.10 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.81 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.14 (td, <i>J</i> = 13.4, 12.5, 5.8 Hz, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.37, 170.24, 163.06, 160.31, 151.86, 145.70, 144.05, 142.50, 130.28, 127.54, 126.33, 125.22, 116.27, 109.61, 89.60, 79.61, 74.80, 56.19, 48.37, 28.72, 20.87, 19.34, 18.56, 17.37, 15.19.

【表 2 - 1 1 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
269	(薄膜) 3376, 2980, 1752, 1676, 1506, 1142, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₁ ClFN ₂ O ₈ の 計算値 541.1747; 実測値 541.1740	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.96 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.71 – 6.63 (m, 2H), 6.50 (dt, <i>J</i> = 10.5, 2.2 Hz, 1H), 5.80 – 5.70 (m, 2H), 5.04 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.79 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.46 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.14 – 2.00 (m, 4H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.35, 170.25, 163.40 (d, <i>J</i> = 248.0 Hz), 163.11, 160.34, 159.01 (d, <i>J</i> = 12.4 Hz), 145.73, 144.09, 142.49, 135.47 (d, <i>J</i> = 13.5 Hz), 112.13 (d, <i>J</i> = 3.2 Hz), 109.64, 109.02 (d, <i>J</i> = 25.3 Hz), 102.08 (d, <i>J</i> = 24.8 Hz), 89.61, 79.49, 73.51, 56.20, 48.37, 28.77, 20.86, 19.29, 18.52, 17.21, 15.15. ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 109.98 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 1 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
270	(薄膜) 3376, 2970, 1751, 1676, 1505, 1201, 1003, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₂ ClN ₂ O ₈ の計 算値 523.1842; 実 測値 523.1839	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.39 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.18 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.98 – 6.82 (m, 3H), 6.76 (ddd, <i>J</i> = 8.3, 2.5, 0.9 Hz, 1H), 5.80 – 5.72 (m, 2H), 5.05 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.80 (pd, <i>J</i> = 7.2, 2.5 Hz, 1H), 4.54 – 4.43 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.17 – 2.03 (m, 4H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.37, 170.25, 163.08, 160.32, 158.19, 145.72, 144.06, 134.93, 130.33, 129.54, 121.28, 116.27, 114.12, 109.61, 89.61, 79.81, 73.07, 56.19, 48.40, 28.74, 20.86, 19.35, 18.60, 17.10, 15.37.
271	(薄膜) 3375, 2972, 1750, 1676, 1505, 1201, 1040, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₅ N ₂ O ₉ の計 算値 519.2337; 実測 値 519.2335	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.38 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.95 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.88 – 6.77 (m, 4H), 5.79 – 5.68 (m, 2H), 4.97 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.79 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.39 (h, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 2.13 (dq, <i>J</i> = 12.6, 6.8, 5.9 Hz, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.46 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.97 (dd, <i>J</i> = 6.8, 5.6 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.81, 170.23, 162.99, 160.27, 154.11, 151.81, 145.71, 143.97, 142.67, 117.18, 114.69, 109.55, 89.58, 81.03, 74.32, 56.18, 55.69, 48.29, 28.60, 20.86, 19.52, 18.68, 17.21, 16.01.

【表 2 - 1 1 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
274	(薄膜) 3387, 2968, 1770, 1676, 1508, 1195, 909, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₂₉ F ₂ N ₂ O ₇ の計 算値 495.1937; 実 測値 495.1935	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.55 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.99 (dq, <i>J</i> = 8.9, 5.7, 5.3 Hz, 2H), 6.70 (ddd, <i>J</i> = 9.7, 6.6, 2.9 Hz, 1H), 6.61 (ddt, <i>J</i> = 8.8, 7.6, 3.2 Hz, 1H), 5.08 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.46 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.15 – 2.05 (m, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.95 (dd, <i>J</i> = 11.9, 6.8 Hz, 6H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 116.83 (d, <i>J</i> = 15.1 Hz), -138.18 (dd, <i>J</i> = 15.0, 1.3 Hz).
275	(薄膜) 3387, 2969, 1771, 1676, 1511, 1110, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₀ F ₃ N ₂ O ₇ の計 算値 527.2000; 実 測値 527.1997	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.54 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.59 – 7.46 (m, 2H), 7.01 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.92 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H), 5.06 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.57 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.14 – 2.03 (m, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 61.54 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 1 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
276	(薄膜) 3384, 2968, 1770, 1588, 1507, 1140, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₂₉ ClFN ₂ O ₇ の 計算値 511.1642; 実測値 511.1634	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.63 – 8.43 (m, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 7.01 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.73 – 6.61 (m, 2H), 6.50 (dq, <i>J</i> = 10.4, 2.6, 2.2 Hz, 1H), 5.03 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.75 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.45 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.06 (dq, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 109.97 .
277	(薄膜) 3377, 2984, 1769, 1674, 1494, 1173, 907, 730	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₇ H ₂₉ N ₂ O ₇ の計算 値 493.1969; 実測 値 493.1965	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.55 (s, 1H), 8.30 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.43 – 7.19 (m, 7H), 6.99 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.93 (t, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 6.89 – 6.83 (m, 2H), 5.95 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 4.82 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.66 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 1.50 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.52, 168.88, 162.49, 159.49, 157.68, 146.64, 141.52, 137.57, 136.75, 129.49, 128.33, 128.23, 127.14, 121.37, 116.45, 109.80, 78.16, 76.12, 56.28, 47.96, 20.75, 18.39, 15.31.

10

20

30

40

【表 2 - 1 1 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
278	(薄膜) 2940, 1770, 1676, 1495, 1193, 908, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₇ H ₂₉ N ₂ O ₇ の計算 値 493.1969; 実測 値 493.1963	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.48 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.29 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.42 – 7.20 (m, 7H), 7.03 – 6.90 (m, 4H), 5.95 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 4.70 (dp, <i>J</i> = 15.4, 6.8, 6.4 Hz, 2H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.66, 168.88, 162.39, 159.47, 158.04, 146.62, 136.50, 129.54, 128.52, 128.46, 128.10, 127.42, 127.39, 121.26, 116.18, 109.75, 78.93, 75.43, 56.28, 47.90, 20.74, 18.32, 16.16.
279	(薄膜) 2988, 1771, 1676, 1493, 1179, 1040, 910, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₇ N ₂ O ₇ の計算 値 431.1813; 実測 値 431.1809	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.50 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.19 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.98 – 6.87 (m, 3H), 5.09 (qd, <i>J</i> = 6.4, 4.3 Hz, 1H), 4.68 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.43 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.47 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.07, 168.88, 162.47, 159.48, 157.88, 146.66, 141.59, 137.53, 129.51, 121.24, 116.38, 109.78, 75.51, 73.82, 56.28, 48.07, 20.74, 18.42, 15.75, 15.14.

10

20

30

40

【表 2 - 1 1 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
280	(薄膜) 3380, 2967, 1771, 1676, 1478, 1197, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₂₉ Cl ₂ N ₂ O ₇ の計 算値 527.1346; 実 測値 527.1344	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.34 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H), 7.15 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.6 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 5.09 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.15 – 2.06 (m, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.23, 168.85, 162.49, 159.50, 151.86, 146.67, 141.55, 137.55, 130.28, 127.53, 126.32, 125.24, 116.30, 109.81, 79.60, 74.79, 56.29, 48.22, 28.73, 20.73, 19.30, 18.60, 17.43, 15.08.
281	(薄膜) 3380, 2967, 1771, 1676, 1508, 1195, 909, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₀ ClN ₂ O ₇ の計 算値 493.1736; 実 測値 493.1733	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.55 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.30 – 7.23 (m, 1H), 7.17 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.01 (t, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 6.96 – 6.83 (m, 2H), 6.75 (ddd, <i>J</i> = 8.4, 2.5, 0.9 Hz, 1H), 5.04 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.51 – 4.44 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.40 (s, 2H), 2.13 – 2.03 (m, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.21, 168.86, 162.48, 159.50, 158.17, 146.66, 137.56, 134.90, 130.31, 129.52, 121.26, 116.21, 114.16, 109.79, 79.80, 73.04, 56.28, 48.23, 28.73, 20.72, 19.30, 18.64, 17.11, 15.27.

【表 2 - 1 1 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
282	(薄膜) 3387, 2967, 1771, 1677, 1506, 1199, 910, 737	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計算 値 489.2231; 実測 値 489.2230	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.86 – 6.76 (m, 4H), 5.03 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.36 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.17 – 2.06 (m, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.93 (dd, <i>J</i> = 13.1, 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.25, 168.86, 162.48, 159.50, 154.24, 151.49, 146.68, 141.59, 137.54, 117.52, 114.71, 109.80, 80.13, 73.95, 56.28, 55.68, 48.28, 28.72, 20.73, 19.38, 18.73, 17.10, 15.56.
283	(薄膜) 3378, 2941, 1770, 1675, 1505, 1198, 829, 737	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₇ N ₂ O ₈ の計算 値 447.1762; 実測 値 447.1754	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.50 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.87 (td, <i>J</i> = 6.3, 2.5 Hz, 2H), 6.83 – 6.76 (m, 2H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.48 (pd, <i>J</i> = 6.4, 4.2 Hz, 1H), 4.36 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.5 Hz, 1H), 4.18 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.2 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.47 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.55, 168.87, 162.49, 159.49, 154.43, 151.73, 146.65, 141.51, 137.55, 117.88, 114.71, 109.81, 73.09, 67.71, 56.29, 55.70, 47.92, 20.74, 18.47, 16.89.

【表 2 - 1 2 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
285	(薄膜) 3370, 2978, 1709, 1493, 1239, 1160, 751, 693	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ NNaO ₅ の計 算値 436.2094; 実 測値 436.2066	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.30 – 7.23 (m, 4H), 7.23 – 7.17 (m, 3H), 6.98 – 6.91 (m, 1H), 6.85 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 5.33 (dt, <i>J</i> = 9.1, 4.7 Hz, 1H), 4.92 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.55 – 4.40 (m, 1H), 4.21 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.11 (dd, <i>J</i> = 14.3, 4.6 Hz, 1H), 2.98 (dd, <i>J</i> = 14.3, 8.8 Hz, 1H), 1.42 (s, 9H), 1.35 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.10 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.66, 157.53, 154.96, 136.84, 129.54, 129.43, 128.39, 126.65, 121.28, 116.20, 79.70, 76.94, 74.12, 49.30, 36.29, 28.32, 18.40, 15.72.
286	(薄膜) 3369, 2980, 1705, 1492, 1238, 1160, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₂₇ NNaO ₅ の計 算値 372.1781; 実 測値 372.1752	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.22 (m, 2H), 6.95 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.92 – 6.88 (m, 2H), 5.94 (ddd, <i>J</i> = 17.3, 10.6, 6.6 Hz, 1H), 5.47 – 5.28 (m, 3H), 5.01 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 4.52 (qd, <i>J</i> = 6.4, 3.8 Hz, 1H), 4.32 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.35 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.27, 157.82, 155.07, 132.06, 129.52, 121.41, 119.41, 116.52, 79.75, 77.31, 75.06, 49.39, 28.34, 18.51, 15.56.

10

20

30

40

【表 2 - 1 2 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
287	(薄膜) 3364, 2980, 1710, 1493, 1240, 1162, 1067, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₂₇ NNaO ₅ の計 算値 372.1781; 実 測値 372.1761	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.21 (m, 2H), 6.98 – 6.88 (m, 3H), 5.89 (ddd, <i>J</i> = 17.2, 10.6, 6.3 Hz, 1H), 5.49 (tt, <i>J</i> = 6.3, 1.2 Hz, 1H), 5.45 – 5.29 (m, 2H), 5.07 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.39 – 4.25 (m, 1H), 1.43 (s, 9H), 1.29 (app t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.52, 157.70, 155.01, 131.81, 129.56, 121.21, 119.51, 115.85, 79.77, 76.85, 74.01, 49.38, 28.33, 18.70, 15.67.
288	(薄膜) 3356, 2976, 1711, 1496, 1206, 1164	ESIMS <i>m/z</i> 420.3 ([M+Na] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 6.81 (ddd, <i>J</i> = 21.3, 8.6, 3.1 Hz, 2H), 6.72 (dd, <i>J</i> = 8.9, 4.6 Hz, 1H), 5.08 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 4.97 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.46 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 4.35 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 2.20 – 2.06 (m, 4H), 1.43 (s, 9H), 1.29 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.22 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.96 (app dd, <i>J</i> = 6.8, 5.6 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.21, 156.78 (d, <i>J</i> = 238.1 Hz), 155.02, 151.54 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), 129.59 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz), 117.53 (d, <i>J</i> = 22.7 Hz), 112.71 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz), 112.36 (d, <i>J</i> = 22.7 Hz), 80.85, 79.72, 73.52, 49.41, 28.66, 28.31, 19.40, 18.71, 17.26, 16.42 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz), 15.84. ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 124.33 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 2 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
291	(薄膜) 3372, 2975, 1712, 1509, 1238, 1164, 910, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₃ NNaO ₅ の計 算値 402.2251; 実 測値 402.2217	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.06 (dd, <i>J</i> = 8.9, 2.8 Hz, 2H), 6.80 – 6.74 (m, 2H), 5.09 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 4.93 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.46 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.35 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 2.27 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz, 3H), 2.11 (h, <i>J</i> = 6.6 Hz, 1H), 1.44 (d, <i>J</i> = 5.9 Hz, 9H), 1.31 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.23 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.37, 155.61, 130.25, 129.97, 115.95, 115.64, 80.93, 79.68, 73.25, 49.43, 28.60, 28.35, 20.45, 19.44, 18.89, 17.27, 15.95.
292	(薄膜) 3371, 2975, 1711, 1508, 1236, 1163, 1064, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₃ NNaO ₅ の計 算値 402.2251; 実 測値 402.2275	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.06 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 6.80 – 6.74 (m, 2H), 5.09 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 5.01 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.44 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.35 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.16 – 2.05 (m, 1H), 1.45 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.91, 155.32, 155.08, 130.42, 129.99, 115.95, 79.92, 79.73, 72.91, 49.59, 28.72, 28.35, 20.48, 19.35, 18.85, 17.08, 15.55.

10

20

30

40

【表 2 - 1 2 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
293	(薄膜) 3362, 2979, 1702, 1508, 1233, 1161, 1067, 735	ESIMS <i>m/z</i> 360.3 ([M+Na] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.07 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 6.85 – 6.79 (m, 2H), 5.02 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.55 (pd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 4.40 – 4.22 (m, 2H), 4.16 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.2 Hz, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.37 – 1.29 (m, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.21, 155.57, 155.07, 130.70, 130.00, 116.23, 79.84, 72.03, 67.62, 49.28, 28.34, 20.48, 18.62, 16.79.
294	(薄膜) 3365, 2976, 1711, 1493, 1239, 1161, 1057, 751, 692	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₂₉ NNaO ₅ の計 算値 374.1938; 実 測値 374.1948	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.33 – 7.21 (m, 2H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.91 – 6.85 (m, 2H), 5.02 (dt, <i>J</i> = 8.6, 4.5 Hz, 2H), 4.45 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.6 Hz, 1H), 4.32 (q, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 1.84 – 1.67 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.38 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.98, 157.82, 155.06, 129.52, 121.21, 116.26, 79.73, 77.98, 74.52, 49.53, 28.34, 22.93, 18.71, 15.71, 9.79.

10

20

30

40

【表 2 - 1 2 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
295	(薄膜) 3362, 2976, 1711, 1493, 1240, 1162, 1066, 752, 692	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₂₉ NNaO ₅ の計 算値 374.1938; 実 測値 374.1948	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.22 (m, 2H), 6.98 – 6.85 (m, 3H), 5.14 – 5.01 (m, 2H), 4.51 – 4.40 (m, 1H), 4.38 – 4.24 (m, 1H), 1.84 – 1.61 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.31 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 0.94 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 173.29, 157.79, 155.07, 129.55, 121.03, 115.70, 79.75, 77.56, 73.54, 49.42, 28.35, 22.70, 18.79, 15.50, 9.70.
296	(薄膜) 3371, 2979, 1711, 1493, 1234, 1160, 1053, 752, 691	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ NNaO ₆ の計 算値 452.2044; 実 測値 452.2003	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.31 – 7.20 (m, 4H), 6.98 – 6.84 (m, 6H), 5.38 (td, <i>J</i> = 5.9, 3.8 Hz, 1H), 5.04 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.72 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.40 – 4.18 (m, 3H), 1.43 (s, 9H), 1.39 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H), 1.35 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.87, 158.44, 157.43, 155.03, 129.59, 129.49, 121.54, 121.23, 116.32, 114.66, 79.85, 74.93, 72.68, 65.99, 49.43, 28.32, 18.58, 16.16.

10

20

30

40

【表 2 - 1 2 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
297	(薄膜) 3354, 2979, 1712, 1493, 1239, 1162, 1067, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₂₉ NNaO ₆ の計 算値 390.1887; 実 測値 390.1896	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.23 (m, 2H), 6.96 (td, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.93 – 6.87 (m, 2H), 5.19 (td, <i>J</i> = 5.5, 4.4 Hz, 1H), 5.05 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.43 – 4.22 (m, 1H), 3.68 – 3.57 (m, 2H), 3.32 (s, 3H), 1.45 (s, 9H), 1.39 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.82, 157.56, 155.05, 129.55, 121.38, 116.27, 79.79, 75.12, 72.53, 70.67, 59.12, 49.44, 28.34, 18.67, 15.97.
298	(薄膜) 3362, 2978, 1712, 1493, 1163, 1067, 752, 694	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ NNaO ₆ の計 算値 466.2200; 実 測値 466.2197	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.34 – 7.22 (m, 7H), 6.95 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.91 – 6.86 (m, 2H), 5.27 – 5.20 (m, 1H), 5.13 – 4.92 (m, 1H), 4.65 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.56 – 4.42 (m, 2H), 4.33 (q, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.72 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.37 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.78, 157.55, 155.01, 137.82, 129.54, 128.36, 127.68, 127.60, 121.34, 116.22, 79.79, 75.22, 73.26, 72.44, 68.16, 49.40, 28.34, 18.70, 15.97.

10

20

30

40

【表 2 - 1 2 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
299	(薄膜) 3371, 2981, 1708, 1494, 1156, 1069, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₂₅ F ₂ NNaO ₅ の 計算値 396.1593; 実測値 396.1589	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.33 – 7.26 (m, 2H), 7.00 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.93 – 6.88 (m, 2H), 6.08 (td, <i>J</i> = 54.4, 2.9 Hz, 1H), 5.29 (dtd, <i>J</i> = 17.2, 6.4, 2.9 Hz, 1H), 5.02 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 4.71 – 4.59 (m, 1H), 4.47 – 4.31 (m, 1H), 1.45 (s, 9H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.37 (dd, <i>J</i> = 6.3, 1.2 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 129.76 (d, <i>J</i> = 292.4 Hz), -132.83 (d, <i>J</i> = 292.5 Hz).
300	(薄膜) 3362, 2976, 1710, 1493, 1239, 1161, 1051, 752, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₂₁ H ₃₃ NNaO ₆ の計 算値 418.2200; 実 測値 418.2203	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.32 – 7.23 (m, 2H), 6.99 – 6.85 (m, 3H), 5.19 (td, <i>J</i> = 5.6, 4.4 Hz, 1H), 5.06 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.62 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.41 – 4.24 (m, 1H), 3.65 (h, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 3.36 (ddt, <i>J</i> = 31.1, 9.1, 6.6 Hz, 2H), 1.53 (h, <i>J</i> = 7.1 Hz, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.39 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.87 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.78, 157.63, 155.03, 129.52, 121.31, 116.26, 79.76, 75.25, 73.09, 72.60, 68.64, 49.41, 28.35, 22.83, 18.74, 15.93, 10.50.

10

20

30

40

【表 2 - 1 2 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
304	(薄膜) 3365, 2963, 2934, 2874, 1716, 1501, 1454, 1366, 1210, 1168, 1065	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₃₇ NO ₅ Na の計 算値 382.2564; 実 測値 382.2561	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 5.09 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.85 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 4.39 – 4.20 (m, 1H), 3.52 – 3.34 (m, 3H), 2.09 – 1.95 (m, 1H), 1.56 – 1.47 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.34 – 1.26 (m, 4H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 – 0.86 (m, 9H).	10
305	(薄膜) 3356, 2974, 2936, 2877, 1713, 1501, 1454, 1366, 1165, 1065	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₃ NO ₅ Na の計 算値 366.2251; 実 測値 366.2249	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 5.09 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.86 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.38 – 4.29 (m, 1H), 3.55 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.32 (dd, <i>J</i> = 10.0, 6.7 Hz, 1H), 3.26 (dd, <i>J</i> = 10.0, 6.9 Hz, 1H), 2.11 – 1.98 (m, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.06 – 0.95 (m, 1H), 0.95 – 0.87 (m, 6H), 0.52 – 0.48 (m, 2H), 0.21 – 0.15 (m, 2H).	20
306		ESIMS <i>m/z</i> 358.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 5.09 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 4.85 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 4.41 – 4.26 (m, 1H), 3.53 – 3.33 (m, 3H), 2.49 (hept, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 2.08 – 1.95 (m, 3H), 1.95 – 1.79 (m, 2H), 1.76 – 1.65 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 3H), 0.89 (d, <i>J</i> = 5.6 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.92, 155.02, 79.92, 77.20, 74.33, 73.43, 49.55, 35.28, 28.56, 28.32, 24.99, 24.89, 19.34, 18.98, 18.54, 17.25, 15.37.	30 40

【表 2 - 1 3 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
307	(薄膜) 3362, 2963, 2934, 2875, 1715, 1501, 1454, 1366, 1166, 1101, 1066	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₈ H ₃₅ NO ₅ Na の計 算値 368.2407; 実 測値 368.2405	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 5.08 (d, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 4.85 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 4.37 – 4.28 (m, 1H), 3.52 – 3.35 (m, 3H), 2.08 – 1.95 (m, 1H), 1.55 – 1.46 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.41 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39 – 1.30 (m, 2H), 1.11 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.93 – 0.87 (m, 9H).	10
308	(薄膜) 3356, 2974, 2932, 2877, 1715, 1501, 1454, 1366, 1166, 1104, 1065	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+Na] ⁺) C ₁₉ H ₃₅ NO ₅ Na の計 算値 380.2407; 実 測値 380.2407	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 5.08 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 4.86 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.33 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 3.57 – 3.42 (m, 3H), 2.04 (h, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.42 – 1.34 (m, 5H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.90 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 6H), 0.76 – 0.66 (m, 1H), 0.45 – 0.36 (m, 2H), 0.06 – 0.01 (m, 2H).	20
309		ESIMS <i>m/z</i> 314.2 ([M+H] ⁺)		30
310		ESIMS <i>m/z</i> 298.2 ([M+H] ⁺)		
311		ESIMS <i>m/z</i> 298.2 ([M+H] ⁺)		40

【表 2 - 1 3 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
312		ESIMS <i>m/z</i> 256.2 ([M+H] ⁺)	10
313		ESIMS <i>m/z</i> 280.2 ([M+H] ⁺)	
314		ESIMS <i>m/z</i> 280.2 ([M+H] ⁺)	20
315		ESIMS <i>m/z</i> 238.2 ([M+H] ⁺)	
316		ESIMS <i>m/z</i> 252.2 ([M+H] ⁺)	30
317		ESIMS <i>m/z</i> 252.2 ([M+H] ⁺)	40

【表 2 - 1 3 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
318		ESIMS <i>m/z</i> 250.2 ([M+H] ⁺)	10
319		ESIMS <i>m/z</i> 250.2 ([M+H] ⁺)	
320		ESIMS <i>m/z</i> 330.2 ([M+H] ⁺)	20
321		ESIMS <i>m/z</i> 268.2 ([M+H] ⁺)	
322		ESIMS <i>m/z</i> 344.2 ([M+H] ⁺)	30
323		ESIMS <i>m/z</i> 274.1 ([M+H] ⁺)	40

【表 2 - 1 3 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
324		ESIMS <i>m/z</i> 296.2 ([M+H] ⁺)	
325		ESIMS <i>m/z</i> 324.2 ([M+H] ⁺)	
326	(薄膜) 3392, 2964, 2876, 1743, 1602, 1496, 1453, 1374, 1236, 1206, 1099, 1026, 911, 736, 697	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₆ H ₂₆ NO ₃ の計算 値 280.1907; 実測 値 280.1897	
327	(薄膜) 3394, 2956, 2871, 1744, 1598, 1513, 1464, 1368, 1235, 1207, 1117, 1101, 910	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₄ H ₃₀ NO ₃ の計算 値 260.2220; 実測 値 260.2197	
328	(薄膜) 3396, 2959, 2932, 2873, 1744, 1622, 1515, 1460, 1377, 1237, 1209, 1102, 912, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₄ H ₃₀ NO ₃ の計算 値 260.2220; 実測 値 260.2213	

【表 2 - 1 3 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
329	(薄膜) 3387, 2966, 1743, 1627, 1521, 1461, 1388, 1239, 1211, 1117, 1040, 911	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₃ H ₂₆ NO ₃ の計算 値 244.1907; 実測 値 244.1901	
330	(薄膜) 3396, 2966, 2934, 2874, 1744, 1598, 1515, 1465, 1240, 1207, 1103, 911, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₄ H ₂₈ NO ₃ の計算 値 258.2064; 実測 値 258.2056	
331	(薄膜) 3389, 2960, 2933, 2873, 1744, 1599, 1513, 1462, 1378, 1236, 1207, 1116, 1101, 910, 737	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₃ H ₂₈ NO ₃ の計算 値 246.2064; 実測 値 246.2061	
332	(薄膜) 3395, 2964, 2931, 1744, 1620, 1515, 1461, 1377, 1237, 1209, 1103, 912, 737	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₁₄ H ₂₈ NO ₃ の計算 値 258.2064; 実測 値 258.2053	

10

20

30

40

【表 2 - 1 3 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
333	(薄膜) 3369, 2980, 1741, 1649, 1528, 1453, 1240, 752	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₂₉ N ₂ O ₆ の計算 値 465.2020; 実測 値 465.1996	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (s, 1H), 8.35 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 7.32 – 7.14 (m, 6H), 6.95 (td, <i>J</i> = 7.3, 1.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.83 (m, 3H), 5.36 (dt, <i>J</i> = 9.0, 4.5 Hz, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.51 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.6 Hz, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.13 (dd, <i>J</i> = 14.3, 4.5 Hz, 1H), 3.03 (dd, <i>J</i> = 14.3, 9.0 Hz, 1H), 2.02 – 1.85 (m, 1H), 1.36 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.54, 168.68, 157.56, 155.38, 148.79, 140.43, 136.76, 130.47, 129.56, 129.40, 128.41, 126.70, 121.35, 116.24, 109.48, 77.45, 74.16, 56.07, 47.95, 36.05, 17.94, 15.78.

10

20

30

40

【表 2 - 1 3 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
334	(薄膜) 3371, 2968, 1743, 1651, 1497, 1207, 802	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₀ FN ₂ O ₆ の計 算値 449.2082; 実 測値 449.2074	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.96 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.89 – 6.68 (m, 4H), 5.02 (t, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.48 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.20 – 2.08 (m, 4H), 1.48 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.23 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (dd, <i>J</i> = 6.8, 2.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.00, 168.73, 156.80 (d, <i>J</i> = 238.3 Hz), 155.40, 151.52 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), 148.80, 140.43, 130.49, 129.69 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz), 117.52 (d, <i>J</i> = 22.6 Hz), 112.78 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz), 112.34 (d, <i>J</i> = 22.8 Hz), 109.45, 81.24, 73.60, 56.07, 48.07, 28.71, 19.50, 18.33, 17.22, 16.39, 15.88. ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 124.25 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 3 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
337	(薄膜) 3372, 2968, 1742, 1651, 1509, 1241, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₁ N ₂ O ₆ の計算 値 431.2177; 実測 値 431.2157	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.51 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.04 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.81 – 6.72 (m, 2H), 4.99 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.78 – 4.70 (m, 1H), 4.48 (t, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (d, <i>J</i> = 2.0 Hz, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.13 (ddd, <i>J</i> = 13.6, 12.3, 6.4 Hz, 1H), 1.47 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (dd, <i>J</i> = 6.8, 2.2 Hz, 6H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.18, 168.72, 155.57, 155.37, 148.79, 140.43, 130.60, 130.29, 129.95, 115.67, 109.43, 81.31, 73.34, 56.06, 48.04, 28.60, 20.45, 19.52, 18.49, 17.11, 15.99.	10 20
338	(薄膜) 3369, 2967, 1741, 1649, 1508, 1263, 801, 731	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₃₁ N ₂ O ₆ の計算 値 431.2177; 実測 値 431.2153	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.16 (s, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.10 – 7.00 (m, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.80 – 6.72 (m, 2H), 5.06 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.46 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.17 – 2.08 (m, 1H), 1.60 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.96 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.72, 168.82, 155.39, 155.27, 148.80, 140.49, 130.53, 130.48, 130.00, 115.95, 109.50, 80.41, 72.91, 56.07, 48.17, 28.71, 20.47, 19.37, 18.45, 17.11, 15.53.	30 40

【表 2 - 1 3 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
339	(薄膜) 3364, 2981, 1742, 1648, 1529, 1238, 801, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₀ H ₂₅ N ₂ O ₆ の計算 値 389.1707; 実測 値 389.1695	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.09 (s, 1H), 8.45 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.11 – 7.00 (m, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.84 – 6.77 (m, 2H), 4.71 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.58 (pd, <i>J</i> = 6.4, 4.0 Hz, 1H), 4.39 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.7 Hz, 1H), 4.22 (dd, <i>J</i> = 11.5, 4.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.51 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.04, 168.80, 155.55, 155.40, 148.80, 140.48, 130.73, 130.45, 129.99, 116.25, 109.50, 72.05, 67.91, 56.07, 47.89, 20.48, 18.18, 16.75.
340	(薄膜) 3369, 2973, 1740, 1648, 1454, 1239, 800, 730	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₇ N ₂ O ₆ の計算 値 403.1864; 実測 値 403.1849	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.15 (s, 1H), 8.49 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.31 – 7.19 (m, 2H), 6.98 – 6.85 (m, 3H), 5.07 (dt, <i>J</i> = 7.8, 4.7 Hz, 1H), 4.71 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.48 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.4 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.02 – 1.69 (m, 3H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.90, 168.80, 157.75, 155.40, 148.81, 140.48, 130.52, 129.53, 121.26, 116.24, 109.50, 78.44, 74.46, 56.07, 48.14, 22.86, 18.29, 15.65, 9.81.

【表 2 - 1 4 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
341	(薄膜) 3368, 2974, 1739, 1648, 1528, 1481, 1240, 800, 732	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₇ N ₂ O ₆ の計算 値 403.1864; 実測 値 403.1825	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (s, 1H), 8.50 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.30 – 7.19 (m, 2H), 6.96 – 6.85 (m, 3H), 5.10 (ddd, <i>J</i> = 9.3, 5.6, 4.1 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 4.48 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.01 – 1.61 (m, 3H), 1.48 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.5 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 172.12, 168.77, 157.75, 155.40, 148.80, 140.47, 130.54, 129.54, 121.06, 115.72, 109.47, 78.03, 73.61, 56.07, 48.05, 22.74, 18.37, 15.55, 9.69.
342	(薄膜) 3370, 2983, 1743, 1649, 1528, 1481, 1240, 801, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₅ N ₂ O ₆ の計算 値 401.1707; 実測 値 401.1683	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.31 – 7.22 (m, 2H), 7.03 – 6.85 (m, 3H), 5.96 (ddd, <i>J</i> = 17.3, 10.6, 6.7 Hz, 1H), 5.52 – 5.28 (m, 3H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.54 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.6 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.00 – 1.85 (m, 1H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.21, 168.81, 157.75, 155.39, 148.80, 140.48, 131.89, 130.49, 129.53, 121.45, 119.72, 116.49, 109.50, 77.75, 75.01, 56.07, 47.99, 18.13, 15.50.

【表 2 - 1 4 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
343	(薄膜) 3369, 2982, 1743, 1648, 1528, 1481, 1240, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₅ N ₂ O ₆ の計算 値 401.1707; 実測 値 401.1686	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.09 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.31 – 7.20 (m, 2H), 6.94 – 6.89 (m, 2H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.90 (ddd, <i>J</i> = 17.2, 10.6, 6.6 Hz, 1H), 5.52 (tt, <i>J</i> = 6.5, 1.2 Hz, 1H), 5.44 (dt, <i>J</i> = 17.3, 1.3 Hz, 1H), 5.35 (dt, <i>J</i> = 10.6, 1.3 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.51 (p, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 3.93 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 3H), 2.02 – 1.85 (m, 1H), 1.46 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.29 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.38, 168.75, 157.69, 155.38, 148.78, 140.47, 131.70, 130.47, 129.54, 121.23, 119.91, 115.87, 109.49, 77.43, 74.08, 56.07, 48.02, 18.26, 15.74.
344	(薄膜) 3366, 2939, 1746, 1528, 1481, 1239, 1049, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₂₉ N ₂ O ₇ の計算 値 481.1969; 実測 値 481.1955	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.09 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.34 – 7.18 (m, 4H), 7.01 – 6.80 (m, 7H), 5.43 (td, <i>J</i> = 5.9, 3.7 Hz, 1H), 4.80 – 4.67 (m, 2H), 4.36 – 4.22 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.76, 168.87, 158.42, 157.40, 155.38, 148.80, 140.48, 130.42, 129.60, 129.49, 121.58, 121.26, 116.31, 114.66, 109.51, 75.36, 72.71, 65.94, 56.05, 48.06, 18.11, 16.18.

【表 2 - 1 4 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
345	(薄膜) 3366, 2937, 1744, 1528, 1481, 1240, 1042, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₁ H ₂₇ N ₂ O ₇ の計算 値 419.1813; 実測 値 419.1797	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (s, 1H), 8.48 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.31 – 7.21 (m, 2H), 7.01 – 6.83 (m, 4H), 5.24 (td, <i>J</i> = 5.6, 4.3 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.62 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.66 (dd, <i>J</i> = 4.9, 1.5 Hz, 2H), 3.33 (s, 3H), 1.57 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.72, 168.83, 157.52, 155.40, 148.80, 140.49, 130.50, 129.55, 121.42, 116.26, 109.51, 75.53, 72.58, 70.61, 59.14, 56.07, 48.06, 18.19, 15.97.
346	(薄膜) 3367, 2938, 1743, 1528, 1481, 1240, 1043, 732	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₇ H ₃₁ N ₂ O ₇ の計算 値 495.2126; 実測 値 495.2116	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.12 (s, 1H), 8.47 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.97 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.36 – 7.18 (m, 7H), 6.95 (tt, <i>J</i> = 7.2, 1.1 Hz, 1H), 6.92 – 6.87 (m, 2H), 6.85 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.32 – 5.24 (m, 1H), 4.79 – 4.63 (m, 2H), 4.55 – 4.44 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.76 (d, <i>J</i> = 4.9 Hz, 2H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.68, 168.82, 157.52, 155.39, 148.80, 140.48, 137.80, 130.48, 129.54, 128.36, 127.67, 127.56, 121.38, 116.23, 109.50, 75.68, 73.28, 72.47, 68.11, 56.06, 48.05, 18.20, 16.00.

【表 2 - 1 4 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
347	(薄膜) 3366, 2986, 1759, 1649, 1529, 1241, 1146, 1041, 755	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₀ H ₂₃ F ₂ N ₂ O ₆ の計 算値 425.1519; 実 測値 425.1508	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 12.01 (s, 1H), 8.44 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.35 – 7.23 (m, 2H), 7.04 – 6.95 (m, 1H), 6.93 – 6.89 (m, 2H), 6.88 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.29 – 5.96 (m, 1H), 5.33 (dtd, <i>J</i> = 17.3, 6.3, 3.0 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.71 – 4.61 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 1.61 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.38 (dd, <i>J</i> = 6.3, 1.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.29, 168.98, 156.67, 155.45, 148.86, 140.57, 130.34, 129.72, 122.08, 116.38, 112.82 (dd, <i>J</i> = 245.6, 243.0 Hz), 109.61, 73.45 (dd, <i>J</i> = 22.7, 20.6 Hz), 71.70 – 71.53 (m), 56.10, 47.90, 17.96, 16.06 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 129.59 (dd, <i>J</i> = 292.9, 2.5 Hz), - 132.79 (dd, <i>J</i> = 293.3, 4.2 Hz).

10

20

30

40

【表 2 - 1 4 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
350	(薄膜) 3368, 2966, 2876, 1738, 1648, 1615, 1575, 1527, 1480, 1437, 1279, 1262, 1211, 1095, 1062, 943, 732	ESIMS <i>m/z</i> 431.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (s, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 7.31 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 4H), 7.26 (s, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 5.03 – 4.95 (m, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.56 – 4.50 (m, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.71 – 3.62 (m, 1H), 2.11 – 2.01 (m, 1H), 1.57 (d, <i>J</i> = 2.8 Hz, 3H), 1.18 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.90 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.90 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). 10
			¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.89, 168.70, 155.34, 148.74, 140.46, 138.30, 130.54, 128.34, 127.72, 127.57, 109.41, 80.13, 73.63, 70.65, 56.07, 48.13, 28.57, 19.35, 18.52, 17.48, 15.17. 20
351	(薄膜) 3370, 2958, 2872, 1739, 1649, 1576, 1527, 1480, 1452, 1438, 1330, 1280, 1263, 1242, 1211, 1150, 1122, 1097, 1061, 943, 849, 801, 733	ESIMS <i>m/z</i> 411.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.89 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.75 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.54 – 3.44 (m, 2H), 3.41 (dt, <i>J</i> = 9.0, 6.8 Hz, 1H), 2.11 – 1.98 (m, 1H), 1.67 (dp, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.57 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 3H), 1.48 – 1.33 (m, <i>J</i> = 6.8 Hz, 2H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.87 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.87 (d, <i>J</i> = 6.6 Hz, 3H). 30
			¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.82, 168.69, 155.34, 148.73, 140.46, 130.55, 109.40, 80.40, 74.24, 67.28, 56.07, 48.14, 38.86, 28.54, 24.93, 22.69, 22.49, 19.39, 18.55, 17.31, 15.34. 40

【表 2 - 1 4 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
352	(薄膜) 3368, 2960, 2934, 2873, 1740, 1650, 1576, 1527, 1481, 1452, 1378, 1332, 1280, 1263, 1242, 1211, 1151, 1099, 1061, 945, 910, 849, 801, 736	ESIMS <i>m/z</i> 411.3 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.98 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> = 5.9 Hz, 1H), 4.75 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.54 – 3.35 (m, 3H), 2.09 – 1.99 (m, 1H), 1.57 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 3H), 1.54 – 1.46 (m, 2H), 1.33 – 1.24 (m, 4H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.91 (dd, <i>J</i> = 6.8, 1.1 Hz, 6H), 0.89 – 0.85 (m, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.82, 168.69, 155.34, 148.73, 140.46, 130.55, 109.40, 80.33, 74.23, 69.05, 56.07, 48.14, 29.71, 28.55, 28.34, 22.50, 19.37, 18.56, 17.34, 15.36, 14.01.
353	(薄膜) 3369, 2966, 2876, 1738, 1648, 1576, 1526, 1480, 1438, 1327, 1279, 1262, 1242, 1211, 1150, 1092, 1062, 1040, 944, 849, 800, 733	ESIMS <i>m/z</i> 395.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 4.91 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.80 – 4.72 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.57 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.32 (dd, <i>J</i> = 9.9, 6.7 Hz, 1H), 3.27 (dd, <i>J</i> = 9.9, 6.9 Hz, 1H), 2.11 – 2.01 (m, 1H), 1.59 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.13 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.07 – 0.95 (m, 1H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.52 – 0.44 (m, 2H), 0.20 – 0.16 (m, 2H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.84, 168.70, 155.34, 148.73, 140.46, 130.55, 109.40, 80.08, 73.84, 73.57, 56.07, 48.14, 28.57, 19.35, 18.55, 17.40, 15.45, 10.81, 2.96, 2.94.

【表 2 - 1 4 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
354	(薄膜) 3365, 2966, 2936, 2875, 1740, 1649, 1576, 1528, 1481, 1452, 1378, 1328, 1280, 1264, 1183, 1151, 1126, 1061, 944, 849, 801, 737	ESIMS <i>m/z</i> 409.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.53 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.86 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.75 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.50 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.44 (dd, <i>J</i> = 9.1, 6.5 Hz, 1H), 3.38 (dd, <i>J</i> = 9.1, 6.8 Hz, 1H), 2.55 – 2.43 (m, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 2.09 – 1.96 (m, 3H), 1.92 – 1.76 (m, 2H), 1.75 – 1.65 (m, 2H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H).
355	(薄膜) 3367, 2961, 2934, 2873, 1739, 1649, 1576, 1526, 1480, 1451, 1438, 1378, 1330, 1279, 1263, 1211, 1182, 1150, 1096, 1060, 943, 849, 801	ESIMS <i>m/z</i> 397.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (d, <i>J</i> = 0.6 Hz, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.90 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.79 – 4.70 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.55 – 3.35 (m, 3H), 2.09 – 1.99 (m, 1H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.53 – 1.45 (m, 2H), 1.39 – 1.28 (m, 2H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.88 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.82, 168.70, 155.34, 148.73, 140.46, 130.55, 109.40, 80.35, 74.23, 68.74, 56.07, 48.14, 32.12, 28.54, 19.36, 18.55, 17.33, 15.36, 13.89.

【表 2 - 1 4 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
356	(薄膜) 3371, 2966, 2935, 2876, 1739, 1648, 1576, 1526, 1480, 1438, 1330, 1263, 1242, 1211, 1183, 1150, 1100, 1060, 944, 800	ESIMS <i>m/z</i> 409.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 12.18 (s, 1H), 8.54 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.99 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 6.87 (d, <i>J</i> = 5.2 Hz, 1H), 4.91 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.75 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.57 – 3.50 (m, 2H), 3.47 (dt, <i>J</i> = 8.9, 6.8 Hz, 1H), 2.10 – 1.99 (m, 1H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.49 – 1.33 (m, 2H), 1.13 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.76 – 0.66 (m, 1H), 0.42 – 0.35 (m, 2H), 0.06 – 0.00 (m, 2H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.82, 168.69, 155.34, 148.73, 140.46, 130.54, 109.40, 80.36, 74.35, 69.07, 56.07, 48.14, 35.13, 28.57, 19.36, 18.55, 17.38, 15.35, 7.93, 4.23, 4.11.
357	(薄膜) 3372, 2983, 1770, 1675, 1507, 1196, 909, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₈ H ₃₁ N ₂ O ₇ の計算 値 507.2126; 実測 値 507.2113	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.42 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 7.34 – 7.12 (m, 7H), 7.05 – 6.82 (m, 4H), 5.35 (dt, <i>J</i> = 8.6, 4.8 Hz, 1H), 4.67 – 4.54 (m, 1H), 4.47 (qd, <i>J</i> = 6.2, 4.8 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.18 – 2.91 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.26 – 1.20 (m, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.07, 168.94, 162.36, 159.45, 157.46, 146.66, 141.47, 137.49, 136.80, 129.56, 129.48, 128.40, 126.67, 121.24, 116.15, 109.77, 77.11, 73.99, 56.31, 48.00, 36.25, 20.77, 18.30, 15.71.

【表 2 - 1 4 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
358	(薄膜) 3381, 2968, 1771, 1676, 1496, 1200, 909, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₂ FN ₂ O ₇ の計 算値 491.2188; 実 測値 491.2183	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 7.01 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.90 – 6.75 (m, 2H), 6.71 (dd, <i>J</i> = 8.8, 4.7 Hz, 1H), 5.08 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.85 – 4.72 (m, 1H), 4.43 (p, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.24 – 2.00 (m, 4H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.93 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 124.13 .
359	(薄膜) 3376, 1770, 1675, 1496, 1199, 909, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₆ FN ₂ O ₇ の計 算値 449.1719; 実 測値 449.1712	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.48 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 8.30 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.89 – 6.75 (m, 3H), 4.72 (dq, <i>J</i> = 8.0, 7.2 Hz, 1H), 4.51 (pd, <i>J</i> = 6.3, 4.1 Hz, 1H), 4.38 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.5 Hz, 1H), 4.21 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.0 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.17 (t, <i>J</i> = 0.5 Hz, 3H), 1.47 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.53, 168.93, 162.47, 159.46, 157.15 (d, <i>J</i> = 238.8 Hz), 151.83 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), 146.65, 141.34, 137.52, 130.08 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz), 117.42 (d, <i>J</i> = 22.5 Hz), 114.85 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz), 112.55 (d, <i>J</i> = 22.6 Hz), 109.82, 73.00, 67.70, 56.45 – 56.15 (m), 47.86, 20.76, 18.41, 16.86, 16.42. ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 123.40 .

【表 2 - 1 5 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
360	(薄膜) 3388, 2976, 1772, 1679, 1509, 1201, 910, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₇ の計算 値 473.2282; 実測 値 473.2272	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.11 – 6.96 (m, 3H), 6.85 – 6.67 (m, 2H), 4.98 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.82 – 4.67 (m, 1H), 4.55 – 4.39 (m, 1H), 3.91 (d, <i>J</i> = 1.4 Hz, 3H), 2.39 (d, <i>J</i> = 1.9 Hz, 3H), 2.27 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz, 3H), 2.16 – 2.05 (m, 1H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.95 (dd, <i>J</i> = 6.8, 3.1 Hz, 6H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.73, 168.95, 162.38, 159.42, 155.55, 146.69, 141.58, 137.46, 130.20, 129.95, 115.63, 109.71, 80.97, 73.31, 56.26, 48.08, 28.55, 20.77, 20.49, 19.50, 18.81, 17.13, 15.92.
361	(薄膜) 3380, 2968, 1771, 1676, 1508, 1199, 909, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₇ の計算 値 473.2282; 実測 値 473.2270	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 7.12 – 6.95 (m, 3H), 6.82 – 6.73 (m, 2H), 5.05 (dd, <i>J</i> = 6.3, 5.2 Hz, 1H), 4.83 – 4.69 (m, 1H), 4.44 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.20 – 2.05 (m, 1H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 0.95 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.25, 168.95, 162.46, 159.46, 155.23, 146.70, 141.51, 137.50, 130.38, 129.99, 115.87, 109.78, 80.10, 72.74, 56.31, 48.26, 28.67, 20.77, 20.49, 19.37, 18.77, 16.98, 15.56.

【表 2 - 1 5 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
362	(薄膜) 3380, 2983, 1770, 1675, 1508, 1175, 908, 824, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₇ N ₂ O ₇ の計算 値 431.1813; 実測 値 431.1805	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.50 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 7.10 – 6.97 (m, 3H), 6.87 – 6.76 (m, 2H), 4.78 – 4.66 (m, 1H), 4.57 (pd, <i>J</i> = 6.3, 4.3 Hz, 1H), 4.38 (dd, <i>J</i> = 11.4, 6.5 Hz, 1H), 4.18 (dd, <i>J</i> = 11.4, 4.4 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.46 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.58, 168.94, 162.47, 159.45, 155.52, 146.68, 141.43, 137.51, 130.66, 129.99, 116.20, 109.79, 71.97, 67.68, 56.28, 47.89, 20.77, 20.50, 18.47, 16.81.
363	(薄膜) 3380, 2976, 1770, 1676, 1507, 1199, 908, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ N ₂ O ₇ の計算 値 445.1969; 実測 値 445.1940	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.53 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.33 – 7.21 (m, 2H), 7.04 – 6.82 (m, 4H), 5.05 (dt, <i>J</i> = 8.1, 4.7 Hz, 1H), 4.78 – 4.66 (m, 1H), 4.45 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.8 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.88 – 1.64 (m, 2H), 1.51 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.41, 168.96, 162.45, 159.46, 157.69, 146.69, 141.50, 137.49, 129.52, 121.16, 116.17, 109.78, 78.10, 74.38, 56.28, 48.18, 23.00, 20.77, 18.61, 15.65, 9.80.

10

20

30

40

【表 2 - 1 5 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)	
364	(薄膜) 3377, 2977, 1770, 1675, 1507, 1200, 908, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ N ₂ O ₇ の計算 値 445.1969; 実測 値 445.1935	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.55 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.19 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.97 – 6.88 (m, 3H), 5.08 (ddd, <i>J</i> = 8.7, 5.5, 4.1 Hz, 1H), 4.80 – 4.67 (m, 1H), 4.54 – 4.43 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.87 – 1.57 (m, 2H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.94 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.67, 168.95, 162.43, 159.44, 157.72, 146.70, 141.51, 137.49, 129.54, 120.99, 115.67, 109.77, 77.60, 73.43, 56.31, 48.07, 22.52, 20.76, 18.66, 15.42, 9.72.	10 20
365	(薄膜) 3377, 2986, 1770, 1676, 1507, 1197, 1174, 1063, 910, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₇ N ₂ O ₇ の計算 値 443.1813; 実測 値 443.1799	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.52 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.34 – 7.19 (m, 3H), 7.04 – 6.86 (m, 4H), 5.94 (ddd, <i>J</i> = 17.2, 10.6, 6.6 Hz, 1H), 5.52 – 5.26 (m, 3H), 4.74 (dq, <i>J</i> = 8.0, 7.2 Hz, 1H), 4.52 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.9 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.40 (s, 2H), 1.49 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 171.72, 168.96, 162.46, 159.45, 157.71, 146.68, 141.45, 137.50, 132.04, 129.53, 121.38, 119.54, 116.46, 109.79, 99.99, 75.01, 56.28, 48.01, 20.77, 18.48, 15.51.	30 40

【表 2 - 1 5 3】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
366	(薄膜) 3378, 2984, 1769, 1675, 1507, 1197, 1174, 908, 734	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₇ N ₂ O ₇ の計算 値 443.1813; 実測 値 443.1800	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.53 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 8.31 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.33 – 7.21 (m, 2H), 6.99 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.97 – 6.89 (m, 3H), 5.89 (ddd, <i>J</i> = 17.1, 10.6, 6.4 Hz, 1H), 5.51 (tt, <i>J</i> = 6.3, 1.2 Hz, 1H), 5.47 – 5.28 (m, 2H), 4.73 (dq, <i>J</i> = 8.1, 7.2 Hz, 1H), 4.51 (p, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.42 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 171.92, 168.94, 162.43, 159.44, 157.66, 146.69, 141.44, 137.49, 131.65, 129.55, 121.17, 119.69, 115.82, 109.79, 76.91, 73.89, 56.28, 48.02, 20.76, 18.59, 15.62.
367	(薄膜) 3381, 2984, 1744, 1674, 1494, 1200, 1002, 969, 731	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₉ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計算 値 537.2231; 実測 値 537.2219	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.25 (t, <i>J</i> = 6.2 Hz, 2H), 7.32 – 7.14 (m, 7H), 7.00 – 6.91 (m, 2H), 6.91 – 6.83 (m, 2H), 5.72 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 2H), 5.42 – 5.30 (m, 1H), 4.63 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.49 (qd, <i>J</i> = 6.3, 4.9 Hz, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.14 (dd, <i>J</i> = 14.3, 4.6 Hz, 1H), 3.02 (dd, <i>J</i> = 14.3, 8.8 Hz, 1H), 2.05 (s, 3H), 1.36 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.20, 170.31, 162.94, 160.26, 157.47, 145.71, 144.00, 142.42, 136.84, 129.56, 129.47, 128.40, 126.66, 121.26, 116.15, 109.57, 89.56, 77.12, 74.05, 56.21, 48.17, 36.24, 20.87, 18.17, 15.79.

【表 2 - 1 5 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
368	(薄膜) 3379, 2972, 1744, 1675, 1496, 1202, 1003, 968, 733	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₄ N ₂ O ₈ の計算 値 521.2294; 実測 値 521.2289	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.95 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.86 – 6.69 (m, 3H), 5.73 (d, <i>J</i> = 3.2 Hz, 2H), 5.01 (t, <i>J</i> = 5.7 Hz, 1H), 4.86 – 4.73 (m, 1H), 4.47 (h, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.20 – 2.11 (m, 4H), 2.07 (s, 3H), 1.44 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.23 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.97 (dd, <i>J</i> = 6.8, 1.9 Hz, 6H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.68, 170.30, 162.95, 160.26, 156.72 (d, <i>J</i> = 237.8 Hz), 151.53 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), 145.71, 143.99, 142.44, 129.64 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz), 117.49 (d, <i>J</i> = 22.9 Hz), 112.69 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz), 112.33 (d, <i>J</i> = 22.9 Hz), 109.55, 89.55, 80.93, 73.56, 56.17, 48.25, 28.66, 20.87, 19.47, 18.53, 17.25, 16.44, 15.84. ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 124.35 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 5 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
369	(薄膜) 3380, 2969, 1744, 1675, 1496, 1200, 1002, 969, 732	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₄ FN ₂ O ₈ の計 算値 521.2297; 実 測値 521.2287	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.41 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.96 (s, 1H), 6.87 – 6.68 (m, 3H), 5.75 (d, <i>J</i> = 2.0 Hz, 2H), 5.09 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.89 – 4.76 (m, 1H), 4.44 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.17 – 2.10 (m, 4H), 2.07 (s, 3H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.98 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.94 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.43, 170.32, 163.01, 160.29, 156.87 (d, <i>J</i> = 238.2 Hz), 151.34 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz), 145.73, 144.05, 142.39, 129.83 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz), 117.57 (d, <i>J</i> = 22.6 Hz), 113.23 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz), 112.37 (d, <i>J</i> = 22.7 Hz), 109.59, 89.60, 80.14, 73.20, 56.22, 48.34, 28.80, 20.87, 19.37, 18.70, 17.32, 16.58, 15.15. ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ - 124.10 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 5 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
375	(薄膜) 3378, 2978, 1742, 1675, 1495, 1201, 1003, 967, 732	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₃₁ N ₂ O ₈ の計算 値 475.2075; 実測 値 475.2054	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.37 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.33 – 7.18 (m, 2H), 6.99 – 6.88 (m, 4H), 5.74 (d, <i>J</i> = 0.8 Hz, 2H), 5.09 (ddd, <i>J</i> = 8.7, 5.5, 4.1 Hz, 1H), 4.83 – 4.69 (m, 1H), 4.57 – 4.43 (m, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.87 – 1.62 (m, 2H), 1.45 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.95 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 172.79, 170.31, 163.01, 160.26, 157.73, 145.75, 143.99, 142.48, 129.54, 120.98, 115.66, 109.57, 89.56, 77.63, 73.49, 56.18, 48.24, 22.61, 20.90, 18.55, 15.47, 9.73.
376	(薄膜) 3381, 2987, 1749, 1676, 1494, 1235, 1201, 1003, 970, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₄ H ₂₉ N ₂ O ₈ の計算 値 473.1918; 実測 値 473.1912	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 8.35 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.26 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.21 (m, 2H), 7.00 – 6.85 (m, 4H), 5.96 (ddd, <i>J</i> = 17.3, 10.6, 6.6 Hz, 1H), 5.74 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 2H), 5.52 – 5.30 (m, 3H), 4.83 – 4.71 (m, 1H), 4.53 (qd, <i>J</i> = 6.3, 3.8 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.51 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (75 MHz, CDCl ₃) δ 171.83, 170.32, 163.04, 160.27, 157.71, 145.73, 144.02, 142.40, 132.05, 129.52, 121.37, 119.55, 116.44, 109.59, 89.58, 76.63, 74.99, 56.18, 48.20, 20.88, 18.35, 15.55.

【表 2 - 1 6 1】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
379	(薄膜) 3381, 2939, 1770, 1677, 1508, 1198, 755	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₉ N ₂ O ₈ の計算 値 461.1918; 実測 値 461.1882	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.53 (s, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.31 – 7.23 (m, 2H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.95 (tt, <i>J</i> = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.93 – 6.88 (m, 2H), 5.22 (td, <i>J</i> = 5.7, 4.1 Hz, 1H), 4.74 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.68 – 3.60 (m, 2H), 3.32 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.23, 168.93, 162.45, 159.45, 157.49, 146.67, 141.49, 137.51, 129.53, 121.31, 116.21, 109.76, 75.22, 72.43, 70.65, 59.16, 56.29, 48.07, 20.76, 18.53, 15.93.
380	(薄膜) 3381, 2940, 1770, 1677, 1507, 1198, 1174, 736	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₉ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計算 値 537.2231; 実測 値 537.2221	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.52 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.33 – 7.21 (m, 7H), 6.99 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.95 (tt, <i>J</i> = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.89 (dt, <i>J</i> = 7.8, 1.0 Hz, 2H), 5.26 (dt, <i>J</i> = 5.9, 4.8 Hz, 1H), 4.79 – 4.70 (m, 1H), 4.66 (p, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 4.54 – 4.44 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.74 (d, <i>J</i> = 4.9 Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.50 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.20, 168.93, 162.45, 159.45, 157.50, 146.67, 141.48, 137.84, 137.51, 129.53, 128.35, 127.64, 127.57, 121.28, 116.18, 109.76, 75.37, 73.24, 72.33, 68.14, 56.28, 48.06, 20.76, 18.55, 15.96.

【表 2 - 1 6 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
381	(薄膜) 3379, 2942, 1768, 1677, 1507, 1194, 1160, 1041, 909, 735	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₂ H ₂₅ F ₂ N ₂ O ₇ の計 算値 467.1624; 実 測値 467.1613	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.49 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.29 (dd, <i>J</i> = 8.7, 7.3 Hz, 2H), 7.03 – 6.96 (m, 2H), 6.93 – 6.89 (m, 2H), 6.10 (td, <i>J</i> = 54.4, 2.9 Hz, 1H), 5.32 (dtd, <i>J</i> = 17.4, 6.3, 2.9 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.65 (p, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.58 – 1.52 (m, 3H), 1.37 (dd, <i>J</i> = 6.3, 1.0 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ - 129.77 (ddd, <i>J</i> = 292.4, 54.1, 6.2 Hz), -132.75 (dd, <i>J</i> = 293.4, 54.6 Hz).
382	(薄膜) 3381, 2937, 1771, 1678, 1507, 1198, 1174, 1043, 755	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₅ H ₃₃ N ₂ O ₈ の計 算値 489.2231; 実測 値 489.2215	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.54 (s, 1H), 8.33 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.30 – 7.23 (m, 3H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 6.94 (tt, <i>J</i> = 7.4, 1.1 Hz, 1H), 6.92 – 6.88 (m, 2H), 5.22 (td, <i>J</i> = 5.7, 4.2 Hz, 1H), 4.74 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.63 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.67 (h, <i>J</i> = 6.2 Hz, 2H), 3.40 (dt, <i>J</i> = 9.3, 6.6 Hz, 1H), 3.33 (dt, <i>J</i> = 9.2, 6.6 Hz, 1H), 2.39 (s, 3H), 1.53 – 1.50 (m, 4H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.86 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.21, 168.93, 162.43, 159.45, 157.56, 146.67, 141.52, 137.51, 129.51, 121.25, 116.20, 109.75, 75.37, 73.09, 72.51, 68.60, 56.28, 48.05, 22.82, 20.76, 18.58, 15.89, 10.50.

【表 2 - 1 6 4】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
385	(薄膜) 2983, 1750, 1676, 1495, 1201, 1042, 1003, 970, 753	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₃₀ H ₃₅ N ₂ O ₉ の計算 値 567.2337; 実測 値 567.2333	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.35 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.32 – 7.22 (m, 7H), 6.98 – 6.92 (m, 2H), 6.92 – 6.87 (m, 2H), 5.80 – 5.69 (m, 2H), 5.27 (dt, <i>J</i> = 5.8, 4.7 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.67 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.55 – 4.44 (m, 2H), 3.91 (s, 3H), 3.75 (d, <i>J</i> = 4.8 Hz, 2H), 2.06 (s, 3H), 1.52 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.33 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.33, 170.30, 163.03, 160.27, 157.50, 145.72, 144.03, 142.44, 137.83, 129.53, 128.35, 127.64, 127.58, 121.29, 116.17, 109.56, 89.57, 75.39, 73.24, 72.35, 68.16, 56.18, 48.25, 20.88, 18.42, 16.03.
386	(薄膜) 3380, 2988, 1756, 1677, 1496, 1201, 1155, 1041, 1004, 970, 756	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₃ H ₂₇ F ₂ N ₂ O ₈ の計 算値 497.1730; 実 測値 497.1724	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.31 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.29 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 7.34 – 7.27 (m, 2H), 7.00 (tt, <i>J</i> = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.96 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.93 – 6.89 (m, 2H), 6.25 – 5.97 (m, 1H), 5.79 – 5.71 (m, 2H), 5.32 (dtd, <i>J</i> = 17.6, 6.4, 2.9 Hz, 1H), 4.79 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 4.66 (p, <i>J</i> = 6.4 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.58 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.39 (dd, <i>J</i> = 6.3, 1.1 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ - 129.80 (ddd, <i>J</i> = 292.2, 53.9, 6.1 Hz), -132.93 (ddd, <i>J</i> = 292.3, 54.9, 17.7 Hz).

【表 2 - 1 6 5】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
387	(薄膜) 2937, 1750, 1676, 1495, 1201, 1042, 1003, 969, 754	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₆ H ₃₅ N ₂ O ₉ の計算 値 519.2337; 実測 値 519.2327	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.36 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.42 – 7.11 (m, 2H), 6.97 – 6.89 (m, 4H), 5.78 – 5.72 (m, 2H), 5.22 (td, <i>J</i> = 5.7, 4.1 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.64 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.72 – 3.64 (m, 2H), 3.40 (dt, <i>J</i> = 9.2, 6.6 Hz, 1H), 3.33 (dt, <i>J</i> = 9.2, 6.6 Hz, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.53 (dd, <i>J</i> = 7.3, 1.4 Hz, 5H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.86 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.34, 170.30, 163.02, 160.26, 157.56, 145.72, 144.02, 142.48, 129.51, 121.26, 116.20, 109.55, 89.58, 75.41, 73.09, 72.52, 68.63, 56.18, 48.24, 22.81, 20.88, 18.46, 15.97, 10.50.
388	(薄膜) 2955, 1752, 1677, 1495, 1201, 1043, 1004, 971, 830, 737	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) ([M+H] ⁺) C ₂₈ H ₃₉ N ₂ O ₉ の計算 値 547.2650; 実測 値 547.2643	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.35 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.28 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.26 (s, 2H), 6.98 – 6.87 (m, 4H), 5.80 – 5.71 (m, 2H), 5.21 (td, <i>J</i> = 5.6, 4.2 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.63 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.72 – 3.64 (m, 2H), 3.46 (dt, <i>J</i> = 9.4, 6.7 Hz, 1H), 3.39 (dt, <i>J</i> = 9.4, 6.7 Hz, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.63 (dp, <i>J</i> = 13.4, 6.7 Hz, 1H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.40 (q, <i>J</i> = 6.8 Hz, 2H), 1.34 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.85 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.34, 170.30, 163.02, 160.27, 157.56, 145.72, 144.02, 142.49, 129.51, 121.25, 116.17, 109.55, 89.58, 75.42, 72.47, 69.89, 68.68, 56.18, 48.23, 38.40, 24.96, 22.60, 22.56, 20.88, 18.44, 15.96.

【表 2 - 1 6 6】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
389	(薄膜) 3377, 2967, 1740, 1675, 1579, 1504, 1454, 1310, 1237, 1202, 1180, 1062 1041, 1003, 968, 830, 738, 699	ESIMS <i>m/z</i> 503.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.42 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.31 (d, <i>J</i> = 4.4 Hz, 4H), 7.26 (s, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.76 – 5.71 (m, 2H), 4.97 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.78 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.56 (d, <i>J</i> = 11.7 Hz, 1H), 4.51 (d, <i>J</i> = 11.7 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.65 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 2.13 – 2.03 (m, 4H), 1.55 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.19 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.90 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.52 , 170.30 , 162.95 , 160.28 , 145.69 , 144.03 , 142.53 , 138.38 , 128.33 , 127.72 , 127.54 , 109.52 , 89.63 , 79.98 , 73.67 , 70.64 , 56.18 , 48.40 , 28.53 , 20.89 , 19.44 , 18.76 , 17.24 , 15.35 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 6 7】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
390	(薄膜) 3379, 2958, 2872, 1741, 1676, 1579, 1504, 1463, 1339, 1201, 1179, 1100, 1042, 1003, 968, 829, 737	ESIMS <i>m/z</i> 483.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.42 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.80 – 5.72 (m, 2H), 4.87 (dd, <i>J</i> = 6.3, 5.2 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.55 – 3.46 (m, 2H), 3.40 (dt, <i>J</i> = 9.0, 6.8 Hz, 1H), 2.11 – 2.02 (m, 4H), 1.71 – 1.63 (m, 1H), 1.55 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.46 – 1.34 (m, 2H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.88 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.87 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.45 , 170.30 , 162.94 , 160.28 , 145.69 , 144.02 , 142.55 , 109.51 , 89.63 , 80.23 , 74.27 , 67.27 , 56.17 , 48.40 , 38.88 , 28.49 , 24.93 , 22.70 , 22.49 , 20.90 , 19.48 , 18.79 , 17.07 , 15.53 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 6 8】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
391	(薄膜) 3380, 2960, 2934, 2873, 1740, 1675, 1579, 1503, 1457, 1309, 1236, 1200, 1154, 1099, 1041, 1002, 967, 911, 829, 731	ESIMS <i>m/z</i> 483.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.42 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.79 – 5.69 (m, 2H), 4.88 (dd, <i>J</i> = 6.2, 5.3 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.54 – 3.43 (m, 2H), 3.38 (dt, <i>J</i> = 8.9, 6.7 Hz, 1H), 2.13 – 2.01 (m, 4H), 1.55 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.54 – 1.47 (m, 2H), 1.34 – 1.23 (m, 4H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.91 – 0.84 (m, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.45 , 170.30 , 162.94 , 160.28 , 145.69 , 144.02 , 142.55 , 109.51 , 89.64 , 80.18 , 74.26 , 69.04 , 56.17 , 48.40 , 29.72 , 28.50 , 28.34 , 22.50 , 20.90 , 19.47 , 18.79 , 17.10 , 15.56 , 14.03 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 6 9】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
392	(薄膜) 3378, 2968, 2876, 1741, 1676, 1579, 1504, 1460, 1310, 1236, 1202, 1180, 1062, 1041, 1004, 969, 930	ESIMS <i>m/z</i> 467.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.42 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.79 – 5.70 (m, 2H), 4.89 (dd, <i>J</i> = 6.2, 5.4 Hz, 1H), 4.77 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.56 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.33 (dd, <i>J</i> = 9.9, 6.7 Hz, 1H), 3.26 (dd, <i>J</i> = 9.9, 6.9 Hz, 1H), 2.14 – 2.03 (m, 4H), 1.56 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.13 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.06 – 0.96 (m, 1H), 0.95 – 0.87 (m, 6H), 0.52 – 0.46 (m, 2H), 0.22 – 0.14 (m, 2H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.47 , 170.30 , 162.95 , 160.28 , 145.69 , 144.02 , 142.55 , 109.51 , 89.64 , 79.97 , 73.86 , 73.55 , 56.18 , 48.40 , 28.51 , 20.90 , 19.45 , 18.78 , 17.15 , 15.64 , 10.83 , 2.98 , 2.95 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 7 0】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
393	(薄膜) 3378, 2961, 2874, 1741, 1675, 1579, 1505, 1458, 1310, 1236, 1202, 1180, 1100, 1042, 1003, 969, 830, 738	ESIMS <i>m/z</i> 469.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.42 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 8.27 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 5.80 – 5.69 (m, 2H), 4.88 (dd, <i>J</i> = 6.2, 5.3 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.53 – 3.44 (m, 2H), 3.38 (dt, <i>J</i> = 9.0, 6.6 Hz, 1H), 2.12 – 2.02 (m, 4H), 1.55 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.54 – 1.42 (m, 2H), 1.40 – 1.28 (m, 2H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.92 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.89 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.45 , 170.30 , 162.94 , 160.28 , 145.69 , 144.02 , 142.56 , 109.51 , 89.63 , 80.20 , 74.26 , 68.72 , 56.17 , 48.40 , 32.14 , 28.50 , 20.90 , 19.47 , 19.36 , 18.79 , 17.09 , 15.55 , 13.90 .

10

20

30

40

【表 2 - 1 7 2】

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	マススペクトル	NMR (¹ H, ¹³ C または ¹⁹ F)
396	(薄膜) 3379, 2960, 2934, 2873, 1772, 1739, 1677, 1571, 1506, 1454, 1339, 1310, 1198, 1175, 1099, 1062, 907, 825, 734	ESIMS <i>m/z</i> 453.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.58 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 4.87 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.53 – 3.34 (m, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.09 – 2.01 (m, 1H), 1.53 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.52 – 1.47 (m, 2H), 1.34 – 1.24 (m, 4H), 1.10 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H), 0.90 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.89 – 0.85 (m, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.31, 168.93, 162.37, 159.44, 146.66, 141.61, 137.48, 109.70, 80.16, 74.26, 69.02, 56.27, 48.26, 29.72, 28.51, 28.34, 22.50, 20.76, 19.43, 18.87, 17.16, 15.48, 14.03.
397	(薄膜) 3379, 2967, 2876, 1772, 1739, 1677, 1591, 1571, 1509, 1455, 1311, 1201, 1176, 1096, 1063, 1041, 909, 737	ESIMS <i>m/z</i> 437.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.58 (s, 1H), 8.32 (d, <i>J</i> = 5.4 Hz, 1H), 7.00 (d, <i>J</i> = 5.5 Hz, 1H), 4.89 (t, <i>J</i> = 5.8 Hz, 1H), 4.73 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.55 (p, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 3.32 (dd, <i>J</i> = 10.0, 6.7 Hz, 1H), 3.26 (dd, <i>J</i> = 9.9, 6.9 Hz, 1H), 2.40 (s, 3H), 2.11 – 2.02 (m, 1H), 1.54 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H), 1.06 – 0.96 (m, 1H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 0.52 – 0.46 (m, 2H), 0.21 – 0.13 (m, 2H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 172.33, 168.93, 162.37, 159.44, 146.66, 141.61, 137.48, 109.71, 79.94, 73.86, 73.54, 56.28, 48.25, 28.52, 20.76, 19.41, 18.86, 17.21, 15.57, 10.83, 2.97, 2.95.

【表 3】

表 3.生物学的試験評価スケール

真菌病原体の評価表	
防除%	評価
> 80	A
≤ 80	B
試験せず	C
報告されたアッセイにおいて 活性が観察されない	D

10

【 0 4 7 5 】

【表 4 - 1】

表 4. 生物学的活性-高容量施用(100ppm)^{*}による PUCCRT および SEPTTR の病気の防除

	PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
122	D	B	D	D
123	A	B	B	B
124	D	B	B	B
125	B	D	D	B
126	B	B	D	B
127	B	D	D	D
128	B	D	D	D
129	D	D	D	D
130	A	A	D	D
131	A	B	B	B
132	B	D	D	B
133	A	B	D	B
134	A	A	B	A
135	A	A	D	B
136	A	A	B	A
137	B	D	D	B
138	A	A	D	B
139	A	D	D	B
140	B	D	D	B
141	D	D	D	B
142	A	A	B	A
143	A	B	D	B
144	A	A	B	A
145	C	C	C	C
146	A	A	A	A
147	D	B	D	D
148	A	B	D	B
149	B	A	D	B
153	C	C	C	C
154	A	A	B	B
155	A	A	D	A
156	C	C	C	C
157	A	A	B	B
158	D	B	D	B
159	D	B	D	B
160	B	B	D	B
161	B	B	D	A
162	B	A	D	A

10

20

30

40

【表 4 - 2】

	PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
163	B	A	D	A
164	A	A	D	A
165	B	A	D	B
166	B	A	D	B
167	B	A	D	D
168	C	C	C	C
169	C	C	C	C
170	C	C	C	C
171	A	A	B	B
172	B	B	D	B
173	C	C	C	C
174	B	B	D	A
175	A	A	D	B
176	A	A	B	B
177	A	A	D	A
178	C	C	C	C
179	B	B	D	B
180	A	A	B	A
181	A	A	B	A
182	A	B	D	B
183	A	A	D	A
184	B	D	D	B
333	A	A	A	B
334	B	D	B	D
335	C	C	C	C
336	B	D	B	D
337	C	C	C	C
338	A	B	B	B
339	B	D	D	D
340	A	A	B	A
341	B	A	B	B
342	A	B	B	B
343	B	D	B	B
344	A	A	B	B
345	A	A	B	B
346	A	A	B	B
347	B	D	B	B
348	A	A	D	B
349	A	A	D	A
350	A	A	B	B

10

20

30

40

【表 4 - 3】

	PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
351	A	A	D	A
352	A	A	B	A
353	A	A	B	B
354	C	C	C	C
355	A	A	B	B
356	A	A	D	A

10

*Cmpd.No.-化合物番号

PUCCRT-コムギ褐色さび病(プッシニアトリチシナ(*Puccinia triticina*))*SEPTTR-コムギの葉枯病(チモセプトリアトリチシ(*Zymoseptoria tritici*))

*1DP-1 日保護剤

*3DC-3 日治療剤

*ppm-百万分率

20

【 0 4 7 8 】

【表 5 - 1】

表 5.生物学的活性-低容量施用(121.5g/H)*による PUCCRT および SEPTTR の病気の防除

	PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
185	B	D	B	B
186	A	A	B	A
187	B	D	D	B
188	D	D	D	D
189	D	B	D	B
190	B	A	D	B
191	D	D	D	B
192	D	D	D	B
193	B	A	B	B
194	D	D	D	B
195	A	A	D	B
196	D	A	D	D
197	B	A	D	D
198	D	B	D	B
199	D	B	D	B
200	B	D	D	B
201	D	B	B	B
202	B	B	B	B
203	D	D	D	B
204	A	A	B	B
205	A	A	B	A
206	A	A	D	B
207	A	A	B	A
208	B	D	B	B
209	A	A	B	A
210	A	A	B	B
211	B	D	D	B
212	B	D	B	B
213	A	A	B	A
214	A	A	B	A
215	A	A	B	A
216	A	B	B	B
217	B	D	B	B
218	D	D	D	B
219	A	A	B	D
220	B	B	D	D
221	A	A	A	A
222	A	A	A	A

10

20

30

40

【表 5 - 2】

	PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
223	B	B	B	D
224	A	A	B	B
225	B	D	B	B
226	A	A	A	B
227	A	B	B	B
228	A	A	A	A
229	D	B	D	D
230	B	B	D	D
231	A	B	B	D
233	B	B	D	D
234	A	B	D	D
236	A	B	B	B
237	A	A	B	A
238	A	A	B	A
239	A	D	B	B
240	A	B	B	D
241	A	B	B	D
242	A	A	B	B
243	B	B	B	B
244	B	B	B	B
245	B	D	B	B
246	A	A	B	A
247	A	A	D	D
248	A	A	B	B
249	A	B	B	B
250	A	A	B	A
251	A	B	B	B
252	A	A	B	B
253	B	A	D	B
254	B	B	B	D
255	A	A	B	B
256	B	B	D	D
257	A	A	D	B
258	B	A	D	D
259	A	A	D	D
260	A	A	D	B
261	A	A	D	B
262	B	A	D	D
263	A	A	D	D
264	A	A	B	D
265	A	A	B	A

10

20

30

40

【表 5 - 3】

	PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
266	A	A	B	D
267	A	A	D	D
268	A	B	D	B
269	A	A	A	A
270	A	A	B	A
271	B	B	D	D
272	A	A	B	A
273	D	B	D	B
274	A	A	D	B
275	A	A	B	A
276	A	A	A	A
277	A	A	D	D
278	B	B	D	B
279	D	B	D	B
280	B	B	B	B
281	A	A	B	A
282	A	A	A	A
283	D	D	D	D
357	A	B	A	A
358	A	B	B	D
359	D	D	D	D
360	D	B	B	B
361	A	A	A	B
362	D	D	B	D
363	A	A	B	A
364	B	B	B	D
365	D	D	B	D
366	D	D	D	B
367	A	A	A	B
368	B	B	D	D
369	A	A	B	B
370	D	D	B	D
371	A	A	D	B
372	A	A	A	A
373	D	D	D	B
374	A	A	A	B
375	A	A	B	D
376	B	B	B	D
377	D	B	D	B
378	A	A	B	B
379	B	D	D	D

10

20

30

40

【表 5 - 4】

	PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
380	A	A	B	B
381	D	D	D	D
382	A	A	B	B
383	A	A	B	B
384	A	A	D	B
385	A	A	B	B
386	B	D	D	B
387	A	A	D	B
388	A	A	B	A
389	A	A	B	D
390	A	A	D	B
391	A	A	B	D
392	A	A	B	D
393	A	A	B	D
394	A	A	B	A
395	A	A	B	D
396	A	A	B	D
397	A	A	B	D
398	A	A	B	D

10

20

*Cmpd.No.-化合物番号

PUCCRT-コムギ褐色さび病(プッシニアトリチシナ(*Puccinia triticina*))*SEPTTR-コムギの葉枯病(チモセプトリアトリチシ(*Zymoseptoria tritici*))

30

*1DP-1日保護剤

*3DC-3日治療剤

*g/H-1ヘクタールあたりのグラム

*ppm-百万分率

【 0 4 8 2 】

【表 6 - 1】

表 6.生物学的活性-高容量施用(25ppm)*による PHAKPA の病気の防除

Cmpd. No.	PHAKPA	
	1DP*	3DC*
186	A	B
204	A	B
205	A	A
206	A	B
207	A	A
208	B	D
209	A	B
210	A	B
211	B	D
213	A	A
214	A	A
215	A	B
216	B	D
217	B	B
218	B	D
219	A	A
220	B	D
221	A	B
222	A	A
223	D	D
224	A	A
225	A	D
226	A	A
228	A	A
229	D	D
230	B	D
231	B	B
233	B	B
234	A	B
236	B	B
237	A	A
238	A	B
239	B	D
240	A	B
241	B	D
242	A	A

10

20

30

40

【表 6 - 2】

Cmpd. No.	PHAKPA	
	1DP*	3DC*
243	B	B
244	A	B
245	B	B
246	A	A
247	A	B
248	A	B
249	A	B
250	A	B
251	A	B
252	A	B
253	A	A
254	A	A
255	A	B
256	A	B
257	A	B
259	A	B
260	A	A
261	A	B
262	B	B
263	B	B
264	A	B
265	B	B
266	A	A
267	A	B
268	A	B
269	A	A
270	A	A
271	B	B
272	A	B
273	B	B
274	A	A
275	B	B
276	A	A
277	A	A
278	B	B
279	B	B
280	B	B
281	A	A
282	A	B

10

20

30

40

【表 6 - 3】

Cmpd. No.	PHAKPA		
	1DP*	3DC*	
283	D	B	
357	A	B	
358	A	D	
359	D	D	
360	A	D	10
361	A	B	
362	B	D	
363	A	B	
364	A	B	
365	D	D	
366	D	B	
367	A	B	
368	B	B	
369	A	D	20
370	B	D	
371	A	B	
372	A	B	
373	B	B	
374	A	A	
375	A	B	
376	B	B	
377	B	D	30
389	A	D	
390	A	A	
391	A	B	
392	A	B	
393	A	A	
394	A	A	
395	A	B	
396	A	A	
397	A	B	
398	A	A	40
399	A	B	

*Cmpd.No.-化合物番号

*PHAKPA-アジアダイズさび病(ファコプソラパキリジ(Phakopsora pachyrhizi))

*1DP-1 日保護剤

*3DC-3 日治療剤

*ppm-百万分率

【表 7】

表 7.生物学的活性-100ppm での 1DP*による病気の防除

Cmpd. No.	ALTESO	CERCBE*	COLLA*	LEPTNO*	PYRIOR*	RHYNSE*	VENTIN*
186	D	B	B	A	C	B	C
205	D	A	B	B	A	B	A
207	B	A	A	A	A	B	A
209	D	B	B	A	C	B	C
213	D	B	B	A	C	B	C
214	D	B	B	A	C	B	C

10

*Cmpd.No.-化合物番号

*1DP-1 日保護剤

*ALTESO-トマトの夏疫病(アルテルナリアソラニ(*Alternaria solani*))*CERCBE-テンサイの葉斑病(セルコスポラベチコラ(*Cercospora beticola*))*COLLA-キュウリ炭疽病(コレトトリクムラゲナリウム(*Colletotricum lagenarium*))*LEPTNO-コムギ包えい枯病 (レプトスファエリアノドルム(*Leptosphaeria nodorum*))*PYRIOR-イネのいもち病(ピリクラオリザ(*Pyricularia oryzae*))*RHYNSE-オオムギ雲形病(リンコスפורウムセカリス(*Rhynchosporium secalis*))*VENTIN-リンゴそうか病(ベンツリアイナエクアリス(*Venturia inaequalis*))

*ppm-百万分率

20

フロントページの続き

(31)優先権主張番号 62/255,131

(32)優先日 平成27年11月13日(2015.11.13)

(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)

(31)優先権主張番号 62/255,125

(32)優先日 平成27年11月13日(2015.11.13)

(33)優先権主張国・地域又は機関
米国(US)

(74)代理人 100104282

弁理士 鈴木 康仁

(72)発明者 ヤオ, チェンリン

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 , インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード
9 3 3 0

(72)発明者 ウィルモット, ジェレミー

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 , インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード
9 3 3 0

(72)発明者 リゴリ, ジャレド

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 0 4 , インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード
9 3 3 0

(72)発明者 メイヤー, ケビン ジー.

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 , インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード
9 3 3 0

(72)発明者 ロイ, ブライアン

アメリカ合衆国 インディアナ州 4 6 2 6 8 , インディアナポリス, ジオンスヴィレ ロード
9 3 3 0

審査官 高橋 直子

(56)参考文献 特表2003-528806(JP, A)

国際公開第2013/169660(WO, A1)

米国特許出願公開第2013/0296375(US, A1)

特表2003-519215(JP, A)

特表2003-519214(JP, A)

特表2008-512362(JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

A01N 43/40

A01N 37/02

A01N 47/12

A01P 3/00

CAplus/REGISTRY(STN)