

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成30年3月22日(2018.3.22)

【公表番号】特表2017-505787(P2017-505787A)

【公表日】平成29年2月23日(2017.2.23)

【年通号数】公開・登録公報2017-008

【出願番号】特願2016-551163(P2016-551163)

【国際特許分類】

C 0 7 D 233/88 (2006.01)

C 0 7 D 277/42 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 333/38 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 17/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 233/88

C 0 7 D 277/42

C 0 7 D 417/04

C 0 7 D 413/04

C 0 7 D 409/04

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 333/38

C 0 7 D 471/04 1 0 7 Z

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/454

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 17/10

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 15/08

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 31/541

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成30年2月9日(2018.2.9)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

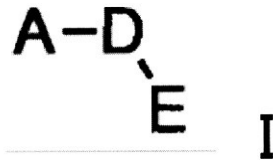
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの構造

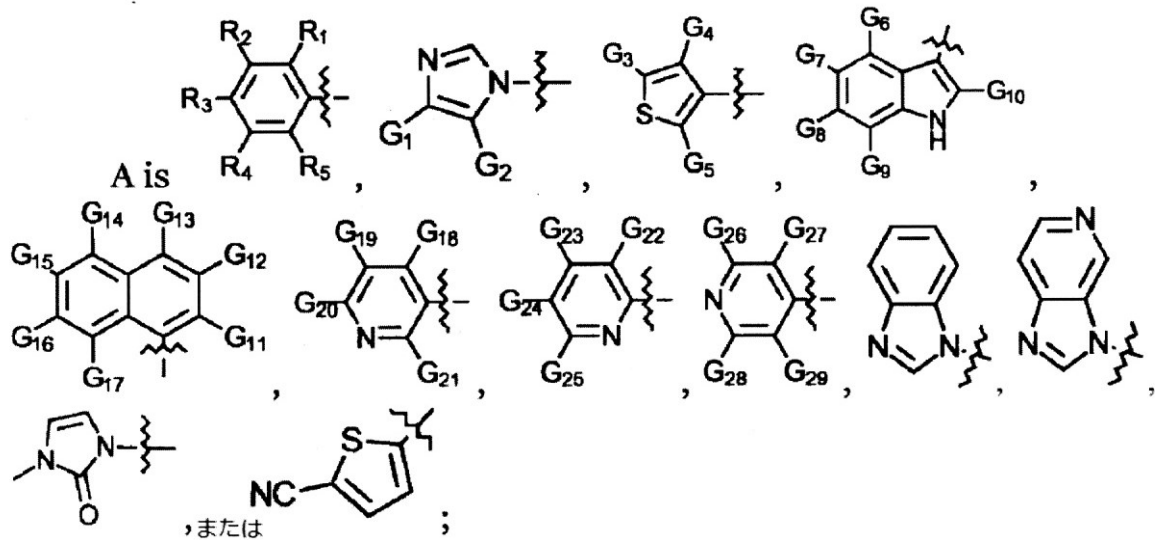
【化1】



を有する化合物であって、

Aが、

【化2】



であり；

R₁が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、Br、I、CN、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃、NHCH₃、CNまたはCF₃であり；

R₂が、H、CF₃、OH、CH₃、CN、NH₂、CH₂OH、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、CH₂CH₃またはOCH₂CH₃であり；

R₃がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R₄が、H、F、CN、Cl、OH、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、CH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₁がH、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

G_1 が、Br、Cl、I、 CH_3 、H、FまたはOHであり；

G_2 が、Br、Cl、H、I、 CH_3 、FまたはOHであり；

G_3 が、Cl、H、 CH_3 、Br、I、FまたはOHであり；

G_4 が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G_3 と G_5 の両方が共にHであるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_6 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_7 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_8 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_9 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_{10} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

$G_{11} \sim G_{17}$ が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

$G_{18} \sim G_{21}$ が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

$G_{22} \sim G_{25}$ が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

G_{26} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

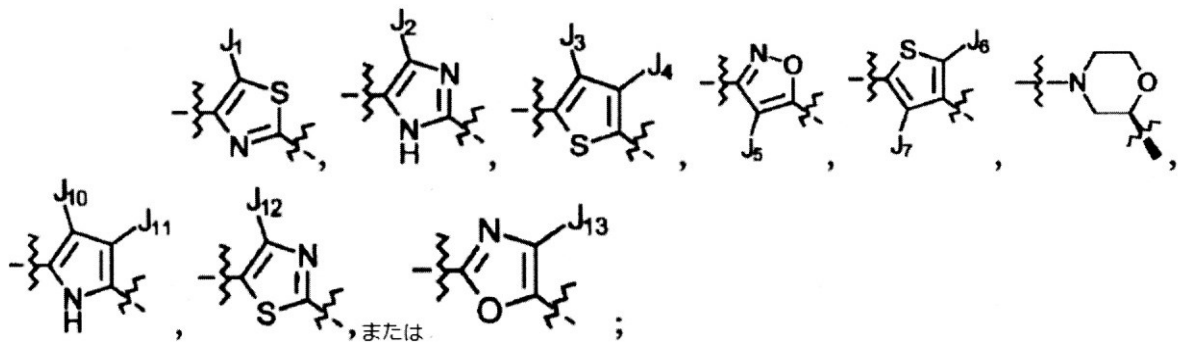
G_{27} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_{28} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_{29} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Dが、

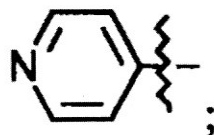
【化3】



であり；

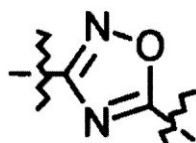
Aが、

【化4】



である場合、Dが任意に、

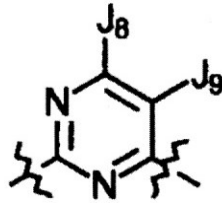
【化5】



であり；

$R_1 \sim R_5$ が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化6】



であり；

J₁が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、F、COOHまたはOHであり

；

R₁がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；

J₂が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₄が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₅が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₆が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₇が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₈が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₉が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₁₀が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

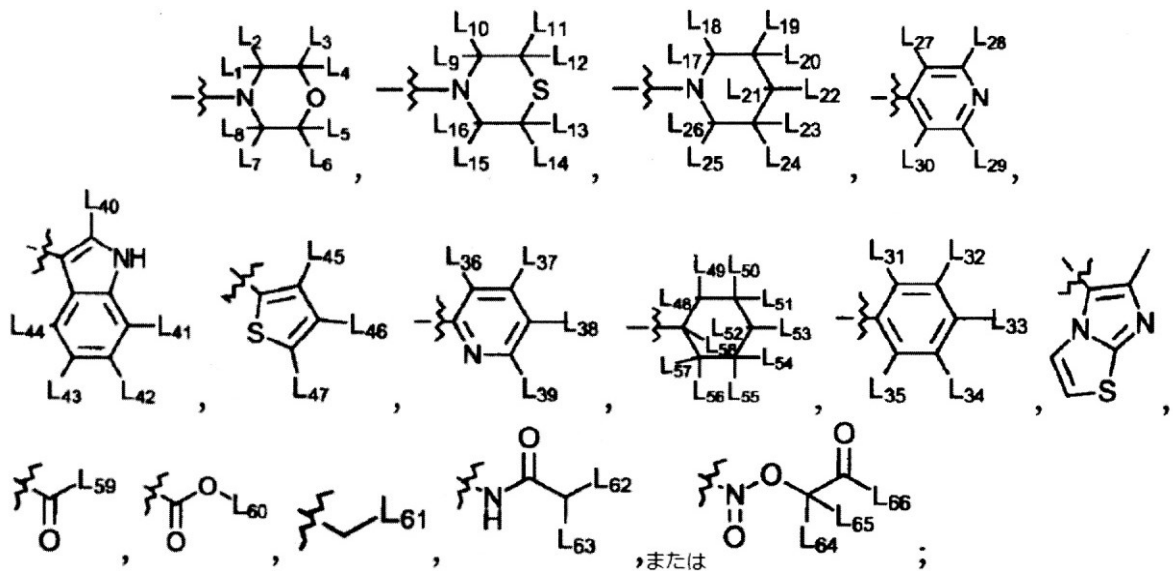
J₁₁が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₁₂が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₁₃が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Eが、

【化7】



であり；

L₁～L₈が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₉～L₁₆が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₁₇～L₂₆が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₂₇～L₃₀が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₃₁～L₃₅が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、

I、F、OHまたはCF₃であり；

L₃₆～L₃₉が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、

I、F、OHまたはCF₃であり；

L₄₀～L₄₄が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、

I、F、OHまたはCF₃であり；

L₄₅～L₄₇が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、

I、F、OHまたはCF₃であり；

L₄₈～L₅₈が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、

I、F、OHまたはCF₃であり；

L₅₉が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、
OHまたはCF₃であり；

L₆₀が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、
OHまたはCF₃であり；

L₆₁が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、
OHまたはCF₃であり；

L₆₂が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、
OHまたはCF₃であり；

L₆₃が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、
OHまたはCF₃であり；

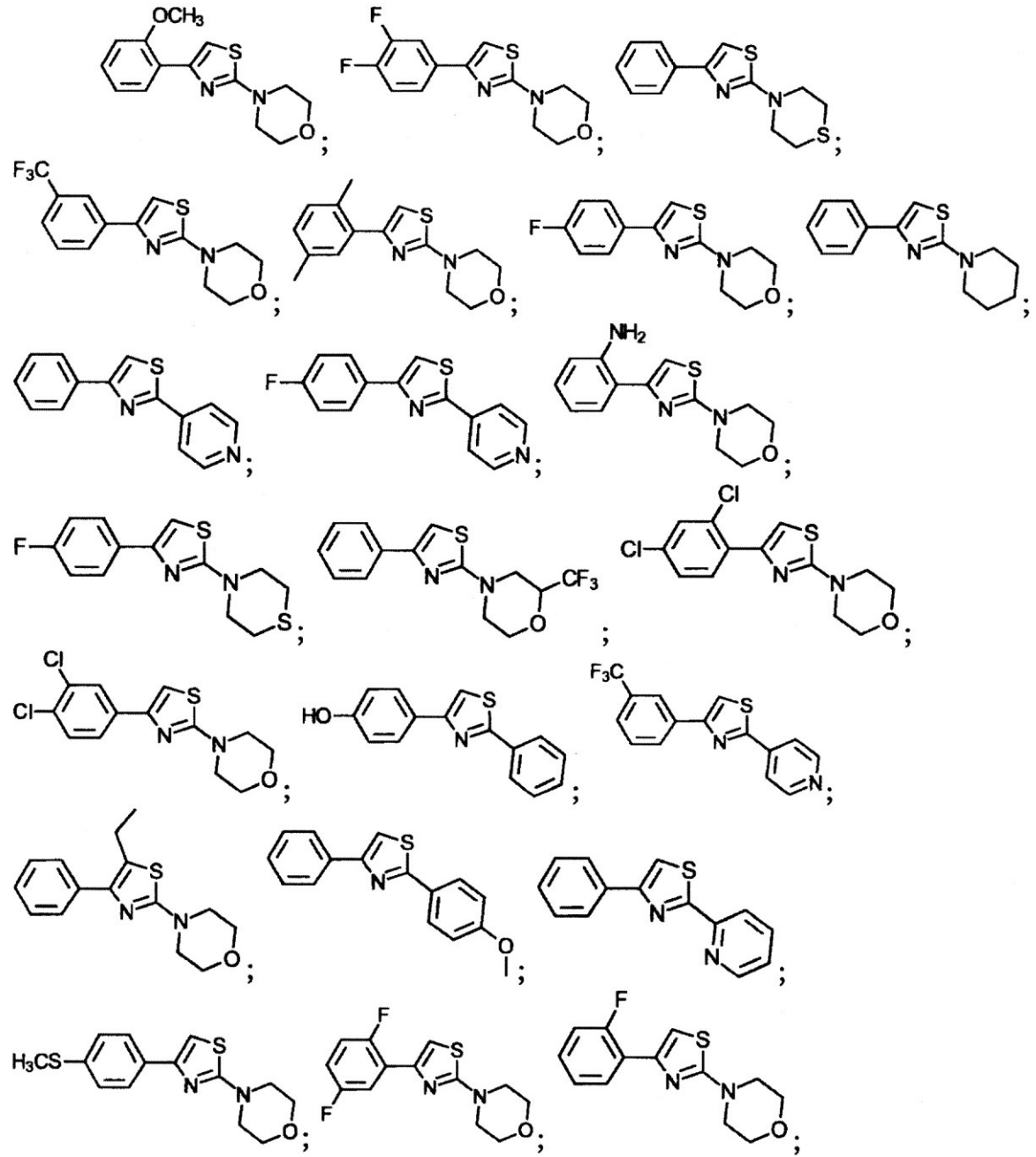
L₆₄が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、
OHまたはCF₃であり；

L₆₅が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、
OHまたはCF₃であり；

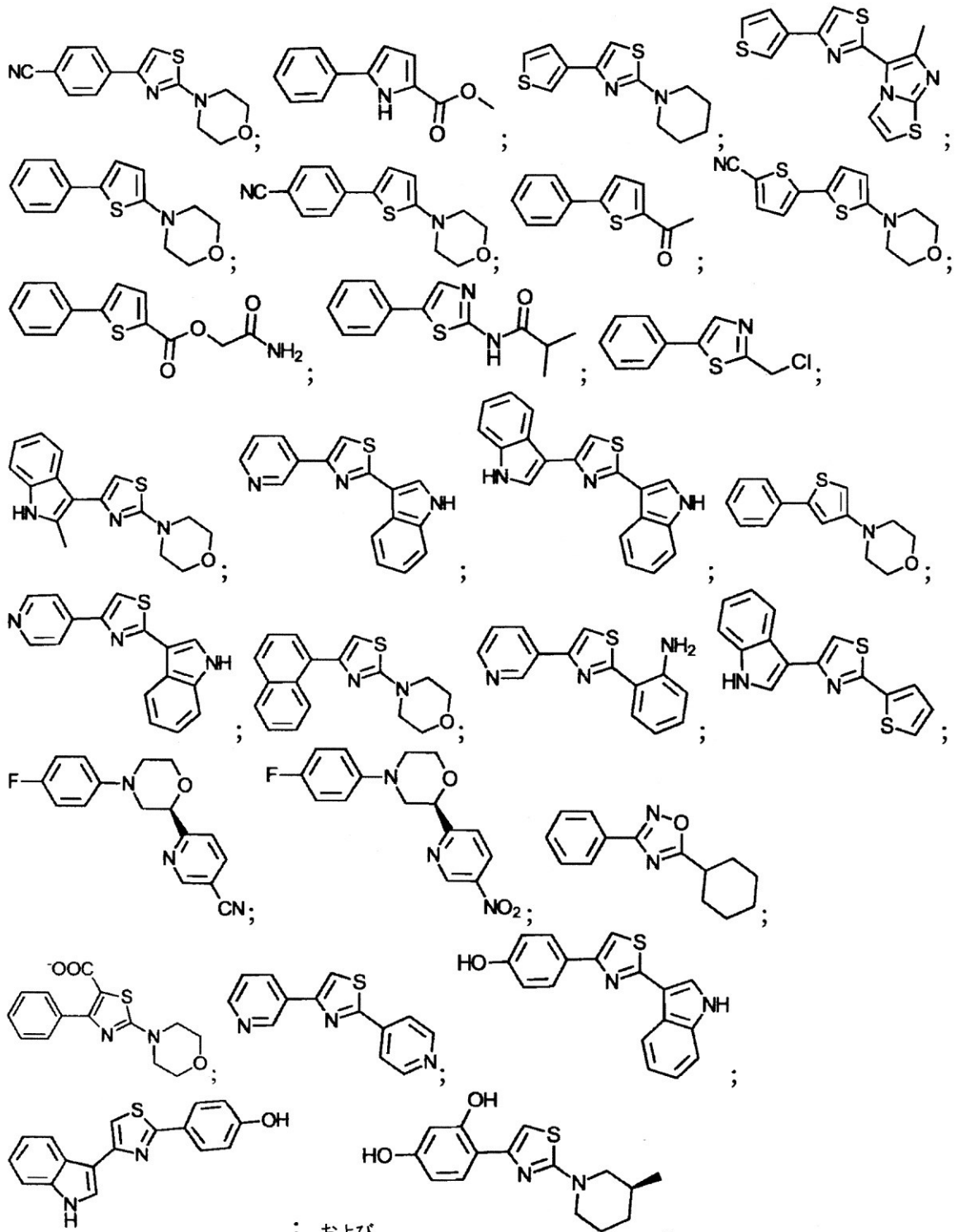
L₆₆が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、
OHまたはCF₃であり；

前記化合物が、

【化 8 - 1】



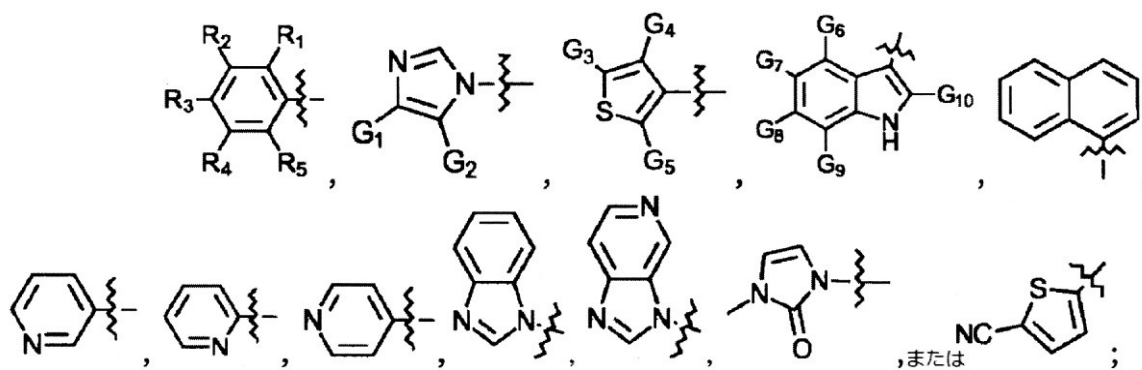
【化 8 - 2】



; および

のうちの1つ以上でないことを条件とし、
 特に、Aが、

【化9】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH、 CH_3 、 NH_2 、Cl、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、Br、I、CN、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 、 $NHCH_3$ 、CNまたは CF_3 であり；

R_2 が、H、 CF_3 、OH、 CH_3 、CN、 NH_2 、 CH_2OH 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_2CH_3 または OCH_2CH_3 であり；

R_3 がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、 R_2 が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R_4 が、H、F、CN、Cl、OH、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_3 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_5 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_6 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

G_1 が、Br、Cl、I、 CH_3 、H、FまたはOHであり；

G_2 が、Br、Cl、H、I、 CH_3 、FまたはOHであり；

G_3 が、Cl、H、 CH_3 、Br、I、FまたはOHであり；

G_4 が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G_3 と G_5 の両方が共にHであるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_6 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_7 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

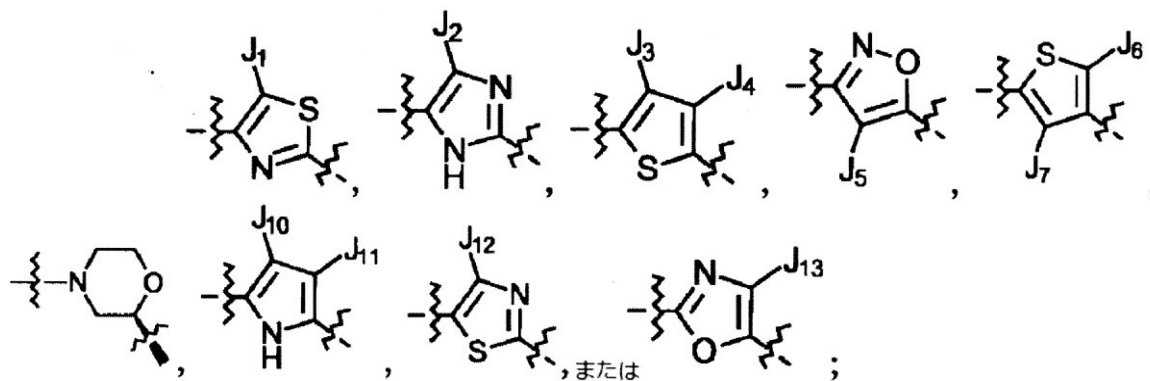
G_8 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_9 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_{10} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

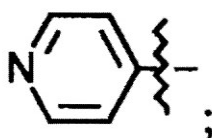
【化10】



であり；

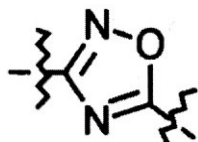
A が、

【化11】



である場合、Dが任意に、

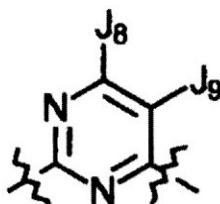
【化12】



であり；

R₁ ~ R₅ が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化13】



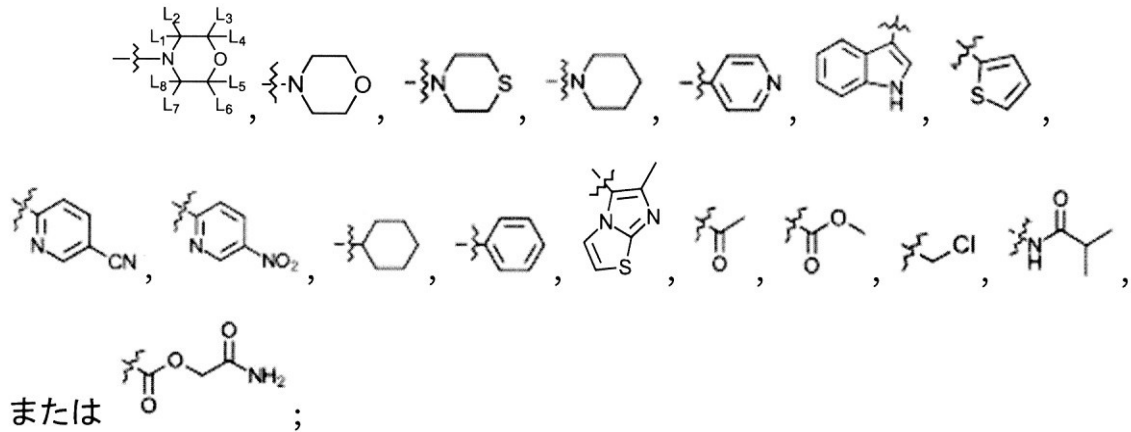
であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、F、COOHまたはOHであり

；

R₁ がOHでない場合、J₁ が任意にCH₃であり；J₂ が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₄ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₅ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₆ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₇ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₈ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₉ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₀ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₁ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₂ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；E が、

【化14】



であり；

L_1 が、 H 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 O
 H または CF_3 であり；

L_2 が、 H 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 O
 H または CF_3 であり；

L_3 が、 H 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 O
 H または CF_3 であり；

L_4 が、 H 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 O
 H または CF_3 であり；

L_5 が、 H 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 O
 H または CF_3 であり；

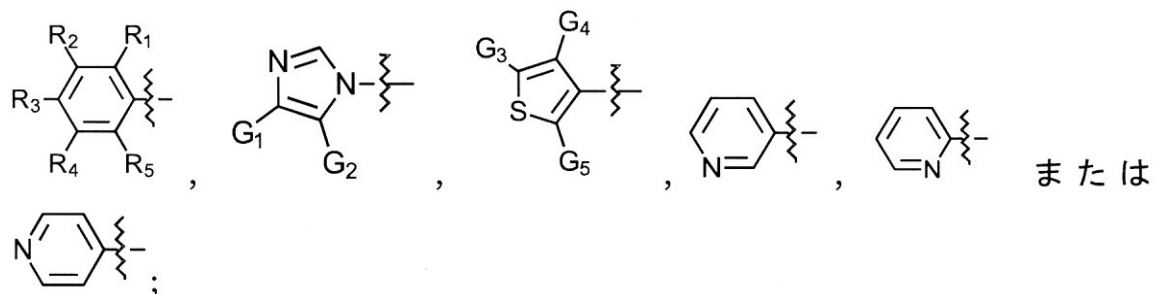
L_6 が、 H 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 O
 H または CF_3 であり；

L_7 が、 H 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 O
 H または CF_3 であり；

L_8 が、 H 、 CN 、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F 、 O
 H または CF_3 であり、

さらに特に、 A が、

【化15】



であり；

R_1 が、 H 、 OCH_3 、 OH 、 CH_3 、 NH_2 、 Cl 、 SO_2CH_3 、 $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 Br 、 I 、 CN 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 、 NHCH_3 、 CN または CF_3 であり；

R_2 が、 H 、 CF_3 、 OH 、 CH_3 、 CN 、 NH_2 、 CH_2OH 、 SO_2CH_3 、 $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 CH_2CH_3 または OCH_2CH_3 であり；

R_1 が Cl 、 F 、 Br または I のうちの 1 つでない場合、 R_2 が任意に F 、 Cl 、 Br および I から選択され；

R_3 が、 H 、 F 、 CN 、 Cl 、 OH 、 SCH_3 、 OCH_3 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 CH_3 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 NHCH_3 、 Br 、 I 、 CH_2O

H、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₄が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

G₁が、Br、Cl、I、CH₃、H、FまたはOHであり；

G₂が、Br、Cl、H、I、CH₃、FまたはOHであり；

G₃が、Cl、H、CH₃、Br、I、FまたはOHであり；

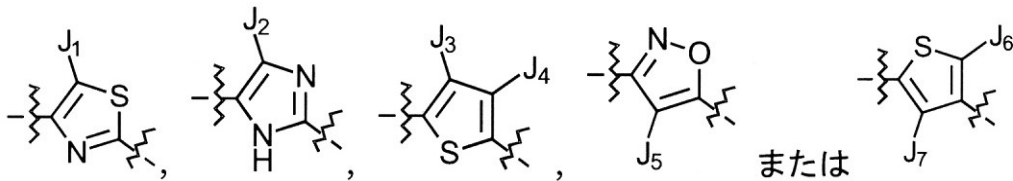
G₄が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Dが、

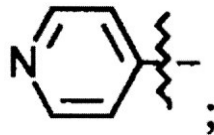
【化16】



であり；

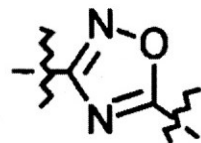
Aが、

【化17】



である場合、Dが任意に、

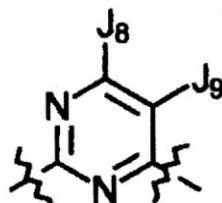
【化18】



であり；

R₁ ~ R₅が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化19】



であり；

J₁が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R₁がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；

J₂が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₄が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₅が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₆が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

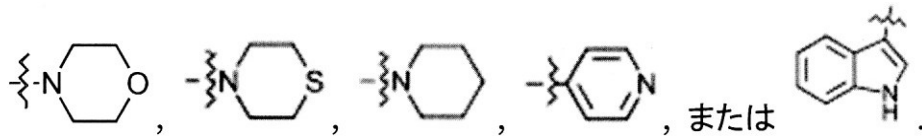
J₇ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₈ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₉ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

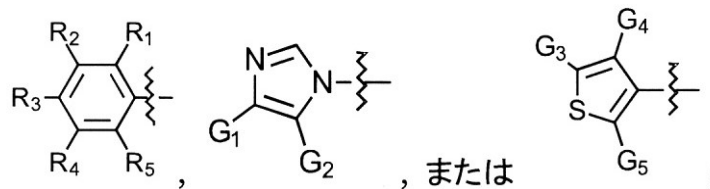
【化20】



であり、

さらに、より特に、A が、

【化21】



であり；

R₁ が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、Br、I、CN、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃、NHCH₃、CNまたはCF₃であり；

R₂ が、H、CF₃、OH、CH₃、NH₂、CN、CH₂OH、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、CH₂CH₃またはOCH₂CH₃であり；

R₃ がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂ が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R₄ が、H、F、CN、Cl、OH、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、CH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

G₁ が、Br、Cl、I、CH₃、H、FまたはOHであり；

G₂ が、Br、Cl、H、I、CH₃、FまたはOHであり；

G₃ が、Cl、H、CH₃、Br、I、FまたはOHであり；

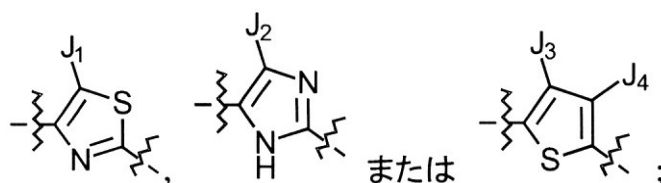
G₄ が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G₃ とG₅ の両方が共にHであるのではない場合、G₄ が任意にCH₃であり；

G₅ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

【化22】



であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R₁ がOHでない場合、J₁ が任意にCH₃であり；

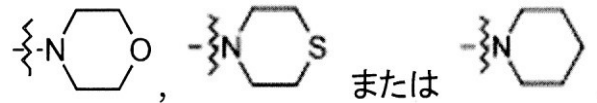
J_2 が、H、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_3 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_4 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

【化23】



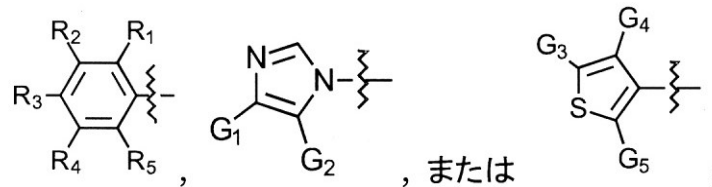
である、

化合物。

【請求項2】

A が、

【化24】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH、 CH_3 、 NH_2 、Cl、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、Br、I、CN、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_2 が、H、 CF_3 、OH、CN、 CH_3 または NH_2 であり；

R_1 がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、 R_2 が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R_3 が、H、F、CN、Cl、OH、 SCH_3 、 OCH_3 、 CH_3 、 NH_2 、Br、I、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_4 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 NH_2 、Br、Iまたは CF_3 であり；

R_5 が、H、 CH_3 、OH、F、CN、Cl、 NH_2 、Br、Iまたは CF_3 であり；

G_1 が、Br、Cl、I、 CH_3 、H、FまたはOHであり；

G_2 が、Br、Cl、H、I、 CH_3 、FまたはOHであり；

G_3 が、Cl、H、 CH_3 、Br、I、FまたはOHであり；

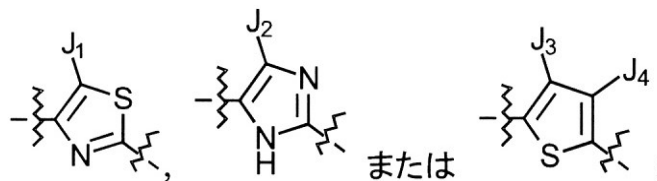
G_4 が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G_3 と G_5 の両方が共にHであるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

【化25】



であり；

J_1 が、H、 CH_2CH_3 、 CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R_1 がOHでない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

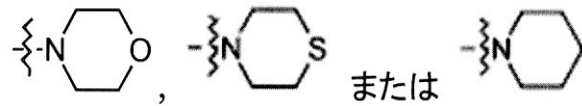
J_2 が、H、 CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_3 が、H、CN、 CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_4 が、H、CN、 CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

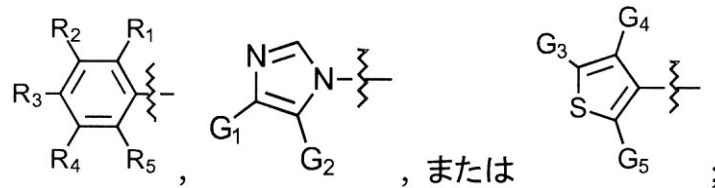
【化26】



であり、

特に、Aが、

【化27】



であり；

R_1 が、 H 、 OCH_3 、 OH 、 CH_3 、 NH_2 、 Cl 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 Br 、 I 、 CN 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_2 が、 H 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 CH_3 または NH_2 であり；

R_1 が Cl 、 F 、 Br または I のうちの1つでない場合、 R_2 が任意に F 、 Cl 、 Br および I から選択され；

R_3 が、 H 、 F 、 CN 、 Cl 、 OH 、 SCH_3 、 OCH_3 、 CH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_4 が、 H 、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、 OH 、 CH_2OH 、 F 、 Cl 、 OCH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_5 が、 H 、 CH_3 、 OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

G_1 が、 Br 、 Cl 、 I 、 CH_3 、 H 、 F または OH であり；

G_2 が、 Br 、 Cl 、 H 、 I 、 CH_3 、 F または OH であり；

G_3 が、 Cl 、 H 、 CH_3 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

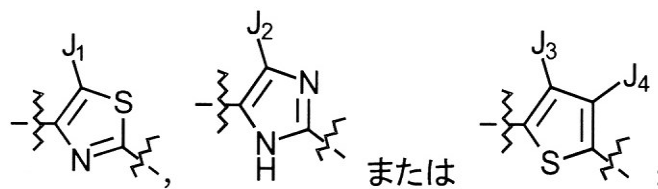
G_4 が、 Cl 、 H 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

Dが、

【化28】



であり；

J_1 が、 H 、 CH_2CH_3 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

R_1 が OH でない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

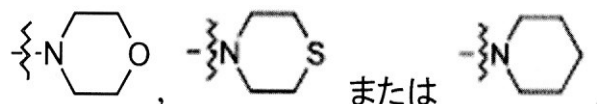
J_2 が、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_3 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_4 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

Eが、

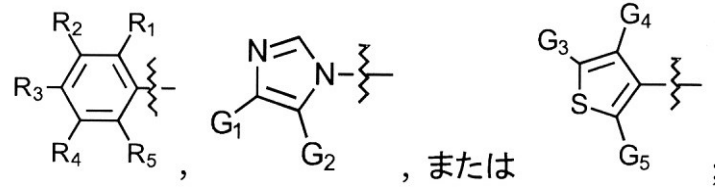
【化29】



であり、

さらに特に、Aが、

【化30】



であり；

R₁が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂またはO(CH₂)₂OCH₃であり；

R₂が、HまたはCF₃であり；

R₃が、Cl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂が、任意にFおよびClから選択され；

R₄が、H、F、CN、Cl、OHまたはSCH₃であり；

R₅が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OHまたはFであり；

R₅がHであり；

G₁が、Br、Cl、IまたはCH₃であり；

G₂が、Br、Cl、H、IまたはCH₃であり；

G₃が、Cl、H、CH₃またはBrであり；

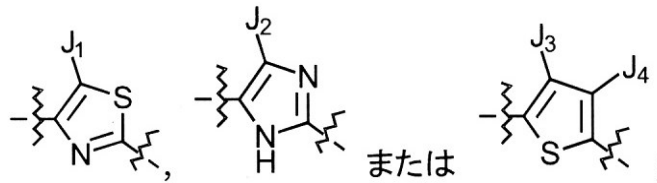
G₄が、Cl、HまたはBrであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅が、HまたはCH₂OHであり；

Dが、

【化31】



であり；

J₁が、HまたはCH₂CH₃であり；

R₁がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；

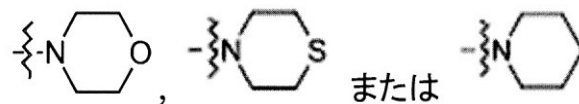
J₂がHであり；

J₃が、HまたはCNであり；

J₄がHであり；

Eが、

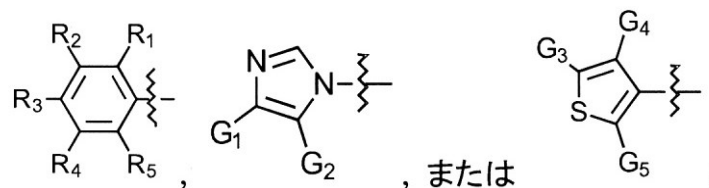
【化32】



であり、

さらにより特に、Aが、

【化33】



であり；

R₁が、H、OCH₃、OHまたはCH₃であり；

R₂が、HまたはCF₃であり；

R₁ が、Cl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂ が、任意にFおよびC
1から選択され；

R₃ が、HまたはFであり；

R₄ が、HまたはCH₃であり；

R₅ がHであり；

G₁ が、BrまたはClであり；

G₂ が、Br、ClまたはHであり；

G₃ が、Cl、H、CH₃またはBrであり；

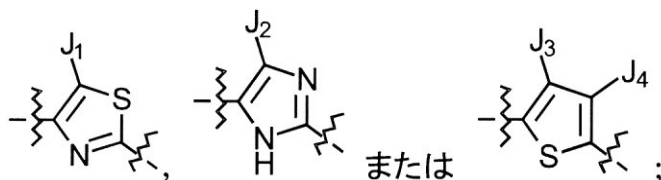
G₄ が、Cl、HまたはBrであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅ が、HまたはCH₂OHであり；

Dが、

【化34】



であり；

J₁ が、Hであり；

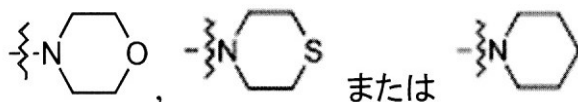
J₂ がHであり；

J₃ が、Hであり；

J₄ がHであり；

Eが、

【化35】

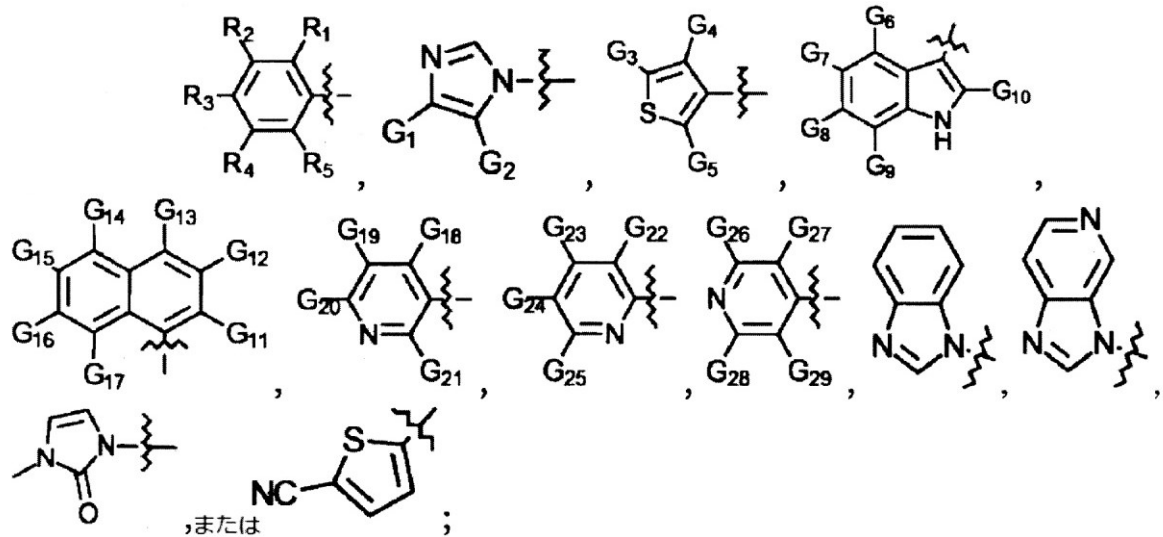


である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

前記化合物が、

【化39】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH、 CH_3 、 NH_2 、Cl、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、Br、I、CN、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 、 $NHCH_3$ 、CNまたは CF_3 であり；

R_2 が、H、 CF_3 、OH、 CH_3 、CN、 NH_2 、 CH_2OH 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_2CH_3 または OCH_2CH_3 であり；

R_1 がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、 R_2 が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R_3 が、H、F、CN、Cl、OH、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_3 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_4 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_5 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

G_1 が、Br、Cl、I、 CH_3 、H、FまたはOHであり；

G_2 が、Br、Cl、H、I、 CH_3 、FまたはOHであり；

G_3 が、Cl、H、 CH_3 、Br、I、FまたはOHであり；

G_4 が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G_3 と G_5 の両方が共にHであるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_6 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_7 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_8 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_9 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_{10} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

$G_{11} \sim G_{17}$ が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

$G_{18} \sim G_{21}$ が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

$G_{22} \sim G_{25}$ が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

G_{26} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

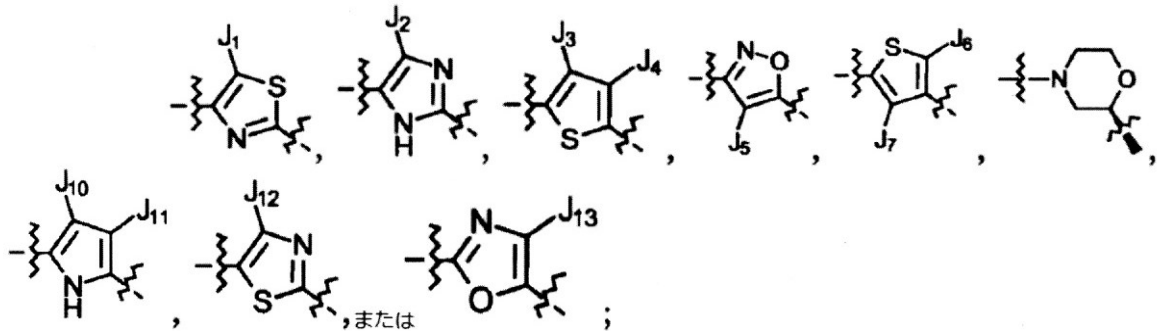
G_{27} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_{28} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G_{29} が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Dが、

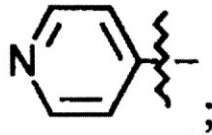
【化40】



であり；

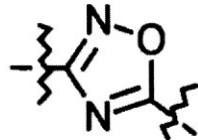
Aが、

【化41】



である場合、Dが任意に、

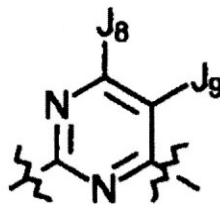
【化42】



であり；

$R_1 \sim R_5$ が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化43】



であり；

J_1 が、H、 CH_2CH_3 、 CH_3 、Cl、Br、I、F、 $COOH$ またはOHであり

；

R_1 がOHでない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

J_2 が、H、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_3 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_4 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_5 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_6 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_7 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_8 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

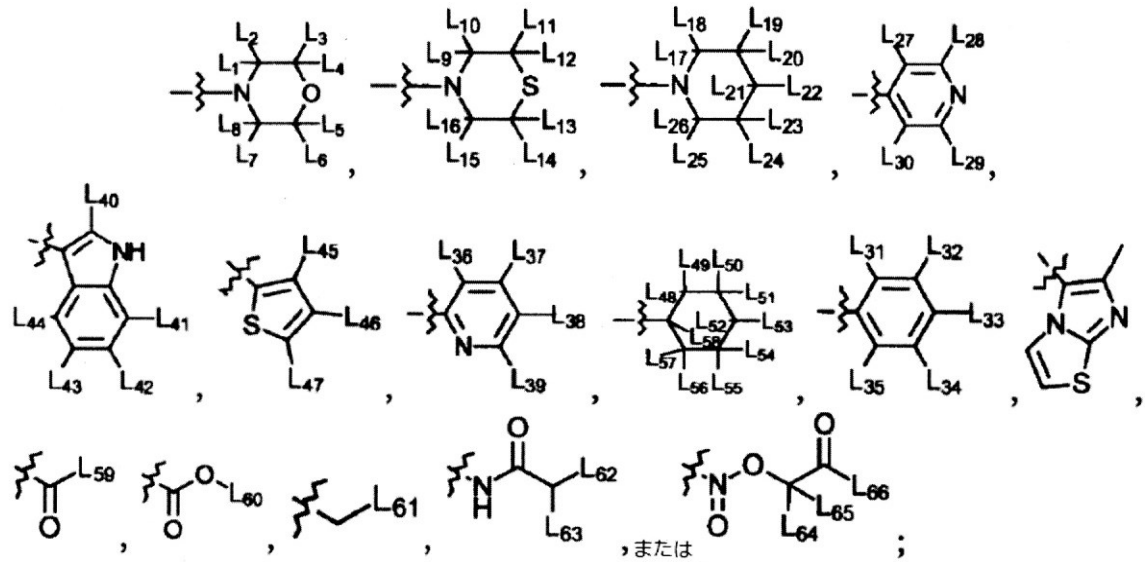
J_9 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_{10} が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_{11} が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₁₂が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；
 J₁₃が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；
 Eが、

【化44】



であり；

L₁ ~ L₈が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₉ ~ L₁₆が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₁₇ ~ L₂₆が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₂₇ ~ L₃₀が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₃₁ ~ L₃₅が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₃₆ ~ L₃₉が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₄₀ ~ L₄₄が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₄₅ ~ L₄₇が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₄₈ ~ L₅₈が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₅₉が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₆₀が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₆₁が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₆₂が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L₆₃が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

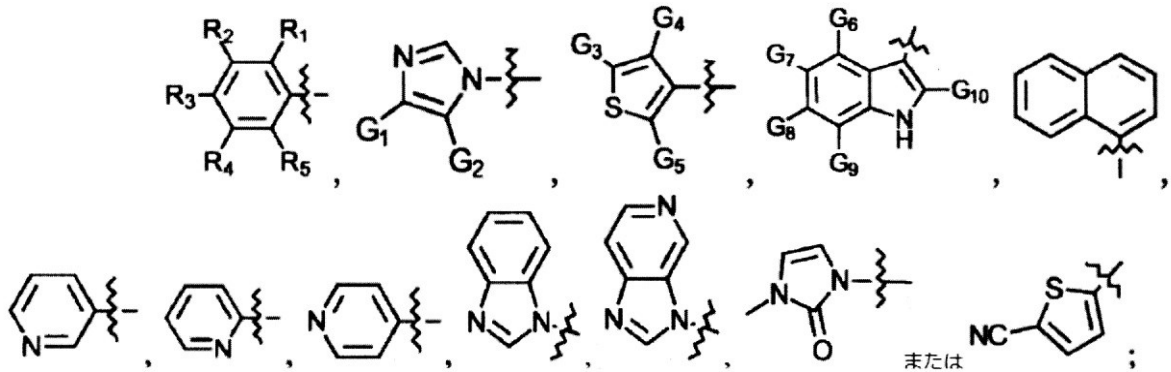
L₆₄が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L_{65} が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_{66} が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり、

特に、A が、

【化45】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH、 CH_3 、 NH_2 、Cl、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、Br、I、CN、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 、 $NHCH_3$ 、CN または CF_3 であり；

R_2 が、H、 CF_3 、OH、 CH_3 、CN、 NH_2 、 CH_2OH 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_2CH_3 または OCH_2CH_3 であり；

R_3 が Cl、F、Br または I のうちの 1 つでない場合、 R_2 が任意に F、Cl、Br および I から選択され；

R_4 が、H、F、CN、Cl、OH、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_3 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_5 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

G_1 が、Br、Cl、I、 CH_3 、H、F または OH であり；

G_2 が、Br、Cl、H、I、 CH_3 、F または OH であり；

G_3 が、Cl、H、 CH_3 、Br、I、F または OH であり；

G_4 が、Cl、H、Br、I、F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

G_6 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

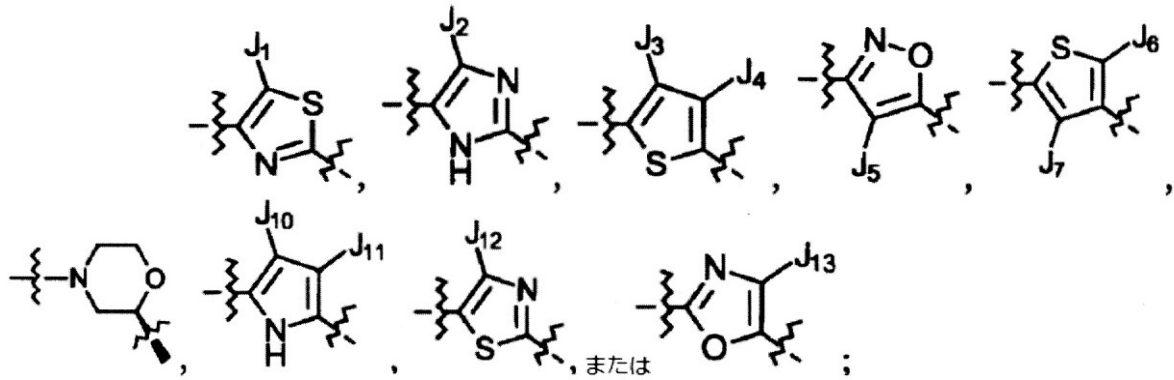
G_7 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

G_8 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

G_9 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

D が、

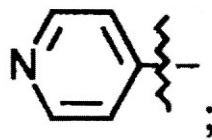
【化46】



であり；

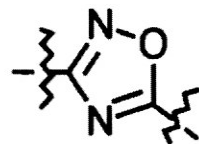
Aが、

【化47】



である場合、Dが任意に、

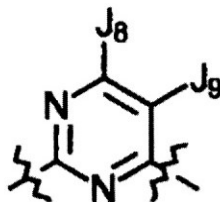
【化48】



であり；

R₁ ~ R₅が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化49】



であり；

J₁が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、F、COOHまたはOHであり

；

R₁がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；J₂が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₃が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₄が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₅が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₆が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₇が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₈が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₉が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₀が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₁が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₂が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₃が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Eが、

H、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₄が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

G₁が、Br、Cl、I、CH₃、H、FまたはOHであり；

G₂が、Br、Cl、H、I、CH₃、FまたはOHであり；

G₃が、Cl、H、CH₃、Br、I、FまたはOHであり；

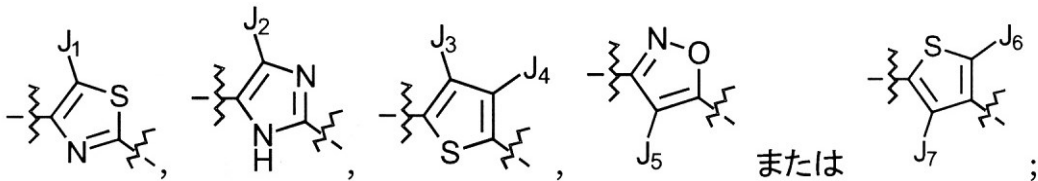
G₄が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Dが、

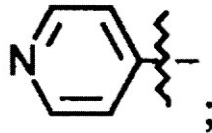
【化52】



であり；

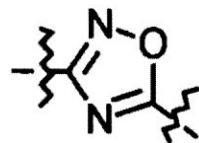
Aが、

【化53】



である場合、Dが任意に、

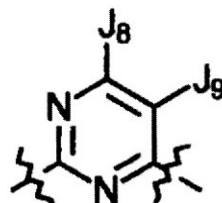
【化54】



であり；

R₁ ~ R₅が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化55】



であり；

J₁が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R₁がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；

J₂が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₄が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₅が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₆が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

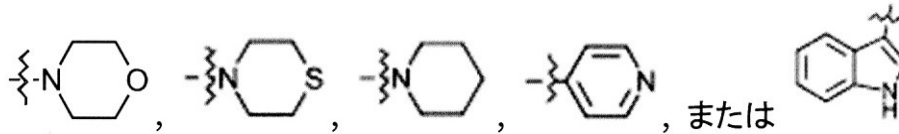
J₇ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₈ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₉ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

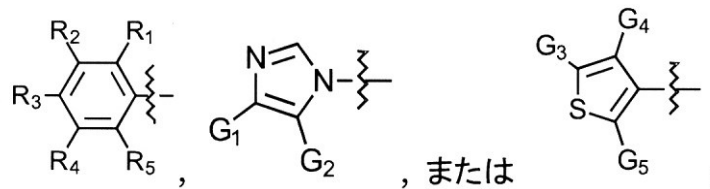
【化56】



であり、

最も特に、A が、

【化57】



であり；

R₁ が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、Br、I、CN、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃、NHCH₃、CNまたはCF₃であり；

R₂ が、H、CF₃、OH、CH₃、NH₂、CN、CH₂OH、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、CH₂CH₃またはOCH₂CH₃であり；

R₃ がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂ が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R₄ が、H、F、CN、Cl、OH、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、CH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

G₁ が、Br、Cl、I、CH₃、H、FまたはOHであり；

G₂ が、Br、Cl、H、I、CH₃、FまたはOHであり；

G₃ が、Cl、H、CH₃、Br、I、FまたはOHであり；

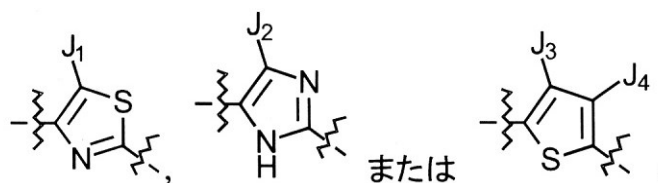
G₄ が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G₃ とG₅ の両方が共にHであるのではない場合、G₄ が任意にCH₃であり；

G₅ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

【化58】



であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R₁ がOHでない場合、J₁ が任意にCH₃であり；

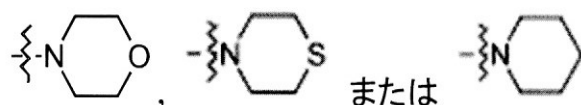
J_2 が、H、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_3 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_4 が、H、CN、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

【化59】

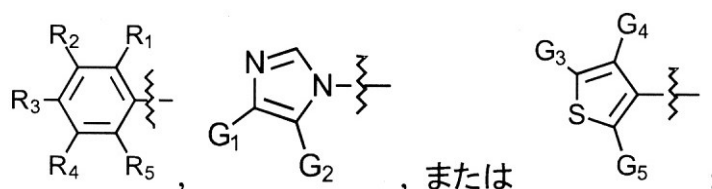


である、化合物。

【請求項6】

A が、

【化60】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH、 CH_3 、 NH_2 、Cl、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、Br、I、CN、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_2 が、H、 CF_3 、OH、CN、 CH_3 または NH_2 であり；

R_1 がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、 R_2 が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R_3 が、H、F、CN、Cl、OH、 SCH_3 、 OCH_3 、 CH_3 、 NH_2 、Br、I、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_4 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 NH_2 、Br、Iまたは CF_3 であり；

R_5 が、H、 CH_3 、OH、F、CN、Cl、 NH_2 、Br、Iまたは CF_3 であり；

G_1 が、Br、Cl、I、 CH_3 、H、FまたはOHであり；

G_2 が、Br、Cl、H、I、 CH_3 、FまたはOHであり；

G_3 が、Cl、H、 CH_3 、Br、I、FまたはOHであり；

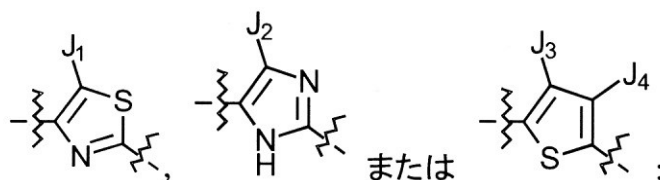
G_4 が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G_3 と G_5 の両方が共にHであるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

【化61】



であり；

J_1 が、H、 CH_2CH_3 、 CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R_1 がOHでない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

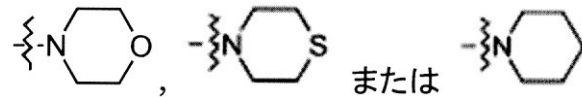
J_2 が、H、 CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_3 が、H、CN、 CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_4 が、H、CN、 CH_3 、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

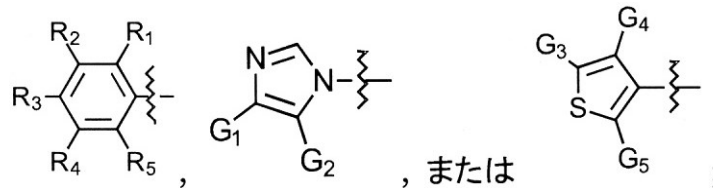
E が、

【化62】



であり、
特に、Aが、

【化63】



であり；

R_1 が、 H 、 OCH_3 、 OH 、 CH_3 、 NH_2 、 Cl 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 Br 、 I 、 CN 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_2 が、 H 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 CH_3 または NH_2 であり；

R_1 が Cl 、 F 、 Br または I のうちの1つでない場合、 R_2 が任意に F 、 Cl 、 Br および I から選択され；

R_3 が、 H 、 F 、 CN 、 Cl 、 OH 、 SCH_3 、 OCH_3 、 CH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_4 が、 H 、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、 OH 、 CH_2OH 、 F 、 Cl 、 OCH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_5 が、 H 、 CH_3 、 OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

G_1 が、 Br 、 Cl 、 I 、 CH_3 、 H 、 F または OH であり；

G_2 が、 Br 、 Cl 、 H 、 I 、 CH_3 、 F または OH であり；

G_3 が、 Cl 、 H 、 CH_3 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

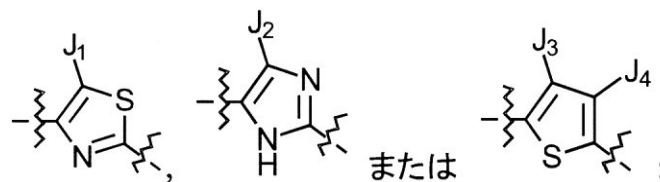
G_4 が、 Cl 、 H 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

Dが、

【化64】



であり；

J_1 が、 H 、 CH_2CH_3 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

R_1 が OH でない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

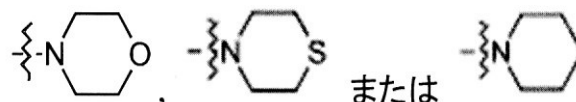
J_2 が、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_3 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_4 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

Eが、

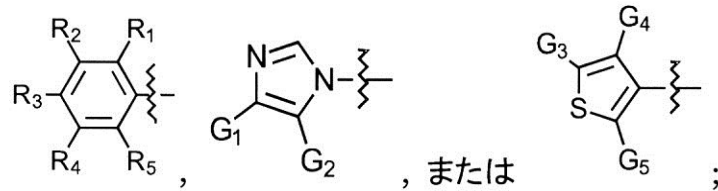
【化65】



であり、

さらに特に、Aが、

【化66】



であり；

R₁が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂またはO(CH₂)₂OCH₃であり；

R₂が、HまたはCF₃であり；

R₁が、Cl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂が、任意にFおよびClから選択され；

R₃が、H、F、CN、Cl、OHまたはSCH₃であり；

R₄が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OHまたはFであり；

R₅がHであり；

G₁が、Br、Cl、IまたはCH₃であり；

G₂が、Br、Cl、H、IまたはCH₃であり；

G₃が、Cl、H、CH₃またはBrであり；

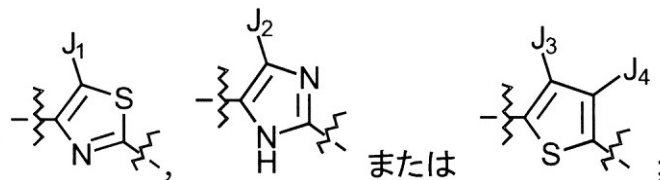
G₄が、Cl、HまたはBrであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅が、HまたはCH₂OHであり；

Dが、

【化67】



であり；

J₁が、HまたはCH₂CH₃であり；

R₁がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；

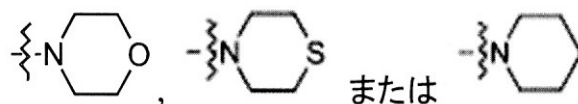
J₂がHであり；

J₃が、HまたはCNであり；

J₄がHであり；

Eが、

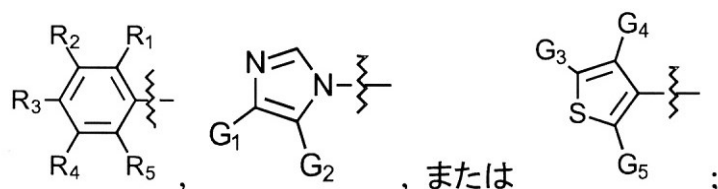
【化68】



であり、

さらにより特に、Aが、

【化69】



であり；

R₁が、H、OCH₃、OHまたはCH₃であり；

R₂ が、H または CF₃ であり；

R₁ が、Cl、F、Br または I のうちの 1 つでない場合、R₂ が、任意に F および Cl から選択され；

R₃ が、H または F であり；

R₄ が、H または CH₃ であり；

R₅ が H であり；

G₁ が、Br または Cl であり；

G₂ が、Br、Cl または H であり；

G₃ が、Cl、H、CH₃ または Br であり；

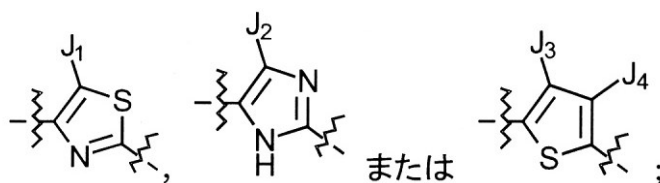
G₄ が、Cl、H または Br であり；

G₃ と G₅ の両方が共に H であるのではない場合、G₄ が任意に CH₃ であり；

G₅ が、H または CH₂OH であり；

D が、

【化 7 0】



であり；

J₁ が、H であり；

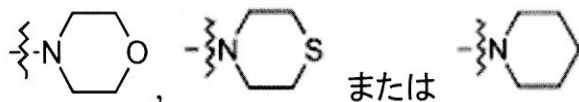
J₂ が H であり；

J₃ が、H であり；

J₄ が H であり；

E が、

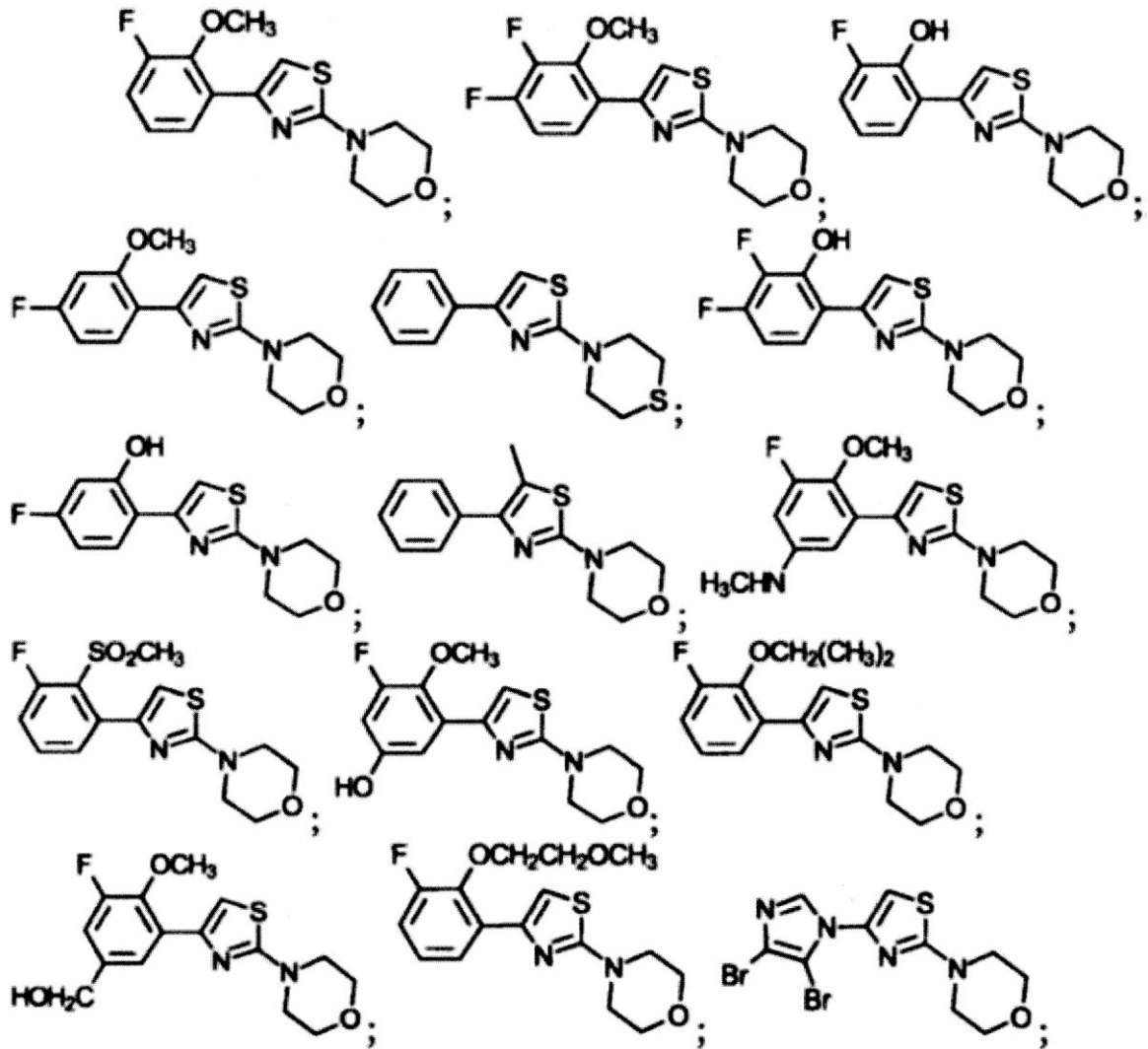
【化 7 1】



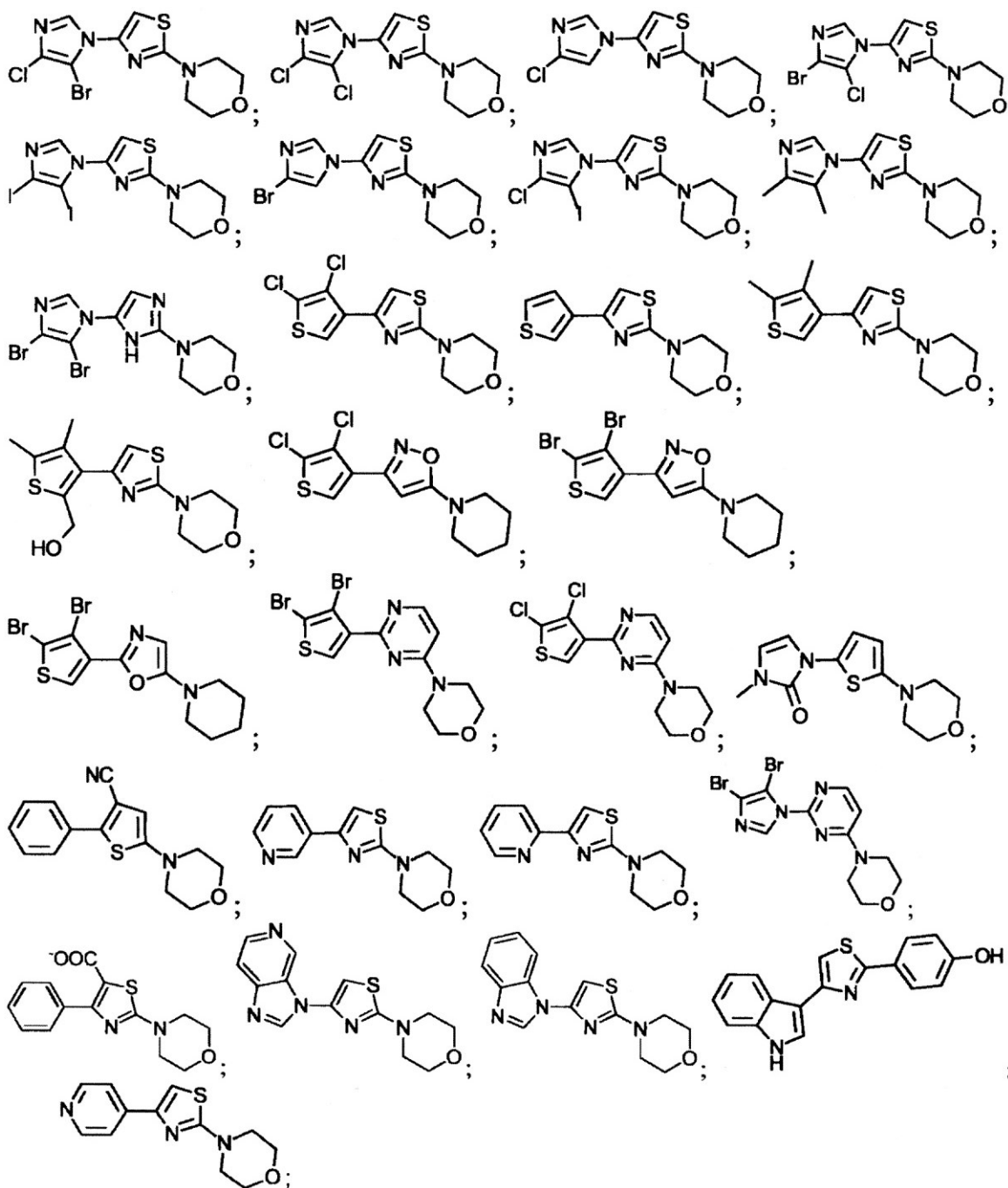
であり、

最も特に、前記化合物が、

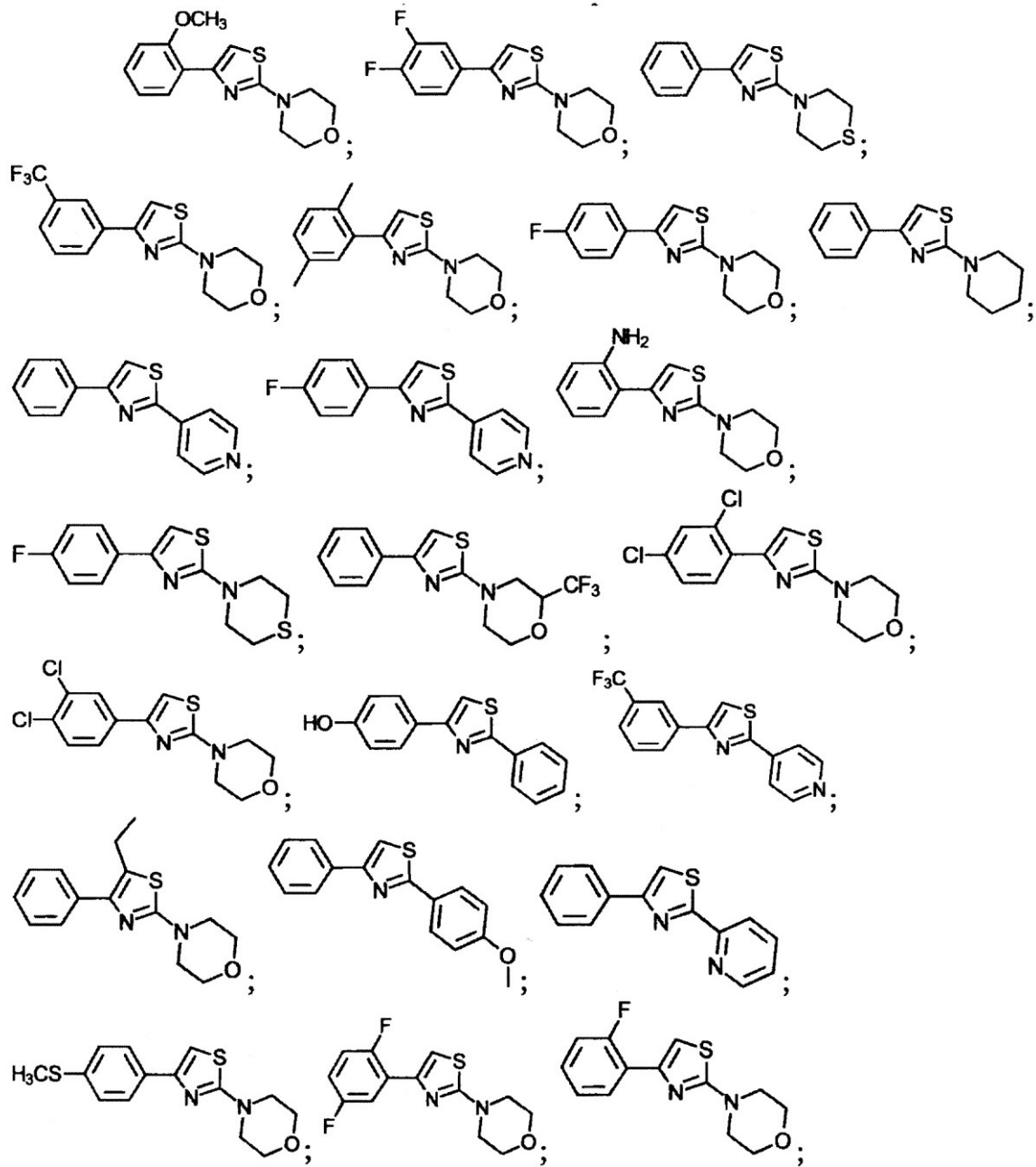
【化 7 2 - 1】



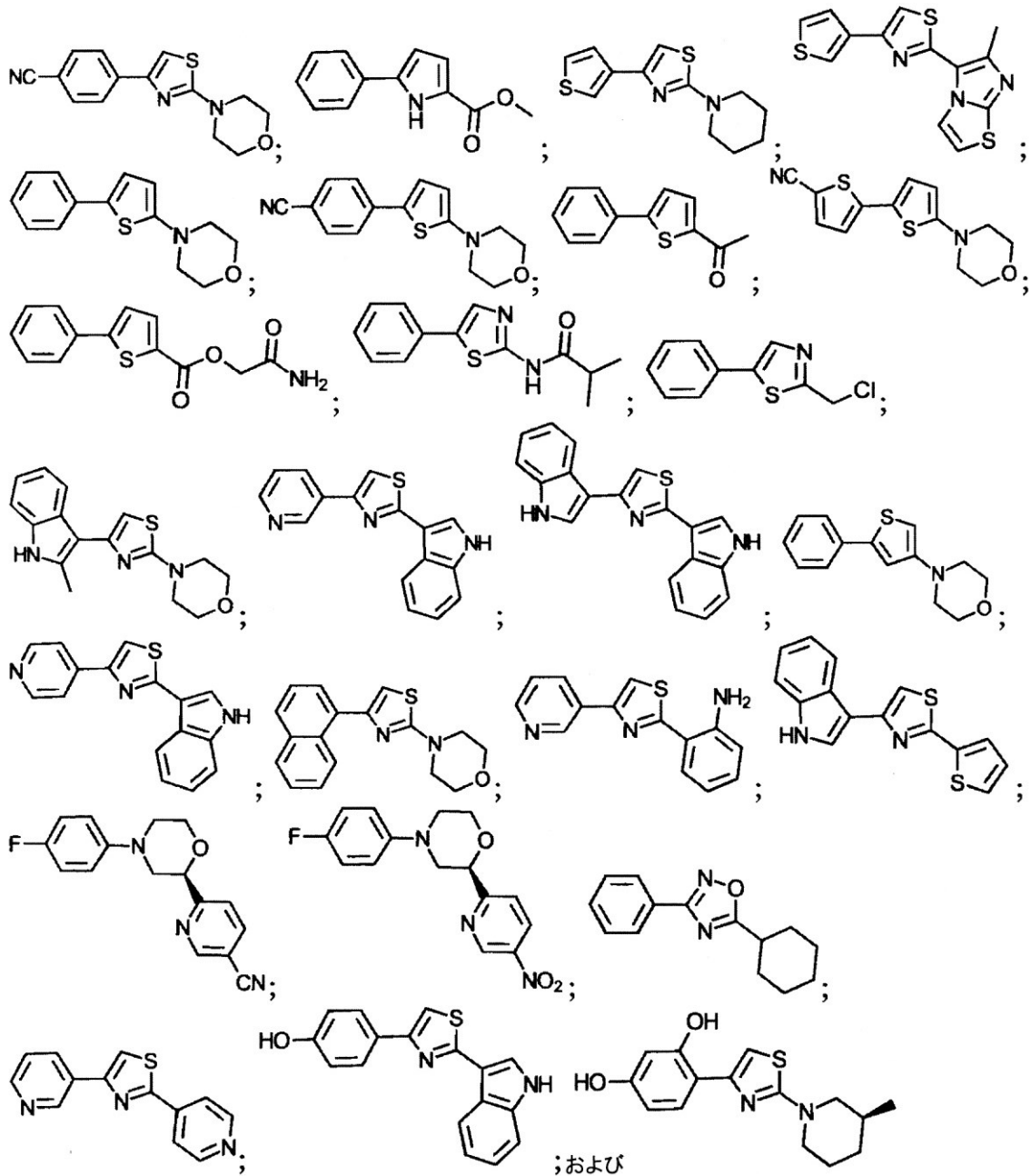
【化 7 2 - 2】



【化 7 3 - 1】



【化 7 3 - 2】



のうちの1つ以上から選択される、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

A R 活性を調節することが、がん、脱毛、にきび、多毛症、卵巣嚢腫、多嚢胞性卵巣疾患、思春期早発症および加齢黄斑変性からなる群から選択される少なくとも1つの兆候を治療するためである、請求項5または6に記載の化合物であって、特に、前記がんがA R 媒介性のがんである、化合物。

【請求項8】

前記がんが、前立腺がん、乳がん、卵巣がん、子宮内膜がんおよび膀胱がんからなる群から選択され、特に、前記がんがタキサン耐性のトリプルネガティブ乳がんである、請求項5または6に記載の化合物。

【請求項9】

A R 活性を調節する医薬を製造するための、請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項10】

A R 活性を調節するための、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 1 1】

A R 活性を調節することが、がん、脱毛、にきび、多毛症、卵巣嚢腫、多嚢胞性卵巣疾患、思春期早発症および加齢黄斑変性からなる群から選択される少なくとも 1 つの兆候を治療するためである、請求項 9 または 10 に記載の使用であって、特に、
前記がんが A R 媒介性のがんである、使用。

【請求項 1 2】

前記がんが、前立腺がん、乳がん、卵巣がん、子宮内膜がんおよび膀胱がんからなる群から選択される、請求項 9 または 10 に記載の使用であって、特に、
前記がんがタキサン耐性のトリプルネガティブ乳がんである使用。

【請求項 1 3】

請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、および医薬的に許容される担体または賦形剤を含む医薬組成物。

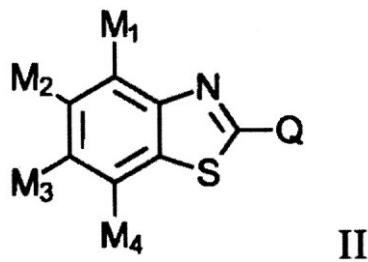
【請求項 1 4】

請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の化合物、および A R 活性を調節するのに使用するための説明書を含む商用パッケージ。

【請求項 1 5】

式 I I の構造

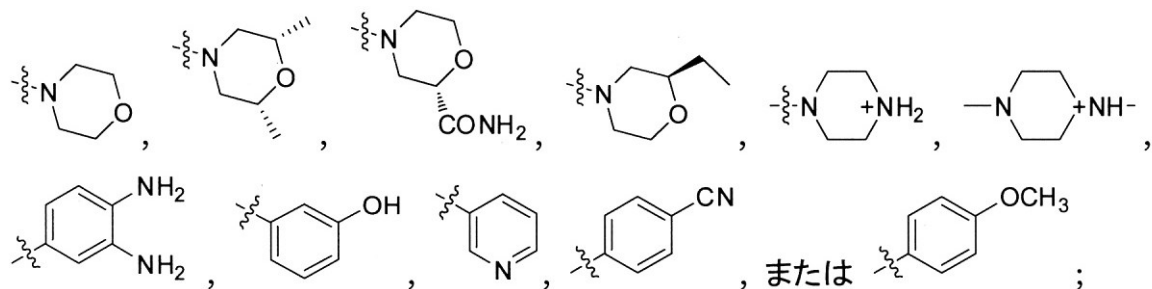
【化 7 4】



を有する化合物であって、

Q が、

【化 7 5】



であり；

M₁ が、H、CH₃、F、SO₂CH₃、OCH₃、OH、NO₂ または NH₂ であり

；

M₂ が、H、CH₃、F、SO₂CH₃、OCH₃、OH、NO₂ または NH₂ であり

；

M₃ が、H、CH₃、F、SO₂CH₃、OCH₃、OH、NO₂ または NH₂ であり

；

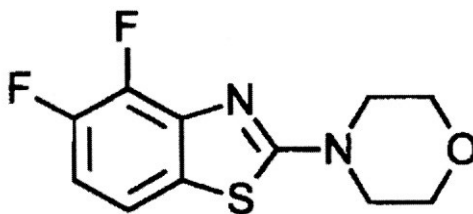
M₄ が、H、CH₃、F、SO₂CH₃、OCH₃、OH、NO₂ または NH₂ であり

；

前記化合物が、化合物 14409 を例外とし、表 1 の系列 2 セクションに見出される化合物のうち 1 つ以上でないことを条件とする、化合物であり、

特に、

【化 7 6】



である、化合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0290

【補正方法】変更

【補正の内容】

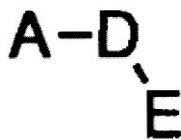
【0290】

本発明の各種態様がここで開示されるが、多くの改変および修正が、当業者の共通一般知識に従って、本発明の範囲内でなされてよい。このような修正は、実質的に同じ方法で同じ結果を実現するために、既知の均等物で本発明の任意の側面を置換することを含む。数値範囲は、範囲を定義する数を含む。「~を含む (comprising)」という語は、「~を含むがこれに限定されない (including, but not limited to)」という句と実質的に同等である、オープンエンドな語としてここで使用され、「~を含む (comprises)」という語は一致する意味を有する。ここでは、単数形「a」、「an」および「the」は、文脈で別に明確に定められない限り、複数の指示対象を含む。したがって、例えば、「a thing」に言及することは、1つを超えるこのような物を含む。ここでの参考文献の引用は、このような参考文献が本発明の態様に対する従来技術であると認めるものではない。本明細書で引用される、特許および特許出願を含むがこれに限定されない、任意の優先権書類および全ての公報は、各個別の公報が参照によりここに組み込まれることを具体的にかつ個別に示されるものとして、またここに完全に記載されるものとして、参照によりここに組み込まれる。本発明は、上記のように、例および図を参照して、実質的に全ての態様および変更を含む。

以下に、本願の出願当初の請求項を実施の態様として付記する。

[1] 式 I の構造

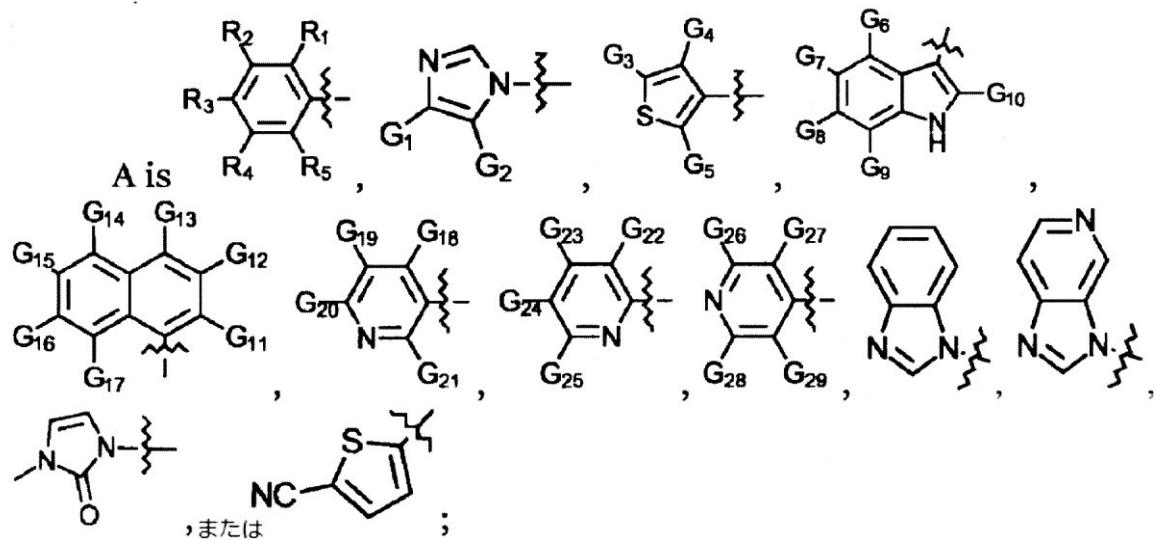
【化 5 5】



を有する化合物であって、

A が、

【化56】



であり；

R_1 が、 H 、 OCH_3 、 OH 、 CH_3 、 NH_2 、 Cl 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 Br 、 I 、 CN 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 、 $NHCH_3$ 、 CN または CF_3 であり；

R_2 が、 H 、 CF_3 、 OH 、 CH_3 、 CN 、 NH_2 、 CH_2OH 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_2CH_3 または OCH_2CH_3 であり；

R_3 が Cl 、 F 、 Br または I のうちの一つでない場合、 R_2 が任意に F 、 Cl 、 Br および I から選択され；

R_4 が、 H 、 F 、 CN 、 Cl 、 OH 、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_3 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、 Br 、 I 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_5 が、 H 、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、 OH 、 CH_2OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、 Br 、 I 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

G_1 が、 Br 、 Cl 、 I 、 CH_3 、 H 、 F または OH であり；

G_2 が、 Br 、 Cl 、 H 、 I 、 CH_3 、 F または OH であり；

G_3 が、 Cl 、 H 、 CH_3 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_4 が、 Cl 、 H 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_6 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_7 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_8 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_9 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_{10} が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_{11} ~ G_{17} が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH から独立に選択され；

G_{18} ~ G_{21} が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH から独立に選択され；

G_{22} ~ G_{25} が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH から独立に選択され；

G₂₆ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

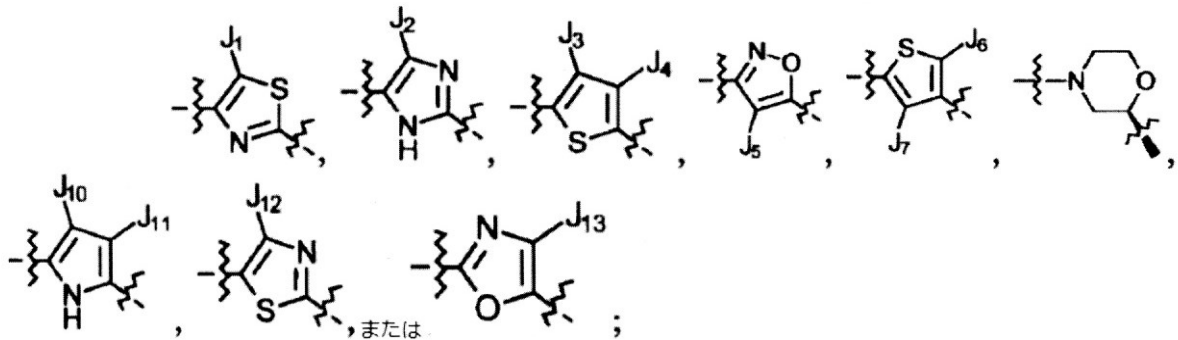
G₂₇ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G₂₈ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G₂₉ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

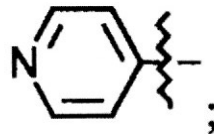
【化57】



であり；

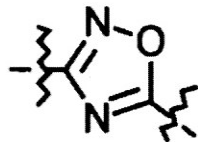
A が、

【化58】



である場合、Dが任意に、

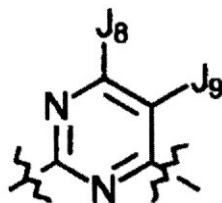
【化59】



であり；

R₁ ~ R₅ が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化60】



であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、F、COOHまたはOHであり

；

R₁ がOHでない場合、J₁ が任意にCH₃であり；

J₂ が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₄ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₅ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₆ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₇ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₈ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₉ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₁₀ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

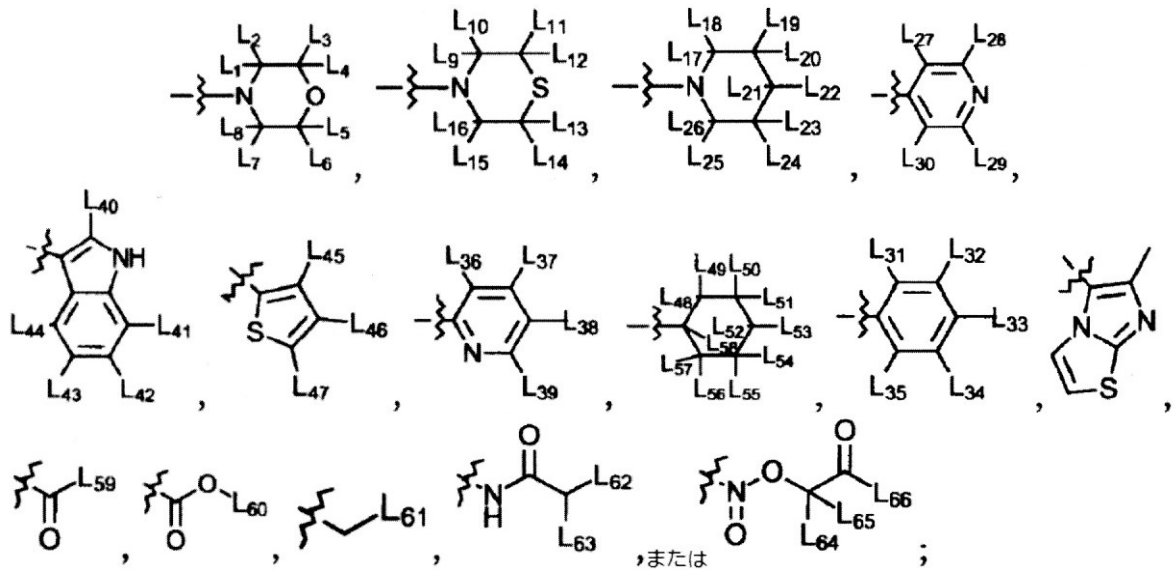
J_{11} が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_{12} が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J_{13} が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Eが、

【化61】



であり；

$L_1 \sim L_8$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

$L_9 \sim L_{16}$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

$L_{17} \sim L_{26}$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

$L_{27} \sim L_{30}$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

$L_{31} \sim L_{35}$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

$L_{36} \sim L_{39}$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

$L_{40} \sim L_{44}$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

$L_{45} \sim L_{47}$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

$L_{48} \sim L_{58}$ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L_{59} が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L_{60} が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L_{61} が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L_{62} が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L_{63} が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、OHまたはCF₃であり；

L_{64} が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、

OH または CF₃ であり;

L₆₅ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、

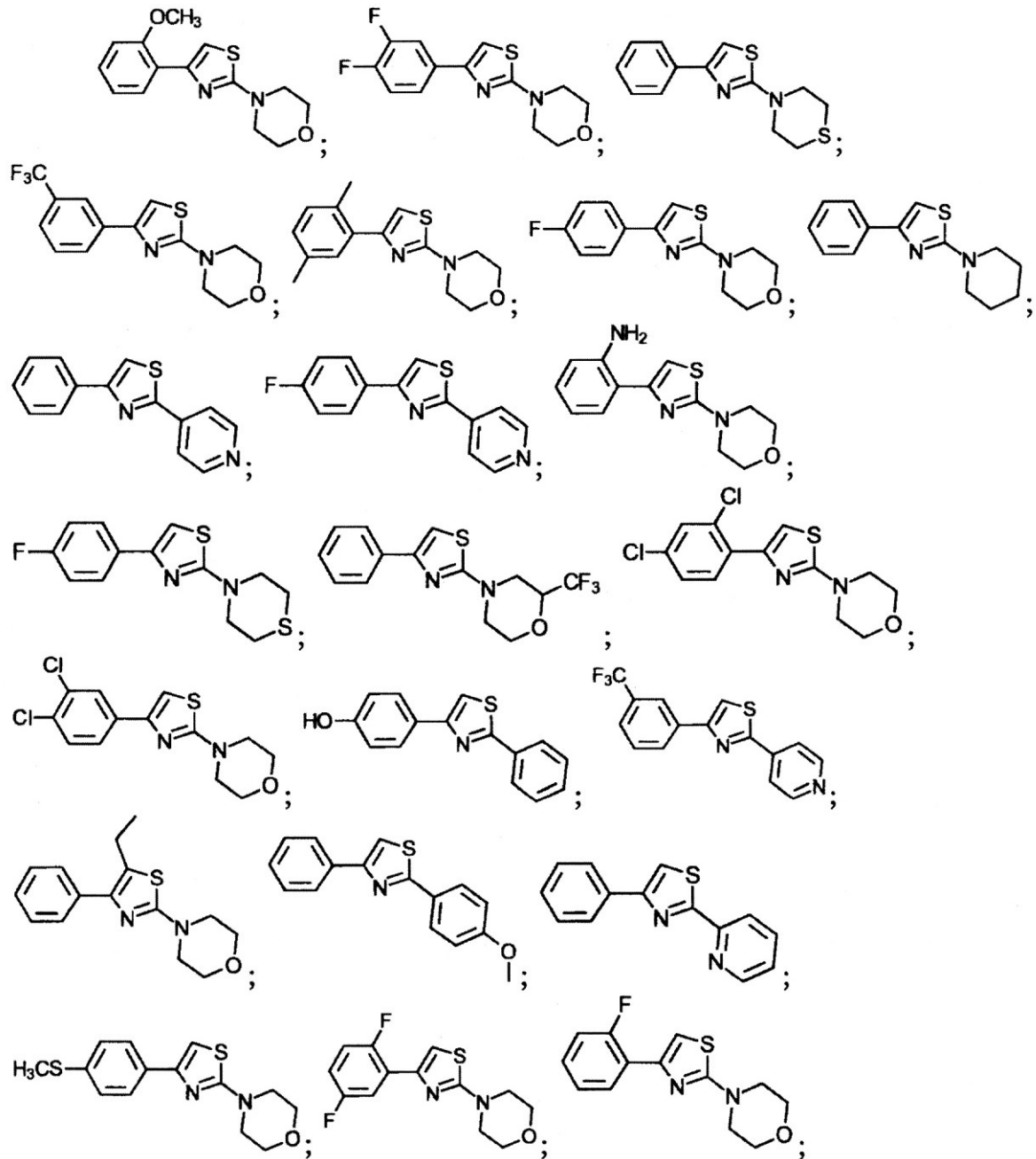
OH または CF₃ であり;

L₆₆ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、

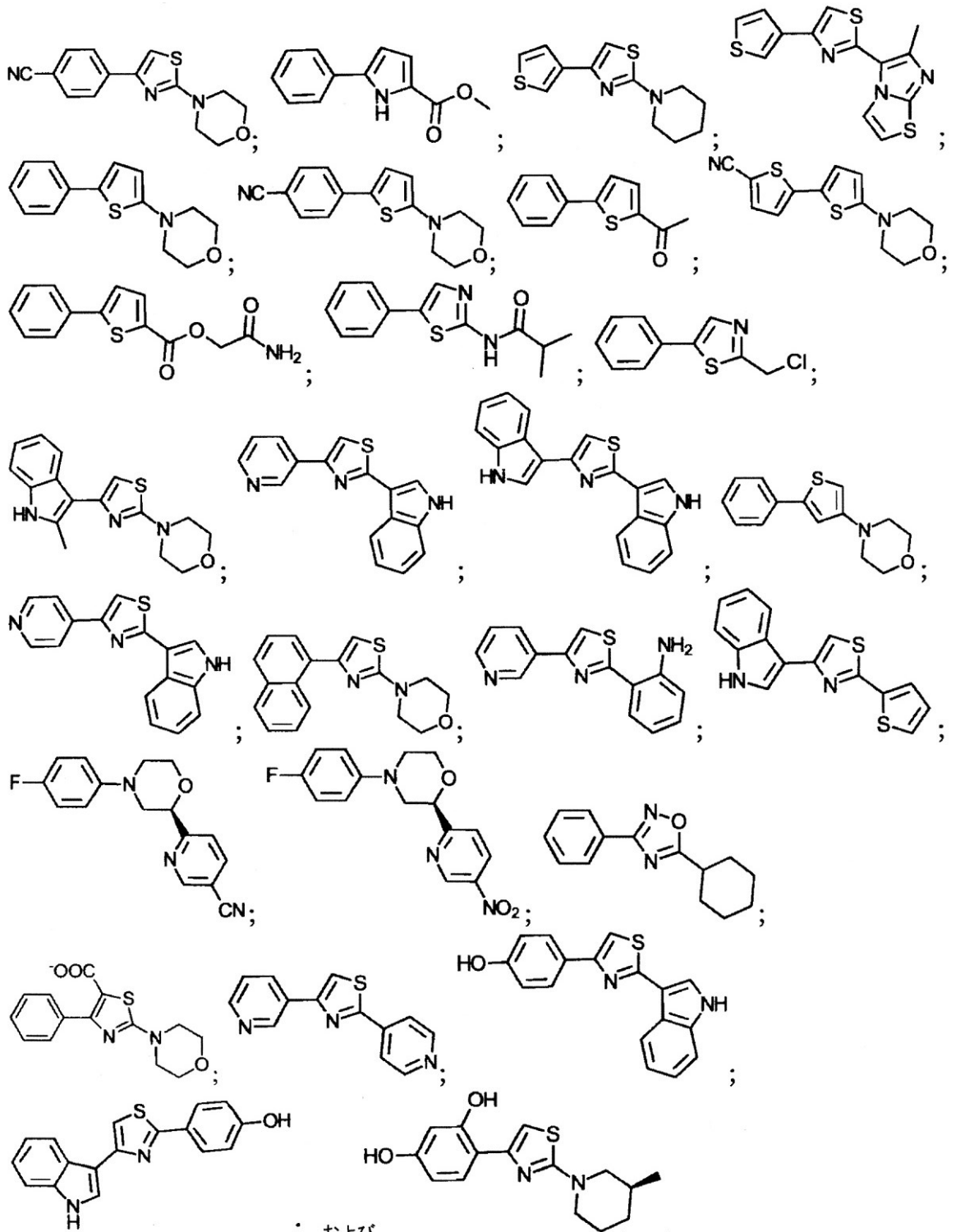
OH または CF₃ であり;

前記化合物が、

【化 62 - 1】



【化62-2】

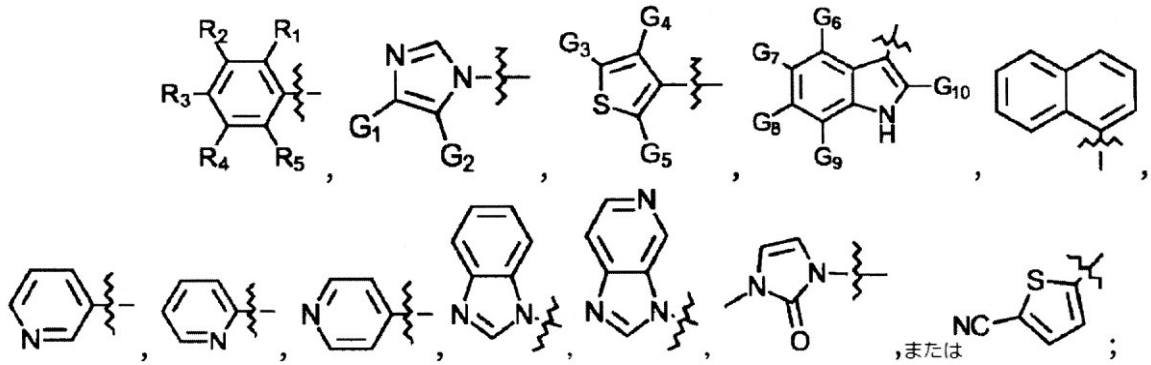


; および

のうちの1つ以上でないことを条件とする、化合物。

[2] Aが、

【化63】



であり；

R_1 が、 H 、 OCH_3 、 OH 、 CH_3 、 NH_2 、 Cl 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 Br 、 I 、 CN 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 、 $NHCH_3$ 、 CN または CF_3 であり；

R_2 が、 H 、 CF_3 、 OH 、 CH_3 、 CN 、 NH_2 、 CH_2OH 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_2CH_3 または OCH_2CH_3 であり；

R_3 が Cl 、 F 、 Br または I のうちの1つでない場合、 R_2 が任意に F 、 Cl 、 Br および I から選択され；

R_4 が、 H 、 F 、 CN 、 Cl 、 OH 、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_3 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、 Br 、 I 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_5 が、 H 、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、 OH 、 CH_2OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、 Br 、 I 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_6 が、 H 、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、 OH 、 CH_2OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、 Br 、 I 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

G_1 が、 Br 、 Cl 、 I 、 CH_3 、 H 、 F または OH であり；

G_2 が、 Br 、 Cl 、 H 、 I 、 CH_3 、 F または OH であり；

G_3 が、 Cl 、 H 、 CH_3 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_4 が、 Cl 、 H 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_6 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_7 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

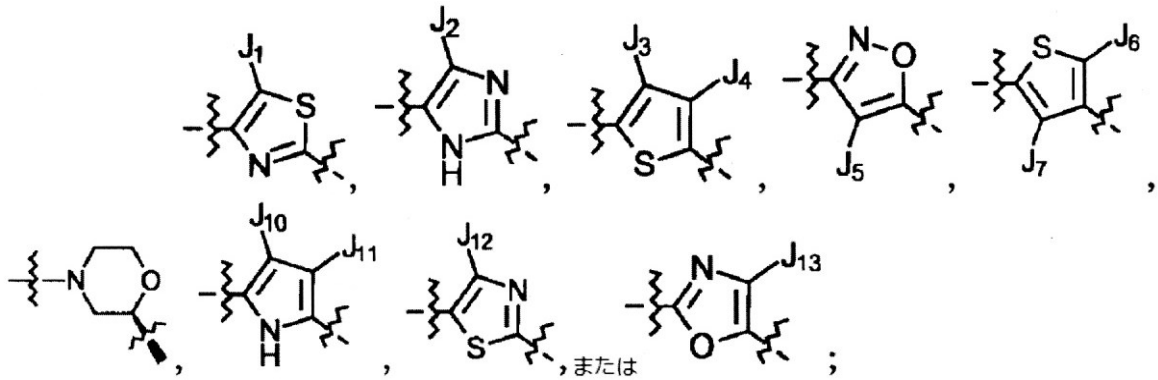
G_8 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_9 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_{10} が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

D が、

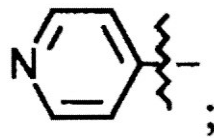
【化64】



であり；

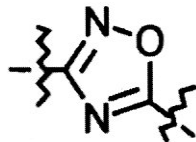
A が、

【化65】



である場合、Dが任意に、

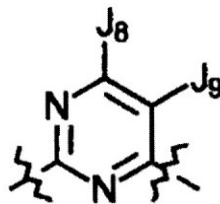
【化66】



であり；

R₁ ~ R₅ が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化67】



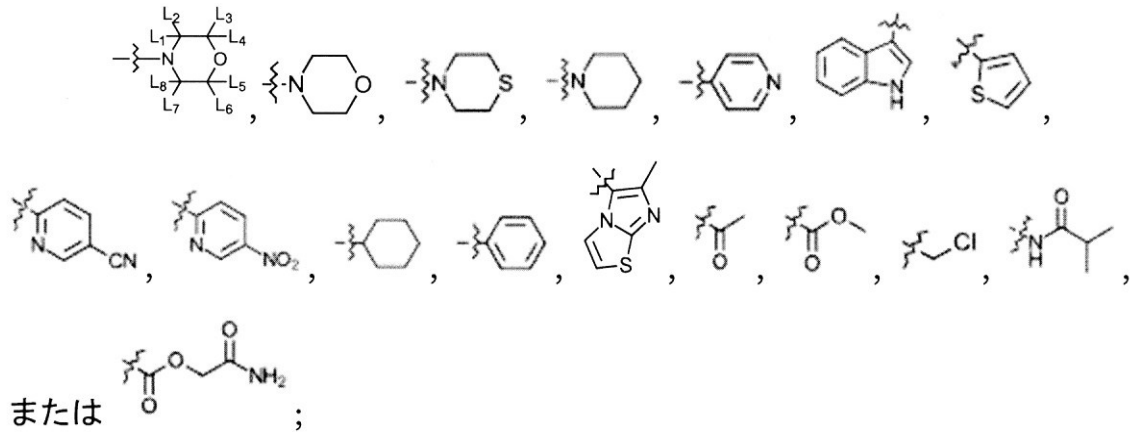
であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、F、COOHまたはOHであり

；

R₁ がOHでない場合、J₁ が任意にCH₃であり；J₂ が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₄ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₅ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₆ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₇ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₈ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₉ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₀ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₁ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₂ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；J₁₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；E が、

【化68】



であり；

L_1 が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_2 が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_3 が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_4 が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_5 が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

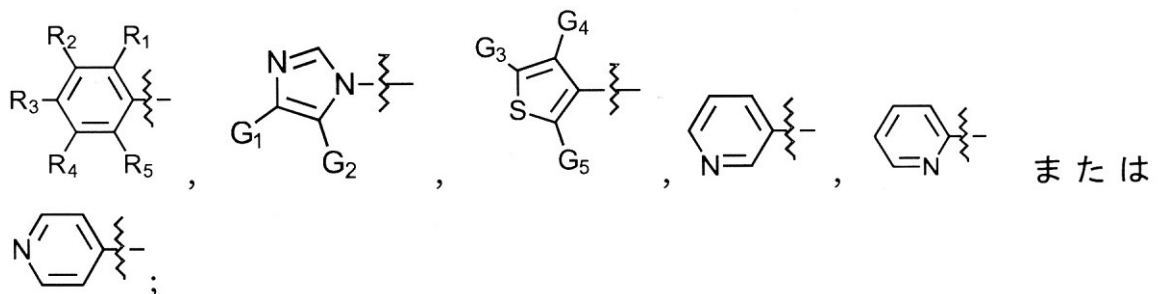
L_6 が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_7 が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_8 が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 である、[1]に記載の化合物。

[3] Aが、

【化69】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH、 CH_3 、 NH_2 、Cl、 SO_2CH_3 、 $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、Br、I、CN、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 、 NHCH_3 、CN または CF_3 であり；

R_2 が、H、 CF_3 、OH、 CH_3 、CN、 NH_2 、 CH_2OH 、 SO_2CH_3 、 $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 CH_2CH_3 または OCH_2CH_3 であり；

R_1 が Cl、F、Br または I のうちの1つでない場合、 R_2 が任意に F、Cl、Br および I から選択され；

R_3 が、H、F、CN、Cl、OH、 SCH_3 、 OCH_3 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 CH_3 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 NHCH_3 、Br、I、 CH_2O

H、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₄が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

G₁が、Br、Cl、I、CH₃、H、FまたはOHであり；

G₂が、Br、Cl、H、I、CH₃、FまたはOHであり；

G₃が、Cl、H、CH₃、Br、I、FまたはOHであり；

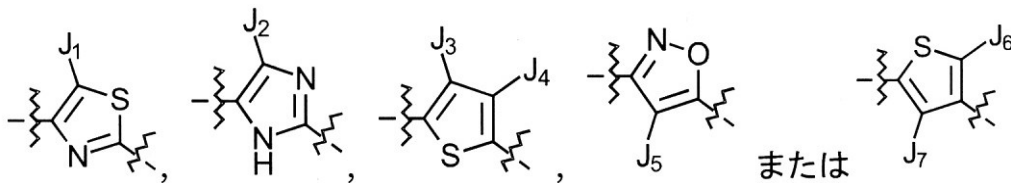
G₄が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Dが、

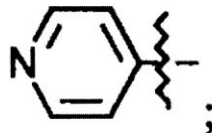
【化70】



であり；

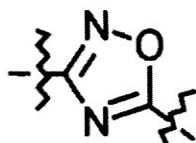
Aが、

【化71】



である場合、Dが任意に、

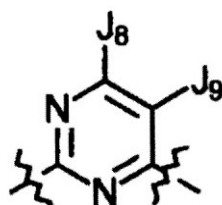
【化72】



であり；

R₁ ~ R₅が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化73】



であり；

J₁が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R₁がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；

J₂が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₄が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₅が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₆が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

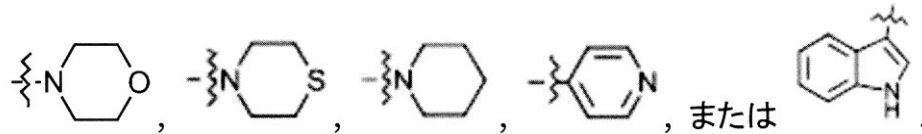
J₇ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₈ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₉ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

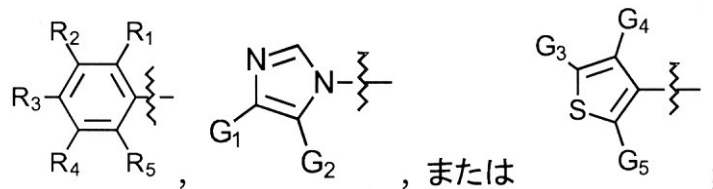
【化74】



である、[1]または[2]に記載の化合物。

[4] Aが、

【化75】



であり；

R₁ が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、Br、I、CN、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃、NHCH₃、CNまたはCF₃であり；

R₂ が、H、CF₃、OH、CH₃、NH₂、CN、CH₂OH、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、CH₂CH₃またはOCH₂CH₃であり；

R₃ がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂ が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R₄ が、H、F、CN、Cl、OH、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、CH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

G₁ が、Br、Cl、I、CH₃、H、FまたはOHであり；

G₂ が、Br、Cl、H、I、CH₃、FまたはOHであり；

G₃ が、Cl、H、CH₃、Br、I、FまたはOHであり；

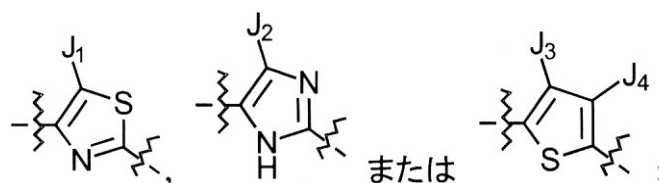
G₄ が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

【化76】



であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R₁ がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；

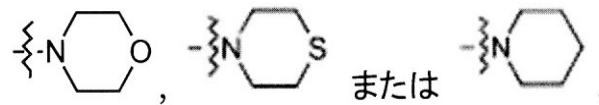
J₂ が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₄ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

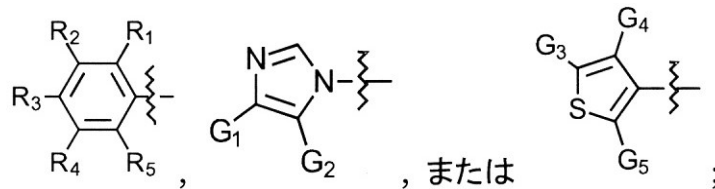
【化77】



である、[1]、[2]または[3]に記載の化合物。

[5] Aが、

【化78】



であり；

R₁ が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、Br、I、CN、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₂ が、H、CF₃、OH、CN、CH₃またはNH₂であり；

R₃ がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R₄ が、H、F、CN、Cl、OH、SCH₃、OCH₃、CH₃、NH₂、Br、I、CH₂OH、CH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、NH₂、Br、IまたはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、OH、F、CN、Cl、NH₂、Br、IまたはCF₃であり；

G₁ が、Br、Cl、I、CH₃、H、FまたはOHであり；

G₂ が、Br、Cl、H、I、CH₃、FまたはOHであり；

G₃ が、Cl、H、CH₃、Br、I、FまたはOHであり；

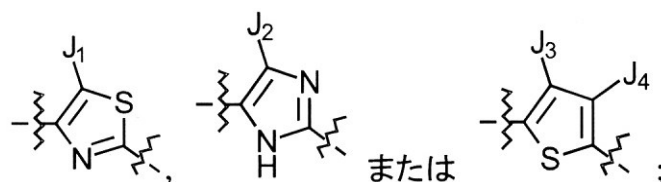
G₄ が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Dが、

【化79】



であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

R₁ がOHでない場合、J₁が任意にCH₃であり；

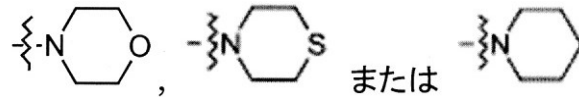
J₂ が、H、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃ が、H、CN、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₄ が、H、CN、CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

Eが、

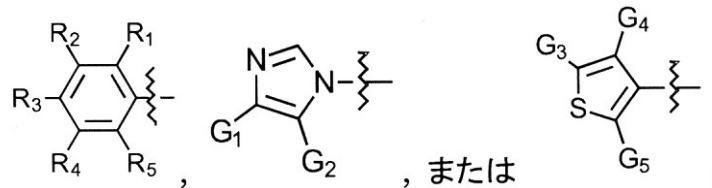
【化80】



である、[1]から[4]のいずれか一項に記載の化合物。

[6] Aが、

【化81】



であり；

R_1 が、 H 、 OCH_3 、 OH 、 CH_3 、 NH_2 、 Cl 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 Br 、 I 、 CN 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_2 が、 H 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 CH_3 または NH_2 であり；

R_1 が Cl 、 F 、 Br または I のうちの1つでない場合、 R_2 が任意に F 、 Cl 、 Br および I から選択され；

R_3 が、 H 、 F 、 CN 、 Cl 、 OH 、 SCH_3 、 OCH_3 、 CH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_4 が、 H 、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、 OH 、 CH_2OH 、 F 、 Cl 、 OCH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_5 が、 H 、 CH_3 、 OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

G_1 が、 Br 、 Cl 、 I 、 CH_3 、 H 、 F または OH であり；

G_2 が、 Br 、 Cl 、 H 、 I 、 CH_3 、 F または OH であり；

G_3 が、 Cl 、 H 、 CH_3 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

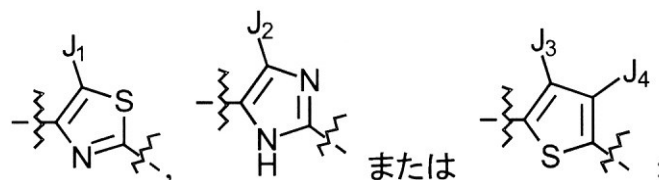
G_4 が、 Cl 、 H 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

Dが、

【化82】



であり；

J_1 が、 H 、 CH_2CH_3 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

R_1 が OH でない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

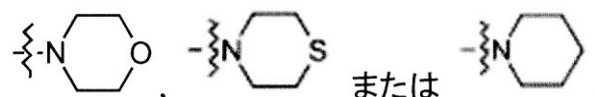
J_2 が、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_3 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_4 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

Eが、

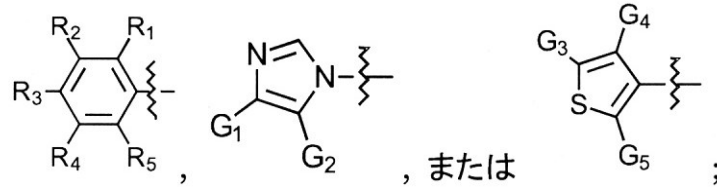
【化83】



である、[1]から[5]のいずれか一項に記載の化合物。

[7] Aが、

【化 8 4】



であり ;

R₁ が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂ または O(CH₂)₂OCH₃ であり ;

R₂ が、H または CF₃ であり ;

R₃ が、Cl、F、Br または I のうちの 1 つでない場合、R₂ が、任意に F および Cl から選択され ;

R₄ が、H、F、CN、Cl、OH または SCH₃ であり ;

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH または F であり ;

R₅ が H であり ;

G₁ が、Br、Cl、I または CH₃ であり ;

G₂ が、Br、Cl、H、I または CH₃ であり ;

G₃ が、Cl、H、CH₃ または Br であり ;

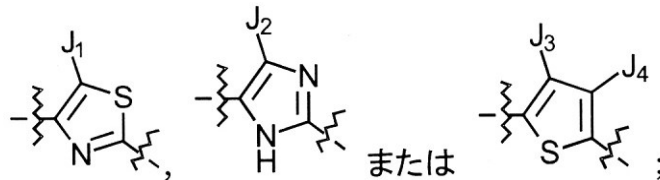
G₄ が、Cl、H または Br であり ;

G₃ と G₅ の両方が共に H であるのではない場合、G₄ が任意に CH₃ であり ;

G₅ が、H または CH₂OH であり ;

D が、

【化 8 5】



であり ;

J₁ が、H または CH₂CH₃ であり ;

R₁ が OH でない場合、J₁ が任意に CH₃ であり ;

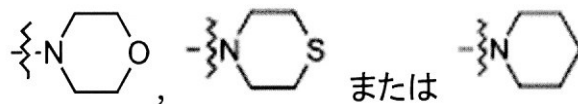
J₂ が H であり ;

J₃ が、H または CN であり ;

J₄ が H であり ;

E が、

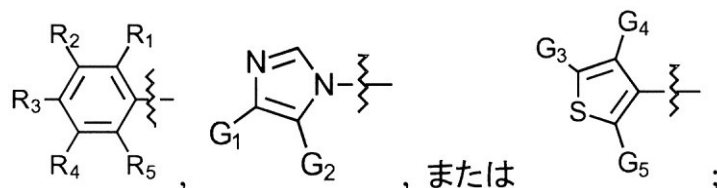
【化 8 6】



である、[1] から [6] のいずれか一項に記載の化合物。

[8] A が、

【化 8 7】



であり ;

R₁ が、H、OCH₃、OH または CH₃ であり ;

R₂ が、H または CF₃ であり ;

R₁ が、Cl、F、Br または I のうちの 1 つでない場合、R₂ が、任意に F および C
1 から選択され；

R₃ が、H または F であり；

R₄ が、H または CH₃ であり；

R₅ が H であり；

G₁ が、Br または Cl であり；

G₂ が、Br、Cl または H であり；

G₃ が、Cl、H、CH₃ または Br であり；

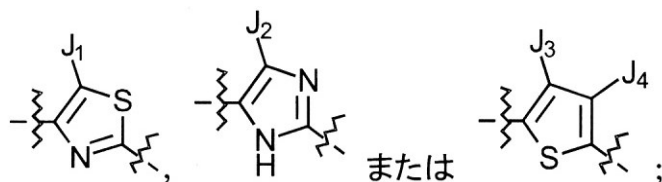
G₄ が、Cl、H または Br であり；

G₃ と G₅ の両方が共に H であるのではない場合、G₄ が任意に CH₃ であり；

G₅ が、H または CH₂OH であり；

D が、

【化 8 8】



であり；

J₁ が、H であり；

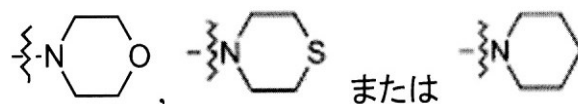
J₂ が H であり；

J₃ が、H であり；

J₄ が H であり；

E が、

【化 8 9】



である、[1] から [7] のいずれか一項に記載の化合物。

[9] 前記化合物が、

G₁₀ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G₁₁ ~ G₁₇ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

G₁₈ ~ G₂₁ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

G₂₂ ~ G₂₅ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHから独立に選択され；

G₂₆ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

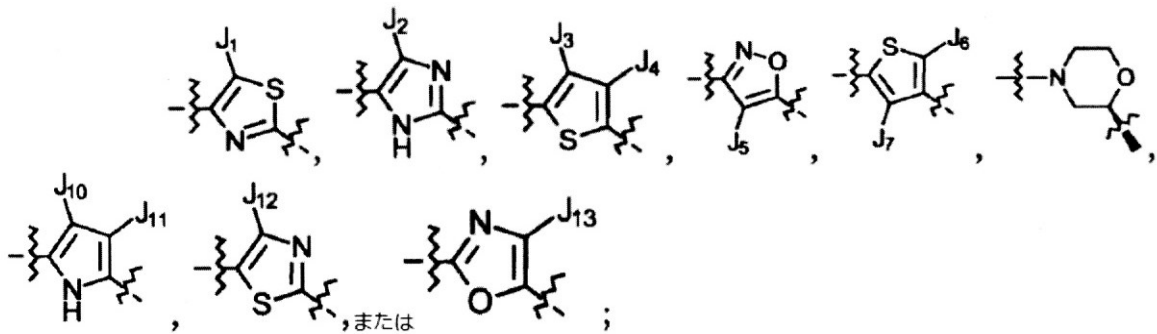
G₂₇ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G₂₈ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G₂₉ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

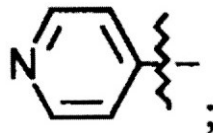
【化94】



であり；

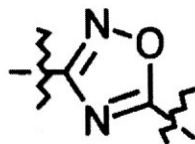
A が、

【化95】



である場合、Dが任意に、

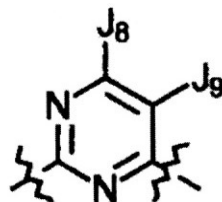
【化96】



であり；

R₁ ~ R₅ が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化97】



であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、F、COOHまたはOHであり

；

R₁ がOHでない場合、J₁ が任意にCH₃であり；

J₂ が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

L_{61} が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_{62} が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_{63} が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

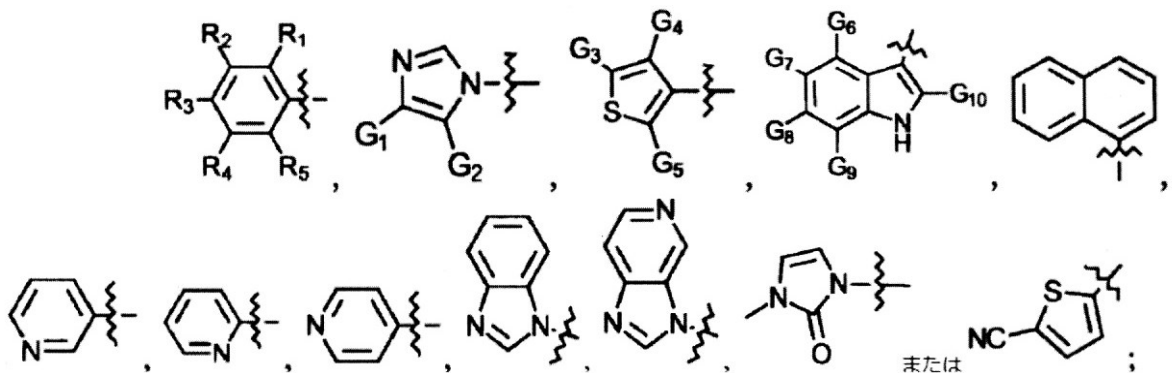
L_{64} が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_{65} が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 であり；

L_{66} が、H、CN、 NH_2 、 NO_2 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、Br、I、F、OH または CF_3 である、方法。

[1 2] A が、

【化 9 9】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH、 CH_3 、 NH_2 、Cl、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、Br、I、CN、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 、 $NHCH_3$ 、CN または CF_3 であり；

R_2 が、H、 CF_3 、OH、 CH_3 、CN、 NH_2 、 CH_2OH 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_2CH_3 または OCH_2CH_3 であり；

R_3 が Cl、F、Br または I のうちの 1 つでない場合、 R_2 が任意に F、Cl、Br および I から選択され；

R_4 が、H、F、CN、Cl、OH、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 CH_3 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_5 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_6 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH 、F、CN、Cl、 SCH_3 、 OCH_3 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 NH_2 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $NHCH_3$ 、Br、I、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

G_1 が、Br、Cl、I、 CH_3 、H、F または OH であり；

G_2 が、Br、Cl、H、I、 CH_3 、F または OH であり；

G_3 が、Cl、H、 CH_3 、Br、I、F または OH であり；

G_4 が、Cl、H、Br、I、F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

G_6 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

G_7 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

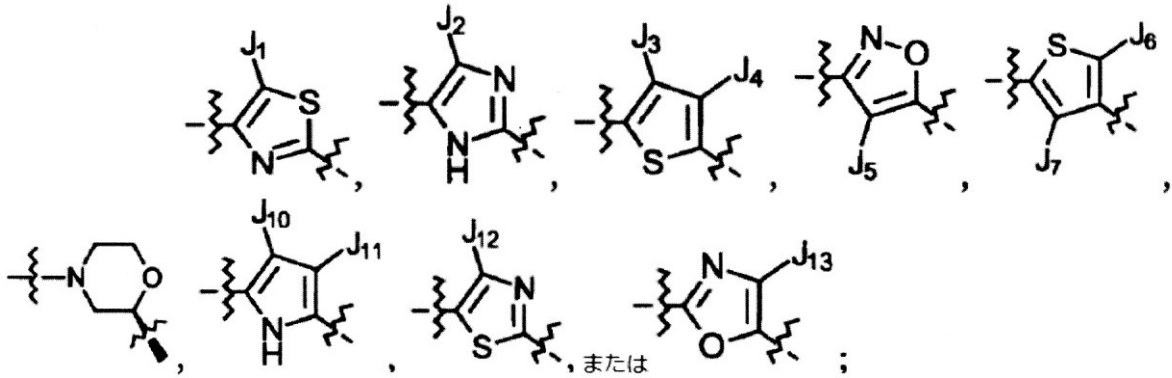
G_8 が、H、 CH_2OH 、Cl、Br、I、F または OH であり；

G₉ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

G₁₀ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

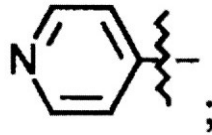
【化100】



であり；

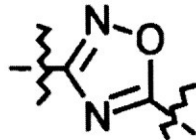
A が、

【化101】



である場合、Dが任意に、

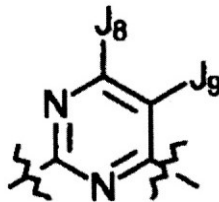
【化102】



であり；

R₁ ~ R₅ が全てHであるのではない場合、Dが任意に、

【化103】



であり；

J₁ が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、F、COOHまたはOHであり

；

R₁ がOHでない場合、J₁ が任意にCH₃であり；

J₂ が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₄ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₅ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₆ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₇ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₈ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₉ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₁₀ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

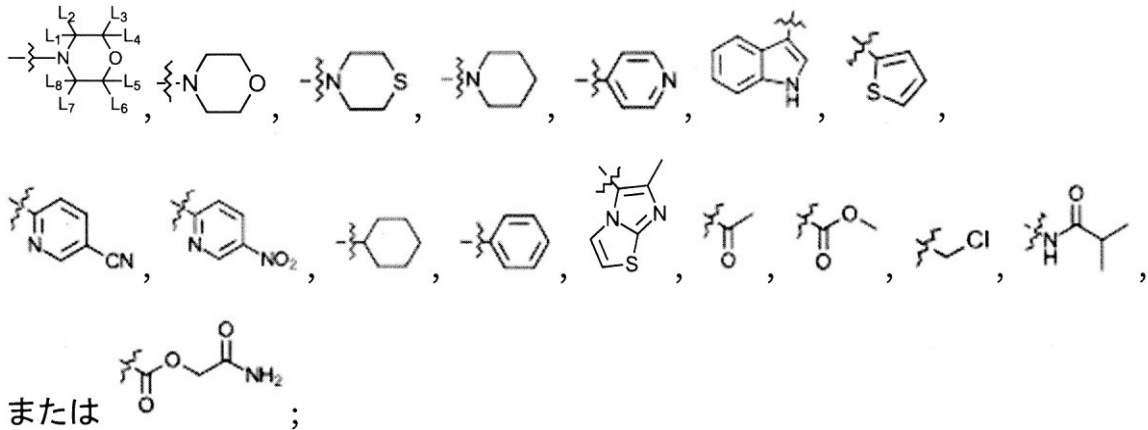
J₁₁ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₁₂ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

J₁₃ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

【化104】



であり；

L₁ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、O
HまたはCF₃であり；

L₂ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、O
HまたはCF₃であり；

L₃ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、O
HまたはCF₃であり；

L₄ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、O
HまたはCF₃であり；

L₅ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、O
HまたはCF₃であり；

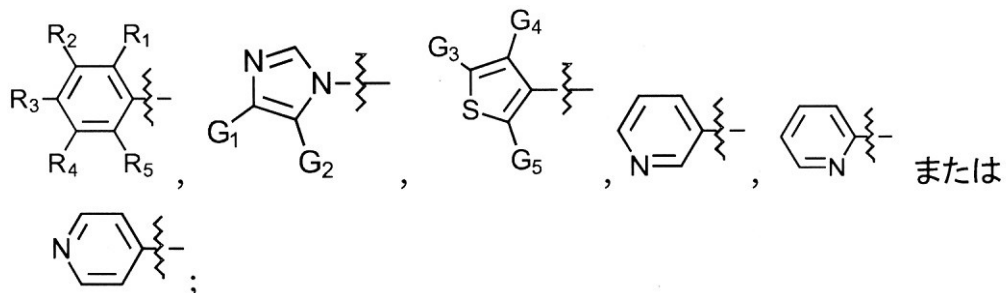
L₆ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、O
HまたはCF₃であり；

L₇ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、O
HまたはCF₃であり；かつ

L₈ が、H、CN、NH₂、NO₂、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F、O
HまたはCF₃である、[11]に記載の方法。

[13] A が、

【化105】



であり；

R₁ が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、Br、I、CN、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃、NHCH₃、CNまたはCF₃であり；

R₂ が、H、CF₃、OH、CH₃、CN、NH₂、CH₂OH、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、CH₂CH₃またはOCH₂CH₃であり；

R₃ がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂が任意にF、Cl、Br

および I から選択され；

R_3 が、H、F、CN、Cl、OH、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、CH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃ または CF₃ であり；

R_4 が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃ または CF₃ であり；

R_5 が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃ または CF₃ であり；

G_1 が、Br、Cl、I、CH₃、H、F または OH であり；

G_2 が、Br、Cl、H、I、CH₃、F または OH であり；

G_3 が、Cl、H、CH₃、Br、I、F または OH であり；

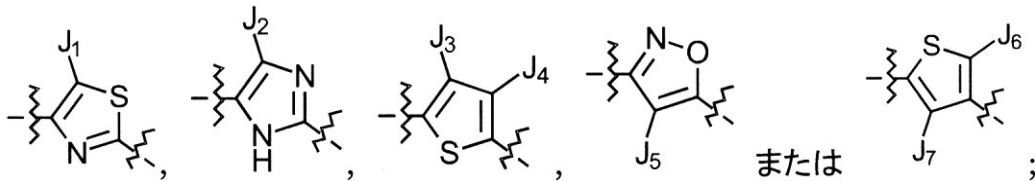
G_4 が、Cl、H、Br、I、F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH₃ であり；

G_5 が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、F または OH であり；

D が、

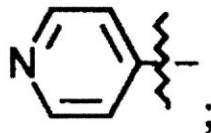
【化 106】



であり；

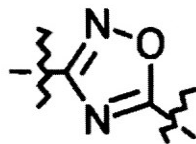
A が、

【化 107】



である場合、D が任意に、

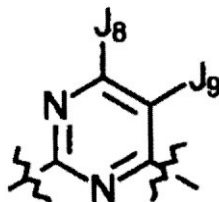
【化 108】



であり；

$R_1 \sim R_5$ が全て H であるのではない場合、D が任意に、

【化 109】



であり；

J_1 が、H、CH₂CH₃、CH₃、Cl、Br、I、F または OH であり；

R_1 が OH でない場合、 J_1 が任意に CH₃ であり；

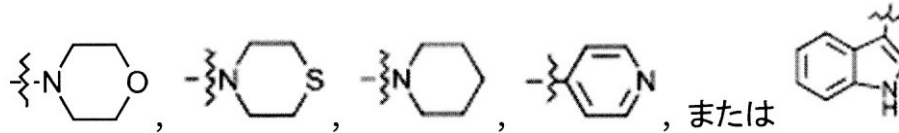
J_2 が、H、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F または OH であり；

J_3 が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、F または OH であり；

J₄ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；
J₅ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；
J₆ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；
J₇ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；
J₈ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；
J₉ が、H、CN、CH₃、CH₂CH₃、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

E が、

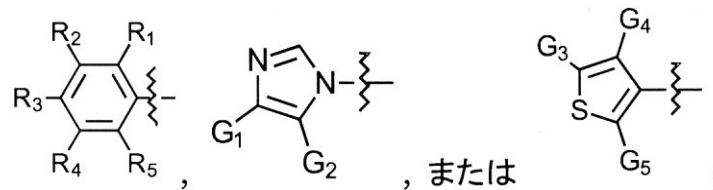
【化110】



である、[11]または[12]に記載の方法。

[14] Aが、

【化111】



であり；

R₁ が、H、OCH₃、OH、CH₃、NH₂、Cl、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、Br、I、CN、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃、NHCH₃、CNまたはCF₃であり；

R₂ が、H、CF₃、OH、CH₃、NH₂、CN、CH₂OH、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、O(CH₂)₂OCH₃、CH₂CH₃またはOCH₂CH₃であり；

R₃ がCl、F、BrまたはIのうちの一つでない場合、R₂が任意にF、Cl、BrおよびIから選択され；

R₄ が、H、F、CN、Cl、OH、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、CH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂OH、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

R₅ が、H、CH₃、NHCH₃、OH、CH₂OH、F、CN、Cl、SCH₃、OCH₃、O(CH₂)₂OCH₃、NH₂、SO₂CH₃、OCH(CH₃)₂、NHCH₃、Br、I、CH₂CH₃、OCH₂CH₃またはCF₃であり；

G₁ が、Br、Cl、I、CH₃、H、FまたはOHであり；

G₂ が、Br、Cl、H、I、CH₃、FまたはOHであり；

G₃ が、Cl、H、CH₃、Br、I、FまたはOHであり；

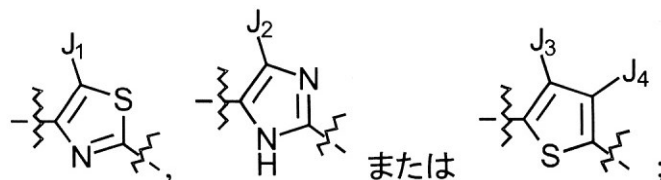
G₄ が、Cl、H、Br、I、FまたはOHであり；

G₃とG₅の両方が共にHであるのではない場合、G₄が任意にCH₃であり；

G₅ が、H、CH₂OH、Cl、Br、I、FまたはOHであり；

D が、

【化112】



であり；

J_1 が、 H 、 CH_2CH_3 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

R_1 が OH でない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

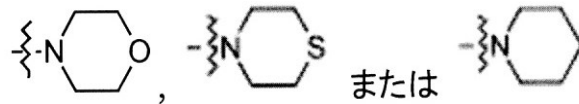
J_2 が、 H 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_3 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_4 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

E が、

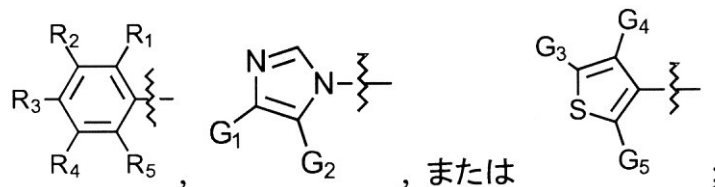
【化113】



である、[11]、[12]または[13]に記載の方法。

[15] A が、

【化114】



であり；

R_1 が、 H 、 OCH_3 、 OH 、 CH_3 、 NH_2 、 Cl 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 Br 、 I 、 CN 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_2 が、 H 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 CH_3 または NH_2 であり；

R_1 が Cl 、 F 、 Br または I のうちの1つでない場合、 R_2 が任意に F 、 Cl 、 Br および I から選択され；

R_3 が、 H 、 F 、 CN 、 Cl 、 OH 、 SCH_3 、 OCH_3 、 CH_3 、 NH_2 、 Br 、 I 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_4 が、 H 、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、 OH 、 CH_2OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 SCH_3 、 OCH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_5 が、 H 、 CH_3 、 OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

G_1 が、 Br 、 Cl 、 I 、 CH_3 、 H 、 F または OH であり；

G_2 が、 Br 、 Cl 、 H 、 I 、 CH_3 、 F または OH であり；

G_3 が、 Cl 、 H 、 CH_3 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

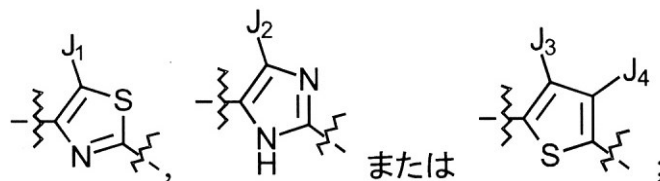
G_4 が、 Cl 、 H 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

D が、

【化115】



であり；

J_1 が、 H 、 CH_2CH_3 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

R_1 が OH でない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

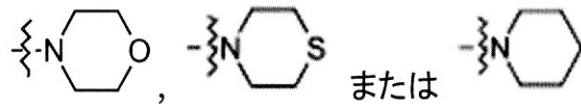
J_2 が、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_3 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_4 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

Eが、

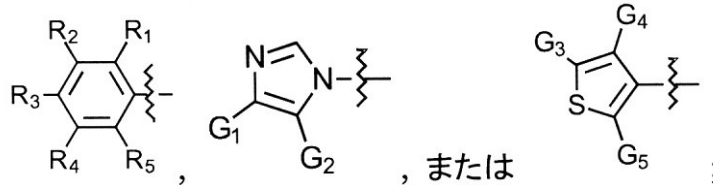
【化116】



である、[11]から[14]のいずれか一項に記載の方法。

[16] Aが、

【化117】



であり；

R_1 が、 H 、 OCH_3 、 OH 、 CH_3 、 NH_2 、 Cl 、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ 、 $O(CH_2)_2OCH_3$ 、 Br 、 I 、 CN 、 CH_2OH 、 CH_2CH_3 、 OCH_2CH_3 または CF_3 であり；

R_2 が、 H 、 CF_3 、 OH 、 CN 、 CH_3 または NH_2 であり；

R_1 が Cl 、 F 、 Br または I のうちの一つでない場合、 R_2 が任意に F 、 Cl 、 Br および I から選択され；

R_3 が、 H 、 F 、 CN 、 Cl 、 OH 、 SCH_3 、 OCH_3 、 CH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_4 が、 H 、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、 OH 、 CH_2OH 、 F 、 Cl 、 OCH_3 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

R_5 が、 H 、 CH_3 、 OH 、 F 、 CN 、 Cl 、 NH_2 、 Br 、 I または CF_3 であり；

G_1 が、 Br 、 Cl 、 I 、 CH_3 、 H 、 F または OH であり；

G_2 が、 Br 、 Cl 、 H 、 I 、 CH_3 、 F または OH であり；

G_3 が、 Cl 、 H 、 CH_3 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

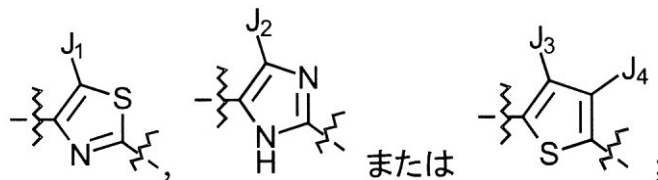
G_4 が、 Cl 、 H 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、 H 、 CH_2OH 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

Dが、

【化118】



であり；

J_1 が、 H 、 CH_2CH_3 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

R_1 が OH でない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

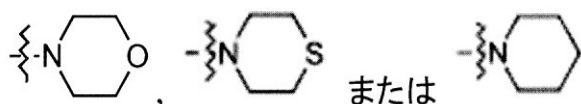
J_2 が、 H 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_3 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

J_4 が、 H 、 CN 、 CH_3 、 Cl 、 Br 、 I 、 F または OH であり；

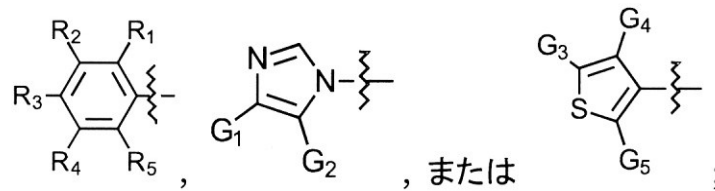
Eが、

【化119】



である、[11]から[15]のいずれか一項に記載の方法。

[1 7] A が、
【化 1 2 0】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH、 CH_3 、 NH_2 、Cl、 SO_2CH_3 、 $OCH(CH_3)_2$ または $O(CH_2)_2OCH_3$ であり；

R_2 が、H または CF_3 であり；

R_3 が、Cl、F、Br または I のうちの 1 つでない場合、 R_4 が、任意に F および Cl から選択され；

R_5 が、H、F、CN、Cl、OH または SCH_3 であり；

R_6 が、H、 CH_3 、 $NHCH_3$ 、OH、 CH_2OH または F であり；

R_7 が H であり；

G_1 が、Br、Cl、I または CH_3 であり；

G_2 が、Br、Cl、H、I または CH_3 であり；

G_3 が、Cl、H、 CH_3 または Br であり；

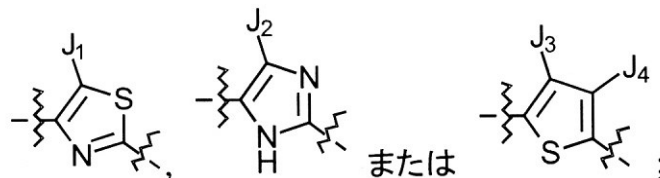
G_4 が、Cl、H または Br であり；

G_3 と G_5 の両方が共に H であるのではない場合、 G_4 が任意に CH_3 であり；

G_5 が、H または CH_2OH であり；

D が、

【化 1 2 1】



であり；

J_1 が、H または CH_2CH_3 であり；

R_1 が OH でない場合、 J_1 が任意に CH_3 であり；

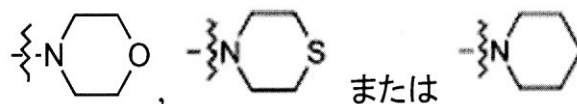
J_2 が H であり；

J_3 が、H または CN であり；

J_4 が H であり；

E が、

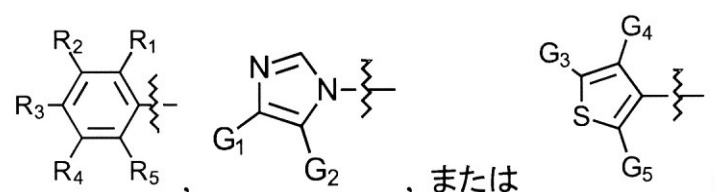
【化 1 2 2】



である、[1 1] から [1 6] のいずれか一項に記載の方法。

[1 8] A が、

【化 1 2 3】



であり；

R_1 が、H、 OCH_3 、OH または CH_3 であり；

R₂ が、H または CF₃ であり；

R₁ が、Cl、F、Br または I のうちの 1 つでない場合、R₂ が、任意に F および Cl から選択され；

R₃ が、H または F であり；

R₄ が、H または CH₃ であり；

R₅ が H であり；

G₁ が、Br または Cl であり；

G₂ が、Br、Cl または H であり；

G₃ が、Cl、H、CH₃ または Br であり；

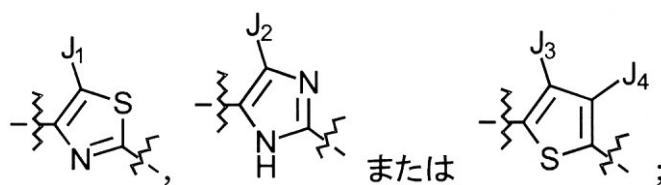
G₄ が、Cl、H または Br であり；

G₃ と G₅ の両方が共に H であるのではない場合、G₄ が任意に CH₃ であり；

G₅ が、H または CH₂OH であり；

D が、

【化 1 2 4】



であり；

J₁ が、H であり；

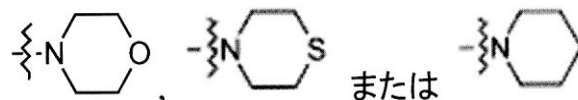
J₂ が H であり；

J₃ が、H であり；

J₄ が H であり；

E が、

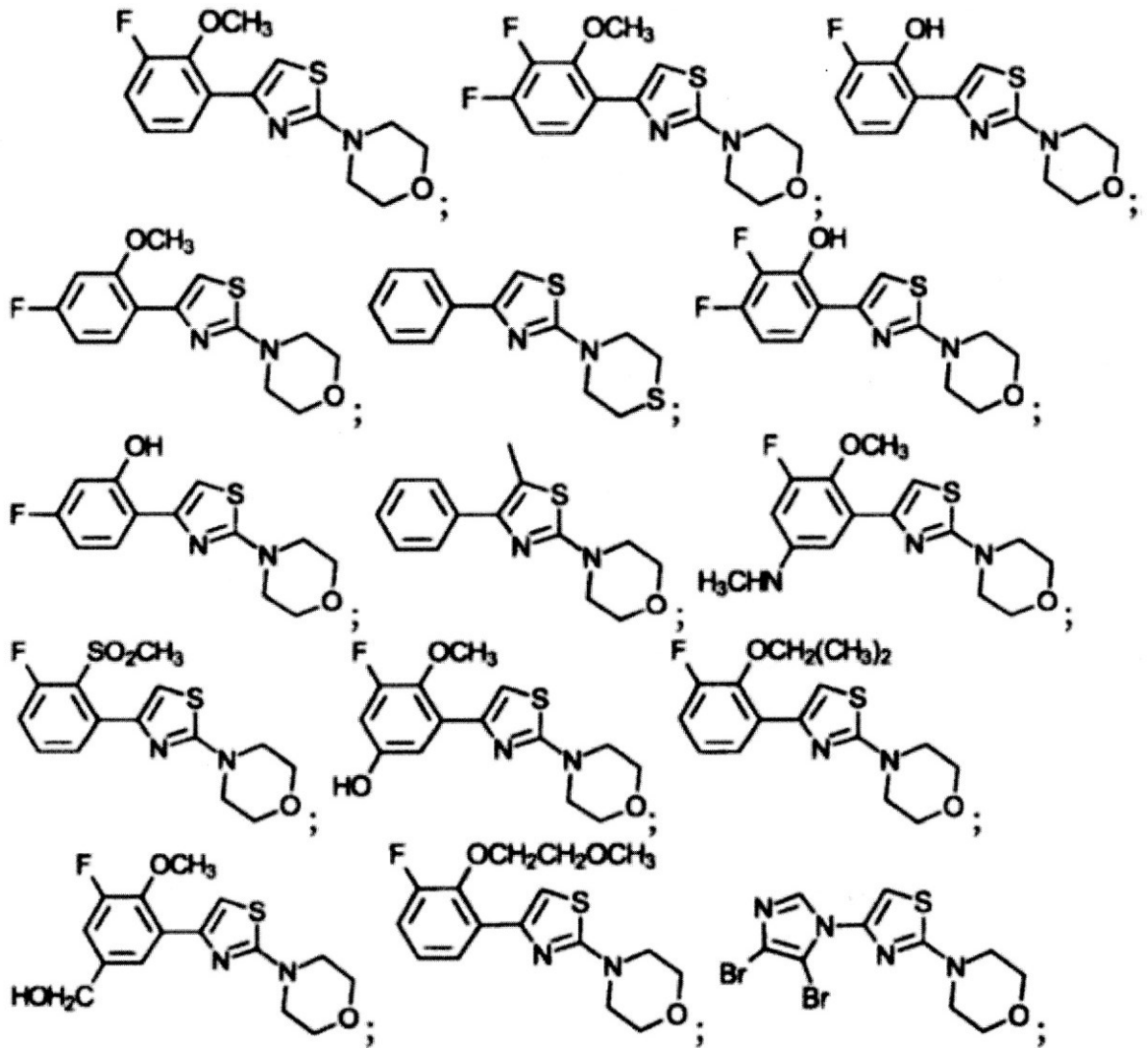
【化 1 2 5】



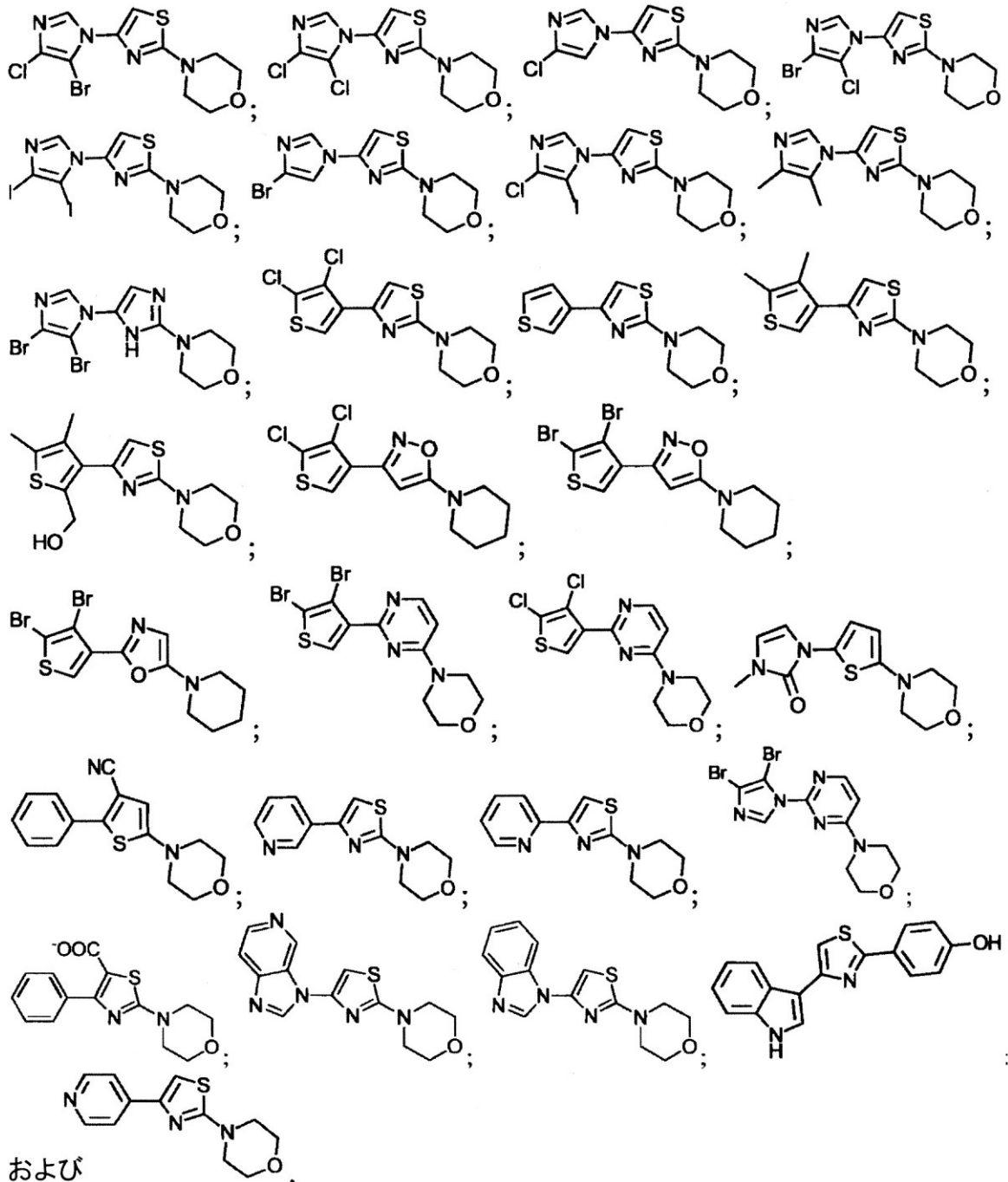
である、[1 1] から [1 7] のいずれか一項に記載の方法。

[1 9] 前記化合物が、

【化 1 2 6 - 1】



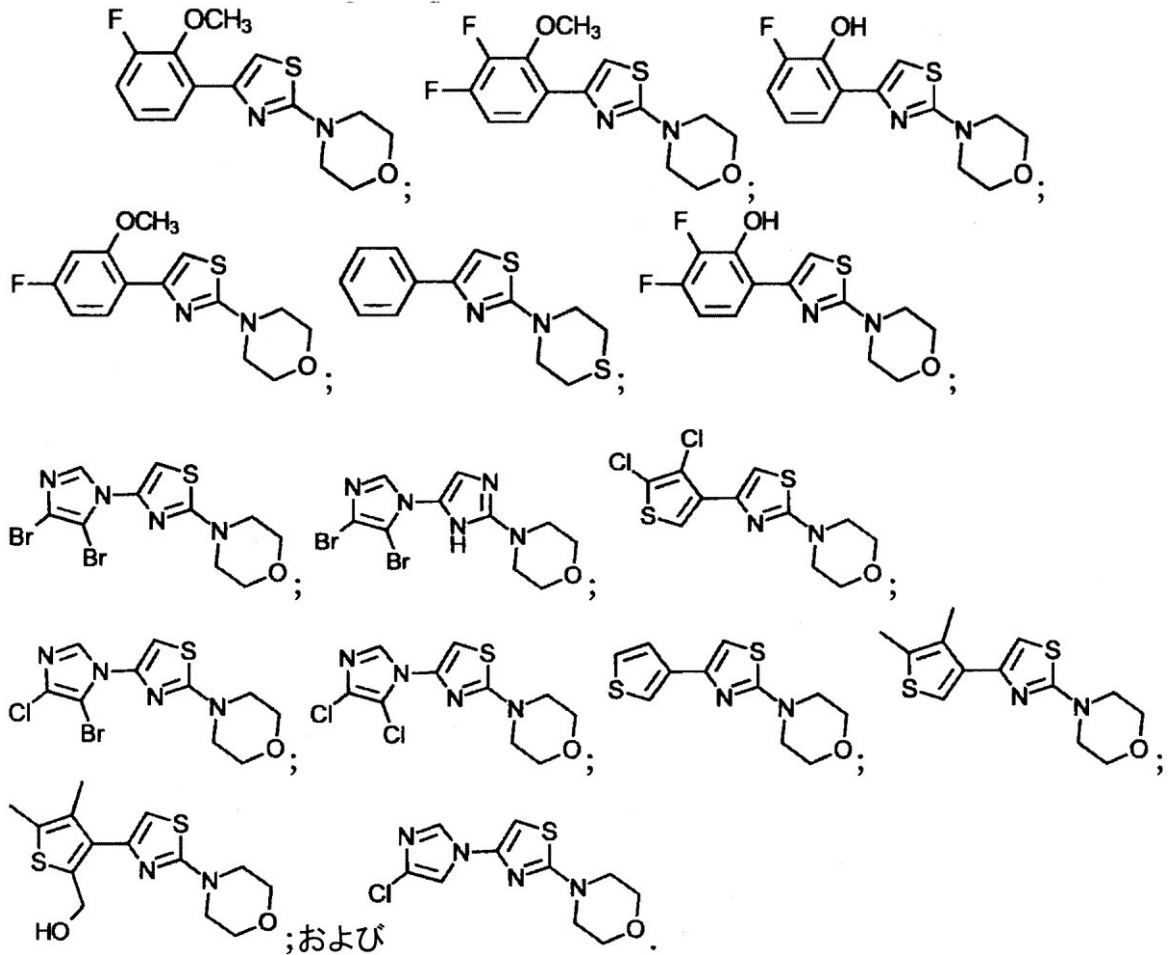
【化 1 2 6 - 2】



の化合物のうちの1つ以上から選択される、[1 1]または[1 2]に記載の方法。

[2 0] 前記化合物が、

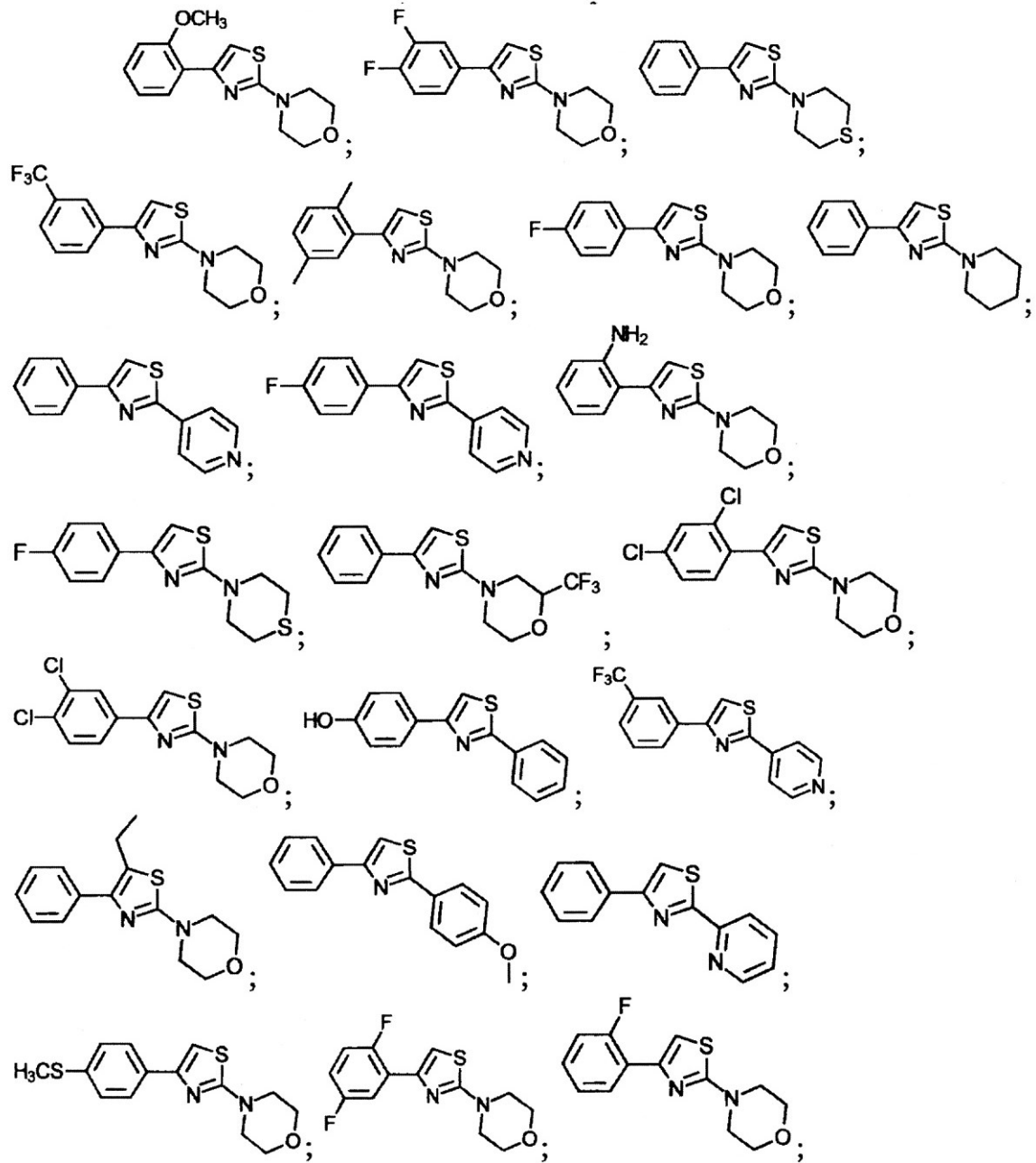
【化 1 2 7】



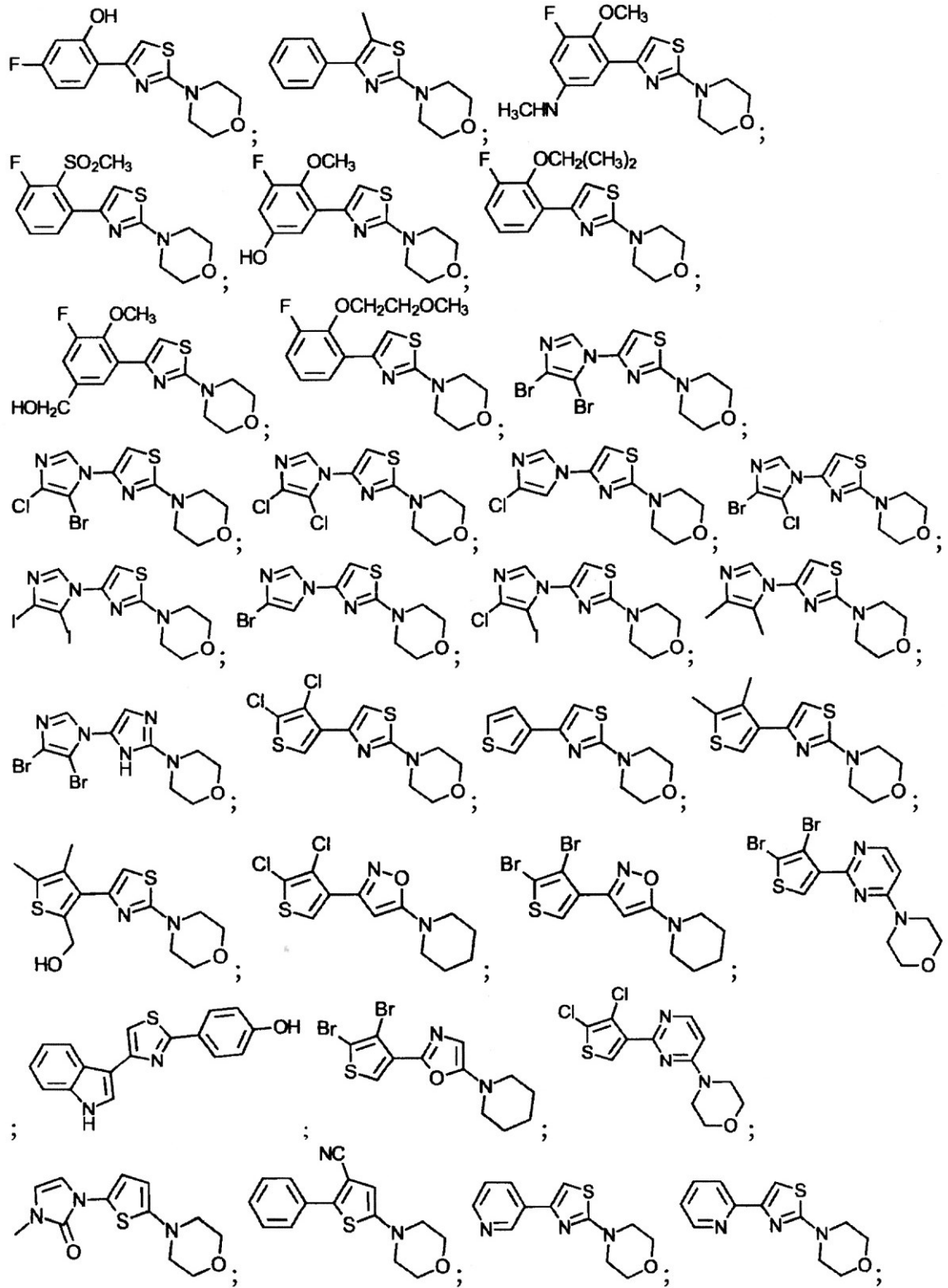
の化合物のうちの一つ以上から選択される、[1 1] または [1 2] に記載の方法。

[2 1] 前記化合物が、

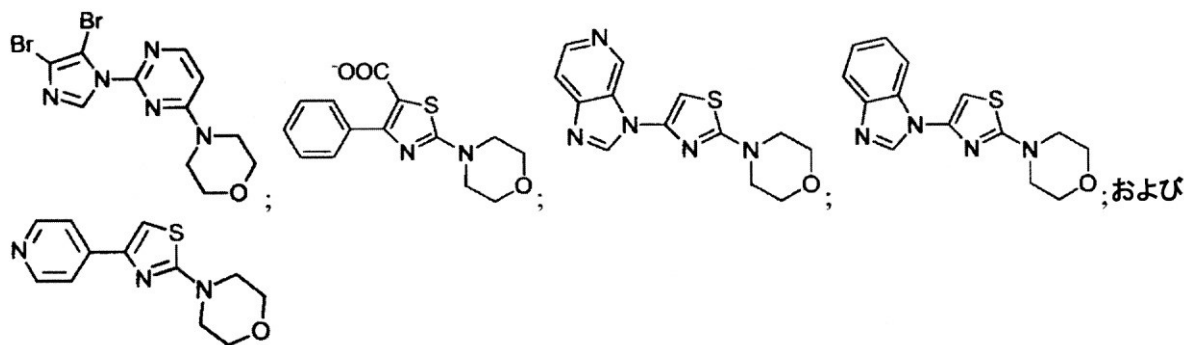
【化 1 2 8 - 1】



【化 1 2 8 - 3】



【化 1 2 8 - 4】



のうちの1つ以上から選択される、[1 1]または[1 2]に記載の方法。

[2 2] A R 活性を調節することが、がん、脱毛、にきび、多毛症、卵巣嚢腫、多嚢胞性卵巣疾患、思春期早発症および加齢黄斑変性からなる群から選択される少なくとも1つの兆候を治療するためである、[1 1]から[2 1]のいずれか一項に記載の方法。

[2 3] 前記がんがA R 媒介性のがんである、[2 2]に記載の方法。

[2 4] 前記がんが、前立腺がん、乳がん、卵巣がん、子宮内膜がんおよび膀胱がんからなる群から選択される、[2 2]または[2 3]に記載の方法。

[2 5] 前記がんがタキサン耐性のトリプルネガティブ乳がんである、[2 3]または[2 4]に記載の方法。

[2 6] A R 活性を調節する医薬を製造するための、[1 1]から[2 1]に記載の化合物の使用。

[2 7] A R 活性を調節するための、[1 1]から[2 1]に記載の化合物の使用。

[2 8] A R 活性を調節することが、がん、脱毛、にきび、多毛症、卵巣嚢腫、多嚢胞性卵巣疾患、思春期早発症および加齢黄斑変性からなる群から選択される少なくとも1つの兆候を治療するためである、[2 3]または[2 4]に記載の使用。

[2 9] 前記がんがA R 媒介性のがんである、[2 8]に記載の使用。

[3 0] 前記がんが、前立腺がん、乳がん、卵巣がん、子宮内膜がんおよび膀胱がんからなる群から選択される、[2 8]または[2 9]に記載の使用。

[3 1] 前記がんがタキサン耐性のトリプルネガティブ乳がんである、[2 9]または[3 0]に記載の使用。

[3 2] A R 活性を調節するための、[1 1]から[2 1]に記載の化合物。

[3 3] A R 活性を調節することが、がん、脱毛、にきび、多毛症、卵巣嚢腫、多嚢胞性卵巣疾患、思春期早発症および加齢黄斑変性からなる群から選択される少なくとも1つの兆候を治療するためである、[3 2]に記載の化合物。

[3 4] 前記がんがA R 媒介性のがんである、[3 3]に記載の化合物。

[3 5] 前記がんが、前立腺がん、乳がん、卵巣がん、子宮内膜がんおよび膀胱がんからなる群から選択される、[3 3]または[3 4]に記載の化合物。

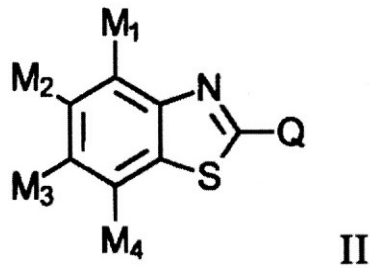
[3 6] 前記がんがタキサン耐性のトリプルネガティブ乳がんである、[3 4]または[3 5]に記載の化合物。

[3 7] [1 1]から[2 1]に記載の化合物、および医薬的に許容される担体または賦形剤を含む医薬組成物。

[3 8] [1 1]から[2 1]に記載の化合物、およびA R 活性を調節するのに使用するための説明書を含む商用パッケージ。

[3 9] 式 I I の構造

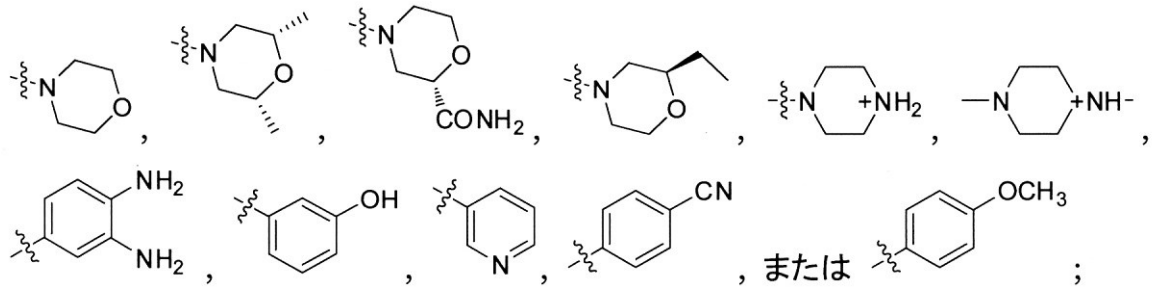
【化 1 2 9】



を有する化合物であって、

Q が、

【化 1 3 0】



であり；

M_1 が、H、 CH_3 、F、 SO_2CH_3 、 OCH_3 、OH、 NO_2 または NH_2 であり

；

M_2 が、H、 CH_3 、F、 SO_2CH_3 、 OCH_3 、OH、 NO_2 または NH_2 であり

；

M_3 が、H、 CH_3 、F、 SO_2CH_3 、 OCH_3 、OH、 NO_2 または NH_2 であり

；

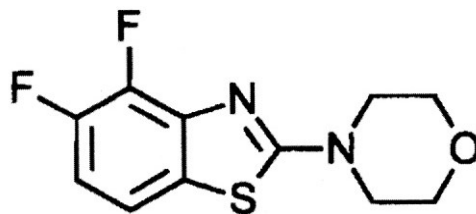
M_4 が、H、 CH_3 、F、 SO_2CH_3 、 OCH_3 、OH、 NO_2 または NH_2 であり

；

前記化合物が、化合物 1 4 4 0 9 を例外とし、表 1 の系列 2 セクションに見出される化合物のうちの一つ以上でないことを条件とする、化合物。

〔 4 0 〕 前記化合物が、

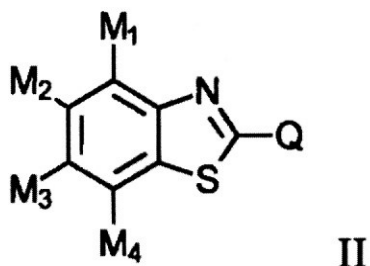
【化 1 3 1】



である、〔 3 9 〕 に記載の化合物。

〔 4 1 〕 A R 活性を調節する方法であって、前記方法が、式 I I の構造

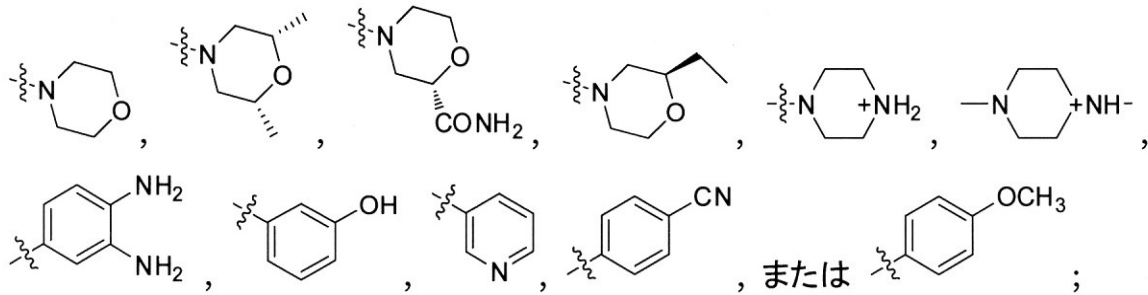
【化 1 3 2】



を有する化合物を、それを必要とする対象に投与することを含み、

Q が、

【化 1 3 3】



であり；

M_1 が、H、 CH_3 、F、 SO_2CH_3 、 OCH_3 、OH、 NO_2 または NH_2 であり

；

M_2 が、H、 CH_3 、F、 SO_2CH_3 、 OCH_3 、OH、 NO_2 または NH_2 であり

；

M_3 が、H、 CH_3 、F、 SO_2CH_3 、 OCH_3 、OH、 NO_2 または NH_2 であり

；

M_4 が、H、 CH_3 、F、 SO_2CH_3 、 OCH_3 、OH、 NO_2 または NH_2 である

、方法。

[4 2] A R 活性を調節する方法であって、前記方法が、表 1 - 系列 3 ~ 6 に提示される化合物を、それを必要とする対象に投与することを含む、方法。

[4 3] A R 活性を調節することが、がん、脱毛、にきび、多毛症、卵巢嚢腫、多嚢胞性卵巢疾患、思春期早発症および加齢黄斑変性からなる群から選択される少なくとも 1 つの兆候を治療するためである、[4 2] に記載の方法。

[4 4] 前記がんが A R 媒介性のがんである、[4 3] に記載の使用。

[4 5] 前記がんが、前立腺がん、乳がん、卵巢がん、子宮内膜がんおよび膀胱がんからなる群から選択される、[4 3] または [4 4] に記載の使用。

[4 6] 前記がんがタキサン耐性のトリプルネガティブ乳がんである、[4 4] または [4 5] に記載の使用。

[4 7] A R 活性を調節する医薬を製造するための、[3 9] または [4 0] に記載の化合物の使用。

[4 8] A R 活性を調節するための、[3 9] または [4 0] に記載の化合物の使用。

[4 9] [3 9] または [4 0] に記載の化合物、および医薬的に許容される担体または賦形剤を含む医薬組成物。

[5 0] [3 9] または [4 0] に記載の化合物、および A R 活性を調節するのに使用するための説明書を含む商用パッケージ。

[5 1] A R 活性を調節する医薬を製造するための、表 1 - 系列 3 ~ 6 に提示される化合物の使用。

[5 2] A R 活性を調節するための、表 1 - 系列 3 ~ 6 に提示される化合物の使用。

[5 3] 表 1 - 系列 3 ~ 6 に提示される化合物、および医薬的に許容される担体または賦形剤を含む医薬組成物。

[5 4] 表 1 - 系列 3 ~ 6 に提示される化合物、および A R 活性を調節するのに使用するための説明書を含む商用パッケージ。