

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5345174号

(P5345174)

(45) 発行日 平成25年11月20日 (2013.11.20)

(24) 登録日 平成25年8月23日 (2013.8.23)

(51) Int.Cl.

F 1

A 6 1 K 31/424 (2006.01)

A 6 1 K 31/424

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/06

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/454

請求項の数 2 (全 887 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2011-101480 (P2011-101480)

(22) 出願日 平成23年4月28日 (2011.4.28)

(62) 分割の表示 特願2005-113726 (P2005-113726)
の分割

原出願日 平成17年4月11日 (2005.4.11)

(65) 公開番号 特開2011-184447 (P2011-184447A)

(43) 公開日 平成23年9月22日 (2011.9.22)

審査請求日 平成23年5月6日 (2011.5.6)

(31) 優先権主張番号 特願2004-114975 (P2004-114975)

(32) 優先日 平成16年4月9日 (2004.4.9)

(33) 優先権主張国 日本国 (JP)

(31) 優先権主張番号 特願2004-125055 (P2004-125055)

(32) 優先日 平成16年4月21日 (2004.4.21)

(33) 優先権主張国 日本国 (JP)

(73) 特許権者 000206956

大塚製薬株式会社

東京都千代田区神田司町2丁目9番地

(74) 代理人 110000796

特許業務法人三枝国際特許事務所

(72) 発明者 壺内 英継

徳島県徳島市城東町一丁目2-35

(72) 発明者 佐々木 博文

徳島県板野郡北島町北村字三町地33-15

(72) 発明者 黒田 英明

徳島県徳島市国府町井戸字前野5-7

(72) 発明者 糸谷 元宏

徳島県徳島市名東町三丁目89-4

前置審査

最終頁に続く

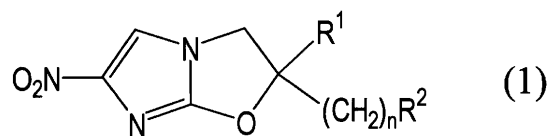
(54) 【発明の名称】 医薬組成物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式 (1)

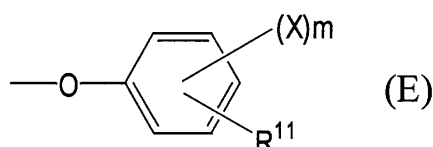
【化1】



で表される 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体及びそれらの薬理学的に許容される塩からなる群より選ばれた少なくとも 1 種を含有する医薬組成物。

[式中、R¹は水素原子又は C 1 ~ 6 アルキル基を示す。n は 0 ~ 6 の整数を示す。R²は下記一般式 (E) で表されるフェノキシ基を示す。

【化2】



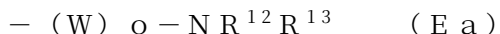
[式中、X はハロゲン原子又は置換基として C 1 ~ 6 アルキル基を有することのあるアミ

ノ置換 C 1 ～ 6 アルキル基を示す。m は 0 ～ 3 の整数を示す。R¹¹は、

E2) ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基；

E3) ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基；

E4) 一般式 (E a) で表される基：



(式中、W は基 -CO- 又は C 1 ～ 6 アルキレン基を示す。o は 0 又は 1 を示す。R¹² 及び R¹³ は同一又は異なって、

(Ea1) 水素原子；

(Ea2) C 1 ～ 6 アルキル基；

(Ea3) C 1 ～ 6 アルカノイル基；

(Ea4) C 1 ～ 6 アルコシカルボニル基；

(Ea5) フェニル C 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基及びフェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。また、C 1 ～ 6 アルキル部分には、C 1 ～ 6 アルコキシイミノ基が置換していてもよい。)；

(Ea6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)；

(Ea7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)；

(Ea8) ピリジル基 (ピリジン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい)；

(Ea9) フェニル C 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)；

(Ea10) フェノキシ C 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)；

又は

(Ea11) ベンゾイル C 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)

を示す。)；

E5) イミダゾリル基；

E6) トリアゾリル基；

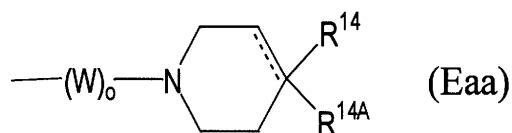
E7) モルホリノ基；

E8) チオモルホリノ基；

E9) s-オキシドチオモルホリノ基；

E10) 一般式 (E a a) で示されるピペリジル基：

【化 3】



(式中、W 及び o は前記に同じ。R^{14A} は、水素原子、水酸基、C 1 ～ 6 アルコキシ基又はフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい。] を示す。点線

10

20

30

40

50

は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示すときは、 R^{14} のみが置換しているものとする。 R^{14} 及び R^{14A} は、これらが隣接する炭素原子と共に互いに結合してC 1～4アルキレンジオキシ基を形成してもよい。 R^{14} は、

(Eaa1) 水素原子；

(Eaa2) C 1～6 アルコキシカルボニル基；

(Eaa3) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基；C 1～4 アルキレンジオキシ基；C 1～6 アルコキシカルボニル基；シアノ基；C 2～6 アルケニル基；ニトロ基；フェニル基；置換基としてフェニル基、C 1～6 アルキル基、カルバモイル基及びC 1～6 アルカノイル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基；C 1～6 アルカノイル置換C 1～6 アルキル基；水酸基；C 1～6 アルコキシカルボニル置換C 1～6 アルキル基；フェニルC 1～6 アルキル基；C 1～6 アルカノイル基；C 1～6 アルキルチオ基；1, 2, 4-トリアゾリル基；イソオキサゾリル基；イミダゾリル基；ベンゾチアゾリル基；2H-ベンゾトリアゾリル基；ピロリル基；ベンゾオキサゾリル基；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、置換基としてC 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；ピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には置換基としてC 1～6 アルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。〕及びカルバモイル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Eaa4) 水酸基；

(Eaa5) カルボキシ基；

(Eaa6) フェニル基（フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Eaa7) C 1～6 アルコキシ基；

(Eaa8) C 3～8 シクロアルキル-C 1～6 アルコキシ基；

(Eaa9) フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Eaa10) テトラヒドロピラニルオキシ基；

(Eaa11) 1, 3-ジオキサニル基；

(Eaa12) オキシ基；

(Eaa13) ナフチルオキシ基（ナフタレン環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい）；

(Eaa14) 2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基（2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Eaa15) ベンゾチアゾリルオキシ基（ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい）；

(Eaa16) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）；

10

20

30

40

50

(Eaa17) 1, 3-ベンゾオキサチオラニルオキシ基 (1, 3-ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa18) イソキノリルオキシ基 ;

(Eaa19) ピリジルオキシ基 ;

(Eaa20) キノリルオキシ基 (キノリン環上には、少なくとも1個のC 1~6アルキル基が置換していてもよい) ;

(Eaa21) ジベンゾフリルオキシ基 ;

(Eaa22) 2H-クロメニルオキシ基 (2H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa23) ベンゾイソオキサゾリルオキシ基 ;

10

(Eaa24) キノキサリルオキシ基 ;

(Eaa25) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ基 (2, 3-ジヒドロ-1H-インデン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa26) ベンゾフラザニルオキシ基 ;

又は

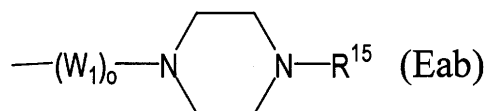
(Eaa27) フェニルC 2~6アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。) ;

E11) 一般式 (E a b) で表される基 :

20

【化 4】



(式中、oは前記に同じ。W₁は、C 1~6アルキレン基を示す。R¹⁵は、

(Eab1) 水素原子 ;

(Eab2) C 1~6アルキル基 (アルキル基上には、モルホリノ基、ベンゾイル基、置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ基が置換していてもよい) ;

30

(Eab3) C 3~8シクロアルキル基 ;

(Eab4) フェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C 1~6アルキルチオ基、C 1~6アルキルスルホニル基、フェニルC 1~6アルコキシ基、C 2~6アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及び1, 2, 3-チアジアゾール基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab5) C 2~6アルケニル基 ;

(Eab6) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

40

(Eab7) C 1~6アルカノイル基 ;

(Eab8) フェニルC 2~6アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab9) ベンゾイル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab10) C 1~20アルコキシカルボニル基 (アルコキシ基上には、ハロゲン原子、置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基及びC 1~6アルコキシ置換C

50

1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab11) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキルチオ基、C 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニルC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab12) フェニルC 3～6アルケニルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

10

(Eab13) フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab14) フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab15) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

20

(Eab16) ベンゾフリル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 (ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。) ;

(Eab17) ベンゾチエニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab18) ナフチル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

(Eab19) ピリジル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 (ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

(Eab20) フリル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 (フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい) ;

30

(Eab21) チエニル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 (チオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

(Eab22) チアゾリル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 (チアゾール環上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab23) テトラゾリル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 (テトラゾール環上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

40

(Eab24) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシカルボニル基 ;

(Eab25) アダマンタン置換C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

(Eab26) フェニルC 3～6アルキニルオキシカルボニル基 ;

(Eab27) フェニルチオC 1～6アルコキシカルボニル基 ;

(Eab28) フェニルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

(Eab29) C 2～6アルケニルオキシカルボニル基 ;

(Eab30) C 2～6アルキニルオキシカルボニル基 ;

(Eab31) C 3～8シクロアルキル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

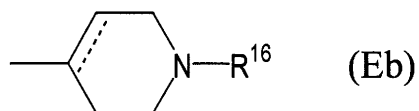
又は

50

(Eab32) ベンゾイル置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基を示す。) ;

E12) 一般式 (E b) で表される基 :

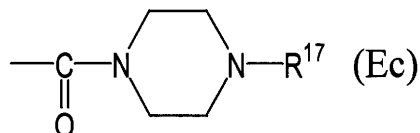
【化 5】



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R¹⁶は、R¹⁵と同一の基を示す。)

E13) 一般式 (E c) で示される基 :

【化 6】



(式中、R¹⁷は、

(Ec1) フェニル C 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Ec2) C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基 ;

又は

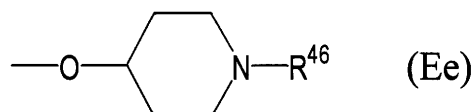
(Ec3) フェニル C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)

を示す。) ;

E14) ピリジル基 ;

E15) 一般式 (E e) で示される基 :

【化 7】



(式中、R⁴⁶は、フェニル基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; フェニル C 1 ～ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; フェニル C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 又は C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基を示す。) ;

E16) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

E17) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

E18) 8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクチル基 (8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン環上には、少なくとも 1 個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ

10

20

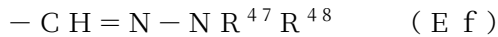
30

40

50

ロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) が置換していてもよい) ;

E19) 一般式 (E f) で示される基 :



(式中、R⁴⁷及びR⁴⁸は、同一又は異なって、水素原子；C 1～6 アルキル基；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕又はピリジル基〔ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基を少なくとも 1 個が置換していてもよい〕を示す。また、この R⁴⁷及び R⁴⁸は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介することなく互いに結合して 5～7 員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基として少なくとも 1 個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕が置換していてもよい。) ;

E20) フェニル C 1～6 アルコキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

E21) アミノ置換 C 2～6 アルケニル基 (該アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれる基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

又は

E22) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも 1 個のオキソ基が置換していてもよい)

を示す。]

【請求項 2】

医薬組成物が抗結核薬である請求項 1 に記載の医薬組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、医薬組成物に関する。

【背景技術】

【0002】

抗酸菌の中で、ヒト結核菌 (*Mycobacterium tuberculosis*) が広く知られており、人類の 3 分の 1 に感染しているといわれる。また、*Mycobacterium africanum* 及び *Mycobacterium bovis* が、ヒト結核菌と同様に結核菌群として知られ、ヒトに対して強い病原性を有するマイコバクテリアとして知られている。

【0003】

これらの結核症に対しては、ファーストラインの薬として位置づけされているリファンピシン、イソニアジド及びエタンブトール (またはストレプトマイシン) の 3 剤、もしくはこれらにピラジナミドを加えた 4 剤を用いた治療が施されている。

【0004】

しかし、結核症の治療には極めて長期に及ぶ服薬が必要であるため、コンプライアンスが悪くなり、治療に失敗することもある。

【0005】

また、リファンピシンには、肝障害、フルシンドローム、薬物アレルギー、P450 関連の酵素誘導による他剤との併用禁忌、イソニアジドには末梢神経障害、リファンピシンとの

10

20

30

40

50

併用で重篤な肝障害を誘発、エタンブトールには視神経障害による視力低下、ストレプトマイシンには第8脳神経障害による聴力の低下、ピラジナミドには肝障害、尿酸値上昇に伴う痛風発作、嘔吐等の副作用が報告されている (A Clinician's Guide To Tuberculosis, Michael D. Iseman 2000 by Lippincott Williams & Wilkins, printed in the USA, ISBN 0-7817-1749-3, 結核第2版, 久世文幸、泉 孝英、医学書院1992年)。

【0006】

実際にこれらの副作用により標準の化学療法が実施できないケースが、全体(調査対象となった全入院患者228症例)の服薬中止症例(約23%、52症例)の70%を占めているという報告もある(Kekkaku Vol.74: 77-82, 1999)。

【0007】

特に上記ファーストラインで併用使用されている5薬剤の内、リファンピシン、イソニアジド及びピラジナミドに共通する肝毒性は、最も頻発する副作用として知られている。また一方で、抗結核剤に耐性を示す結核菌、多剤耐性となった結核菌等が増加しており、治療を更に困難にしている。

【0008】

WHOの調査(1996年~1999年)によると、世界で分離される結核菌の内、既存抗結核剤のどれかに耐性を示す割合は、19%に達し、多剤耐性結核菌も5.1%と発表されている。このような多剤耐性結核菌に感染している保菌者は、世界で6千万人に達しているであろうといわれており、今後益々多剤耐性結核菌の増加が懸念されている (April 2001 as a supplement to the journal Tuberculosis, the "Scientific Blueprint for TB Drug Development")。

【0009】

更には、AIDS患者の死亡原因の大半が結核であり、1997年の時点で結核とHIVに混合感染しているヒトは1070万人に達していると報告されている (Global Alliance for TB drug development)。また、混合感染により、通常より少なくとも30倍高い結核への発症リスクを伴うと考えられている。

【0010】

このような現状を踏まえ、望まれる抗結核剤のプロファイルとして、(1)多剤耐性結核菌にも有効なもの、(2)短期化学療法を可能にするもの、(3)副作用の少ないもの、(4)潜伏感染している結核菌(Latentな結核菌)に効力を示すもの、(5)経口投与可能なもの、等が挙げられる。

【0011】

また、近年増加してきているMAC症(Mycobacterium avium-intracellulare complex症)の原因菌である Mycobacterium avium や Mycobacterium intracellulare、また、その他 Mycobacterium kansasii、Mycobacterium marinum、Mycobacterium simiae、Mycobacterium scrofulaceum、Mycobacterium szulgai、Mycobacterium xenopi、Mycobacterium malmoense、Mycobacterium haemophilum、Mycobacterium ulcerans、Mycobacterium shimoidei、Mycobacterium fortuitum、Mycobacterium chelonae、Mycobacterium smegmatis、Mycobacterium aurum等の非定型抗酸菌が、ヒトに病原性を有する菌として知られている。

【0012】

今日、これらの非定型抗酸菌症に対して有望な治療薬は乏しく、抗結核剤であるリファンピシン、イソニアジド、エタンブトール、ストレプトマイシン、カナマイシン、一般細菌感染症治療薬であるニューキノロン剤、マクロライド系抗菌剤、アミノ配糖体系抗菌剤及びテトラサイクリン系抗菌剤が組み合わせて使用されているのが現状である。

【0013】

しかしながら、非定型抗酸菌症の治療には、一般細菌による感染症に比較し、長期の服薬が強いられ、難治化し、死亡する症例も報告されている。このような現状を解決するために、より強い効力を示す薬剤の開発が望まれている。

【0014】

例えば、特表平11-508270号公報(WO97/01562、特許文献1)に、6-ニトロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ[2, 1-b]イミダゾピラン化合物が、インビトロにおいて結核菌(H37Rv株)及び多剤耐性結核菌に対して殺菌作用を有していること及び結核感染動物モデルに対して経口投与で治療効果を有していることから、抗結核剤として有用であることが開示されている。

【0015】

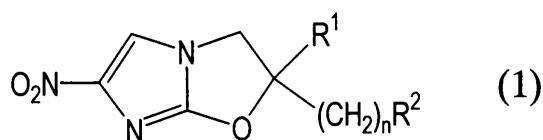
しかしながら、上記文献に記載されている化合物は、本発明化合物とは基本的な骨格が異なり、非類似の化合物である。

【0016】

更に、クプスワミーナガラジャン(Kuppsuwamy Nagarajan)等は、ヨーロピアン ジャーナル オブ メディシナル ケミストリー、1989年、第24巻、第631～633頁(European Journal of Medicinal Chemistry 1989, Vol.24, p631-633)(非特許文献1)に、一般式(I)

【0017】

【化1】



【0018】

において、R¹が水素原子又はメチル基を示し、-(CH₂)_nR²がクロロメチル基、C1～C7のアルキル基、イソプロポキシメチル基、3-プロペニルオキシメチル基、無置換のフェノキシメチル基を示す化合物並びにR¹及び-(CH₂)_nR²が結合してシクロペンタン環又はシクロヘキサン環を形成した化合物(計16種類の化合物)が結核菌(H37Rv株)に対して、殺菌作用を有することを報告している。

【0019】

しかしながら、上記文献には、経口投与で有効な化合物は僅かに4種類だけであり、その中で最も活性の高い化合物、即ち一般式(I)においてR¹が水素原子を示し、-(CH₂)_nR²がエチルである化合物(CGI-17341)に変異原性が見つかったため、これら一連の化合物群の薬剤としての開発を断念したとの記載がある。

【0020】

更に、アンティマイクロバイアル エージェント アンド ケモセラピー、1993年2月号、第183～186頁(Dilip R. Astekar et. Al., Antimicrobial Agents and Chemotherapy, Feb. 1993, p183-186)(非特許文献2)には、上記CGI-17341の抗菌プロファイル、即ち、結核菌(H37Rv株)及び多剤耐性結核菌に対して殺菌作用を有しているものの、非定型抗酸菌属の *M. avium*、*M. intracellulare* 及び *M. fortuitum* に対しては250 µg/ml以下では活性を有していないことが報告されている。

【特許文献1】WO97/01562

【非特許文献1】ヨーロピアン ジャーナル オブ メディシナル ケミストリー、1989年、第24巻、第631～633頁

【非特許文献2】アンティマイクロバイアル エージェント アンド ケモセラピー、1993年2月号、第183～186頁

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0021】

本発明は、結核菌及び多剤耐性結核菌に対して優れた殺菌作用を有する医薬組成物を提供することを課題とする。

【0022】

本発明は、非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する医薬組成物を提供することを

10

20

30

40

50

課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0023】

本発明者は、上記課題を解決すべく鋭意研究を重ねた結果、結核菌、多剤耐性結核菌及び非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する新規2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール化合物の合成に成功した。本発明は、斯かる知見に基づき完成されたものである。

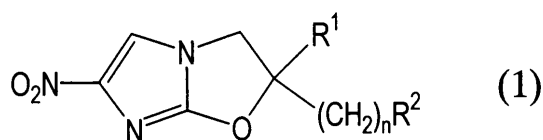
【0024】

本発明は、下記1～3に示す発明を提供する。

1. 一般式 (1)

【0025】

【化2】



【0026】

で表される2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール化合物、それらの光学活性体及びそれらの薬理的に許容される塩からなる群より選ばれた少なくとも1種を含有する医薬組成物。

〔式中、R¹は水素原子又はC1～6アルキル基を示す。nは0～6の整数を示す。R²は下記一般式(A)～(G)及び(a)～(r)のいずれかの基を示す。また、R¹及び-(CH₂)_nR²は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して下記一般式(H)で表されるスピロ環を形成していてもよい。〕

一般式(A)で表される基：



(式中、R³は、

A1) 水素原子；

A2) C1～6アルキル基；

A3) C1～6アルコキシ-C1～6アルキル基；

A4) フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、フェニルC1～6アルコキシ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

A5) ビフェニルC1～6アルキル基；

A6) フェニルC2～6アルケニル基；

A7) C1～6アルキルスルホニル基；

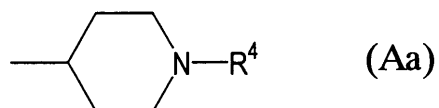
A8) C1～6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基；

A9) C1～6アルカノイル基；

A10) 一般式(Aa)で表される基：

【0027】

【化3】



【0028】

10

20

30

40

50

(ここで R^4 は、C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、フェニルC 1～6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕又はフェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、フェニルC 1～6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。)；

A11) ビフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基；

A12) ベンゾオキサゾリルC 1～6アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）；

A13) ベンゾオキサゾリル基；

又は

A14) オキサゾリルC 1～6アルキル基（オキサゾール環上には、フェニル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。）

一般式（B）で表される基：



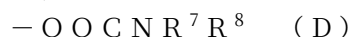
（式中、 R^5 は、テトラゾリル基〔テトラゾール環上には、C 1～6アルキル基又はハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい〕又はベンゾオキサゾリル基を示す）

一般式（C）で表される基：



（式中、 R^6 はC 1～6アルキル基を示す。）

一般式（D）で表されるカルバモイルオキシ基：



（式中、 R^7 及び R^8 は、同一又は異なって、

D1) 水素原子；

D2) C 1～8アルキル基；

D3) ハロゲン置換C 1～6アルキル基；

D4) C 1～6アルコキシカルボニル-C 1～6アルキル基；

D5) C 3～8のシクロアルキル基；

D6) フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

D7) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルカノイル基、カルボキシル基、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、C 1～6アルキルカルバモイル基、アミノスルホン基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい）；

D8) ナフチル基；

又は

D9) ピリジル基

を示す。

D10) R^7 及び R^8 は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記(D10-1)～(D10-3)に示す飽和複素環基又は下記(D10-4)～(D10-7)に示すベンゼン縮合複素環基を形成していてもよい。）

(D10-1) 一般式（Da）で示されるピペラジニル基：

10

20

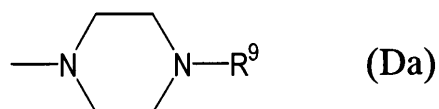
30

40

50

【0029】

【化4】



【0030】

(ここでR⁹は、

(Da1) 水素原子；

(Da2) C 1～6 アルキル基；

(Da3) フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Da4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Da5) C 1～6 アルコキシカルボニル基；

(Da6) フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Da7) フェニル C 3～6 アルケニルオキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）；

又は

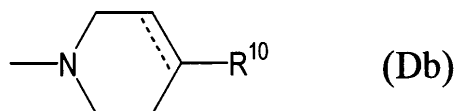
(Da8) フェニル C 1～6 アルキリデン置換アミノ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）

を示す。）；

(D10-2) 一般式 (D b) で示される基：

【0031】

【化5】



【0032】

(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R¹⁰は、

(Db1) 水素原子；

(Db2) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Db3) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）；

又は

(Db4) フェニルアミノ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）

を示す。）；

(D10-3) モルホリノ基；

(D10-4) インドリニル基（インドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

(D10-5) イソインドリニル基（イソインドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

(D10-6) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

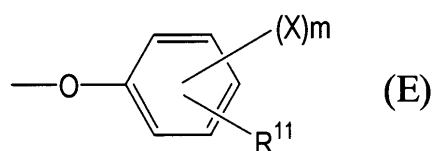
又は

(D10-7) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)

一般式 (E) で表されるフェノキシ基 :

【0033】

【化6】



10

【0034】

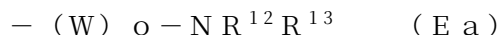
[式中、Xはハロゲン原子又は置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1~6アルキル基を示す。mは0~3の整数を示す。R¹¹は、

E1) 水素原子 ;

E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基 ;

E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基 ;

E4) 一般式 (E a) で表される基 :



(式中、Wは基-CO-又はC 1~6アルキレン基を示す。oは0又は1を示す。R¹²及びR¹³は同一又は異なって、

(Ea1) 水素原子 ;

(Ea2) C 1~6アルキル基 ;

(Ea3) C 1~6アルカノイル基 ;

(Ea4) C 1~6アルコキシカルボニル基 ;

(Ea5) フェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及びフェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。また、C 1~6アルキル部分には、C 1~6アルコキシイミノ基が置換していてもよい。) ;

(Ea6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Ea7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Ea8) ピリジル基 (ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

(Ea9) フェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Ea10) フェノキシC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

又は

20

30

40

50

(Ea11) ベンゾイル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。）；

E5) イミダゾリル基；

E6) トリアゾリル基；

E7) モルホリノ基；

E8) チオモルホリノ基；

E9) s-オキシドチオモルホリノ基；

E10) 一般式 (E a a) で示されるピペリジル基；

【0035】

【化7】



【0036】

（式中、W及びoは前記に同じ。R^{14A}は、水素原子、水酸基、C 1～6 アルコキシ基又はフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい。〕を示す。点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示すときは、R¹⁴のみが置換しているものとする。R¹⁴及びR^{14A}は、これらが隣接する炭素原子と共に互いに結合して C 1～4 アルキレンジオキシ基を形成してもよい。R¹⁴は、

(Eaa1) 水素原子；

(Eaa2) C 1～6 アルコキシカルボニル基；

(Eaa3) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基；C 1～4 アルキレンジオキシ基；C 1～6 アルコキシカルボニル基；シアノ基；C 2～6 アルケニル基；ニトロ基；フェニル基；置換基としてフェニル基、C 1～6 アルキル基、カルバモイル基及び C 1～6 アルカノイル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基；C 1～6 アルカノイル置換 C 1～6 アルキル基；水酸基；C 1～6 アルコキシカルボニル置換 C 1～6 アルキル基；フェニル C 1～6 アルキル基；C 1～6 アルカノイル基；C 1～6 アルキルチオ基；1, 2, 4-トリアゾリル基；イソオキサゾリル基；イミダゾリル基；ベンゾチアゾリル基；2H-ベンゾトリアゾリル基；ピロリル基；ベンゾオキサゾリル基；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、置換基として C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕；ピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には置換基として C 1～6 アルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。〕及びカルバモイル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Eaa4) 水酸基；

(Eaa5) カルボキシ基；

(Eaa6) フェニル基（フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及

10

20

30

40

50

びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eaa7) C 1 ～ 6 アルコキシ基 ;

(Eaa8) C 3 ～ 8 シクロアルキル-C 1 ～ 6 アルコキシ基 ;

(Eaa9) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eaa10) テトラヒドロピラニルオキシ基 ;

(Eaa11) 1, 3-ジオキソラニル基 ;

(Eaa12) オキシ基 ;

10

(Eaa13) ナフチルオキシ基 (ナフタレン環上には、少なくとも 1 個の C 1 ～ 6 アルキル基が置換していてもよい) ;

(Eaa14) 2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基 (2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C 1 ～ 6 アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eaa15) ベンゾチアゾリルオキシ基 (ベンゾチアゾール環上には、少なくとも 1 個の C 1 ～ 6 アルキル基が置換していてもよい) ;

(Eaa16) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも 1 個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa17) 1, 3-ベンゾオキサチオランオキシ基 (1, 3-ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも 1 個のオキシ基が置換していてもよい) ;

20

(Eaa18) イソキノリルオキシ基 ;

(Eaa19) ピリジルオキシ基 ;

(Eaa20) キノリルオキシ基 (キノリン環上には、少なくとも 1 個の C 1 ～ 6 アルキル基が置換していてもよい) ;

(Eaa21) ジベンゾフリルオキシ基 ;

(Eaa22) 2 H-クロメニルオキシ基 (2 H-クロメン環上には、少なくとも 1 個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa23) ベンゾイソオキサゾリルオキシ基 ;

(Eaa24) キノキサリルオキシ基 ;

30

(Eaa25) 2, 3-ジヒドロ-1 H-インデニルオキシ基 (2, 3-ジヒドロ-1 H-インデン環上には、少なくとも 1 個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa26) ベンゾフラザニルオキシ基 ;

又は

(Eaa27) フェニル C 2 ～ 6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)

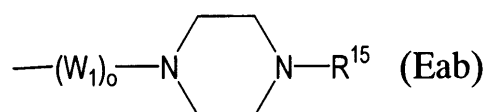
を示す。) ;

E11) 一般式 (E a b) で表される基 :

【 0 0 3 7 】

40

【化 8】



【 0 0 3 8 】

(式中、o は前記に同じ。W₁ は、C 1 ～ 6 アルキレン基を示す。R¹⁵ は、

(Eab1) 水素原子 ;

(Eab2) C 1 ～ 6 アルキル基 (アルキル基上には、モルホリノ基、ベンゾイル基、置換基として C 1 ～ 6 アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ基が置換してい

50

てもよい) ;

(Eab3) C 3～8 シクロアルキル基 ;

(Eab4) フェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C 1～6 アルキルチオ基、C 1～6 アルキルスルホニル基、フェニル C 1～6 アルコキシ基、C 2～6 アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基及び 1, 2, 3-チアジアゾール基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab5) C 2～6 アルケニル基 ;

(Eab6) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab7) C 1～6 アルカノイル基 ;

(Eab8) フェニル C 2～6 アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab9) ベンゾイル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab10) C 1～20 アルコキシカルボニル基 (アルコキシ基上には、ハロゲン原子、置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基及び C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab11) フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキルチオ基、C 1～6 アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基及び 1, 2, 3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab12) フェニル C 3～6 アルケニルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab13) フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab14) フェニル C 1～6 アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab15) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab16) ベンゾフリル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基 (ベンゾフラン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい。) ;

(Eab17) ベンゾチエニル C 1～6 アルコキシカルボニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Eab18) ナフチル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基 ;

(Eab19) ピリジル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基 (ピリジン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

10

20

30

40

50

(Eab20) フリル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基（フラン環上には、少なくとも 1 個のニトロ基が置換していてもよい）；

(Eab21) チエニル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基（チオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

(Eab22) チアゾリル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基（チアゾール環上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Eab23) テトラゾリル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基（テトラゾール環上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

10

(Eab24) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシカルボニル基；

(Eab25) アダマンタン置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基；

(Eab26) フェニル C 3～6 アルキニルオキシカルボニル基；

(Eab27) フェニルチオ C 1～6 アルコキシカルボニル基；

(Eab28) フェニル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基；

(Eab29) C 2～6 アルケニルオキシカルボニル基；

(Eab30) C 2～6 アルキニルオキシカルボニル基；

(Eab31) C 3～8 シクロアルキル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基；

20

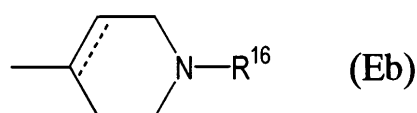
又は

(Eab32) ベンゾイル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。）；

E12) 一般式 (E b) で表される基：

【0039】

【化9】



30

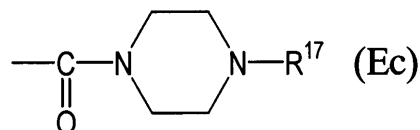
【0040】

（式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R¹⁶は、R¹⁵と同一の基を示す。）

E13) 一般式 (E c) で示される基：

【0041】

【化10】



40

【0042】

（式中、R¹⁷は、

(Ec1) フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ec2) C 1～6 アルコキシカルボニル基；

又は

(Ec3) フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）

50

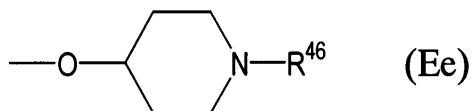
を示す。) ;

E14) ピリジル基 ;

E15) 一般式 (E e) で示される基 :

【0043】

【化11】



【0044】

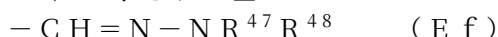
(式中、 R^{46} は、フェニル基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニルC1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニルC1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕又はC1～6アルコキシカルボニル基を示す。) ;

E16) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

E17) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

E18) 8-アザビシクロ〔3, 2, 1〕オクチル基 (8-アザビシクロ〔3, 2, 1〕オクタン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい) ;

E19) 一般式 (E f) で示される基 :



(式中、 R^{47} 及び R^{48} は、同一又は異なって、水素原子；C1～6アルキル基；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕又はピリジル基〔ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基を少なくとも1個が置換していてもよい〕を示す。また、この R^{47} 及び R^{48} は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい。) ;

E20) フェニルC1～6アルコキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

E21) アミノ置換C2～6アルケニル基 (該アミノ基上には、C1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた

10

20

30

40

50

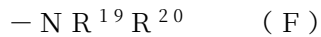
基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

又は

E22) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)

を示す。]

一般式 (F) で表される基 :



[式中、 R^{19} 及び R^{20} は、同一又は異なって、

F1) 水素原子 ;

F2) C 1 ~ 6 アルキル基 ;

F3) フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基 ; アミノ基 (アミノ基上には、C 1 ~ 6 アルキル基及びフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。] なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

F4) フェノキシ C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

F5) アミノ C 1 ~ 6 アルキル基 (アミノ基上には、C 1 ~ 6 アルキル基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子もしくはハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

F6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及び C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

F7) C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 ;

F8) フェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

F9) 一般式 (F a) で表される基 :

【0045】

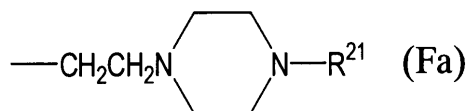
10

20

30

40

【化 1 2】



【0 0 4 6】

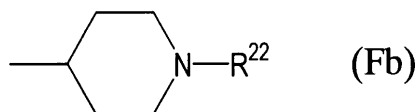
(ここで、 R^{21} は、C 1～6 アルコキシカルボニル基；フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。）；

10

F10) 一般式 (F b) で表される 1-置換-4-ピペリジル基：

【0 0 4 7】

【化 1 3】



20

【0 0 4 8】

(ここで、 R^{22} は、C 1～6 アルコキシカルボニル基；フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。）；又は

30

F11) ピペリジル C 1～6 アルキル基（ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい）が置換していてもよい）

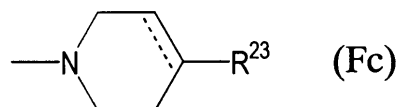
を示す。；

F12) 更に、 R^{19} 及び R^{20} は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記(F12-1)～(F12-10)に示す複素環を形成していてもよい。；

(F12-1) 一般式 (F c) で表される基：

【0 0 4 9】

【化 1 4】



40

【0 0 5 0】

[ここで、点線は二重結合であってもよいことを示す。 R^{23} は、

(Fc1) C 1～6 アルキル基；

(Fc2) フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

50

(Fc3) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基；置換基として C 1～6 アルキル基及びフェニル C 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれる基を有することのあるアミノ基；フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕、フェニル C 1～6 アルコキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）及び C 1～6 アルキル基なる群より選ばれる基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。〕からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

10

(Fc4) フェニル C 1～6 アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

20

(Fc5) ビフェニル C 1～6 アルコキシ基；

(Fc6) フェニル環上に少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニル C 3～6 アルケニルオキシ基；

(Fc7) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Fc8) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Fc9) C 1～6 アルコキシカルボニル基；

30

(Fc10) フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が少なくとも 1 個置換していてもよい）；

(Fc11) フェニル環上に少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニル C 1～6 アルキルカルバモイル基；

(Fc12) フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Fc13) フェニルチオ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が少なくとも 1 個置換していてもよい）；

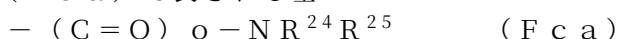
(Fc14) フェニルスルホキシド（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が少なくとも 1 個置換していてもよい）；

40

(Fc15) ピリジル C 1～6 アルコキシ基；

又は

(Fc16) 一般式 (F c a) で表される基：



（式中、o は前記に同じ。R²⁴及び R²⁵は、各々

(Fca1) 水素原子；

(Fca2) C 1～6 アルキル基；

(Fca3) フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アル

50

コキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Fca4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Fca5) C 1～6アルカノイル基；

(Fca6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 2～6アルカノイル基；

(Fca7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Fca8) C 1～6アルコキシカルボニル基；

(Fca9) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Fca10) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)；

又は

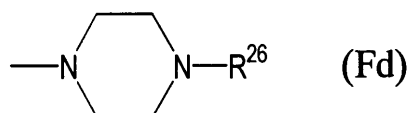
(Fca11) ピペリジルオキシカルボニル基 (ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] が少なくとも1個置換していてもよい) を示す。；

(Fca12) R^{24} 及び R^{25} は、これらが隣接する窒素原子を介して5～6員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基；ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェニルC 2～6アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。]；

(F12-2) 一般式 (F d) で表される4-置換-1-ピペラジニル基：

【0051】

【化15】



【0052】

10

20

30

40

50

- (式中、 R^{26} は、
- (Fd1) 水素原子；
- (Fd2) C 1～6 アルキル基；
- (Fd3) C 3～8 シクロアルキル基；
- (Fd4) C 3～8 シクロアルキル C 1～6 アルキル基；
- (Fd5) C 1～6 アルコキシカルボニル C 1～6 アルキル基；
- (Fd6) フェニル C 2～6 アルケニル基；
- (Fd7) フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基；C 3～8 シクロアルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基；置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基；C 1～6 アルコキシカルボニル基；フェノキシ基；フェニル C 1～6 アルキル基；フェニル C 2～6 アルケニル基；ピリジル基；イミダゾリル基及びピペリジル基からなる群より選ばれた基が 1～3 個置換していてもよい）；
- (Fd8) ビフェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基及び置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
- (Fd9) ナフチル C 1～6 アルキル基；
- (Fd10) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；シアノ基；置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基；C 1～6 アルコキシカルボニル基；カルボキシ基；フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕；アミノ C 1～6 アルキル基〔アミノ基上にはフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種が置換していてもよい〕及びフェニル C 1～6 アルコキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
- (Fd11) ビフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい）；
- (Fd12) アミノ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、フェニル C 1～6 アルキルアミノ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい）又はフェニルアミノ基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
- (Fd13) ベンゾイル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい）；
- (Fd14) フェニルカルバモイル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい）；
- (Fd15) チアゾリル C 1～6 アルキル基（チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
- (Fd16) オキサゾリル C 1～6 アルキル基（オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
- (Fd17) インドリル C 1～6 アルキル基；

(Fd18) フリル C 1～6 アルキル基（フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が少なくとも 1 個置換していてもよい）；

(Fd19) イミダゾリル C 1～6 アルキル基（イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい）；

(Fd20) キノリル C 1～6 アルキル基；

(Fd21) テトラゾリル基（テトラゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい）；

(Fd22) フェニル基が置換していてもよいピリミジル基；

(Fd23) ピリジル基；

(Fd24) ベンゾオキサゾリル基；

(Fd25) ベンゾチアゾリル基；

10

(Fd26) ベンゾオキサゾリル C 1～6 アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも 1 個のオキソ基が置換していてもよい）；

(Fd27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシ C 2～6 アルカノイル基；

(Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオ C 2～6 アルカノイル基；

(Fd29) フェニル C 2～6 アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Fd30) ベンゾイル基（フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基及び置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

20

(Fd31) ビフェニルカルボニル基；

(Fd32) ピリジルカルボニル基；

(Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニル C 2～6 アルケニルカルボニル基；

(Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニル C 1～6 アルキルスルホニル基；

(Fd35) ベンゼンスルホニル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

30

(Fd36) 一般式 (F d a) で表される基：



（式中、 R^{27} は、

(Fda1) ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～8 アルキル基；

(Fda2) C 3～C 8 シクロアルキル基；

(Fda3) C 3～C 8 シクロアルキル-C 1～6 アルキル基；

(Fda4) C 1～6 アルコキシ-C 1～6 アルキル基；

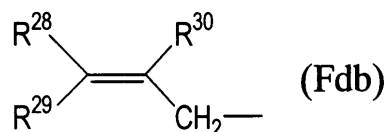
(Fda5) C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ-C 1～6 アルキル基；

(Fda6) 一般式 (F d b) で表される基

40

【0053】

【化16】



【0054】

（ここで R^{28} 、 R^{29} 及び R^{30} は、各々水素原子；C 1～6 アルキル基；フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及び

50

ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。)；

(Fda7) フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキルチオ基、フェニルC 1～6 アルコキシ基、ヒドロキシ基、C 1～6 アルキルスルフィニル基、C 1～6 アルキルスルホニル基、C 1～6 アルキルスルホニルオキシ基、シアノ基、C 1～6 アルカノイル基、ベンゾイル基、アルキル部分にC 1～6 アルコキシ基を有することのあるフェニルC 1～6 アルキル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、C 1～6 アルカノイルアミノ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、C 1～6 アルキルアミノカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基、トリC 1～6 アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及びイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1～5個置換していてもよい)；

(Fda8) ビフェニルC 1～6 アルキル基；

(Fda9) ベンズヒドリル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Fda10) フェノキシC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

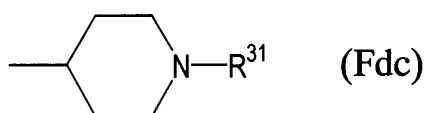
(Fda11) フェニルC 2～6 アルキニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)；

(Fda12) ピリジルC 1～6 アルキル基；

(Fda13) 一般式 (F d c) で表される基

【0055】

【化17】



【0056】

(ここで、R³¹は、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；フェニルC 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 又はベンゾイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]を示す。)；

(Fda14) ピペリジノC 1～6 アルキル基 (ピペリジン環上には、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を少なくとも1個有することのあるフェノキシ基が置換していてもよい)；

(Fda15) アミノC 1～6 アルキル基 (アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基を有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Fda16) 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジルC 1～6 アルキル基 (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい] が置換していてもよい)；

- (Fda17) ナフチル C 1～6 アルキル基；
 (Fda18) フルオレニル C 1～6 アルキル基；
 (Fda19) ピリジル C 1～6 アルキル基；
 (Fda20) フリル C 1～6 アルキル基（フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；
 (Fda21) チエニル C 1～6 アルキル基；
 (Fda22) オキサゾリル C 1～6 アルキル基（オキサゾール環上には、ハロゲン原子又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；
 (Fda23) オキサジアゾリル C 1～6 アルキル基（オキサジアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；
 (Fda24) ピラゾリル C 1～6 アルキル基（ピラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；
 (Fda25) ベンゾチエニル C 1～6 アルキル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
 (Fda26) チオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニル C 1～6 アルキル基；
 (Fda27) ベンゾチアゾリル C 1～6 アルキル基；
 (Fda28) ベンゾフラン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾフリル C 1～6 アルキル基；
 (Fda29) インドリニル C 1～6 アルキル基（インドリン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
 (Fda30) ベンゾオキサゾリル C 1～6 アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、ハロゲン原子、C 1～6 アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
 (Fda31) クロメニル C 1～6 アルキル基；
 (Fda32) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル C 1～6 アルキル基（キノリン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
 (Fda33) チアゾリル C 1～6 アルキル基（チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
 又は
 (Fda34) テトラゾリル C 1～6 アルキル基（テトラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）
 を示す。）；
 (Fd37) 一般式 (F e) で表される基：

$$-Z-NR^{32}R^{33} \quad (F e)$$

 （式中、Z は $-C=O$ 又は $-C=S$ を示す。R³² 及び R³³ は、同一又は異なって、
 (Fe1) 水素原子；
 (Fe2) C 1～6 アルキル基；
 (Fe3) C 3～8 シクロアルキル基；
 (Fe4) フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
 (Fe5) フェニル C 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；
 又は

10

20

30

40

50

(Fe6) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。；

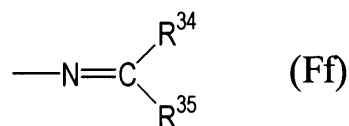
(Fe7) 或いは、R³²及び R³³は、これらが隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合してピペリジン環又は 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環を形成してもよい。該ピペリジン環及び 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。

10

(Fd38) 一般式 (F f) で表される基：

【0057】

【化18】



【0058】

(式中、R³⁴は水素原子又は C 1～6 低級アルキル基を示す。R³⁵は、

(Ff1) C 3～8 シクロアルキル基；

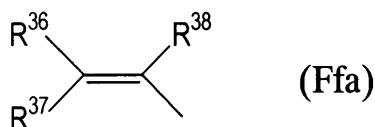
20

(Ff2) C 3～8 シクロアルケニル基；

(Ff3) 一般式 (F f a) で表される基：

【0059】

【化19】



【0060】

(ここで、R³⁶、R³⁷及び R³⁸は、各々水素原子；C 1～6 アルキル基；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基、C 1～4 アルキレンジオキシ基、C 1～6 アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基として C 1～6 アルカノイル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が 1～5 個置換していてもよい〕；ベンゾフリル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕；ビフェニル基、フリル基〔フラン環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい〕又はチアゾリル基〔チアゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフェニル基が少なく

30

40

とも 1 個置換していてもよい〕を示す。；

(Ff4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 のアルキル基；C 3～8 シクロアルキル基；ヒドロキシル基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～8 のアルコキシ基；C 3～8 シクロアルコキシ基；C 1～4 アルキレンジオキシ基；シアノ基；ニトロ基；フェニル C 2～6 アルケニル基；C 2～6 アルカノイルオキシ基；置換基として C 1～6 アルカノイル基を有することのあるアミノ基；C 1～6 アルキルスルホニルアミノ基；フェニル C 1～6 アルコキシ基；フェノキシ基；C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換したアミノ基；フェニル基が少なくとも 1 個置換したアミノ基；アミノ C 1～6 アルコキシ基〔アミノ基上には、C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい〕；C 1～6 アルコキシカルボニル基；C 1～6 アルコキ

50

シカルボニル C 1～6 アルコキシ基；C 1～6 アルキルチオ基；ピロリル基；イミダゾリル基；ピペリジル基；モルホリノ基；ピロリジニル基；チエニル基；ベンゾフリル基；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、置換基として C 1～6 アルキル基、フェニル C 1～6 アルキル基及び C 1～6 アルキル基を少なくとも 1 種有することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕；キノリル基〔キノリン環上に C 1～6 アルコキシ基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕；ピペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff5) ナフチル基（ナフタレン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基及び置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff6) ビフェニリル基（ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～9 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff7) フルオレニル基；ピレニル基；

(Ff8) ベンゾフリル基（ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff9) ベンゾチエニル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff10) ピリジル基（ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が少なくとも 1 種が置換していてもよい〕、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff11) フリル基（フラン環上には、C 1～6 のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 のアルコキシ基及びニトロ基からなる群より選ばれた基が少なくとも 1 種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が 1～3 個置換していてもよい）；

(Ff12) ベンゾチアゾール基（ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上に C 1～6 のアルコキシ基を有することのあるフェニル基が少なくとも 1 個置換していてもよい）；

(Ff13) チエニル基（チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C 1～6 アルキル基、ピラゾール環上にハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff14) インドリル基（インドール環上には、置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニル C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff15) ピロリル基（ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよいフェニル基及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Ff16) クマリル基；

(Ff17) ベンゾイミダゾリル基（ベンゾイミダゾール環上には、少なくとも 1 個のチエニル基が置換していてもよい）；

(Ff18) オキサゾリル基（オキサゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフ

10

20

30

40

50

フェニル基が少なくとも1個置換していてもよい)；

(Ff19) チアゾリル基 (チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が置換していてもよい。該フェニル環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)；

(Ff21) キノリル基；

(Ff22) 3, 4-ジヒドロカルボスチリル基 (3, 4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキル基及びフェニル C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、カルボスチリル基 (カルボスチリル環上には、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキル基及びフェニル C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Ff23) イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基；

(Ff24) イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基；

(Ff25) クロマニル基 (クロマン環上には、少なくとも1個の C 1～6 アルキル基が置換していてもよい)；

又は

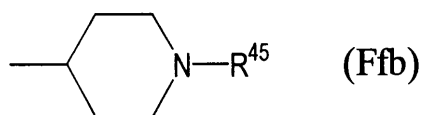
(Ff26) 2, 3-ジヒドロベンゾフリル基
を示す。)；

又は

(Fd39) 一般式 (F f b) で表される基：

【0 0 6 1】

【化 2 0】



【0 0 6 2】

(式中、R⁴⁵は、C 1～6 アルコキシカルボニル基；フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；アミノ置換 C 1～6 アルキル基 [アミノ基上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及び C 1～6 アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；ベンゾイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；フェニル C 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 又はフェニル C 2～6 アルケニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] を示す。)

を示す。)

(F12-3) モルホリノ基；

(F12-4) イミダゾリル基；

(F12-5) 1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デシル基 (1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デカン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)；

(F12-6) ホモピペラジニル基（ホモピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(F12-7) ピペラジニル基（ピペラジン環上には、オキシ基、C 1～6 アルキル基、フェニル C 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基の少なくとも 1 個が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(F12-8) ピペリジル基（ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のオキシ基が置換していてもよい）；

(F12-9) ピロリジニル基（ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基を有することのあるフェノキシ C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい）；

又は

(F12-10) イソインドリニル基

を示す。；

F13) 更に、R¹⁹及びR²⁰は、これらが隣接する窒素原子と共にヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して、下記(F13-1)～(F13-11)に示す環状イミド又はアミドを形成していてもよい。

【0063】

(F13-1) スクシンイミド基；

(F13-2) オキサゾリジニル基（オキサゾリジン環上には、少なくとも 1 個のオキシ基が置換していてもよい）；

(F13-3) ベンゾー 1, 3-オキサゾリジニル基（ベンゾー 1, 3-オキサゾリジン環上には、オキシ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(F13-4) イミダゾリジニル基（イミダゾリジン環上には、オキシ基、フェニル C 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子及び C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～3 個置換していてもよい〕及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(F13-5) ベンゾイミダゾリジニル基（ベンゾイミダゾリジン環上には、オキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、C 1～6 アルキル基、フェニル環上にハロゲン原子が 1～3 個置換していてもよいフェニル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(F13-6) フタルイミド基；

(F13-7) インドリニル基（インドリン環上には、C 1～6 アルキル基、ハロゲン原子及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(F13-8) 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾリル基（2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール環上には、少なくとも 1 個のオキシ基が置換していてもよい）；

(F13-9) 1H-2, 4-ベンゾオキサジニル基（1H-2, 4-ベンゾオキサジン環上には、少なくとも 1 個のオキシ基が置換していてもよい）；

(F13-10) 一般式 (F g a) で表される基：

【0064】

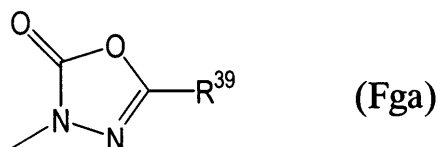
10

20

30

40

【化 2 1】



【0065】

(式中、 R^{39} は、水素原子；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC 1～6アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシC 1～6アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基；ピリジル基又はピラジニル基を示す。)

10

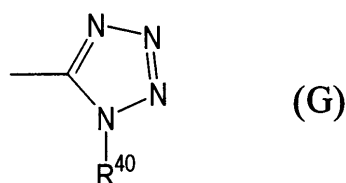
(F13-11) 1, 3-チアゾリジニル基 (1, 3-チアゾリジン環上には、置換基としてオキシ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基を有していてもよいフェニルC 1～6アルキリデン基からなる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい)]

一般式 (G) で表される基：

20

【0066】

【化 2 2】



【0067】

(式中、 R^{40} は、C 1～6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基を示す。)

30

(a) フェニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] が置換していてもよい) ；

(b) ベンゾチアゾリルオキシ基 (ベンゾチアゾール環上には、(b-1)フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、(b-2)ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] 及び(b-3)ピペリジル基 [ピペリジン環上には、アミノ基 (アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン

40

50

置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) :

(c) キノリルオキシ基 (キノリン環上には、(c-1)ハロゲン原子、(c-2)フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、(c-3)ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] 及び(c-4)ピペリジル基 [ピペリジン環上には、アミノ基 (アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニルC 1～6アルキリデン基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) :

(d) ピリジルオキシ基 (ピリジン環上には、(d-1)ピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及び(d-2)ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) :

(e) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルオキシ基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、オキシ基、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6ア

ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びフェニルC1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) :

(f) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) :

(g) 2H-クロメニオキシ基 (2H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) :

10

(h) ナフチルオキシ基 (ナフタレン環上には、少なくとも1個のピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] が置換していてもよい) :

(i) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリルオキシ基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、C1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) :

20

(j) 基-NR^{22'}R^{23'}

(R^{22'}は、水素原子又はC1～6アルキル基を示す。R^{23'}は、(j-1)フェニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のピペリジル基 (ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい) が置換しているものとする]、(j-2)フェニルC1～6アルキル基 [フェニル環上には、ピペリジル基 (ピペリジン環上には、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換しているものとする) 及び基-NR^{24'}R^{25'} (R^{24'}は、水素原子又はC1～6アルキル基を示す。R^{25'}は、フェニルC2～6アルケニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] を示す。) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする]、(j-3)ピペリジルC1～6アルキル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換しているものとする] 又は(j-4)チアゾリル基 [チアゾール環上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、ピペラジニルC1～6アルキル基 (ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい) 及びピペリ

30

40

50

ジルC 1～6アルキル基（ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。）：

（k）ベンゾオキサゾリルオキシ基（ベンゾオキサゾール環上には、ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする）：

10

（l）ベンゾイミダゾリルオキシ基（ベンゾイミダゾール環上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群から選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）：

20

（m）1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、(m-1)アミノ基〔アミノ基上には、C 1～6アルキル基、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びフェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕及び(m-2)フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）：

30

（n）ピペリジル基（ピペリジン環上には、(n-1)フェニル基〔フェニル環上には、少なくとも1個の基-NR^{26'}R^{27'}（R^{26'}は、水素原子又はC 1～6アルキル基を示す。R^{27'}は、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。）が置換しているものとする〕、(n-2)基-W₁NR^{28'}R^{29'}〔W₁はC 1～6アルキレン基を示す。R^{28'}は、水素原子又はC 1～6アルキル基を示す。R^{29'}は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。〕及び(n-3)フェニル基が2個置換したC 1～6アルコキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）：

40

（o）ピペラジニル基（ピペラジン環上には、フェニル基が2個置換したC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキ

50

ル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC 2～6アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする〕及びイミダゾリル基〔イミダゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする）：

10

(p) チアゾリルC 1～6アルコキシ基（チアゾール環上には、(p-1)フェノキシC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、(p-2)アニリノC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、(p-3)フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、(p-4)ピペラジニルC 1～6アルキル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕及び(p-5)ピペリジルC 1～6アルキル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）：

20

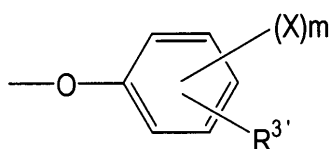
(q) 8-アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクチル基（8-アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクタン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい）：

30

(r) 基

【0068】

【化23】



40

【0069】

〔ここで、Xはハロゲン原子又は置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1～6アルキル基を示す。mは0～3の整数を示す。R^{3'}は、下記(i)～(xii)のいずれかの基を示す。

(i) 基—(W) o—NR^{4'}R^{5'}

(Wは、基—CO—又はC 1～6アルキレン基を示す。oは0又は1を示す。R^{4'}は、水素原子、C 1～6アルキル基又はフェニルカルバモイル基〔フェニル環上には、ハロゲン

50

10

【化 2 4】



30

40

50

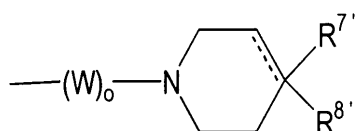
くは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；ベンゾチエニル基；ナフチル基；キノリル基；ベンゾチアゾリル基（ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい）；2，3-ジヒドロ-1H-インデニル基（2，3-ジヒドロ-1H-インダン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）；9H-フルオレニル基又はフェニルC 2～6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。]

を示す。)；

(ii) 基

【0072】

【化25】



【0073】

(W及びoは、前記に同じ。点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示すときはR^{7'}のみが置換するものとする。R^{7'}は、水素原子、水酸基、C 1～6アルコキシ基又はフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲンが置換していてもよい〕を示す。R^{8'}は、下記(1)～(58)のいずれかの基を示す。

(1) フェニルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、フェノキシ基、C 1～6アルキルチオ基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(2) フェニルC 1～6アルコキシ基（フェニル環上には、シアノ基、フェニル基、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェノキシ基、C 1～6アルキルチオ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(3) フェニルC 2～6アルケニルオキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(4) 基—(W) o—NR^{9'}R^{10'}

(W及びoは前記に同じ。

R^{9'}及びR^{10'}は、同一又は異なって、水素原子；置換基として水酸基を有することのあるC 1～6アルキル基；C 1～6アルカノイル基；C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニル基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基、置換基としてC 1～6アルカノイル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、アミノスルホニル基、1，2，3，4-テトラヒドロキノリル基（1，2，3，4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が少なくとも1個置換していてもよい）、C 1～6アルキルスルホニル基、C 3～8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C 1～6アルキルチオ基、フェニルスルホニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6ア

10

20

30

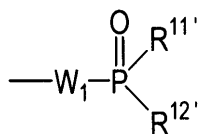
40

50

ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)、水酸基置換 C 1～6 アルキル基及び基

【0074】

【化 26】



【0075】

(W₁はC 1～6 アルキレン基を示す。R^{11'}及びR^{12'}は、同一又は異なって、C 1～6 アルコキシ基を示す。) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; フェニルC 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、置換基としてC 1～4 アルキレンジオキシ基、フェニル基、基-N (R^{11A'}) R^{12A'} (R^{11A'}及びR^{12A'}は、同一又は異なって水素原子、C 1～6 アルキル基又はフェニル基を示す。R^{11A'}及びR^{12A'}は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい)、フェノキシ基、フェニルC 1～6 アルコキシ基、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基置換C 1～6 アルコキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～10 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; ベンゾフリルC 1～6 アルキル基 [ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; フェニルスルホニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基及びC 1～4 アルキレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; フェノキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; フェニルC 2～6 アルケニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; C 1～6 アルコキシ置換C 1～6 アルキル基; C 2～6 アルケニル基; C 1～6 アルコキシ置換C 2～6 アルカノイル基; C 3～8 シクロアルキル置換C 1～6 アルキル基; フェノキシC 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; ベンゾイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; フェニルカルバモイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; ピリジル基; ピリジルC 1～6 アルキル基; イミダゾリルC 1～6 アルキル基; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 [1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; キノリル基; インドリル基; 置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基; インダゾリル基; ナフチル基; C 3～8 シクロアルキル基; 置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1～6 アルキル基; シアノ置換C 1～6 アルキル基; フリル置換C 1～6 アルキル基又はピペラジニル置換C 1～6 アルキル基 [ピペラジン環上には、置換基として少なくとも 1 個のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基

10

20

30

40

50

の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]を示す。

R^{9'}及びR^{10'}は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基、イソインドリル基又は5~7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基、フェニル基〔フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ベンゾイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ピリジルC1~6アルキル基、C3~8シクロアルキル基、フェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上には、C1~4アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ピペリジルC1~6アルキル基、ピペリジル基、フェニルC1~6アルコキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいアミノ基、ベンゾオキサゾリル基及びベンゾイミダゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(5) フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(6) カルバモイルオキシ基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(7) カルバモイルオキシ置換C1~6アルキル基(アミノ基上には、C1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基、C3~8シクロアルキル基、ナフチル基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基、2, 3-ジヒドロベンゾフリル基及びフェニル基〔フェニル環上には、C1~4アルキレンジオキシ基、シアノ基、フェノキシ基、C1~6アルキルチオ基、C1~6アルカノイル基、フェニル基、フェニルC1~6アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~10アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~10アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(8) フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子；C1~4アルキレンジオキシ基；C1~6アルコキシカルボニル基；フェニル基；フェノキシ基；ピロリル基；ベンゾチアゾリル基；1, 2, 4-トリアゾリル基；イミダゾリル基；イソオキサゾリル基；ベンゾオキサゾリル基；ベンゾトリアゾリル基；シアノ基；ニトロ基；C2~6アルケニル基；C1~6アルカノイル基；C1~6アルコキシカルボニル置換C1~6アルキル基；C1~6アルカノイル置換C1~6アルキル基；基-N(R^{11B'})R^{12B'}(

10

20

30

40

50

$R^{11B'}$ 及び $R^{12B'}$ は、同一又は異なって水素原子、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルカノイル基又はフェニル基を示す。 $R^{11B'}$ 及び $R^{12B'}$ は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して 5～7 員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びアミノ基〔アミノ基上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；フェニル C 1～6 アルコキシ基；フェニル C 1～6 アルキル基；C 1～6 アルキルチオ基；C 3～8 シクロアルキル基；ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～10 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(9) テトラヒドロピラニルオキシ C 1～6 アルキル基；

(10) 水酸基置換 C 1～6 アルキル基；

(11) フリル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基（フラン環上には、少なくとも 1 個の C 1～6 アルコキシカルボニル基が置換していてもよい）；

(12) テトラゾリル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基（テトラゾール環上には、フェニル C 1～6 アルキル基及び C 3～8 シクロアルキル C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基が置換していてもよい）；

(13) イソオキサゾリル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基（イソオキサゾール環上には、少なくとも 1 個の C 1～6 アルキル基が置換していてもよい）；

(14) ベンゾチエニル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(15) 1, 3, 4-オキサジアゾリル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基（1, 3, 4-オキサジアゾール環上には、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕が置換していてもよい）；

(16) C 2～6 アルキニルオキシ置換 C 1～6 アルキル基；

(17) ナフチル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基；

(18) 1, 2, 4-オキサジアゾリル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基〔1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい〕；

(19) ピリジル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基〔ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕；

(20) チアゾリル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基〔チアゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕；

(21) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基〔1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも 1 個の C 1～6 アルキル基が置換していてもよい〕；

(22) カルバモイル C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基〔アミノ基上には、C 3～8 シクロアルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕；

- (23)ベンゾフリルC 1～6 アルコキシ置換C 1～6 アルキル基 [ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のシアノ基が置換していてもよい] ；
- (24)ベンゾフリルC 1～6 アルキル基 [ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ；
- (25)フェノキシ基 [フェニル環上には、フェニルC 1～6 アルコキシ基、C 3～8 シクロアルキル基、C 7～10 アルコキシ基及びフェノキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種を置換しているものとする] ；
- (26)ナフチルオキシ基 ；
- (27)2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基 [2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい] ； 10
- (28)ベンゾチアゾリルオキシ基 [ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい] ；
- (29)1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基 [1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい] ；
- (30)ジベンゾフリルオキシ基 ；
- (31)キノリルオキシ基 ；
- (32)フリルC 1～6 アルコキシ基 [フラン環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルコキシカルボニル基が置換していてもよい] ；
- (33)テトラゾリルC 1～6 アルコキシ基 [テトラゾール環上には、フェニルC 1～6 アルキル基及びC 3～8 シクロアルキルC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種を置換していてもよい] ； 20
- (34)1, 2, 4-オキサジアゾリルC 1～6 アルコキシ基 [1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい] ；
- (35)ベンゾチエニルC 1～6 アルコキシ基 [ベンゾチオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] ；
- (36)イソオキサゾリルC 1～6 アルコキシ基 [イソオキサゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい] ； 30
- (37)1, 3, 4-オキサジアゾリルC 1～6 アルコキシ基 [1, 3, 4-オキサジアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい）が置換していてもよい] ；
- (38)ナフチルC 1～6 アルコキシ基 ；
- (39)ピリジルC 1～6 アルコキシ基（ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい） ；
- (40)チアゾリルC 1～6 アルコキシ基 [チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい] ； 40
- (41)1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルC 1～6 アルコキシ基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい） ；
- (42)フェノキシC 1～6 アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい） ；
- (43)カルバモイルC 1～6 アルコキシ基 [アミノ基上には、C 3～8 シクロアルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が 50

置換していてもよい]；

(44)ベンゾフリルC 1～6アルコキシ基（ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のシアノ基が置換していてもよい）；

(45)ナフチルオキシC 1～6アルキル基（ナフタレン環上には、少なくとも1個のC 1～6アルコキシ基が置換していてもよい）；

(46)ベンゾチアゾリルオキシC 1～6アルキル基（ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい）；

(47)キノリルオキシC 1～6アルキル基（キノリン環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい）；

(48)2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシC 1～6アルキル基（2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C 1～6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(49)1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシC 1～6アルキル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）；

(50)2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシC 1～6アルキル基（2, 3-ジヒドロ-1H-インデン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）；

(51)ベンゾオキサチオラニルオキシC 1～6アルキル基（ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）；

(52)イソキノリルオキシC 1～6アルキル基；

(53)ピリジルオキシC 1～6アルキル基；

(54)ジベンゾフリルオキシC 1～6アルキル基；

(55)2H-1-ベンゾピラニルオキシC 1～6アルキル基（2H-1-ベンゾピラン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）；

(56)ベンゾイソオキサゾリルオキシC 1～6アルキル基；

(57)ベンゾフラザニルオキシC 1～6アルキル基；

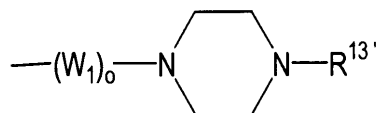
(58)キノキサリルオキシC 1～6アルキル基；

また、 $R^{7'}$ 及び $R^{8'}$ は、一緒になって、基= $C(R^{29'})$ ($R^{30'}$)を形成してもよい。ここで、 $R^{29'}$ 及び $R^{30'}$ は、同一又は異なって、水素原子、C 1～6アルキル基又はフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。）；

(iii) 基

【0076】

【化27】



【0077】

(W_1 及び o は前記に同じ。 $R^{13'}$ は、2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基；ベンゾチエニル基；フェニルC 2～10アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、C 1～4アルキレンジオキシ基、C 1～6アルキルチオ基、ベンゾイル基、シアノ基、ニトロ基、C 2～6アルカノイルオキシ基、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基、水酸基、フェニルC 1～6アルコキシ基、フェノキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；ナフチルC 2～6アルケニル基；ベンゾフリルC 1～6アルキル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕

] ; ベンゾチエニル C 2 ~ 6 アルケニル基 ; ベンゾチアゾリル C 2 ~ 6 アルケニル基 [ベンゾチアゾール環上には、少なくとも 1 個の C 1 ~ 6 アルキル基が置換していてもよい]
 ; フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ピペリジニル基 (ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] が置換していてもよい) 及びフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換しているものとする] ; ジフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; フェニル基 [フェニル環上には、C 1 ~ 4 アルキレンジオキシ基、フェニル基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、水酸基及びフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換しているものとする]
 ; ベンゾフリル基 [ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種を置換していてもよい] ; ベンゾチアゾリニル基 [ベンゾチアゾリン環上には、少なくとも 1 個のオキソ基が置換していてもよい] ; ベンゾチエニル基 [ベンゾチオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい] ; ナフチル基 ; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 [1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、オキソ基及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; ベンゾイソオキサゾリル基 ; 2, 3-ジヒドロベンゾフリル基 ; 1, 2-ジヒドロヒドロキノリル基 [1, 2-ジヒドロヒドロキノリン環上には、少なくとも 1 個のオキソ基が置換していてもよい] ; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリニル基 [1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン環上には、オキソ基及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; ベンゾシクロヘプチル基 ; フェノキシ C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; ベンゾチエニル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 [ベンゾチオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子を有していてもよい] ; ナフチル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 ; ピリジル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 [ピリジン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい] ; フリル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 [フラン環上には、少なくとも 1 個のニトロ基が置換していてもよい] ; チエニル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 [チオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい] ; チアゾリル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 [チアゾール環上には、C 1 ~ 6 アルキル基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; テトラゾリル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 [テトラゾール環上には、少なくとも 1 個の C 1 ~ 6 アルキル基が置換していてもよい] ; イソオキサゾリル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 [イソオキサゾール環上には、少なくとも 1 個の C 1 ~ 6 アルキル基が置換していてもよい] ; 1, 2, 4-オキサジアゾリル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 [1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基 (フェニル環上には、C 1 ~ 6 のアルキル基が置換していてもよい) が置換していてもよい] 又はベンゾフラザニル置換 C 1 ~ 6 アルキル基を示す。) ;

(iv) 基

【0078】

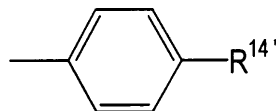
10

20

30

40

【化 2 8】



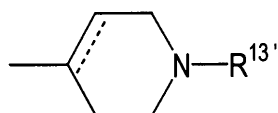
【0079】

($R^{14'}$ は、フェニルアミノ基 [フェニルアミノ基のN位にはC 1～6 アルキル基が置換していてもよく、フェニルアミノ基のフェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい] ; ピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい) 及びアミノ基 (該アミノ基上には、置換基としてC 1～6 アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC 2～6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ホモピペラジニル基 [ホモピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] 又はフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及びフェノキシ置換フェニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] を示す。) ;

(v) 基

【0080】

【化 2 9】



【0081】

($R^{13'}$ は前記に同じ。点線は二重結合であってもよいことを示す。) ;
 (vi) ホモピペラジニル基 (ホモピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基 ; フェニルC 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロ

10

20

30

40

50

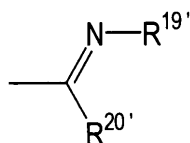
ゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；フェニルC 1～6アルコシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニルカルバモイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニルC 2～6アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕及びベンゾイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；

10

(vii)基

【0082】

【化30】



20

【0083】

(式中、R^{19'}は、C 1～6アルコキシ基を示す。R^{20'}は、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。)；

(viii)基—CHR^{20'}R^{21'}

(R^{20'}は、前記に同じ。R^{21'}は、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基を示す。)；

30

(ix) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のアミノ基〔アミノ基上には、フェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい)；

(x)オキサゾリル基(オキサゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい)；

40

(xi)イソインドリル基(イソインドリン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(xii)チアゾリル基(チアゾール環上には、フェノキシC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6

50

アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；基—(W₁) o NR^{31'} R^{32'} [W₁及びoは、前記に同じ。R^{31'}及びR^{32'}は、同一又は異なって、水素原子、C 1～6 アルキル基、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）又はフェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。]；ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい]；ペリジル基 [ペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい] 及びフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]

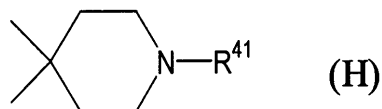
10

20

一般式 (H) で表されるスピロ環基：

【0084】

【化31】



【0085】

(式中、R⁴¹は、

H1) 水素原子；

H2) C 1～6 のアルキル基；

H3) フェニル環上に置換基としてフェニル基を有することのあるフェニルC 1～6 アルキル基；

H4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、アミノ基 [アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びペリジル基 [ペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

H5) ピペラジニルC 1～6 アルキル基（ピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していても

30

40

50

よい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

H6) ピペラジニルカルボニルC 1～6アルキル基 (ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基を有していてもよいフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

H7) フェニルカルバモイルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

H8) ベンゾオキサゾリルC 1～6アルキル基 (ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) ;

H9) ベンゾチアゾリル基 ;

H10) テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が置換していてもよい) ;

H11) C 1～6アルキルスルホニル基 ;

H12) フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい) ;

H13) フェニルチオカルバモイル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

H14) C 1～8のアルコキシカルボニル基 ;

H15) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、C 1～6アルコキシカルボニル基、置換基としてC 1～6アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、ニトロ基及びC 1～6アルキルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

H17) フェニル置換もしくは非置換のフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 ;

H18) ナフチルC 1～6アルコキシカルボニル基 ;

H19) ピリジルC 1～6アルコキシカルボニル基 ;

H20) C 1～6アルコキシ置換C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

H21) ピペラジニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

H22) フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、C 1～6アルキル基及びC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

H23) C 1～6アルカノイル基 ;

H24) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

H25) フェニルC 1～6アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

H26) フェノキシC 1～6アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子が1～3個置換していてもよい) ;

H27) ピペラジニルC 2～6アルカノイル基 (ピペラジン環上には、C 1～6アルカノイル基、フェニルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6ア

10

20

30

40

50

ルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい〕及びベンゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

H28) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシル基、C 1～6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい)；

H29) フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

又は

H30) ピペラジニルカルボニル基 (ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕及びフェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。)

但し、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(A)で表される基を示す場合、 R^3 はイソプロピル基であってはならない。また、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(E)で表される基を示し、mが0を示す場合、 R^{11} は水素原子であってはならない。更に、 R^1 が水素原子を示し、 R^2 が一般式(F)で表される基を示す場合、 R^{19} は水素原子を示し且つ R^{20} がtert-ブトキシカルボニル基を示してはならない。]

【0086】

2. 本発明は、医薬組成物が抗結核薬である上記1に記載の医薬組成物を提供する。

【0087】

3. 本発明は、オキサゾール化合物が、

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロベニルエステル、

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロベニルエステル、

(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロベニルエステル、

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール、

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール、

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノ

10

20

30

40

50

キシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) - 8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) - 8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) - 8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) - 8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 4-トルエンスルホン酸塩、

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2- [4- (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2- [4- (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2- [4- (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2- [4- (5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ

10

20

30

40

50

10

20

30

40

50

4-イルメチル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

10

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

20

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

30

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

40

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

50

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-クロロベンジル)ピペリジン]

50

ー4-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
からなる群より選ばれた少なくとも1種である上記1又は2に記載の医薬組成物を提供する。

【0088】

本明細書において、 R^1 及び(A)～(G)において示される各基は、具体的に次の通りである。

【0089】

ハロゲン原子としては、例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を示す。

10

【0090】

C1～6アルキル基とは、炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、sec-ブチル基、n-ペンチル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、3-メチルペンチル基等を挙げることができる。

【0091】

C1～6アルコキシ基とは、上記定義されたC1～6アルキル基と酸素原子で構成される基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、n-ペントキシ基、ネオペントキシ基、n-ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、3-メチルペントキシ基等を挙げることができる。

20

【0092】

C1～6アルコキシ-C1～6アルキル基とは、上記C1～6アルキル基とC1～6アルコキシ基で構成される基であって、例えば、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、4-メトキシブチル基、5-メトキシペンチル基、6-メトキシヘキシル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、3-エトキシプロピル基、2-イソプロポキシエチル基、tert-ブトキシメチル基、2-(tert-ブトキシ)エチル基、3-(tert-ブトキシ)プロピル基、6-(tert-ブトキシ)ヘキシル基、4-(tert-ブトキシ)ブチル基等を挙げることができる。

30

【0093】

ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基とは、上記定義された炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基及びハロゲン原子が1～7個置換した前記アルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、sec-ブチル基、n-ペンチル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、3-メチルペンチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロプロピル基、3-ブロモプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブロモブチル基、2-クロロブチル基、5, 5, 5-トリフルオロペンチル基、5-クロロペンチル基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基、6-クロロヘキシル基等を挙げることができる。

40

【0094】

ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基とは、上記で定義されたC1～6のアルコキシ基及びハロゲン原子が1～7個置換した前記アルコキシ基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、n-ペントキシ基、ネオペ

50

ントキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、3-メチルペントキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、ブロモメトキシ基、ジブロモメトキシ基、ジクロロフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロイソプロポキシ基、3-クロロプロポキシ基、2-クロロプロポキシ基、3-ブロモプロポキシ基、4, 4, 4-トリフルオロブトキシ基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブトキシ基、4-クロロブトキシ基、4-ブロモブトキシ基、2-クロロブトキシ基、5, 5, 5-トリフルオロペントキシ基、5-クロロペントキシ基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシルオキシ基、6-クロロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

10

【0095】

フェニルC 1~6アルキル基（フェニル環上には、フェニルC 1~6アルコキシ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、2, 4-ジベンジルオキシベンジル基、2, 4, 6-トリベンジルオキシベンジル基、2-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、3-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、4-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、2-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、3-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、2-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、4-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、2-(5-フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、3-(5-フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、4-(5-フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、2-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、2-メチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、3, 4-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 4, 6-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、3, 4-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、2, 6-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2, 3, 4-トリフルオロメトキシベンジル基、1-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、1-(3-ベンジルオキシフェニル)エチル基、1-(2-ベンジルオキシフェニル)エチル基、1-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(3-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロ

20

30

40

50

メトキシフェニル) エチル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(3-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(2-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2-フェノキシベンジル基、3-フェノキシベンジル基、4-フェノキシベンジル基、2, 5-ジフェノキシベンジル基、2, 4, 6-トリフェノキシベンジル基、1-(4-フェノキシフェニル) エチル基、1-(3-フェノキシフェニル) エチル基、1-(2-フェノキシフェニル) エチル基、3-(4-フェノキシフェニル) プロピル基、3-(3-フェノキシフェニル) プロピル基、3-(2-フェノキシフェニル) プロピル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、1-(4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル) エチル基、1-(3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル) エチル基、1-(2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル) エチル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル) プロピル基、3-(3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル) プロピル基、3-(2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル) プロピル基、2-トリフルオロメチル-3-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ベンジルオキシ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3-フェノキシ-4-トリフルオロメチルベンジル基等のフェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、フェニルC 1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基が1~3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0096】

ビフェニルC 1~6アルキル基としては、例えば、2-ビフェニルメチル基、2-(2-ビフェニル) エチル基、3-(2-ビフェニル) プロピル基、4-(2-ビフェニル) ブチル基、5-(2-ビフェニル) ペンチル基、6-(2-ビフェニル) ヘキシル基、3-ビフェニルメチル基、2-(3-ビフェニル) エチル基、3-(3-ビフェニル) プロピル基、4-(3-ビフェニル) ブチル基、5-(3-ビフェニル) ペンチル基、6-(3-ビフェニル) ヘキシル基、4-ビフェニルメチル基、2-(4-ビフェニル) エチル基、3-(4-ビフェニル) プロピル基、4-(4-ビフェニル) ブチル基、5-(4-ビフェニル) ペンチル基、6-(4-ビフェニル) ヘキシル基等のフェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、フェニルC 1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルコキシ基を少なくとも1種有することのあるフェノキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)等を挙げることができる。

【0097】

フェニルC 2~6アルケニル基とは、フェニル基と炭素数2から6で二重結合を1~3個有するアルケニル基から構成される基を意味し、フェニルC 2~6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC 2~6アルケニル基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニル基(慣用名: シンナミル基)、4-フェニル-2-ブテニル基、4-フェニル-3-ブテニル基、5-フェニル-4-ペンテニル基、

5-フェニル-3-ペンテニル基、6-フェニル-5-ヘキセニル基、6-フェニル)-4-ヘキセニル基、6-フェニル-3-ヘキセニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニル基等を挙げることができる。

【0098】

C1~6アルキルスルホニル基とは、炭素数1ないしは6個で構成されるアルキル基とスルホニル基で構成される基であって、例えば、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、プロパンスルホニル基、ブタンスルホニル基、ペンタンスルホニル基、ヘキサンスルホニル基等を挙げることができる。

【0099】

C1~6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基としては、例えば、ベンゼンスルホニル基、o-トルエンズルホニル基、m-トルエンズルホニル基、p-トルエンズルホニル基、2-エチルベンゼンスルホニル基、3-エチルベンゼンスルホニル基、4-エチルベンゼンスルホニル基、2-プロピルベンゼンスルホニル基、3-プロピルベンゼンスルホニル基、4-プロピルベンゼンスルホニル基、2, 3-ジメチルベンゼンスルホニル基、2, 4-ジメチルベンゼンスルホニル基、2, 4, 6-トリメチルベンゼンスルホニル基等のC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよいベンゼンスルホニル基を挙げることができる。

【0100】

C1~6アルカノイル基としては、炭素原子数1~6で構成される脂肪族カルボン酸から誘導される基であって、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、ペンタノイル基、ヘキサノイル基等が挙げられる。

【0101】

C1~6アルコキシカルボニル基とは、上記で定義されたC1~6アルコキシ基とカルボニル基で構成された基であって、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、n-ペントキシカルボニル基、ネオペントキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、イソヘキシルオキシカルボニル基、3-メチルペントキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0102】

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、上で定義したフェニル環上にフェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニルC1~6アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェニルエトキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、3-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、4-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)ベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4

10

20

30

40

50

ージメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)ベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ベンジルオキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-ベンジルオキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ベンジルオキシフェニル)ブトキシカルボニル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル)ブトキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(3-ベンジルオキシフェニル)ペントキシカルボニル基、5-(4-ベンジルオキシフェニル)ペントキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、6-(3-ベンジルオキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ベンジルオキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-[3-(2-フェネチルオキシ)フェニル]ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(2-フェネチルオキシ)フェニル]ヘキシルオキシカルボニル基、6-[3-(3-フェニルプロポキシ)フェニル]ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(4-フェニルブトキシ)フェニル]ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル]ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル]ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチル-4-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシ-5-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチル-3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0103】

フェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、2, 4-ジベンジルオキシベンジル基、2, 4, 6-トリベンジルオキシベンジル基、2-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、3-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、4-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、2-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、3-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、2-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、4-(4-フェニルブ

トキシ)ベンジル基、2-(5-フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、3-(5-フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、4-(5-フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、2-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、2-メチルベンジル基、2,3-ジメチルベンジル基、3,4-ジメチルベンジル基、3,5-ジメチルベンジル基、2,6-ジメチルベンジル基、2,4-ジメチルベンジル基、2,5-ジメチルベンジル基、2,4,6-トリメチルベンジル基、3,5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2,4,6-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2,3-ジメトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、3,5-ジメトキシベンジル基、2,6-ジメトキシベンジル基、2,4-ジメトキシベンジル基、2,5-ジメトキシベンジル基、2,4,6-トリメトキシベンジル基、2,6-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2,3,4-トリフルオロメトキシベンジル基、1-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、1-(3-ベンジルオキシフェニル)エチル基、1-(2-ベンジルオキシフェニル)エチル基、1-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(3-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル)プロピル基、3-(3-ベンジルオキシフェニル)プロピル基、3-(2-ベンジルオキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、2-トリフルオロメチル-3-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ベンジルオキシ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3-フェノキシ-4-トリフルオロメチルベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0104】

ビフェニルC1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、2-ビフェニルメトキシカルボニル基、2-(2-ビフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-ビフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ビフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(2-ビフェニル)ペントキシカルボニル基、6-(2-ビフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、3-ビフェニルメトキシカルボニル基、2-(3-ビフェニル)エトキシカルボニル基、3-(3-ビフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ビフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(3-ビフェニル)ペントキシカルボニル基、6-(3-ビフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、4-ビフェニルメトキ

10

20

30

40

50

シカルボニル基、2-(4-ビフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(4-ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(4-ビフェニリル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0105】

ベンゾオキサゾールC 1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-7-イルメチル基、2-(ベンゾオキサゾール-4-イル)エチル基、1-(ベンゾオキサゾール-5-イル)エチル基、3-(ベンゾオキサゾール-6-イル)プロピル基、4-(ベンゾオキサゾール-7-イル)ブチル基、5-(ベンゾオキサゾール-2-イル)ペンチル基、6-(ベンゾオキサゾール-4-イル)ヘキシル基、2-メチル-3-(ベンゾオキサゾール-5-イル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(ベンゾオキサゾール-2-イル)エチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル)メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル)メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル)メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)メチル基、2-(ベンゾオキサゾール-6-イル)エチル基、2-(ベンゾオキサゾール-7-イル)エチル基、2-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル)エチル基、2-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル)エチル基、2-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル)エチル基、2-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)エチル基、2-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)エチル基、3-(ベンゾオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(ベンゾオキサゾール-4-イル)プロピル基、3-(ベンゾオキサゾール-5-イル)プロピル基、3-(ベンゾオキサゾール-7-イル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)プロピル基、3-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)プロピル基、4-(ベンゾオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(ベンゾオキサゾール-4-イル)ブチル基、4-(ベンゾオキサゾール-5-イル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)ブチル基、4-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)ブチル基、5-(ベンゾオキサゾール-4-イル)ペンチル基、5-(ベンゾオキサゾール-5-イル)ペンチル基、5-(ベンゾオキサゾール-6-イル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)ペンチル基、5-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)ペンチル基、6-(ベンゾオキサゾール-2-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾオキサゾール-5-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾオキサゾール-6-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾオキサゾール-7-イル)ヘキシル基、6-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル)ヘキシル基、6-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾ

10

20

30

40

50

オキサゾール-4-イル)ヘキシル基、6-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル)ヘキシル基、6-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)ヘキシル基、6-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0106】

ベンゾオキサゾリル基としては、例えば ベンゾオキサゾール-2-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基等を挙げることができる。

【0107】

オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、フェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、オキサゾール-2-イルメチル基、オキサゾール-4-イルメチル基、オキサゾール-5-イルメチル基、2-(オキサゾール-2-イル)エチル基、1-(オキサゾール-4-イル)エチル基、3-(オキサゾール-5-イル)プロピル基、4-(オキサゾール-2-イル)ブチル基、5-(オキサゾール-4-イル)ペンチル基、6-(オキサゾール-5-イル)ヘキシル基、2-メチル-3-(オキサゾール-2-イル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(オキサゾール-5-イル)エチル基、(4-メチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-メチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-エチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-エチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-n-プロピルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-プロピルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-n-ブチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-ブチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)メチル基、2-(オキサゾール-4-イル)エチル基、2-(オキサゾール-5-イル)エチル基、2-(4-メチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-メチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-エチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-エチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-n-プロピルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-n-プロピルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-n-ブチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-n-ブチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)エチル基、3-(オキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(オキサゾール-4-イル)プロピル基、3-(4-メチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5-メチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(4-エチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5-エチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(4-n-プロピルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5-n-プロピルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(4-n-ブチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5-n-ブチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(4-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(4-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(5-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)プロピル基、4-(オキサゾール-4-イル)ブチル基、4-(オキサゾール-5-イル)ブチル基、4-(4-メチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-メチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(4-エチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-エチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(4-n-プロピルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-n-プロピルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(4-n-ブチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-n-ブチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(4-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(4-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)ブチル基、

10

20

30

40

50

ールー2-イル)ブチル基、4-(4-n-ヘキシロキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(5-n-ヘキシロキサゾール-2-イル)ブチル基、5-(オキサゾール-2-イル)ペンチル基、5-(オキサゾール-5-イル)ペンチル基、6-(オキサゾール-2-イル)ヘキシル基、6-(オキサゾール-4-イル)ヘキシル基、(5-フェニロキサゾール-2-イル)メチル基、(2-フェニロキサゾール-4-イル)メチル基、(2-フェニロキサゾール-5-イル)メチル基、2-(5-フェニロキサゾール-2-イル)エチル基、2-(2-フェニロキサゾール-4-イル)エチル基、2-(2-フェニロキサゾール-5-イル)エチル基、3-(5-フェニロキサゾール-2-イル)プロピル基、3-(2-フェニロキサゾール-4-イル)プロピル基、3-(2-フェニロキサゾール-5-イル)プロピル基、4-(5-フェニロキサゾール-2-イル)ブチル基、4-(2-フェニロキサゾール-4-イル)ブチル基、4-(2-フェニロキサゾール-5-イル)ブチル基、5-(5-フェニロキサゾール-2-イル)ペンチル基、5-(2-フェニロキサゾール-4-イル)ペンチル基、5-(2-フェニロキサゾール-5-イル)ペンチル基、(2-フェニル-4-メチロキサゾール-5-イル)メチル基、(2, 4-ジメチロキサゾール-5-イル)メチル基、(2, 5-ジフェニロキサゾール-4-イル)メチル基等のオキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、フェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

【0108】

テトラゾリル基[テトラゾール環上には、C1~6アルキル基又はハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい]としては、例えば、5-(1H)-テトラゾリル基、1-メチル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-エチル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-プロピル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-イソプロピル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-ブチル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(2-メチルプロピル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(4-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(4-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(4-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(3, 4-ジフルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(3, 4-ジクロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基等のテトラゾリル基(テトラゾール環上には、置換基としてC1~6アルキル基又はハロゲン原子を1~3個有することのあるフェニル基で置換していてもよい)を挙げることができる。

20

30

【0109】

C1~8アルキル基とは、炭素原子が1ないし8から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、sec-ブチル基、n-ペンチル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、3-メチルペンチル基、n-ヘプチル基、6-メチルヘプチル基、n-オクチル基、3, 5-ジメチルヘキシル基等を挙げることができる。

40

【0110】

ハロゲン置換C1~6アルキル基としては、例えば、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロプロピル基、3-ブロモプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブロモブチル基、2-クロロブチル基、5, 5, 5-トリフルオロペンチル基、5-ク

50

ロロペンチル基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基、6-クロロヘキシル基等のハロゲン原子が1~7個置換したC1~6アルキル基を挙げることができる。

【0111】

C1~6アルコキシカルボニル-C1~6アルキル基とは、既に定義されたC1~6アルコキシカルボニル基が置換した上記で定義したC1~6アルキル基であって、例えば、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、プロポキシカルボニルメチル基、イソプロポキシカルボニルメチル基、n-ブトキシカルボニルメチル基、tert-ブトキシカルボニルメチル基、ペントキシカルボニルメチル基、n-ヘキシルオキシカルボニルメチル基、2-(メトキシカルボニル)エチル基、2-(エトキシカルボニル)エチル基、2-(1-プロポキシカルボニル)エチル基、2-(イソプロポキシカルボニル)エチル基、2-(n-ブトキシカルボニル)エチル基、2-(tert-ブトキシカルボニル)エチル基、2-(2-ペントキシカルボニル)エチル基、2-(n-ヘキシルオキシカルボニル)エチル基、3-(メトキシカルボニル)プロピル基、3-(エトキシカルボニル)プロピル基、3-(1-プロポキシカルボニル)プロピル基、3-(イソプロポキシカルボニル)プロピル基、3-(n-ブトキシカルボニル)プロピル基、3-(tert-ブトキシカルボニル)プロピル基、3-(3-ペントキシカルボニル)プロピル基、3-(n-ヘキシルオキシカルボニル)プロピル基、4-(メトキシカルボニル)ブチル基、4-(エトキシカルボニル)ブチル基、4-(1-プロポキシカルボニル)ブチル基、4-(イソプロポキシカルボニル)ブチル基、4-(n-ブトキシカルボニル)ブチル基、4-(tert-ブトキシカルボニル)ブチル基、5-(メトキシカルボニル)ペンチル基、5-(エトキシカルボニル)ペンチル基、5-(プロポキシカルボニル)ペンチル基、5-(イソプロポキシカルボニル)ペンチル基、5-(n-ブトキシカルボニル)ペンチル基、5-(tert-ブトキシカルボニル)ペンチル基、6-(メトキシカルボニル)ヘキシル基、6-(エトキシカルボニル)ヘキシル基、6-(プロポキシカルボニル)ヘキシル基、6-(イソプロポキシカルボニル)ヘキシル基、6-(n-ブトキシカルボニル)ヘキシル基、6-(tert-ブトキシカルボニル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0112】

C3~8シクロアルキル基とは、構成する炭素原子数が3個ないしは8個の3員環、4員環、5員環、6員環、7員環及び8員環の環状アルキル基であって、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、3, 4-ジメチルシクロペンチル基、3, 3-ジメチルシクロヘキシル基等を挙げることができる。

【0113】

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェニルC1~6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された基が1~5個、好ましくは1~3個置換されている基であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベ

ンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0114】

フェニル基（フェニル環には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基、C1～6アルカノイル基、カルボキシル基、C1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC1～6アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、C1～6アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい）としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブromoフェニル基、3-ブromoフェニル基、4-ブromoフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、

2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3,
 4-トリクロロフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、
 2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル
 基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチ
 ルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基
 、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシ
 フェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、3, 5-
 ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ
 -4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブ
 ロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル
 基、4-メチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチ
 ルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル
 基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-
 イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル
 基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-
 ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-
 n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基
 、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ペンチルフェニル基、4-n-
 ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシ
 フェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-メトキシフェニル基、
 2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-メトキシフェニル基、2, 3,
 4-トリメトキシフェニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリ
 メトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキ
 シフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェ
 ニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニ
 ル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキ
 シフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基
 、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-
 ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポ
 キシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオ
 ロプロポキシフェニル基、4-ペントキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、
 2-ホルミルフェニル基、3-ホルミルフェニル基、4-ホルミルフェニル基、2-アセチ
 ルフェニル基、3-アセチルフェニル基、4-アセチルフェニル基、2-プロピオニルフ
 エニル基、3-プロピオニルフェニル基、4-プロピオニルフェニル基、2-ブチリルフ
 エニル基、3-ブチリルフェニル基、4-ブチリルフェニル基、2-ペンタノイルフェニ
 ル基、3-ペンタノイルフェニル基、4-ペンタノイルフェニル基、2-ヘキサノイルフ
 エニル基、3-ヘキサノイルフェニル基、4-ヘキサノイルフェニル基、2-メトキシカ
 ルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェ
 ニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-
 エトキシカルボニルフェニル基、2-プロポキシカルボニルフェニル基、3-プロポキシ
 カルボニルフェニル基、4-プロポキシカルボニルフェニル基、2-ブトキシカルボニル
 フェニル基、3-ブトキシカルボニルフェニル基、4-ブトキシカルボニルフェニル基、
 2-tert-ブトキシカルボニルフェニル基、3-tert-ブトキシカルボニルフェ
 ニル基、4-tert-ブトキシカルボニルフェニル基、2-ペントキシカルボニルフェ
 ニル基、3-ペントキシカルボニルフェニル基、4-ペントキシカルボニルフェニル基、
 2-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、3-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、
 4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、2-ベンジルオキシカルボニルフェニル基、
 3-ベンジルオキシカルボニルフェニル基、4-ベンジルオキシカルボニルフェニル基、
 2-カルボキシルフェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシルフェニル
 基、2-アミノスルホニルフェニル基、3-アミノスルホニルフェニル基、4-アミノス

10

20

30

40

50

ルホニルフェニル基、2-カルバモイルフェニル基、3-カルバモイルフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、2-メチルカルバモイルフェニル基、3-メチルカルバモイルフェニル基、4-メチルカルバモイルフェニル基、2-エチルカルバモイルフェニル基、3-エチルカルバモイルフェニル基、4-エチルカルバモイルフェニル基、2-ジメチルカルバモイルフェニル基、3-ジメチルカルバモイルフェニル基、4-ジメチルカルバモイルフェニル基、2-ジエチルカルバモイルフェニル基、3-ジエチルカルバモイルフェニル基、4-ジエチルカルバモイルフェニル基、4-モルホリノフェニル基、3-モルホリノフェニル基、4-モルホリノフェニル基等を挙げることができる。

【0115】

C1~6アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル(−CONH₂)基を構成する1個又は2個の水素が上で定義されたC1~6アルキル基で置換された基であって、例えば、N-メチルカルバモイル基、N,N-ジメチルカルバモイル基、n-エチルカルバモイル基、N-n-プロピルカルバモイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-n-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-n-ペンチルカルバモイル基、N-n-ヘキシルカルバモイル基、N-メチル-N-エチルカルバモイル基、N-メチル-N-n-プロピルカルバモイル基、N-メチル-N-イソプロピルカルバモイル基、N-メチル-N-n-ブチルカルバモイル基、N-メチル-N-tert-ブチルカルバモイル基、N-メチル-N-n-ペンチルカルバモイル基、N-メチル-N-n-ヘキシルカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルカルバモイル基、N-エチル-N-tert-ブチルカルバモイル基、N-プロピル-N-tert-ブチルカルバモイル基、N-イソプロピル-N-tert-ブチルカルバモイル基等を挙げることができる。

【0116】

フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシからなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェニル基であって、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、2,3,4-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,4,6-トリフルオロフェニル基、2,4,6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2,3,4-トリクロロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2,4,6-トリメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2,4-ジメチルフェニル基、2,3-ジメチルフェニル基、2,6-ジメチルフェニル基、3,5-ジメチルフェニル基、2,5-ジメチルフェニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2,4-ジメトキシフェニル基、2,3-ジメトキシフェニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、3,5-ジメトキシフェニル基、2,5-ジメトキシフェニル基、2,4,6-トリメトキシフェニル基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチ

ルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、3, 4-ジメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることができる。

【0117】

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい）とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されていてもよいフェニルC1~6アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-フルオロ-4-ブromoベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロピルベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメ

チルベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブトキシベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0118】

フェニルC 3~6アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい。)とは、無置換のフェニル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1乃至3個置換されたフェニル基と炭素数3から6で二重結合を1~3個有するアルケニルオキシ基とカルボニル基から構成される基であり、トランス体及びシス体の両者を包含する。このような基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニルオキシカルボニル基(慣用名:シンナミルオキシカルボニル基)、4-フェニル-2-ブテニルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-2-ペンテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-3-ペンテニルオキシカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニル-4-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルオキシカルボニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルオキシカルボニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基

、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-3-ブテニルオキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-3-ブテニルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ブテニルオキシカルボニル基、3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-[2,4,6-トリ(トリフルオロメチル)フェニル]-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,4-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

10

【0119】

フェニルC1~6アルキリデン置換アミノ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)とは、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよいフェニル基が置換したC1~6アルキリデン置換アミノ基であって、例えば、ベンジリデンアミノ基、2-フェニルエチリデンアミノ基、3-フェニルプロピリデンアミノ基、4-フェニルブチリデンアミノ基、5-フェニルペンチリデンアミノ基、6-フェニルヘキシリデンアミノ基、2-メチルベンジリデンアミノ基、2-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、3-メチルベンジリデンアミノ基、3-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、4-メチルベンジリデンアミノ基、4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、3,4-ジメチルベンジリデンアミノ基、3,4,5-トリメチルベンジリデンアミノ基、3,5-ジトリフルオロメチルベンジリデンアミノ基等を挙げることができる。

20

【0120】

フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)とは、無置換のフェノキシ基又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1ないし3個置換したフェノキシ基であって、例えば、フェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-エチルフェノキシ基、3-エチルシフェノキシ基、4-エチルフェノキシ基、4-n-プロピルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2,3-ジメチルフェノキシ基、3,4,5-トリメチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ基等を挙げることができる。

30

【0121】

フェニルアミノ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)とは、無置換のフェニルアミノ基(別名:アニリノ基)又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1ないし3個置換したフェニルアミノ基であって、例えば、フェニルアミノ基、2-メチルフェニルアミノ基、3-メチルフェニルアミノ基、4-メチルフェニルアミノ基、2-エチルフェニルアミノ基、3-エチルフェニルアミノ基、4-エチルフェニルアミノ基、4-プロピルフェニルアミノ基、4-tert-ブチルフェニルアミノ基、4-ブチルフェニルアミノ基、2-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、3-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、4-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、2,3-ジメチルフェニルアミノ基、3,4,5-トリメチルフェニルアミノ基、4-n-ペンチルフェニルアミノ基、4-n-ヘキシルフェニルアミノ基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニルアミノ基等を挙げることができる。

40

【0122】

50

インドリニル基（インドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）とは、無置換又は2, 3, 4, 5, 6又は7位にフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1～3個置換したインドリニル基であって、例えば、1-インドリニル基、2-フルオロ-1-インドリニル基、3-ブロモ-1-インドリニル基、4, 5-ジクロロ-1-インドリニル基、4-フルオロ-1-インドリニル基、4, 5, 6-トリフルオロ-1-インドリニル基、5-フルオロ-1-インドリニル基、6-フルオロ-1-インドリニル基、7-フルオロ-1-インドリニル基、4-クロロ-1-インドリニル基、5-クロロ-1-インドリニル基、6-クロロ-1-インドリニル基、7-クロロ-1-インドリニル基、4-ブロモ-1-インドリニル基、5-ブロモ-1-インドリニル基、6-ブロモ-1-インドリニル基、7-ブロモ-1-インドリニル基、4-ヨード-1-インドリニル基、5-ヨード-1-インドリニル基、6-ヨード-1-インドリニル基、7-ヨード-1-インドリニル基等を挙げることができる。

10

【0123】

イソインドリニル基（イソインドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）とは、無置換又は1, 3, 4, 5, 6又は7位にフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1～3個置換したイソインドリニル基であって、例えば、2-イソインドリニル基、1-フルオロ-2-イソインドリニル基、3-ブロモ-2-イソインドリニル基、4, 5-ジクロロ-2-イソインドリニル基、4, 5, 6-トリフルオロ-2-イソインドリニル基、4-フルオロ-2-イソインドリニル基、5-フルオロ-2-イソインドリニル基、6-フルオロ-2-イソインドリニル基、7-フルオロ-2-イソインドリニル基、4-クロロ-2-イソインドリニル基、5-クロロ-2-イソインドリニル基、6-クロロ-2-イソインドリニル基、7-クロロ-2-イソインドリニル基、4-ブロモ-2-イソインドリニル基、5-ブロモ-2-イソインドリニル基、6-ブロモ-2-イソインドリニル基、7-ブロモ-2-イソインドリニル基、4-ヨード-2-イソインドリニル基、5-ヨード-2-イソインドリニル基、6-ヨード-2-イソインドリニル基、7-ヨード-2-イソインドリニル基等を挙げることができる。

20

【0124】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）とは、無置換又は2, 3, 4, 5, 6, 7又は8位にフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1～3個置換した1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基であって、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、5-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、3-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、3, 4-ジクロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4, 5, 6-トリクロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、6-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、7-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、8-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、5-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、6-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、7-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、8-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、5-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、6-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、7-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、8-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、5-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、6-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、7-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、8-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基等を挙げることができる。

30

40

【0125】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソ

50

キノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)を示す。)とは、無置換又は1, 3, 4, 5, 6, 7又は8位にフッ素原子、原子、臭素原子又はヨウ素原子が1~3個置換した1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基であって、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、1-ブromo-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、3-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、4-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、3, 4-ジクロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、4, 5, 6-トリクロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、5-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、8-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、5-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、8-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、5-ブromo-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-ブromo-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-ブromo-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、8-ブromo-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、5-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、8-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル等を挙げることができる。

【0126】

C1~6アルキレン基としては、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等を挙げることができる。

【0127】

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ基[フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。また、C1~6アルキル部分には、C1~6アルコキシイミノ基が置換していてもよい。)とは、無置換のフェニル基又はハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ基[フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換したフェニル基と炭素数1乃至6個のアルキル基で構成される基であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブromoベンジル基、3-ブromoベンジル基、4-ブromoベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブromoベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3,

4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-
 ペンタリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピル
 ベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基
 、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、
 2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジ
 ル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、4-
 イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、
 2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2
 , 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベン
 ジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5
 -ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4
 -メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル
 -4-フルオロベンジル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリ
 フルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチ
 ルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジ
 ル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3
 -トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタ
 フルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフル
 オロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3
 -トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エ
 チル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロ
 メトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2
 -(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキ
 シフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(
 2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)
 プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフル
 オロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロ
 ピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフル
 オロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロ
 ピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオ
 ロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、
 4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチル
 フェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4
 -トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)
 プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリ
 フルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチ
 ル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロ
 メチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6
 -(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、3-フェノキシベンジル基、4-
 フェノキシベンジル基、2-(4-フェノキシフェニル)エチル基、3-(4-フェノキシ
 フェニル)プロピル基、2-(4-フェノキシフェニル)プロピル基、4-(4-フェ
 ノキシフェニル)ブチル基、5-(4-フェノキシフェニル)ペンチル基、4-(4-フェ
 ノキシフェニル)ペンチル基、6-(4-フェノキシフェニル)ヘキシル基、2-フェ
 ノキシベンジル基、2-(3-フェノキシフェニル)エチル基、3-(2-フェノキシフ
 ェニル)プロピル基、2-(2-フェノキシフェニル)プロピル基、4-(3-フェノキシ
 フェニル)ブチル基、5-(2-フェノキシフェニル)ペンチル基、4-(3-フェノ
 シフェニル)ペンチル基、6-(3-フェノキシフェニル)ヘキシル基、4-(2-クロ
 ロフェノキシ)ベンジル基、4-(3-クロロフェノキシ)ベンジル基、4-(4-クロ
 ロフェノキシ)ベンジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、
 4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(4-トリフルオロメチル

10

20

30

40

50

フェノキシ) ベンジル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、2-[4-(4-クロロフェノキシ) フェニル] エチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] エチル基、3-[4-(4-クロロフェノキシ) フェニル] プロピル基、3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] プロピル基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル] プロピル基、2-[4-(4-クロロフェノキシ) フェニル] プロピル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ) フェニル] ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル] ブチル基、5-[4-(4-クロロフェノキシ) フェニル] ペンチル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ) フェニル] ペンチル基、6-[4-(4-クロロフェノキシ) フェニル] ヘキシル基、6-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] ヘキシル基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル] ヘキシル基、(2-フルオロ-4-ブromoフェノキシ) ベンジル基、(4-クロロ-3-フルオロフェノキシ) ベンジル基、(2, 3, 4-トリクロロフェノキシ) ベンジル基、(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ) ベンジル基、(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ) ベンジル基、(4-イソプロピルフェノキシ) ベンジル基、(4-n-ブチルフェノキシ) ベンジル基、(4-メチルフェノキシ) ベンジル基、(2-メチルフェノキシ) ベンジル基、(3-メチルフェノキシ) ベンジル基、(2, 4-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、(2, 3-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、(2, 6-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、(3, 5-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、(2, 5-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ) ベンジル基、(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基、(4-イソプロポキシフェノキシ) ベンジル基、(4-n-ブトキシフェノキシ) ベンジル基、(4-メトキシフェノキシ) ベンジル基、(2-メトキシフェノキシ) ベンジル基、(3-メトキシフェノキシ) ベンジル基、(2, 4-ジメトキシフェノキシ) ベンジル基、(2, 3-ジメトキシフェノキシ) ベンジル基、(2, 6-ジメトキシフェノキシ) ベンジル基、(3, 5-ジメトキシフェノキシ) ベンジル基、(2, 5-ジメトキシフェノキシ) ベンジル基、(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) ベンジル基、(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、(2-イソプロポキシフェノキシ) ベンジル基、(3-クロロ-4-メトキシフェノキシ) ベンジル基、(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、(3-メチル-4-フルオロフェノキシ) ベンジル基、(4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基等を挙げることができる。

【0128】

ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾイル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-フルオロベンゾイル基、2, 3-ジフルオロベンゾイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンゾイル基、3, 4-ジフルオロベンゾイル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイル基、2, 3-ジクロロベンゾイル基、3, 4-ジクロロベンゾイル基、2-ブromoベンゾイル基、3-ブromoベンゾイル基、4-ブromoベンゾイル基、2, 3-ジブromoベンゾイル基、3, 4-ジブromoベンゾイル基、2-フルオロ-4-ブromoベンゾイル基、4-クロロ-3-フルオロベンゾイル基、2, 3, 4-トリフルオロベンゾイル基、2, 4, 6-トリクロロベンゾイル基、4-イソプロピルベンゾイル基、4-n-ブチルベンゾイル基、2, 4-ジメチルベンゾイル基、2, 3-ジメチルベンゾイル基、2, 6-ジメチルベンゾイル基、3, 5-ジメチルベンゾイル基、2, 5-ジメチルベンゾイル基、2, 4, 6-トリメチルベンゾイル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、4-n-ブトキシベンゾイル基、2, 4-ジメトキシベンゾイル基、2, 3-ジメトキシベンゾイル基、2, 6-ジメトキシベンゾイル基、3, 5-ジメトキシベンゾイ

ル基、2, 5-ジメトキシベンゾイル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンゾイル基、3-クロロ-4-メトキシベンゾイル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-メチル-4-フルオロベンゾイル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、3, 4-ジメチルベンゾイル基、2-ヨードベンゾイル基、3-ヨードベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル基、2, 3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3, 4-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、2-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイル基、4-トリフルオロメトキシベンゾイル基等のベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換してもよい）を挙げることができる。

【0129】

ピリジル基（ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）としては、例えば、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-クロロピリジン-3-イル基、2-クロロピリジン-4-イル基、2-クロロピリジン-5-イル基、5-クロロピリジン-2-イル基、4-クロロピリジン-2-イル基、3-クロロピリジン-2-イル基、2-フルオロピリジン-3-イル基、2-フルオロピリジン-4-イル基、2-フルオロピリジン-5-イル基、5-フルオロピリジン-2-イル基、4-フルオロピリジン-2-イル基、3-フルオロピリジン-2-イル基、2-ブロモピリジン-3-イル基、2-ブロモピリジン-4-イル基、2-ブロモピリジン-5-イル基、5-ブロモピリジン-2-イル基、4-ブロモピリジン-2-イル基、3-ブロモピリジン-2-イル基、2-ブロモ-4-クロロピリジン-4-イル基、2, 6-ジクロロピリジン-4-イル基、2, 4, 6-トリクロロピリジン-3-イル等のピリジル基（ピリジン環上には、1～3個のハロゲン原子が置換していてもよい）を挙げることができる。

【0130】

フェノキシC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換のフェノキシ基又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びハロゲンからなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換したフェノキシ基とC 1～6アルキル基で構成される基であって、例えば、フェノキシメチル基、2-フェノキシエチル基、3-フェノキシプロピル基、4-フェノキシブチル基、5-フェノキシペンチル基、6-フェノキシヘキシル基、4-フルオロフェノキシメチル基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシメチル基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシメチル基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシメチル基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシメチル基、4-イソプロピルフェノキシメチル基、4-n-ブチルフェノキシメチル基、4-メチルフェノキシメチル基、2-メチルフェノキシメチル基、3-メチルフェノキシメチル基、2, 4-ジメチルフェノキシメチル基、2, 3-ジメチルフェノキシメチル基、2, 6-ジメチルフェノキシメチル基、3, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシメチル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシメチル基、4-イソプロポキシフェノキシメチル基、4-n-ブトキシフェノキシメチル基、4-メトキシフェノキシメチル基、2-メトキシフェノキシメチル基、3-メトキシフェノキシメチル基、2, 4-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 3-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 6-ジメトキシフェノキシメチル基、3, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメトキシ

10

20

30

40

50

フェノキシメチル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシメチル基、2-イソプロポキシフェノキシメチル基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシメチル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル基、3-メチル-4-フルオロフェノキシメチル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-(4-フルオロフェノキシ)エチル基、3-(4-フルオロフェノキシ)プロピル基、4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル基、5-(4-フルオロフェノキシ)ペンチル基、6-(4-フルオロフェノキシ)ヘキシル基、4-クロロフェノキシメチル基、2-(4-クロロフェノキシ)エチル基、3-(4-クロロフェノキシ)プロピル基、4-(4-クロロフェノキシ)ブチル基、5-(4-クロロフェノキシ)ペンチル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキシル基、4-メチルフェノキシメチル基、2-(4-メチルフェノキシ)エチル基、3-(4-メチルフェノキシ)プロピル基、4-(4-メチルフェノキシ)ブチル基、5-(4-メチルフェノキシ)ペンチル基、6-(4-メチルフェノキシ)ヘキシル基、4-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ヘキシル基、4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ブチル基、5-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ヘキシル基、2-(4-メトキシフェノキシ)エチル基、3-(4-メトキシフェノキシ)プロピル基、4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル基、5-(4-メトキシフェノキシ)ペンチル基、6-(4-メトキシフェノキシ)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0131】

ベンゾイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾイルメチル基、2-ベンゾイルエチル基、1-ベンゾイルエチル基、3-ベンゾイルプロピル基、4-ベンゾイルブチル基、5-ベンゾイルペンチル基、6-ベンゾイルヘキシル基、2-メチル-3-ベンゾイルプロピル基、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル基、2-フルオロベンゾイルメチル基、3-フルオロベンゾイルメチル基、4-フルオロベンゾイルメチル基、2-クロロベンゾイルメチル基、3-クロロベンゾイルメチル基、4-クロロベンゾイルメチル基、2-ブromoベンゾイルメチル基、3-ブromoベンゾイルメチル基、4-ブromoベンゾイルメチル基、2-フルオロ-4-ブromoベンゾイルメチル基、4-クロロ-3-フルオロベンゾイルメチル基、2, 3, 4-トリクロロベンゾイルメチル基、2, 4, 6-トリクロロベンゾイルメチル基、4-イソプロピルベンゾイルメチル基、4-n-ブチルベンゾイルメチル基、2, 4-ジメチルベンゾイルメチル基、2, 3-ジメチルベンゾイルメチル基、2, 6-ジメチルベンゾイルメチル基、3, 5-ジメチルベンゾイルメチル基、2, 5-ジメチルベンゾイルメチル基、2, 4, 6-トリメチルベンゾイルメチル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンゾイルメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンゾイルメチル基、4-n-ブトキシベンゾイルメチル基、2, 4-ジメトキシベンゾイルメチル基、2, 3-ジメトキシベンゾイルメチル基、2, 6-ジメトキシベンゾイルメチル基、3, 5-ジメトキシベンゾイルメチル基、2, 5-ジメトキシベンゾイルメチル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、3-クロロ-4-メトキシベンゾイルメチル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、3-メチル-4-フルオロベンゾイルメチル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンゾイルメチル基、2-トリフルオロメチルベンゾイルメチル基、3-トリフルオロメチルベンゾイルメチル基、4-トリフルオロメチルベンゾイルメチル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、4-トリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、2-(2-フル

10

20

30

40

50

オロベンゾイル) エチル基、2-(3-フルオロベンゾイル) エチル基、2-(4-フル
 オロベンゾイル) エチル基、2-(2-クロロベンゾイル) エチル基、2-(3-クロロ
 ベンゾイル) エチル基、2-(4-クロロベンゾイル) エチル基、2-(2-ブロモベン
 ズイル) エチル基、2-(3-ブロモベンゾイル) エチル基、2-(4-ブロモベンゾイ
 ル) エチル基、2-(2-トリフルオロメチルベンゾイル) エチル基、2-(3-トリフ
 ルオロメチルベンゾイル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルベンゾイル) エチル
 基、2-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル) エチル基、2-(3-トリフルオロメ
 トキシベンゾイル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) エチル基、
 3-(2-クロロベンゾイル) プロピル基、3-(3-クロロベンゾイル) プロピル基、
 3-(4-クロロベンゾイル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルベンゾイル) 10
 プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルベンゾイル) プロピル基、3-(4-トリフ
 ルオロメチルベンゾイル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル) プ
 ロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル) プロピル基、3-(4-トリフ
 ルオロメトキシベンゾイル) プロピル基、4-(2-クロロベンゾイル) ブチル基、4-
 (3-クロロベンゾイル) ブチル基、4-(4-クロロベンゾイル) ブチル基、4-(2-
 ートリフルオロメチルベンゾイル) ブチル基、4-(3-トリフルオロメチルベンゾイ
 ル) ブチル基、4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル) ブチル基、4-(2-トリフル
 オロメトキシベンゾイル) ブチル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル) ブチ
 ル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ブチル基、5-(2-クロロベンゾ
 イル) ペンチル基、5-(3-クロロベンゾイル) ペンチル基、5-(4-クロロベンゾ
 イル) ペンチル基、5-(2-トリフルオロメチルベンゾイル) ペンチル基、5-(3-
 ートリフルオロメチルベンゾイル) ペンチル基、5-(4-トリフルオロメチルベンゾイ
 ル) ペンチル基、5-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル) ペンチル基、5-(3-
 ートリフルオロメトキシベンゾイル) ペンチル基、5-(4-トリフルオロメトキシベンゾイ
 ル) ペンチル基、6-(2-クロロベンゾイル) ヘキシル基、6-(3-クロロベンゾイ
 ル) ヘキシル基、6-(4-クロロベンゾイル) ヘキシル基、6-(2-トリフルオロメ
 チルベンゾイル) ヘキシル基、6-(3-トリフルオロメチルベンゾイル) ヘキシル基、
 6-(4-トリフルオロメチルベンゾイル) ヘキシル基、6-(2-トリフルオロメトキシ
 ベンゾイル) ヘキシル基、6-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル) ヘキシル基、
 6-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ヘキシル基等のベンゾイルC 1~6アルキ
 ル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキ
 ル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が
 1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0132】

フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1
 ~6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基；C 1~4アルキ
 レンジオキシ基；C 1~6アルコキシカルボニル基；シアノ基；C 2~6アルケニル基；
 ニトロ基；フェニル基；置換基としてフェニル基、C 1~6アルキル基、カルバモイル基
 及びC 1~6アルカノイル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基；C
 1~6アルカノイル置換C 1~6アルキル基；水酸基；C 1~6アルコキシカルボニル置
 換C 1~6アルキル基；フェニルC 1~6アルキル基；C 1~6アルカノイル基；C 1~
 6アルキルチオ基；1, 2, 4-トリアゾリル基；イソオキサゾリル基；イミダゾリル基
 ；ベンゾチアゾリル基；2H-ベンゾトリアゾリル基；ピロリル基；ベンゾオキサゾリル
 基；ピペラジニル基[ピペラジン環上には、置換基としてC 1~6アルコキシカルボニル
 基及びフェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又
 は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基から
 なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた
 基の少なくとも1種が置換していてもよい]；ピペリジル基[ピペリジン環上には、少な
 くとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には置換基としてC 1~6アル
 キル基及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の

10

20

30

40

50

C 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。] 及びカルバモイル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2-ヨードフェノキシ基、3-ヨードフェノキシ基、4-ヨードフェノキシ基、2, 3-ジフルオロフェノキシ基、3, 4-ジフルオロフェノキシ基、3, 5-ジフルオロフェノキシ基、2, 4-ジフルオロフェノキシ基、2, 6-ジフルオロフェノキシ基、2, 3-ジクロロフェノキシ基、3, 4-ジクロロフェノキシ基、3, 5-ジクロロフェノキシ基、2, 4-ジクロロフェノキシ基、2, 6-ジクロロフェノキシ基、2, 3, 4-トリフルオロフェノキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシ基、2-フルオロ-4-クロロフェノキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ基、3-フルオロ-4-クロロフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2, 6-ジメチルフェノキシ基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシ基、2-メチル-3-クロロフェノキシ基、3-メチル-4-クロロフェノキシ基、2-クロロ-4-メチルフェノキシ基、2-メチル-3-フルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、3, 5-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、3, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、4-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2-イソプロピルフェノキシ基、3-イソプロピルフェノキシ基、4-イソプロピルフェノキシ基、2-tert-ブチルフェノキシ基、3-tert-ブチルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、2-sec-ブチルフェノキシ基、3-sec-ブチルフェノキシ基、4-sec-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-ペンチルフェノキシ基、4-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、2-メトキシ-3-クロロフェノキシ基、2-フルオロ-3-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ基、2, 4-ジメチルフェノキシ基、2, 3-ジメチルフェノキシ基、3, 5-ジメチルフェノキシ基、2, 5-ジメチルフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、3, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-メチル-4-フルオロフェノキシ基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、3, 5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオ

10

20

30

40

50

ロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、2, 3-メチレンジオキシフェノキシ基、3, 4-メチレンジオキシフェノキシ基、2, 3-エチレンジオキシフェノキシ基、3, 4-エチレンジオキシフェノキシ基、2-メトキシカルボニルフェノキシ基、3-メトキシカルボニルフェノキシ基、4-メトキシカルボニルフェノキシ基、2-エトキシカルボニルフェノキシ基、3-エトキシカルボニルフェノキシ基、4-エトキシカルボニルフェノキシ基、4-プロポキシカルボニルフェノキシ基、4-ブトキシカルボニルフェノキシ基、4-ペントキシカルボニルフェノキシ基、4-ヘキシルオキシカルボニルフェノキシ基、2-シアノフェノキシ基、3-シアノフェノキシ基、4-シアノフェノキシ基、2, 3-ジシアノフェノキシ基、2, 4, 6-トリシアノフェノキシ基、2-ビニルフェノキシ基、3-ビニルフェノキシ基、4-ビニルフェノキシ基、2-アリルフェノキシ基、3-アリルフェノキシ基、4-アリルフェノキシ基、2-(3-ブテニル)フェノキシ基、3-(3-ブテニル)フェノキシ基、4-(3-ブテニル)フェノキシ基、2-(4-ペンテニル)フェノキシ基、3-(4-ペンテニル)フェノキシ基、4-(4-ペンテニル)フェノキシ基、2-(5-ヘキセニル)フェノキシ基、3-(5-ヘキセニル)フェノキシ基、4-(5-ヘキセニル)フェノキシ基、2-ニトロフェノキシ基、3-ニトロフェノキシ基、4-ニトロフェノキシ基、2, 3-ジニトロフェノキシ基、2, 4-ジニトロフェノキシ基、2, 4, 6-トリニトロフェノキシ基、2-ビフェニルオキシ基、3-ビフェニルオキシ基、4-ビフェニルオキシ基、2-ジメチルアミノフェノキシ基、3-ジメチルアミノフェノキシ基、4-ジメチルアミノフェノキシ基、2-ジエチルアミノフェノキシ基、3-ジエチルアミノフェノキシ基、4-ジエチルアミノフェノキシ基、2-ジ-(N-プロピル)アミノフェノキシ基、3-ジ-(N-プロピル)アミノフェノキシ基、4-ジ-(N-プロピル)アミノフェノキシ基、2-ジフェニルアミノフェノキシ基、3-ジフェニルアミノフェノキシ基、4-ジフェニルアミノフェノキシ基、2-アセチルアミノフェノキシ基、3-アセチルアミノフェノキシ基、4-アセチルアミノフェノキシ基、2-プロピオニルアミノフェノキシ基、3-プロピオニルアミノフェノキシ基、4-プロピオニルアミノフェノキシ基、2-ブチリルアミノフェノキシ基、3-ブチリルアミノフェノキシ基、4-ブチリルアミノフェノキシ基、4-ペンタノイルアミノフェノキシ基、4-ヘキサノイルアミノフェノキシ基、3-(N-メチル-N-フェニルアミノ)フェノキシ基、2-(N-アセチル-N-メチルアミノ)フェノキシ基、2-カルバモイルアミノフェノキシ基、3-カルバモイルアミノフェノキシ基、4-カルバモイルアミノフェノキシ基、4-(N-アセチル-N-フェニルアミノ)フェノキシ基、4-アセチルメチルフェノキシ基、4-プロピオニルメチルフェノキシ基、4-n-ブチリルメチルフェノキシ基、4-(2-アセチルエチル)フェノキシ基、4-(3-アセチルプロピル)フェノキシ基、4-(4-アセチルブチル)フェノキシ基、4-(5-アセチルペンチル)フェノキシ基、4-(6-アセチルヘキシル)フェノキシ基、2-ヒドロキシフェノキシ基、3-ヒドロキシフェノキシ基、4-ヒドロキシフェノキシ基、2, 4-ジヒドロキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリヒドロキシフェノキシ基、2-ヒドロキシ-3-クロロフェノキシ基、2-フルオロ-3-ヒドロキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-ヒドロキシフェノキシ基、4-メトキシカルボニルメチルフェノキシ基、4-エトキシカルボニルメチルフェノキシ基、4-n-プロポキシカルボニルメチルフェノキシ基、4-(2-エトキシカルボニルエチル)フェノキシ基、4-(3-エトキシカルボニルプロピル)フェノキシ基、4-(4-エトキシカルボニルブチル)フェノキシ基、4-(5-エトキシカルボニルペンチル)フェノキシ基、4-(6-エトキシカルボニルヘキシル)フェノキシ基、2-ベンジルフェノキシ基、3-ベンジルフェノキシ基、4-ベンジルフェノキシ基、2-(2-フェニルエチル)フェノキシ基、3-(2-フェニルエチル)フェノキシ基、4-(2-フェニルエチル)フェノキシ基、2-(3-フェニルプロピル)フェノキシ基、3-(3-フェニルプロピル)フェノキシ基、4-(3-フェニルプロピル)フェノキシ基、2-(4-フェニルブチル)フェノキシ基、3-(4-フェニルブチル)フェノキシ基、4-(4-フェニルブチル)フェノキシ基、2-(5-フェニルペンチル)

10

20

30

40

50

) フェノキシ基、3-(5-フェニルペンチル) フェノキシ基、4-(5-フェニルペンチル) フェノキシ基、2-(6-フェニルヘキシル) フェノキシ基、3-(6-フェニルヘキシル) フェノキシ基、4-(6-フェニルヘキシル) フェノキシ基、2-アセチルフェノキシ基、3-アセチルフェノキシ基、4-アセチルフェノキシ基、4-n-プロピオニルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、4-n-ペンタノイルフェノキシ基、4-n-ヘキサノイルフェノキシ基、2-メチルチオフェノキシ基、3-メチルチオフェノキシ基、4-メチルチオフェノキシ基、4-エチルチオフェノキシ基、4-n-プロピルチオフェノキシ基、4-イソプロピルチオフェノキシ基、4-n-ブチルチオフェノキシ基、4-tert-ブチルチオフェノキシ基、4-n-ペンチルチオフェノキシ基、4-n-ヘキシルチオフェノキシ基、2, 4-ジメチルチオフェノキシ基、3, 4, 5-ジメチルチオフェノキシ基、2-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェノキシ基、3-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェノキシ基、4-(1, 2, 4-トリ

10

アゾール-1-イル) フェノキシ基、2-(3-イソオキサゾリル) フェノキシ基、3-(4-イソオキサゾリル) フェノキシ基、4-(5-イソオキサゾリル) フェノキシ基、2-(1-イミダゾリル) フェノキシ基、3-(1-イミダゾリル) フェノキシ基、4-(1-イミダゾリル) フェノキシ基、2-(2-ベンゾチアゾリル) フェノキシ基、3-(2-ベンゾチアゾリル) フェノキシ基、4-(2-ベンゾチアゾリル) フェノキシ基、2-(2H-ベンゾトリアゾール-2-イル) フェノキシ基、3-(2H-ベンゾトリアゾール-2-イル) フェノキシ基、4-(2H-ベンゾトリアゾール-2-イル) フェノキシ基、2-(1-ピロリル) フェノキシ基、3-(1-ピロリル) フェノキシ基、4-(1-ピロリル) フェノキシ基、2-(2-ベンゾオキサゾリル) フェノキシ基、3-(2-ベンゾオキサゾリル) フェノキシ基、4-(2-ベンゾオキサゾリル) フェノキシ基、2-(1-ピペラジニル) フェノキシ基、3-(1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-プロポキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-ペンチルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-ヘキシルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-ベンジル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-(2-フェネチル)-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-[4-(2-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2-クロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3-クロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-クロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2, 3-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3, 5-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3, 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2-ペンタフルオロエチルベン

20

30

40

50

ジル) - 1 - ピペラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (3 - ペンタフルオロエチルベン
 ジル) - 1 - ピペラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (4 - ペンタフルオロエチルベン
 ジル) - 1 - ピペラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (2 - トリフルオロメトキシベン
 ジル) - 1 - ピペラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (3 - トリフルオロメトキシベン
 ジル) - 1 - ピペラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシベン
 ジル) - 1 - ピペラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (4 - メトキシベンジル) - 1 -
 ピペラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (3, 4 - ジメトキシベンジル) - 1 - ピペラ
 ジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (2, 4, 6 - トリメトキシベンジル) - 1 - ピペラ
 ジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (2 - ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1 - ピペ
 ラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (3 - ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1 - ピ
 ペラジニル] フェノキシ基、4 - [4 - (4 - ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1 -
 ピペラジニル] フェノキシ基、4 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル)
 エチル] - 1 - ピペラジニル} フェノキシ基、4 - {4 - [3 - (4 - トリフルオロメト
 キシフェニル) プロピル] - 1 - ピペラジニル} フェノキシ基、4 - {4 - [4 - (4 -
 トリフルオロメトキシフェニル) ブチル] - 1 - ピペラジニル} フェノキシ基、4 - {4
 - [5 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル] - 1 - ピペラジニル} フェ
 ノキシ基、4 - {4 - [6 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル] - 1 - ピペ
 ラジニル} フェノキシ基、4 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エチル
] - 1 - ピペラジニル} フェノキシ基、4 - {4 - [3 - (4 - トリフルオロメチルフェ
 ニル) プロピル] - 1 - ピペラジニル} フェノキシ基、4 - {4 - [4 - (4 - トリフル
 オロメチルフェニル) ブチル] - 1 - ピペラジニル} フェノキシ基、4 - {4 - [5 - (4
 - トリフルオロメチルフェニル) ペンチル] - 1 - ピペラジニル} フェノキシ基、4 -
 {4 - [6 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル] - 1 - ピペラジニル} フェ
 ノキシ基、2 - ピペリジノフェノキシ基、3 - ピペリジノフェノキシ基、4 - ピペリジノ
 フェノキシ基、2 - (4 - アミノ - 1 - ピペリジル) フェノキシ基、3 - (4 - アミノ -
 1 - ピペリジル) フェノキシ基、4 - (4 - アミノ - 1 - ピペリジル) フェノキシ基、4
 - (4 - メチルアミノ - 1 - ピペリジル) フェノキシ基、4 - (4 - エチルアミノ - 1 -
 ピペリジル) フェノキシ基、4 - (4 - n - プロピルアミノ - 1 - ピペリジル) フェノキ
 シ基、4 - (4 - ジメチルアミノ - 1 - ピペリジル) フェノキシ基、4 - (4 - ジエチル
 アミノ - 1 - ピペリジル) フェノキシ基、4 - (4 - ジ - n - プロピルアミノ - 1 - ピペ
 リジル) フェノキシ基、4 - (4 - フェニルアミノ - 1 - ピペリジル) フェノキシ基、4
 - [4 - (N - フェニル - N - メチルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 - [4
 - (2 - フルオロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 - [4 - (3
 - フルオロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 - [4 - (4 - フルオ
 ロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 - [4 - (2 - クロロフェニル
 アミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 - [4 - (3 - クロロフェニルアミノ) -
 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 - [4 - (4 - クロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリ
 ジル] フェノキシ基、4 - [4 - (2, 3 - ジクロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル]
] フェノキシ基、4 - [4 - (2, 4 - ジクロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェ
 ノキシ基、4 - [4 - (3, 4 - ジクロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノ
 キシ基、4 - [4 - (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ
 基、4 - [4 - (2 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキ
 シ基、4 - [4 - (2 - メチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 -
 [4 - (2, 3 - ジメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 - [4
 - (2 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 - [4
 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4 -
 [4 - (4 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基、4
 - [4 - (2 - ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキシ基
 、4 - [4 - (3 - ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェノキ
 シ基、4 - [4 - (4 - ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル] フェ

10

20

30

40

50

ノキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(2-メトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(2,3-ジメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(2,4,6-トリメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-{4-[N-メチル-N-(2,4,6-トリメトキシフェニルアミノ)]-1-ピペリジル}フェノキシ基、4-{4-[N-メチル-N-(3,4-ジメチルフェニルアミノ)]-1-ピペリジル}フェノキシ基、4-[4-(3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、4-[4-(4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]フェノキシ基、2-カルバモイルフェノキシ基、3-カルバモイルフェノキシ基、4-カルバモイルフェノキシ基等のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基；C1~4アルキレンジオキシ基；C1~6アルコキシカルボニル基；シアノ基；C2~6アルケニル基；ニトロ基；フェニル基；置換基としてフェニル基、C1~6アルキル基、カルバモイル基及びC1~6アルカノイル基からなる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ基；C1~6アルカノイル置換C1~6アルキル基；水酸基；C1~6アルコキシカルボニル置換C1~6アルキル基；フェニルC1~6アルキル基；C1~6アルカノイル基；C1~6アルキルチオ基；1,2,4-トリアゾリル基；イソオキサゾリル基；イミダゾリル基；ベンゾチアゾリル基；2H-ベンゾトリアゾリル基；ピロリル基；ベンゾオキサゾリル基；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。）からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい〕；ピペリジル基〔ピペリジン環上には、置換基としてアミノ基（該アミノ基上には置換基としてC1~6アルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。）からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい〕及びカルバモイル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

【0133】

フェニル基（フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、2,3,4-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,4,6-トリフルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2,4,6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-フルオ

ロー4-ブロモフェニル基、3-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(2-メチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(2, 4-ジメチルフェノキシ)フェニル基、2-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3, 4-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフ

10

20

30

40

50

ルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基[フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基種が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

【0134】

C3~8シクロアルキル-C1~6アルコキシ基とは、炭素数3乃至8個の環状アルキル基と炭素数1乃至6個のアルコキシ基で構成される基であって、例えば、シクロプロピルメトキシ基、2-シクロプロピルエトキシ基、3-シクロプロピルプロポキシ基、4-シクロプロピルブトキシ基、5-シクロプロピルペンチルオキシ基、6-シクロプロピルヘキシルオキシ基、シクロブチルメトキシ基、2-シクロブチルエトキシ基、3-シクロブチルプロポキシ基、4-シクロブチルブトキシ基、5-シクロブチルペンチルオキシ基、6-シクロブチルヘキシルオキシ基、シクロペンチルメトキシ基、2-シクロペンチルエトキシ基、3-シクロペンチルプロポキシ基、4-シクロペンチルブトキシ基、5-シクロペンチルペンチルオキシ基、6-シクロペンチルヘキシルオキシ基、シクロヘキシルメトキシ基、2-シクロヘキシルエトキシ基、3-シクロヘキシルプロポキシ基、4-シクロヘキシルブトキシ基、5-シクロヘキシルペンチルオキシ基、6-シクロヘキシルヘキシルオキシ基、シクロヘプチルメトキシ基、2-シクロヘプチルエトキシ基、3-シクロヘプチルプロポキシ基、4-シクロヘプチルブトキシ基、5-シクロヘプチルペンチルオキシ基、6-シクロヘプチルヘキシルオキシ基、シクロオクチルメトキシ基、2-シクロオクチルエトキシ基、3-シクロオクチルプロポキシ基、4-シクロオクチルブトキシ基、5-シクロオクチルペンチルオキシ基、6-シクロオクチルヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

20

【0135】

フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されていてもよいアニリン、N-C1~6アルキルアニリン又はN-フェニルC1~6アルキルアニリンとカルボニル基から構成される基であって、例えば、フェニルカルバモイル基、2-フルオロフェニルカルバモイル基、3-フルオロフェニルカルバモイル基、4-フルオロフェニルカルバモイル基、2-クロロフェニルカルバモイル基、3-クロロフェニルカルバモイル基、4-クロロフェニルカルバモイル基、2-ブロモフェニルカルバモイル基、3-ブロモフェニルカルバモイル基、4-ブロモフェニルカルバモイル基、2-ヨードフェニルカルバモイル基、3-ヨードフェニルカルバモイル基、4-ヨードフェニルカルバモイル基、2,3-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3,4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3,5-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2,4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2,6-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2,3-ジクロロフェニルカルバモイル基、3,4-ジクロロフェニルカルバモイル基、3,5-ジクロロフェニルカルバモイル基、2,4-ジクロロフェニルカルバモイル基、2,6-ジクロロフェニルカルバモイル基、3,4,5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルカルバモイル基、3,4,5-トリクロロフェニルカルバモイル基、2,4,6-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2,4,6-トリクロロフェニルカルバモイル基、2-メチルフェニルカルバモイル基、3-メチル

30

40

50

フェニルカルバモイル基、4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-クロロ
 フェニルカルバモイル基、3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイル基、2-クロロ
 -4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイル
 基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルフェニル
 カルバモイル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイル基、N-(2-フルオロフェニ
 ル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモ
 イル基、N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-クロロ
 フェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-クロロフェニル)-N-メチルカル
 バモイル基、N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-プロ
 モフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-ヨードフェニル)-N-メチルカル
 バモイル基、N-(3-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-ヨ
 ードフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,3-ジフルオロフェニル)-N
 -メチルカルバモイル基、N-(3,4-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモ
 イル基、N-(3,5-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,4
 -ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,6-ジフルオロフェニ
 ル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,3-ジクロロフェニル)-N-メチルカル
 バモイル基、N-(3,4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、n-(3
 ,5-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,4-ジクロロフェニ
 ル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,6-ジクロロフェニル)-N-メチルカル
 バモイル基、N-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、
 N-(3,4,5-トリクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,4,
 6-トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2,4,6-トリクロ
 ロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカル
 バモイル基、N-(3-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-メ
 チルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチル-3-クロロフェニル)
 -N-メチルカルバモイル基、N-(3-メチル-4-クロロフェニル)-N-メチルカル
 バモイル基、N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、
 N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-トリ
 フルオロメチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-トリフルオロメチ
 ルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-ベンジル-N-フェニルカルバモイル基
 、N-ベンジル-N-(2-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3
 -フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フルオロフェニル)
 カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベン
 ジル-N-(3-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-クロロフ
 ェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-プロモフェニル)カルバモイル基、
 N-ベンジル-N-(3-プロモフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-
 プロモフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ヨードフェニル)カルバモ
 イル基、N-ベンジル-N-(3-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N
 -(4-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,3-ジフルオロフ
 ェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4-ジフルオロフェニル)カルバモ
 イル基、N-ベンジル-N-(3,5-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベン
 ジル-N-(2,4-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,
 6-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、n-ベンジル-N-(2,3-ジクロロフェ
 ニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4-ジクロロフェニル)カルバモイル
 基、N-ベンジル-N-(3,5-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N
 -(2,4-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,6-ジクロ
 ロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4,5-トリフルオロフェニ
 ル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4,5-トリクロロフェニル)カルバモ
 イル基、N-ベンジル-N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)カルバモイル基、N
 -ベンジル-N-(2,4,6-トリクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-

10

20

30

40

50

N-(2-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチル-4-クロロフェニル)カルバモイル基、n-ベンジル-N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイル基、3-イソプロピルフェニルカルバモイル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイル基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-ペンチルフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルフェニルカルバモイル基、2,4-ジメチルフェニルカルバモイル基、2,4,6-トリメチルフェニルカルバモイル基、3,4-ジメトキシフェニルカルバモイル基、3,4,5-トリメトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシフェニルカルバモイル基、3-メトキシフェニルカルバモイル基、4-メトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイル基、2,6-ジメトキシフェニルカルバモイル基、2,3,4-トリフルオロフェニルカルバモイル基、3,4,5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ペンチルオキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルカルバモイル基等を挙げることができる。

【0136】

ナフチルオキシ基（ナフトレン環上には、少なくとも1個のC1～6アルキル基が置換していてもよい。）としては、例えば、1-ナフチルオキシ基、2-ナフチルオキシ基、2-メチル-1-ナフチルオキシ基、3-メチル-1-ナフチルオキシ基、4-メチル-1-ナフチルオキシ基、5-メチル-1-ナフチルオキシ基、6-メチル-1-ナフチルオキシ基、7-メチル-1-ナフチルオキシ基、8-メチル-1-ナフチルオキシ基、1-メチル-2-ナフチルオキシ基、5-メチル-2-ナフチルオキシ基、4-エチル-1-ナフチルオキシ基、5-エチル-1-ナフチルオキシ基、6-エチル-1-ナフチルオキシ基、1-エチル-2-ナフチルオキシ基、5-エチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-プロピル-1-ナフチルオキシ基、6-n-プロピル-1-ナフチルオキシ基、1-n-プロピル-2-ナフチルオキシ基、5-n-プロピル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ブチル-1-ナフチルオキシ基、6-n-ブチル-1-ナフチルオキシ基、1-n-ブチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ブチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ペン

チル-1-ナフチルオキシ基、6-n-ペンチル-1-ナフチルオキシ基、1-n-ペンチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ヘキシル-1-ナフチルオキシ基、6-n-ヘキシル-1-ナフチルオキシ基、1-n-ヘキシル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ヘキシル-2-ナフチルオキシ基、2, 4-ジメチル-1-ナフチルオキシ基、4, 6, 7-トリメチル-2-ナフチルオキシ基等のナフチルオキシ基（ナフタレン環上には、置換基としてC 1~6 アルキル基が1~3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

【0137】

2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基（2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C 1~6 アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）としては、例えば、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、3-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-2-イルオキシ基、3-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、3-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、3-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、3-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、2-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、2-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、2-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、2-エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、2-エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、2-エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、5-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、6-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、6-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、6-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、7-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、7-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、7-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、7-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-n-プロピル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-n-プロピル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-n-ブチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-n-ブチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-n-ペンチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-n-ペンチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2, 2, 4-トリメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、3-オキソ-4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2, 2-ジメチル-3-オキソ-2, 3

10

20

30

40

50

ージヒドロベンゾフランー5-イルオキシ基等の2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基(2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C1~6アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)が挙げられる。

【0138】

ベンゾチアゾリルオキシ基(ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい)としては、例えば、2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-エチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-エチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-エチル-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-エチル-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-プロピル-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-プロピル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-プロピル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-プロピル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-ブチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-ブチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-ブチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-ブチル-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-ペンチル-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-ペンチル-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-ペンチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-ペンチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、2, 4-ジメチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2, 4, 6-トリメチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基等のベンゾチアゾリルオキシ基(ベンゾチアゾール環上には、C1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0139】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフトレン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-オキソ-5-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-オキソ-3-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-オキソ-6-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-3-オキソ-5-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-4-オキソ-6-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-オキソ-7-ナフチルオキシ基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-オキソ-8-ナフチルオキシ基等を挙げることができる。

【0140】

1, 3-ベンゾオキサチオランニルオキシ基(1, 3-ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、1, 3-ベンゾオキサチオラン-4-イルオキシ基、1, 3-ベンゾオキサチオラン-5-イルオキシ基、1, 3-ベンゾオキサチオラン-6-イルオキシ基、1, 3-ベンゾオキサチオラン-7-イルオキシ基、2-オキソ-1, 3-ベンゾオキサチオラン-5-イルオキシ基、2-オキソ-1, 3-ベンゾオキサチオラン-6-イルオキシ基、2-オキソ-1, 3-ベンゾオキサチオラン-7-イルオキシ基等を挙げることができる。

【0141】

イソキノリルオキシ基としては、例えば、イソキノリン-1-イルオキシ基、イソキノリン-3-イルオキシ基、イソキノリン-4-イルオキシ基、イソキノリン-5-イルオキシ基、イソキノリン-6-イルオキシ基、イソキノリン-7-イルオキシ基、イソキノリン-8-イルオキシ基等が挙げられる。

【0142】

ピリジルオキシ基は、2-ピリジルオキシ基、3-ピリジルオキシ基、及び4-ピリジルオキシ基を含む。

【0143】

キノリルオキシ基（キノリン環上には、少なくとも1個のC1～6アルキル基が置換していてもよい）としては、例えば、2-キノリルオキシ基、3-キノリルオキシ基、4-キノリルオキシ基、5-キノリルオキシ基、6-キノリルオキシ基、7-キノリルオキシ基、8-キノリルオキシ基、3-メチル-2-キノリルオキシ基、4-メチル-2-キノリルオキシ基、5-メチル-2-キノリルオキシ基、6-メチル-2-キノリルオキシ基、7-メチル-2-キノリルオキシ基、2-メチル-3-キノリルオキシ基、4-メチル-3-キノリルオキシ基、5-メチル-3-キノリルオキシ基、6-メチル-3-キノリルオキシ基、7-メチル-3-キノリルオキシ基、8-メチル-3-キノリルオキシ基、2-メチル-4-キノリルオキシ基、3-メチル-4-キノリルオキシ基、5-メチル-4-キノリルオキシ基、6-メチル-4-キノリルオキシ基、7-メチル-4-キノリルオキシ基、8-メチル-4-キノリルオキシ基、2-メチル-5-キノリルオキシ基、4-メチル-5-キノリルオキシ基、3-メチル-5-キノリルオキシ基、6-メチル-5-キノリルオキシ基、7-メチル-5-キノリルオキシ基、8-メチル-5-キノリルオキシ基、2-メチル-6-キノリルオキシ基、4-メチル-6-キノリルオキシ基、5-メチル-6-キノリルオキシ基、3-メチル-6-キノリルオキシ基、7-メチル-6-キノリルオキシ基、8-メチル-6-キノリルオキシ基、2-メチル-7-キノリルオキシ基、4-メチル-7-キノリルオキシ基、5-メチル-7-キノリルオキシ基、6-メチル-7-キノリルオキシ基、3-メチル-7-キノリルオキシ基、8-メチル-7-キノリルオキシ基、2-メチル-8-キノリルオキシ基、4-メチル-8-キノリルオキシ基、5-メチル-8-キノリルオキシ基、6-メチル-8-キノリルオキシ基、7-メチル-8-キノリルオキシ基、3-メチル-8-キノリルオキシ基、2, 5-ジメチル-8-キノリルオキシ基、6, 7-ジメチル-4-キノリルオキシ基、4, 6, 7-トリメチル-5-キノリルオキシ基及びこれらの化合物群のメチル基をエチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基又はn-ヘキシル基に置換した化合物群等のキノリルオキシ基（キノリン環上には、置換基としてC1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

【0144】

ジベンゾフリルオキシ基は、1-ジベンゾフリルオキシ基、2-ジベンゾフリルオキシ基、3-ジベンゾフリルオキシ基、4-ジベンゾフリルオキシ基、5-ジベンゾフリルオキシ基、6-ジベンゾフリルオキシ基、7-ジベンゾフリルオキシ基、8-ジベンゾフリルオキシ基及び9-ジベンゾフリルオキシ基を含む。

【0145】

2H-クロメニルオキシ基（2H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、4-(2H)クロメニルオキシ基、5-(2H)クロメニルオキシ基、6-(2H)クロメニルオキシ基、7-(2H)クロメニルオキシ基、8-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-4-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-5-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-6-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-7-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-8-(2H)クロメニルオキシ基等を挙げることができる。

【0146】

ベンゾイソオキサゾリルオキシ基としては、例えば、3-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基、4-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基、5-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基、6-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基、7-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基等を挙げることができる。

【0147】

キノキサリルオキシ基としては、例えば、2-キノキサリルオキシ基、5-キノキサリルオキシ基、6-キノキサリルオキシ基等を挙げることができる。

【0148】

2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ基(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-3-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-6-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-7-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-2-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-3-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-4-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-5-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-6-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-7-イルオキシ基等を挙げることができる。

10

【0149】

ベンゾフラザニルオキシ基としては、例えば、4-ベンゾフラザニルオキシ基、5-ベンゾフラザニルオキシ基等を挙げることができる。

【0150】

フェニルC2~6アルケニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換又はハロゲン原子、ハロゲンC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されたフェニル基と炭素数2から6で少なくとも二重結合を1個有するアルケニル基から構成される基である。フェニルC2~6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC2~6アルケニル基としては、例えば、前記したフェニルC2~6アルケニル基に加えて、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(

20

30

40

50

2, 6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニル基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

【0151】

C1~6アルキル基(アルキル基には、モルホリノ基、ベンゾイル基、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ基が置換していてもよい)としては、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、モルホリノメチル基、2-モルホリノエチル基、3-モルホリノプロピル基、4-モルホリノブチル基、5-モルホリノペンチル基、6-モルホリノヘキシル基、ベンゾイルメチル基、2-ベンゾイルエチル基、1-ベンゾイルエチル基、3-ベンゾイルプロピル基、4-ベンゾイルブチル基、5-ベンゾイルペンチル基、6-ベンゾイルヘキシル基、カルバモイルメチル基、2-カルバモイルエチル基、1-カルバモイルエチル基、3-カルバモイルプロピル基、4-カルバモイルブチル基、5-カルバモイルペンチル基、6-カルバモイルヘキシル基、2-メチル-3-カルバモイルプロピル基、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエチル基、メチルカルバモイルメチル基、2-メチルカルバモイルエチル基、3-メチルカルバモイルプロピル基、4-メチルカルバモイルブチル基、5-メチルカルバモイルペンチル基、6-メチルカルバモイルヘキシル基、ジメチルカルバモイルメチル基、2-ジメチルカルバモイルエチル基、3-ジメチルカルバモイルプロピル基、4-ジメチルカルバモイルブチル基、5-ジメチルカルバモイルペンチル基、6-ジメチルカルバモイルヘキシル基、ジエチルカルバモイルメチル基、2-ジエチルカルバモイルエチル基、3-ジエチルカルバモイルプロピル基、4-ジエチルカルバモイルブチル基、5-ジエチルカルバモイルペンチル基、6-ジエチルカルバモイルヘキシル基、n-プロピルカルバモイルメチル基、2-n-プロピルカルバモイルエチル基、3-n-プロピルカルバモイルプロピル基、4-n-プロピルカルバモイルブチル基、5-n-プロピルカルバモイルペンチル基、6-n-プロピルカルバモイルヘキシル基、n-ブチルカルバモイルメチル基、2-n-ブチルカルバモイルエチル基、3-n-ブチルカルバモイルプロピル基、4-n-ブチルカルバモイルブチル基、5-n-ブチルカルバモイルペンチル基、6-n-ブチルカルバモイルヘキシル基、n-ヘキシルカルバモイルメチル基、2-n-ヘキシルカルバモイルエチル基、3-n-ヘキシルカルバモイルプロピル基、4-n-ヘキシルカルバモイルブチル基、5-n-ヘキシルカルバモイルペンチル基、6-n-ヘキシルカルバモイルヘキシル基、シアノメチル基、2-シアノエチル基、1-シアノエチル基、3-シアノプロピル基、4-シアノブチル基、5-シアノペンチル基、6-シアノヘキシル基等を挙げることができる。

【0152】

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル

10

20

30

40

50

基、ニトロ基、C 1～6アルキルチオ基、C 1～6アルキルスルホニル基、フェニルC 1～6アルコキシ基、C 2～6アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及び1, 2, 3-チアジアゾール基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、4-ビフェニリルメチル基、2-(4-ビフェニリル)エチル基、3-(4-ビフェニリル)プロピル基、2-(4-ビフェニリル)プロピル基、4-(4-ビフェニリル)ブチル基、5-(4-ビフェニリル)ペンチル基、4-(4-ビフェニリル)ペンチル基、6-(4-ビフェニリル)ヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリフルオロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリクロロベンジル基、2-ジフルオロメチルベンジル基、3-ジフルオロメチルベンジル基、4-ジフルオロメチルベンジル基、4-クロロ-3-ジフルオロメチルベンジル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジル基、3-ブロモ-4-ジフルオロメチルベンジル基、3, 5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンジル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペン

10

20

30

40

50

タフルオロエトキシフェニル) エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)
 エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオ
 ロメチルフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、
 3-(2-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメト
 キシフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3
 -(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエト
 キシフェニル) プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) ブチル基、5
 -(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェ
 ニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル基、6-(3-
 トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘ
 キシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2-メチルチオベン
 ジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、2, 3-ジメチルチオ
 ベンジル基、2, 4, 6-トリメチルチオベンジル基、2-(2-メチルチオフェニル)
 エチル基、2-(3-メチルチオフェニル) エチル基、2-(4-メチルチオフェニル)
 エチル基、3-(4-メチルチオフェニル) プロピル基、4-(4-メチルチオフェニル)
) ブチル基、5-(4-メチルチオフェニル) ペンチル基、6-(4-メチルチオフェニ
 ル) ヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-
 ベンジルオキシベンジル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(3-
 ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル) エチル基、3
 -(4-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル) ブ
 チル基、5-(4-ベンジルオキシフェニル) ペンチル基、6-(4-ベンジルオキシフ
 ェニル) ヘキシル基、2-(2-フェニルエトキシ) ベンジル基、3-(2-フェニルエ
 トキシ) ベンジル基、4-(2-フェニルエトキシ) ベンジル基、2-(2-(2-フェ
 ニルエトキシ) フェニル) エチル基、2-(3-(2-フェニルエトキシ) フェニル) エ
 チル基、2-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) エチル基、3-(4-(2-フェ
 ニルエトキシ) フェニル) プロピル基、4-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル)
) ブチル基、5-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) ペンチル基、6-(4-(2-
 フェニルエトキシ) フェニル) ヘキシル基、2-(3-フェニルプロポキシ) ベンジ
 ル基、3-(3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、4-(3-フェニルプロポキシ) ベ
 ンジル基、2-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ) ベ
 ンジル基、4-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、2-アセチルオキシベンジル基、
 3-アセチルオキシベンジル基、4-アセチルオキシベンジル基、2-(2-アセチルオ
 キシフェニル) エチル基、2-(3-アセチルオキシフェニル) エチル基、2-(4-ア
 セチルオキシフェニル) エチル基、3-(4-アセチルオキシフェニル) プロピル基、4
 -(4-アセチルオキシフェニル) ブチル基、5-(4-アセチルオキシフェニル) ペン
 チル基、6-(4-アセチルオキシフェニル) ヘキシル基、2-メタンスルホニルベンジ
 ル基、3-メタンスルホニルベンジル基、4-メタンスルホニルベンジル基、3, 4-ジ
 メタンスルホニルベンジル基、3, 4, 5-トリメタンスルホニルベンジル基、2-(2-
 メタンスルホニルフェニル) エチル基、2-(3-メタンスルホニルフェニル) エチル
 基、2-(4-メタンスルホニルフェニル) エチル基、3-(4-メタンスルホニルフェ
 ニル) プロピル基、4-(4-メタンスルホニルフェニル) ブチル基、5-(4-メタン
 スルホニルフェニル) ペンチル基、6-(4-メタンスルホニルフェニル) ヘキシル基、
 2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、2, 4-ジシア
 ノベンジル基、3, 4, 5-トリシアノベンジル基、2-(2-シアノフェニル) エチル
 基、2-(3-シアノフェニル) エチル基、2-(4-シアノフェニル) エチル基、3-
 (4-シアノフェニル) プロピル基、4-(4-シアノフェニル) ブチル基、5-(4-
 シアノフェニル) ペンチル基、6-(4-シアノフェニル) ヘキシル基、2-ニトロベン
 ジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、2, 6-ジニトロベンジル基、
 3, 4, 5-トリニトロベンジル基、2-(2-ニトロフェニル) エチル基、2-(3-
 ニトロフェニル) エチル基、2-(4-ニトロフェニル) エチル基、3-(4-ニトロフ

10

20

30

40

50

フェニル) プロピル基、4-(4-ニトロフェニル) ブチル基、5-(4-ニトロフェニル) ペンチル基、6-(4-ニトロフェニル) ヘキシル基、2-(1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル) ベンジル基、3-(1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル) ベンジル基、4-(1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル) ベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C1~6アルキルチオ基、C1~6アルキルスルホニル基、フェニルC1~6アルコキシ基、C2~6アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び1, 2, 3-チアジアゾール基からなる群より選ばれた基が1~5個好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

【0153】

C2~C6アルケニル基としては、例えば、ビニル基、2-プロペニル基、3-ブテニル基、2-ブテニル基、4-ペンテニル基、3-ペンテニル基、5-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

【0154】

フェニル基(フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、無置換のフェニル基、上記で定義されたハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェニル基であって、より具体的には、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基

20

30

40

50

、2, 3-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることができる。

【0155】

フェニルC 2~6のアルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、フェニルアセチル基、3-フェニルプロピオニル基、4-フェニルブチリル基、5-フェニルペンタノイル基、6-フェニルヘキサノイル基、4-フルオロフェニルアセチル基、3-(4-フルオロフェニル)プロピオニル基、4-(4-フルオロフェニル)ブチリル基、5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル基、6-(4-フルオロフェニル)ヘキサノイル基、2-クロロフェニルアセチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアセチル基、3-(2-クロロフェニル)プロピオニル基、4-(2-クロロフェニル)ブチリル基、5-(2-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(2-クロロフェニル)ヘキサノイル基、3-クロロフェニルアセチル基、3-(3-クロロフェニル)プロピオニル基、4-(3-クロロフェニル)ブチリル基、5-(3-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(3-クロロフェニル)ヘキサノイル基、4-クロロフェニルアセチル基、3-(4-クロロフェニル)プロピオニル基、4-(4-クロロフェニル)ブチリル基、5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェニル)ヘキサノイル基、3, 4-ジクロロフェニルアセチル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)プロピオニル基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)ブチリル基、5-(3, 4-ジクロロフェニル)ペンタノイル基、6-(3, 4-ジクロロフェニル)ヘキサノイル基、2-メチルフェニルアセチル基、3-メチルフェニルアセチル基、4-メチルフェニルアセチル基、(2, 4, 6-トリメチルフェニル)アセチル基、(2, 6-ジメトキシフェニル)アセチル基、(2, 4, 5-トリメトキシフェニル)アセチル基、(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)アセチル基、(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)アセチル基、2-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、3-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、4-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、2-フェニルプロピオニル基、3-(2-メチルフェニル)プロピオニル基、3-(3-メチルフェニル)プロピオニル基、3-(4-メチルフェニル)プロピオニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピオニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピオニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピオニル基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)プロピオニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチリル基、5

ー（４－トリフルオロメチルフェニル）ペンタノイル基、６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ヘキサノイル基、４－（４－ペンタフルオロエチルフェニル）ブチル基、５－（４－ペンタフルオロエチルフェニル）ペンタノイル基、６－（４－ペンタフルオロエチルフェニル）ヘキサノイル基、２－メトキシフェニルアセチル基、３－メトキシフェニルアセチル基、４－メトキシフェニルアセチル基、２－トリフルオロメトキシフェニルアセチル基、３－トリフルオロメトキシフェニルアセチル基、４－トリフルオロメトキシフェニルアセチル基、３－（２－メトキシフェニル）プロピオニル基、３－（３－メトキシフェニル）プロピオニル基、３－（４－メトキシフェニル）プロピオニル基、３－（２－トリフルオロメトキシフェニル）プロピオニル基、３－（３－トリフルオロメトキシフェニル）プロピオニル基、３－（４－トリフルオロメトキシフェニル）プロピオニル基、３－（３，５－ジメトキシフェニル）プロピオニル基、４－（４－トリフルオロメトキシフェニル）ブチル基、５－（４－トリフルオロメトキシフェニル）ペンタノイル基、６－（４－トリフルオロメトキシフェニル）ヘキサノイル基、４－（４－トリフルオロメトキシフェニル）ブチル基、５－（４－ペンタフルオロエトキシフェニル）ペンタノイル基、６－（４－ペンタフルオロエトキシフェニル）ヘキサノイル基等のフェニルＣ２～６のアルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基１～５個、好ましくは１～３個置換していてもよい）を挙げることができる。

【０１５６】

Ｃ１～２０のアルコキシカルボニル基（アルコキシ基上には、ハロゲン原子、置換基としてＣ１～６アルキル基を有することのあるアミノ基及びＣ１～６アルコキシ置換Ｃ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい）とは、置換基としてハロゲン原子、Ｃ１～６アルキル基を有することのあるアミノ基及びＣ１～６アルコキシ置換Ｃ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基を１～７個有していてもよい炭素数１乃至２０個のアルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、ｎ－プロポキシキシカルボニル基、ｎ－ブキシキシカルボニル基、ｎ－ペンチルオキシカルボニル基、ｎ－ヘキシルオキシカルボニル基、ｎ－ヘプチルオキシカルボニル基、ｎ－オクチルオキシカルボニル基、ｎ－ノニルオキシカルボニル基、ｎ－デシルオキシカルボニル基、ｎ－ウンデシルオキシカルボニル基、ｎ－ドデシルオキシカルボニル基、ｎ－トリデシルオキシカルボニル基、ｎ－テトラデシルオキシカルボニル基、ｎ－ペンタデシルオキシカルボニル基、ｎ－ヘキサデシルオキシカルボニル基、ｎ－ヘプタデシルオキシカルボニル基、ｎ－オクタデシルオキシカルボニル基、ｎ－ノナデシルオキシカルボニル基、ｎ－イコシルオキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、トリクロロメトキシカルボニル基、２－ブロモエトキシカルボニル基、２，２－ジブロモエトキシカルボニル基、３－フルオロプロポキシキシカルボニル基、４－ヨードブトキシキシカルボニル基、５，５，５，４，４，３，３－ヘプタフルオロペンチルオキシカルボニル基、４，４，４，３，３，２，２－ヘプタフルオロブトキシカルボニル基、５－クロロペンチルオキシカルボニル基、６－ブロモヘキシルオキシカルボニル基、７－クロロヘプチルオキシカルボニル基、８－ヨードオクチルオキシカルボニル基、９－クロロノニルオキシカルボニル基、１０－ブロモデシルオキシカルボニル基、１１－フルオロウンデシルオキシカルボニル基、１２－ヨードドデシルオキシカルボニル基、１２－クロロドデシルオキシカルボニル基、１３－フルオロトリデシルオキシカルボニル基、１４－ブロモテトラデシルオキシカルボニル基、１５－ヨードペンタデシルオキシカルボニル基、１６－クロロヘキサデシルオキシカルボニル基、１７－ブロモヘプタデシルオキシカルボニル基、１８－フルオロオクタデシルオキシカルボニル基、１９－クロロノナデシルオキシカルボニル基、２０－クロロイコシルオキシカルボニル基、アミノメトキシカルボニル基、ジエチルアミノメトキシカルボニル基、２－ジエチルアミノエトキシカルボニル基、３－ジエチルアミノプロポキシキシカルボニル基、４－ジエチルアミノブキシキシカルボニル基、５－ジエチルアミノペンチルオキシカルボニル基、６－ジエチルアミノヘキシルオキシカルボニル基、７－ジエチルアミノヘプチルオキシカル

ルボニル基、8-ジエチルアミノクチルオキシカルボニル基、9-ジエチルアミノノニル
 オキシカルボニル基、10-ジエチルアミノデシルオキシカルボニル基、11-ジエチル
 アミノデシルオキシカルボニル基、12-ジエチルアミノドデシルオキシカルボニル基
 、13-ジエチルアミノトリデシルオキシカルボニル基、14-ジエチルアミノテトラデ
 シルオキシカルボニル基、15-ジエチルアミノペンタデシルオキシカルボニル基、16
 -ジエチルアミノヘキサデシルオキシカルボニル基、17-ジエチルアミノヘプタデシル
 オキシカルボニル基、18-ジエチルアミノオクタデシルオキシカルボニル基、19-ジ
 エチルアミノノナデシルオキシカルボニル基、20-ジエチルアミノイコシルオキシカル
 ボニル基、メトキシエトキシメトキシカルボニル基、2-(2-エトキシエトキシ)エト
 キシカルボニル基、2-(2-プロポキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-(2-
 ブトキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-(2-ペンチルオキシエトキシ)エトキ
 シカルボニル基、2-(2-ヘキシルオキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-メト
 キシエトキシエトキシカルボニル基、3-(3-メトキシプロポキシ)プロポキシキシカ
 ルボニル基、4-(4-メトキシブトキシ)ブキシキシカルボニル基、5-(5-メトキ
 シペンチルオキシ)ペンチルオキシカルボニル基、6-(6-メトキシヘキシルオキシ)
 ヘキシルオキシカルボニル基、7-(2-メトキシエトキシ)ヘプチルオキシカルボニル
 基、8-(1-メトキシエトキシ)オクチルオキシカルボニル基、9-(1-メトキシエ
 トキシ)ノニルオキシカルボニル基、10-(2-メトキシエトキシ)デシルオキシカル
 ボニル基、11-(1-メトキシエトキシ)ウンデシルオキシカルボニル基、12-(2
 -メトキシエトキシ)ドデシルオキシカルボニル基、12-(1-メトキシエトキシ)ド
 デシルオキシカルボニル基、13-(2-メトキシエトキシ)トリデシルオキシカルボニ
 ル基、14-(1-メトキシエトキシ)テトラデシルオキシカルボニル基、15-(2-
 メトキシエトキシ)ペンタデシルオキシカルボニル基、16-(1-メトキシエトキシ)
 ヘキサデシルオキシカルボニル基、17-(2-メトキシエトキシ)ヘプタデシルオキシ
 カルボニル基、18-(1-メトキシエトキシ)オクタデシルオキシカルボニル基、19
 -(2-メトキシエトキシ)ノナデシルオキシカルボニル基、20-(1-メトキシエト
 キシ)イコシルオキシカルボニル基、ジメチルアミノメトキシカルボニル基、2-メチル
 アミノエトキシカルボニル基、3-(N-メチル-N-ブチルアミノ)プロポキシキシカ
 ルボニル基、4-プロピルアミノブキシキシカルボニル基、5-ヘキシルアミノペンチル
 オキシカルボニル基、6-ペンチルアミノヘキシルオキシカルボニル基、7-(N-エチ
 ル-N-プロピルアミノ)ヘプチルオキシカルボニル基、8-(N-プロピル-N-ヘキ
 シル)アミノオクチルオキシカルボニル基、9-(N-ペンチル-N-メチルアミノ)ノ
 ニルオキシカルボニル基、10-ジプロピルアミノデシルオキシカルボニル基、11-ジ
 ペンチルアミノウンデシルオキシカルボニル基、12-ジヘキシルアミノドデシルオキシ
 カルボニル基、12-ジブチルアミノドデシルオキシカルボニル基、13-(N-エチル
 -N-ブチルアミノ)トリデシルオキシカルボニル基、14-(N-メチル-N-ヘキシ
 ルアミノ)テトラデシルオキシカルボニル基、15-ジメチルアミノペンタデシルオキシ
 カルボニル基、16-ジメチルアミノヘキサデシルオキシカルボニル基、17-ジメチル
 アミノヘプタデシルオキシカルボニル基、18-ジメチルアミノオクタデシルオキシカル
 ボニル基、19-ジメチルアミノノナデシルオキシカルボニル基、20-ジメチルアミノ
 イコシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0157】

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ
 ン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア
 ルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、C1~
 6アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニルC1~6アルコキシ基、C1~
 6アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基
 の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル
 オキシカルボニル基、1-フェネチルオキシカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボ
 ニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、

10

20

30

40

50

50

カルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、
 2-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシ
 ベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基
 、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4
 -ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチル
 フェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカ
 ルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、(2-ト
 リフルオロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、(3-トリフルオロメトキシフェ
 ニル)メトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカル
 ボニル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(
 3-ペンタフルオロエトキシフェニル)メトキシカルボニル基、2-(4-ペンタフルオ
 ロエトキシフェニル)メトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)
 プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボ
 ニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-ト
 リフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシ
 フェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロ
 ポキシカルボニル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキシカルボ
 ニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3
 -ペンタフルオロエトキシフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメ
 チルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)
 ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチルオキ
 シカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基
 、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ト
 リフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-メチルチオベンジルオ
 キシカルボニル基、3-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、4-メチルチオベンジ
 ルオキシカルボニル基、2-(2-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(
 3-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-メチルチオフェニル)エト
 キシカルボニル基、3-(4-メチルチオフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4
 -メチルチオフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-メチルチオフェニル)ペンチ
 ルオキシカルボニル基、6-(4-メチルチオフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、
 2-トリフルオロメチルチオベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルチオ
 ベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルチオベンジルオキシカルボニル基
 、2-(2-トリフルオロメチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリ
 フルオロメチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルチ
 オフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)プロ
 ポキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)ブトキシカルボニル
 基、5-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(
 4-トリフルオロメチルチオフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-ベンジルオキ
 シベンジルオキシカルボニル基、3-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、4-
 ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル)メト
 キシカルボニル基、2-(3-ベンジルオキシフェニル)メトキシカルボニル基、2-(
 4-ベンジルオキシフェニル)メトキシカルボニル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル)
 プロポキシカルボニル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル)ブトキシカルボニル
 基、5-(4-ベンジルオキシフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-ベン
 ジルオキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-(2-フェニルエトキシ)ベン
 ジルオキシカルボニル基、3-(2-フェニルエトキシ)ベンジルオキシカルボニル基、
 4-(2-フェニルエトキシ)ベンジルオキシカルボニル基、2-(2-(2-フェニル
 エトキシ)フェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-(2-フェニルエトキシ)フェ
 ニル)エトキシカルボニル基、2-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)エトキシ
 カルボニル基、3-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)プロポキシカルボニル基

10

20

30

40

50

、4-（4-（2-フェニルエトキシ）フェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-（2-フェニルエトキシ）フェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-（2-フェニルエトキシ）フェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-（3-フェニルプロポキシ）ベンジルオキシカルボニル基、3-（3-フェニルプロポキシ）ベンジルオキシカルボニル基、4-（3-フェニルプロポキシ）ベンジルオキシカルボニル基、2-（4-フェニルブトキシ）ベンジルオキシカルボニル基、3-（4-フェニルブトキシ）ベンジルオキシカルボニル基、4-（4-フェニルブトキシ）ベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-（2-メトキシカルボニルフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-メトキシカルボニルフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-メトキシカルボニルフェニル）エトキシカルボニル基、3-（4-メトキシカルボニルフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-メトキシカルボニルフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-メトキシカルボニルフェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-メトキシカルボニルフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-ブチリルアミノベンジルオキシカルボニル基、3-ブチリルアミノベンジルオキシカルボニル基、4-ブチリルアミノベンジルオキシカルボニル基、2-（2-ブチリルアミノフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-ブチリルアミノフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-ブチリルアミノフェニル）エトキシカルボニル基、3-（4-ブチリルアミノフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-ブチリルアミノフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-ブチリルアミノフェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-ブチリルアミノフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-ニトロベンジルオキシカルボニル基、3-ニトロベンジルオキシカルボニル基、4-ニトロベンジルオキシカルボニル基、2-（2-ニトロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-ニトロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（2, 4-ジニトロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（2, 4, 6-トリニトロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-ニトロフェニル）エトキシカルボニル基、3-（4-ニトロフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-ニトロフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-ニトロフェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-ニトロフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-アミノベンジルオキシカルボニル基、3-アミノベンジルオキシカルボニル基、4-アミノベンジルオキシカルボニル基、2-（2-アミノフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-アミノフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-アミノフェニル）エトキシカルボニル基、3-（4-アミノフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-アミノフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-アミノフェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-アミノフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-アセチルアミノベンジルオキシカルボニル基、3-プロピオニルアミノベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタノイルアミノベンジルオキシカルボニル基、2-（2-ヘキサノイルアミノフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-アセチルアミノフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-アセチルアミノフェニル）エトキシカルボニル基、3-（4-アセチルアミノフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-アセチルアミノフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-アセチルアミノフェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-アセチルアミノフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、3-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、4-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-（2-エトキシカルボニルフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-ブトキシカルボニルフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-プロポキシカルボニルフェニル）エトキシカルボニル基、3-（4-エトキシカルボニルフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-ペンチルオキシカルボニルフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-エトキシカルボニルフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-（1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル）

10

20

30

40

50

ベンジルオキシカルボニル基、3-(1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル)ベンジルオキシカルボニル基、4-(1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル)ベンジルオキシカルボニル基等のフェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、C1~6アルカノイル基を1~2個有することのあるアミノ基、フェニルC1~6アルコキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは、1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0158】

フェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換フェニル基又はハロゲン原子、ハロゲンC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されたフェニル基と炭素数3から6二重結合を1~3個有するアルケニルオキシ基とカルボニル基から構成される基である。フェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC3~6アルケニルオキシカルボニル基としては、例えば、無置換の3-フェニル-2-プロペニルオキシカルボニル基(慣用名:シンナミルオキシカルボニル基)、4-フェニル-2-ブテニルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-2-ペンテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-3-ペンテニルオキシカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニル-4-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルオキシカルボニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルオキシカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 3, 4-トリクロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 3-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペ

10

20

30

40

50

ニルオキシカルボニル基、3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカル
 ボニル基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニ
 ル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボ
 ニル基、3-(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(
 2, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 3-ジ
 メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 6-ジメトキシフ
 ェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)-
 2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペ
 ニルオキシカルボニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロ
 ペニルオキシカルボニル基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニル
 オキシカルボニル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロ
 ペニルオキシカルボニル基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペ
 ニルオキシカルボニル基、3-(4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-
 プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカ
 ルボニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(
 4-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメ
 チルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチル
 フェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチル
 フェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメトキシ
 フェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシ
 フェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシ
 フェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-メトキシフェニル)-2-プロ
 ペニルオキシカルボニル基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカ
 ルボニル基、3-(4-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(
 3, 4-ジメトキシ
 フェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、4-(4-クロロフェニル)-2-
 ブテニルオキシカルボニル基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニルオキシカル
 ボニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ペンテニルオキシカルボニル基、5-(4-
 クロロフェニル)-4-ペンテニルオキシカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-
 3-ペンテニルオキシカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニルオキ
 シカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニルオキシカルボニル基、6
 -(4-クロロフェニル)-2-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-(4-クロロフェ
 ニル)-3-ヘキセニルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0159】

フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未
 置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からな
 る群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してもよい）としては、例えば、フェノキシ
 カルボニル基、2-フルオロフェノキシカルボニル基、3-フルオロフェノキシカルボ
 ニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシカルボニル基、4-フルオロフェ
 ノキシカルボニル基、2-クロロフェノキシカルボニル基、3-クロロフェノキシカル
 ボニル基、4-クロロフェノキシカルボニル基、2, 3-ジクロロフェノキシカルボニル基
 、3, 4-ジクロロフェノキシカルボニル基、3, 5-ジクロロフェノキシカルボニル基
 、2-ブromoフェノキシカルボニル基、3-ブromoフェノキシカルボニル基、4-ブromo
 フェノキシカルボニル基、2-メチルフェノキシカルボニル基、3-メチルフェノキシカ
 ルボニル基、4-メチルフェノキシカルボニル基、2-エチルフェノキシカルボニル基、
 3-エチルシフェノキシカルボニル基、4-エチルフェノキシカルボニル基、4-プロピ
 ルフェノキシカルボニル基、4-tert-ブチルフェノキシカルボニル基、4-ブチル
 フェノキシカルボニル基、2, 3-ジメチルフェノキシカルボニル基、3, 4, 5-トリ
 メチルフェノキシカルボニル基、4-ペンチルフェノキシカルボニル基、4-ヘキシル
 フェノキシカルボニル基、2-フルオロ-4-ブromoフェノキシカルボニル基、4-クロロ
 -3-フルオロフェノキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシカルボニル

10

20

30

40

50

基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシカルボニル基、4-イソプロピルフェノキシカルボニル基、4-n-ブチルフェノキシカルボニル基、2, 4-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 6-ジメチルフェノキシカルボニル基、3, 5-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 5-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 6-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 5-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-メチル-4-フルオロフェノキシカルボニル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエチルシフェノキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、2-メトキシフェノキシカルボニル基、3-メトキシフェノキシカルボニル基、4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-エトキシフェノキシカルボニル基、3-エトキシフェノキシカルボニル基、4-エトキシフェノキシカルボニル基、4-プロポキシフェノキシカルボニル基、4-tert-ブトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェノキシカルボニル基、4-ペントキシフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルオキシフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基等のフェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換してもよい）を挙げることができる。

【0160】

フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい）としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、2-フェネチルカルバモイル基、3-フェニルプロピルカルバモイル基、2-フェニルプロピルカルバモイル基、4-フェニルブチルカルバモイル基、5-フェニルペンチルカルバモイル基、4-フェニルペンチルカルバモイル基、6-フェニルヘキシルカルバモイル基、2-フルオロベンジルカルバモイル基、3-フルオロベンジルカルバモイル基、4-フルオロベンジルカルバモイル基、2-クロロベンジルカルバモイル基、3-クロロベンジルカルバモイル基、4-クロロベンジルカルバモイル基、2-ブromoベンジルカルバモイル基、3-ブromoベンジルカルバモイル基、4-ブromoベンジルカルバモイル基、2-ヨードベンジルカルバモイル基、3-ヨードベンジルカルバモイル基、4-ヨードベンジルカルバモイル基、N-ベンジル-N-メチルカルバモイル基、N-メチル-N-（2-フェネチル）カルバモイル基、N-メチル-N-（3-フェニルプロピル）カルバモイル基、N-メチル-N-（2-フェニルプロピル）カルバモイル基、N-メチル-N-（4-フェニルブチル）カルバモイル基、N-メチル-N-（5-フェニルペンチル）カルバモイル基、N-メチル-N-（4-フェニルペンチル）カルバモイル基、N-メチル-N-（6-フェニルヘキシル）カルバモイル基、N-（2-フルオロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（3-フルオロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（4-フルオロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（2-クロロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（3-クロロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（4-クロロベンジル）-N-メチルカルバ

モイル基、N-(2-ブロモベンジル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-ブロモベンジル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-ブロモベンジル)-N-メチルカルバモイル基、N、N-ジベンジルカルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-フェネチル)カルバモイル基、N-ベンジル-(3-フェニルプロピル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-フェニルプロピル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フェニルブチル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(5-フェニルペンチル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フェニルペンチル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(6-フェニルヘキシル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-フルオロベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-フルオロベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フルオロベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-クロロベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-クロロベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ブロモベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-ブロモベンジル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ブロモベンジル)カルバモイル基、2, 3-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 5-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 6-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 3-ジクロロベンジルカルバモイル基、3, 4-ジクロロベンジルカルバモイル基、3, 5-ジクロロベンジルカルバモイル基、2, 4-ジクロロベンジルカルバモイル基、2, 6-ジクロロベンジルカルバモイル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルカルバモイル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルカルバモイル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルカルバモイル基、4-イソプロピルベンジルカルバモイル基、4-n-ブチルベンジルカルバモイル基、4-メチルベンジルカルバモイル基、2-メチルベンジルカルバモイル基、3-メチルベンジルカルバモイル基、2, 4-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 3-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 6-ジメチルベンジルカルバモイル基、3, 5-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 5-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルカルバモイル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、4-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、4-n-ブトキシベンジルカルバモイル基、4-メトキシベンジルカルバモイル基、2-メトキシベンジルカルバモイル基、3-メトキシベンジルカルバモイル基、2, 4-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2, 3-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2, 6-ジメトキシベンジルカルバモイル基、3, 5-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2, 5-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルカルバモイル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、2-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルカルバモイル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、3-メチル-4-フルオロベンジルカルバモイル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、2-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエチルベンジルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルベンジルカルバモイル基、2-トリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルカルバモイル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチルカルバモイル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチルカルバモイル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルカルバモイル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチルカルバモイル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチルカルバモイル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチルカルバモイル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチルカルバモイル基、2

10

20

30

40

50

ー（３－ペンタフルオロエトキシフェニル）エチルカルバモイル基、２－（４－ペンタフルオロエトキシフェニル）エチルカルバモイル基、３－（２－トリフルオロメチルフェニル）プロピルカルバモイル基、３－（３－トリフルオロメチルフェニル）プロピルカルバモイル基、３－（４－トリフルオロメチルフェニル）プロピルカルバモイル基、３－（２－トリフルオロメトキシフェニル）プロピルカルバモイル基、３－（３－トリフルオロメトキシフェニル）プロピルカルバモイル基、３－（４－トリフルオロメトキシフェニル）プロピルカルバモイル基、３－（３－ペンタフルオロエトキシフェニル）プロピルカルバモイル基、３－（４－ペンタフルオロエトキシフェニル）プロピルカルバモイル基、４－（３－ペンタフルオロエトキシフェニル）ブチルカルバモイル基、５－（４－トリフルオロメチルフェニル）ペンチルカルバモイル基、４－（４－トリフルオロメチルフェニル）ペンチルカルバモイル基、４－（４－トリフルオロメトキシフェニル）ペンチルカルバモイル基、６－（３－トリフルオロメチルフェニル）ヘキシルカルバモイル基、６－（４－トリフルオロメチルフェニル）ヘキシルカルバモイル基、６－（４－トリフルオロメトキシフェニル）ヘキシルカルバモイル基等のフェニルＣ１～６アルキルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基が１～５個、好ましくは１～３個置換されていてもよい）を挙げることができる。

【０１６１】

ベンゾフリル置換Ｃ１～６アルコキシカルボニル基（ベンゾフラン環上には、少なくとも１個のハロゲン原子が置換していてもよい。）としては、例えば、２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、１－（２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（４－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、３－（５－ベンゾフリル）プロポキシカルボニル基、４－（６－ベンゾフリル）ブトキシカルボニル基、５－（７－ベンゾフリル）ペンチルオキシカルボニル基、６－（２－ベンゾフリル）ヘキシルオキシカルボニル基、４－フルオロ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、５－フルオロ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、６－フルオロ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、７－フルオロ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、４－クロロ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、５－クロロ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、６－クロロ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、７－クロロ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、４－ブロモ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、５－ブロモ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、６－ブロモ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、７－ブロモ－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、４－ヨード－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、５－ヨード－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、６－ヨード－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、７－ヨード－２－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、４－フルオロ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、５－フルオロ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、６－フルオロ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、７－フルオロ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、４－クロロ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、５－クロロ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、６－クロロ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、７－クロロ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、４－ブロモ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、５－ブロモ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、６－ブロモ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、７－ブロモ－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、４－ヨード－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、５－ヨード－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、６－ヨード－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、７－ヨード－３－ベンゾフリルメトキシカルボニル基、２－（４－フルオロ－２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（５－フルオロ－２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（６－フルオロ－２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（７－フルオロ－２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（４－クロロ－２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（５－クロロ－２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（６－クロロ－２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（７－クロロ－２－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２

10

20

30

40

50

ー（４－フルオロー３－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（５－フルオロー３－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（６－フルオロー３－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（７－フルオロー３－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（４－クロロー３－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（５－クロロー３－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（６－クロロー３－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、２－（７－クロロー３－ベンゾフリル）エトキシカルボニル基、６－（４－フルオロー２－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（５－フルオロー２－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（６－フルオロー２－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（７－フルオロー２－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（４－クロロー２－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（５－クロロー２－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（６－クロロー２－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（７－クロロー２－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（４－フルオロー３－ベンゾフリル）メトキシカルボニル基、６－（５－フルオロー３－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（６－フルオロー３－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（７－フルオロー３－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（４－クロロー３－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（５－クロロー３－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、６－（６－クロロー３－ベンゾフリル）ヘキシロキシカルボニル基、（２，４－ジブromo－３－ベンゾフリル）メトキシカルボニル基、（４，５，６－トリクロロー３－ベンゾフリル）メトキシカルボニル基等のベンゾフラン環上にハロゲン原子が１～３個置換していてもよいベンゾフリル置換Ｃ１～６アルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【０１６２】

ベンゾチエニルＣ１～６アルコキシカルボニル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい）としては、例えば、２－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、３－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、４－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、５－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、６－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、７－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、２－（２－ベンゾチエニル）エトキシカルボニル基、３－（２－ベンゾチエニル）プロポキシカルボニル基、４－（２－ベンゾチエニル）ブトキシカルボニル基、５－（２－ベンゾチエニル）ペンチロキシカルボニル基、６－（２－ベンゾチエニル）ヘキシロキシカルボニル基、５－トリフルオロメトキシ－２－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、５－トリフルオロメトキシ－３－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、５－トリフルオロメトキシ－４－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、４－トリフルオロメトキシ－５－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、３－トリフルオロメトキシ－６－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、２－トリフルオロメトキシ－７－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、２－メトキシ－７－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、５，６－ジメトキシ－３－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、２，５，６－トリメトキシ－３－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、５－クロロー６－メトキシ－３－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、２－（４－エトキシ－２－ベンゾチエニル）エトキシカルボニル基、５－クロロー３－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、３，４－ジブromo－２－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、４，５，６－トリクロロー２－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、５－トリフルオロメトキシ－２－クロロー７－ベンゾチエニルメトキシカルボニル基等のベンゾチエニルＣ１～６アルコキシカルボニル基（ベンゾチオフェン環上には、置換基としてハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基が１～３個置換していてもよい）を挙げることができる。

【０１６３】

ナフチル置換Ｃ１～６アルコキシカルボニル基としては、例えば、１－ナフチルメトキシカルボニル基、２－ナフチルメトキシカルボニル基、２－（１－ナフチル）エトキシカ

10

20

30

40

50

ルボニル基、2-(2-ナフチル)エトキシカルボニル基、3-(1-ナフチル)プロポキシカルボニル基、3-(2-ナフチル)プロポキシカルボニル基、4-(1-ナフチル)ブトキシカルボニル基、4-(2-ナフチル)ブトキシカルボニル基、5-(1-ナフチル)ペントキシカルボニル基、5-(2-ナフチル)ペントキシカルボニル基、6-(1-ナフチル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(2-ナフチル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0164】

ピリジル置換C1~6アルコキシカルボニル基(ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、2-ピリジルメトキシカルボニル基、3-ピリジルメトキシカルボニル基、4-ピリジルメトキシカルボニル基、2-(2-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(3-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(4-ピリジル)エトキシカルボニル基、3-(2-ピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(4-ピリジル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(3-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(4-ピリジル)ブトキシカルボニル基、5-(2-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(4-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-クロロ-3-ピリジルメトキシカルボニル基、3-ブromo-2-ピリジルメトキシカルボニル基、4-フルオロ-2-ピリジルメトキシカルボニル基、2-(2-クロロ-4-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(3-クロロ-5-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(4-ヨード-3-ピリジル)エトキシカルボニル基、3-(2-ブromo-5-ピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(3-フルオロ-4-ピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(4-クロロ-2-ピリジル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ヨード-5-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(3-ブromo-5-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(4-クロロ-5-ピリジル)ブトキシカルボニル基、5-(2-クロロ-5-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-フルオロ-2-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(4-ブromo-2-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-クロロ-5-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-フルオロ-4-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ブromo-2-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、(2, 6-ジクロロ-4-ピリジル)メトキシカルボニル基、(2, 3, 4-トリクロロ-6-ピリジル)メトキシカルボニル基等のピリジル置換C1~6アルコキシカルボニル基(ピリジン環上には、置換基としてハロゲン原子が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0165】

フリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい)としては、例えば、2-フリルメトキシカルボニル基、3-フリルメトキシカルボニル基、2-(2-フリル)エトキシカルボニル基、3-(2-フリル)プロポキシカルボニル基、3-(3-フリル)プロポキシカルボニル基、4-(2-フリル)ブトキシカルボニル基、4-(3-フリル)ブトキシカルボニル基、5-(2-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-フリル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-フリル)ヘキシルオキシカルボニル基、5-ニトロ-2-フリルメトキシカルボニル基、5-ニトロ-3-フリルメトキシカルボニル基、2-(5-ニトロ-2-フリル)エトキシカルボニル基、3-(5-ニトロ-2-フリル)プロポキシカルボニル基、4-(5-ニトロ-2-フリル)ブトキシカルボニル基、4-(5-ニトロ-3-フリル)ブトキシカルボニル基、5-(5-ニトロ-2-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(5-ニトロ-3-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(5-ニトロ-2-フリル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(5-ニトロ-3-フリル)ヘキシルオキシカルボニル基、(4, 5-ジニ

トロ-2-フリル)メトキシカルボニル基、(2, 4, 5-トリニトロ-3-フリル)メトキシカルボニル基等のフリル置換C 1~6アルコキシカルボニル基(フラン環上には、置換基としてニトロ基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0166】

チエニル置換C 1~6アルコキシカルボニル基(チオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、2-チエニルメトキシカルボニル基、3-チエニルメトキシカルボニル基、2-(2-チエニル)エトキシカルボニル基、3-(2-チエニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-チエニル)プロポキシカルボニル基、4-(2-チエニル)ブトキシカルボニル基、4-(3-チエニル)ブトキシカルボニル基、5-(2-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-チエニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-チエニル)ヘキシルオキシカルボニル基、5-クロロ-2-チエニルメトキシカルボニル基、5-クロロ-3-チエニルメトキシカルボニル基、2-(4-ブロモ-2-チエニル)エトキシカルボニル基、3-(3-フルオロ-2-チエニル)プロポキシカルボニル基、4-(5-ヨード-2-チエニル)ブトキシカルボニル基、4-(4-クロロ-3-チエニル)ブトキシカルボニル基、5-(3-クロロ-2-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(2-クロロ-3-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-クロロ-2-チエニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(5-クロロ-3-チエニル)ヘキシルオキシカルボニル基、(4, 5-ジクロロ-2-チエニル)メトキシカルボニル基、(2, 4, 5-トリクロロ-3-チエニル)メトキシカルボニル基等のチエニル置換C 1~6アルコキシカルボニル基(チオフェン環上には、置換基としてハロゲン原子を1~3個有していてもよい)を挙げることができる。

【0167】

チアゾリル置換C 1~6アルコキシカルボニル基(チアゾール環上には、C 1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-チアゾリル)エトキシカルボニル基、3-(2-チアゾリル)プロポキシカルボニル基、4-(2-チアゾリル)ブトキシカルボニル基、5-(2-チアゾリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-チアゾリル)ヘキシルオキシカルボニル基、4-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-メチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-メチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-メチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-メチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-メチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-メチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-エチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-エチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-エチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-プロピル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ブチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-エチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ペンチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-n-ヘキシル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-n-ヘキシル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ペンチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-n-ヘキシル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ヘキシル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-n-ヘキシル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ヘキシル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-フェニル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-フェニル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-フェニル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-フェニル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-フェニル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(4-フェニル-2-チアゾリル)エトキシカルボニル基、5-フェニル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-フェニル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル

10

20

30

40

50

基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-プロモフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(3-クロロフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,3-ジフルオロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,4-ジプロモフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-(2,5-ジクロロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,4,6-トリクロロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(4-クロロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,4-ジクロロフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-(2-メチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-エチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-n-プロピルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(3-イソプロピルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(3-n-ブチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(4-n-ペンチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-(2-n-ヘキシルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,4-ジメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,3-ジメチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2,4,6-トリメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-メチルフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2,4-ジメチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシカルボニル基等のチアゾリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(チアゾール環上には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0168】

テトラゾリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(テトラゾール環上には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、2-(5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、3-(5-(1H)-テトラゾリル)プロポキシカルボニル基、4-(5-(1H)-テトラゾリル)ブトキシカルボニル基、5-(5-(1H)-テトラゾリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(5-(1H)-テトラゾリル)ヘキシルオキシカルボニル基、1-メチル-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-エチル-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-n-プロピル-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-n-ブチル-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-n-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-n-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(2-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(3-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-

10

20

30

40

50

(4-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(2-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(3-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(4-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(2-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(3-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-(4-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメトキシカルボニル基、2-(1-メチル-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-エチル-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-プロピル-5-(1H)-テトラゾリル)メトキシカルボニル基、2-(1-ブチル-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(2,4-ジフルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(3-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(4-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(3-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(4-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(2-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(3-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基、2-(1-(4-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エトキシカルボニル基等のテトラゾリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(テトラゾール環上には、置換基としてC1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、1~5個、好ましくは1~3個のハロゲン原子が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0169】

2,3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシカルボニル基としては、例えば、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イルオキシカルボニル基、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0170】

アダマンタン置換C1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、アダマンタン-1-イルメトキシカルボニル基、2-(アダマンタン-1-イル)エトキシカルボニル基、3-(アダマンタン-1-イル)プロポキシカルボニル基、4-(アダマンタン-1-イル)ブトキシカルボニル基、5-(アダマンタン-1-イル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(アダマンタン-1-イル)ヘキシルオキシカルボニル基等が挙げられる。

【0171】

フェニルC3~6アルキニルオキシカルボニル基としては、例えば、2-フェニルエチニルオキシカルボニル基、3-フェニル-2-プロピニルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブチン-1-イルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブチン-2-イルオキシカルボニル基、5-フェニル-4-ペンチンル-1-イルオキシカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0172】

フェニルチオC1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、フェニルチオメトキシカルボニル基、2-フェニルチオエトキシカルボニル基、1-フェニルチオエトキシカルボニル基、3-(フェニルチオ)プロポキシカルボニル基、4-(フェニルチオ)ブトキシカルボニル基、5-(フェニルチオ)ペンチルオキシカルボニル基、6-(フェニルチオ)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0173】

フェニルC1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、

10

20

30

40

50

ベンジルオキシメトキシカルボニル基、2-ベンジルオキシエトキシカルボニル基、3-（ベンジルオキシ）プロポキシカルボニル基、4-（ベンジルオキシ）ブトキシカルボニル基、5-（ベンジルオキシ）ペンチルオキシカルボニル基、6-（ベンジルオキシ）ヘキシルオキシカルボニル基、2-フェニルエトキシメトキシカルボニル基、2-フェニルエトキシエトキシカルボニル基、3-（2-フェニルエトキシ）プロポキシカルボニル基、4-（2-フェニルエトキシ）ブトキシカルボニル基、5-（2-フェニルエトキシ）ペンチルオキシカルボニル基、6-（2-フェニルエトキシ）ヘキシルオキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシメトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシエトキシカルボニル基、3-（3-フェニルプロポキシ）プロポキシカルボニル基、4-（3-フェニルプロポキシ）ブトキシカルボニル基、5-（3-フェニルプロポキシ）ペンチルオキシカルボニル基、6-（3-フェニルプロポキシ）ヘキシルオキシカルボニル基、4-フェニルブトキシメトキシカルボニル基、4-フェニルブトキシエトキシカルボニル基、3-（4-フェニルブトキシ）プロポキシカルボニル基、4-（4-フェニルブトキシ）ブトキシカルボニル基、5-（4-フェニルブトキシ）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-フェニルブトキシ）ヘキシルオキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシメトキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシエトキシカルボニル基、3-（5-フェニルペンチルオキシ）プロポキシカルボニル基、4-（5-フェニルペンチルオキシ）ブトキシカルボニル基、5-（5-フェニルペンチルオキシ）ペンチルオキシカルボニル基、6-（5-フェニルペンチルオキシ）ヘキシルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシメトキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシエトキシカルボニル基、3-（6-フェニルヘキシルオキシ）プロポキシカルボニル基、4-（6-フェニルヘキシルオキシ）ブトキシカルボニル基、5-（6-フェニルヘキシルオキシ）ペンチルオキシカルボニル基、6-（6-フェニルヘキシルオキシ）ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

10

20

【0174】

C2～6アルケニルオキシカルボニル基としては、例えば、ビニルオキシカルボニル基、2-プロペニルオキシカルボニル基（慣用名：アリルオキシカルボニル基）、2-ブテン-1-イルオキシカルボニル基、3-ブテン-1-イルオキシカルボニル基、4-ペンテン-1-イルオキシカルボニル基、3-ペンテン-1-イルオキシカルボニル基、5-ヘキセン-1-イルオキシカルボニル基、4-ヘキセン-1-イルオキシカルボニル基、3-ヘキセン-1-イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

30

【0175】

C2～6アルキニルオキシカルボニル基としては、例えば、アセチレンオキシカルボニル基、2-プロピニルオキシカルボニル基、2-ブチン-1-イルオキシカルボニル基、3-ブチン-1-イルオキシカルボニル基、4-ペンチン-1-イルオキシカルボニル基、3-ペンチン-1-イルオキシカルボニル基、5-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基、4-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基、3-ヘキシン-1-イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0176】

C3～8シクロアルキル置換C1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、シクロプロピルメトキシカルボニル基、シクロブチルメトキシカルボニル基、シクロペンチルメトキシカルボニル基、シクロヘキシルメトキシカルボニル基、シクロヘプチルメトキシカルボニル基、シクロオクチルメトキシカルボニル基、2-シクロプロピルエトキシカルボニル基、2-シクロブチルエトキシカルボニル基、2-シクロペンチルエトキシカルボニル基、2-シクロヘキシルエトキシカルボニル基、2-シクロヘプチルエトキシカルボニル基、3-シクロプロピルプロポキシカルボニル基、3-シクロブチルプロポキシカルボニル基、3-シクロペンチルプロポキシカルボニル基、3-シクロヘキシルプロポキシカルボニル基、3-シクロヘプチルプロポキシカルボニル基、3-シクロオクチルプロポキシカルボニル基、4-シクロプロピルブトキシカルボニル基、4-シクロブチルブトキシカルボニル基、4-シクロヘキシルブトキシカルボニル基、5-シクロヘキシルペンチ

40

50

ルオキシカルボニル基、6-シクロヘキシルヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0177】

ベンゾイル置換C1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンゾイルメトキシカルボニル基、2-ベンゾイルエトキシカルボニル基、1-ベンゾイルエトキシカルボニル基、3-(ベンゾイル)プロポキシカルボニル基、4-(ベンゾイル)ブトキシカルボニル基、5-(ベンゾイル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(ベンゾイル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0178】

フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2-ヨードフェノキシ基、3-ヨードフェノキシ基、4-ヨードフェノキシ基、2,3-ジフルオロフェノキシ基、3,4-ジフルオロフェノキシ基、3,5-ジフルオロフェノキシ基、2,4-ジフルオロフェノキシ基、2,6-ジフルオロフェノキシ基、2,3-ジクロロフェノキシ基、3,4-ジクロロフェノキシ基、3,5-ジクロロフェノキシ基、2,4-ジクロロフェノキシ基、2,6-ジクロロフェノキシ基、2,3,4-トリフルオロフェノキシ基、3,4,5-トリフルオロフェノキシ基、2,4,5-トリクロロフェノキシ基、2,4,6-トリフルオロフェノキシ基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ基、2,4,6-トリクロロフェノキシ基、2-フルオロ-4-クロロフェノキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ基、3-フルオロ-4-クロロフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2,6-ジメチルフェノキシ基、2,4,6-トリメチルフェノキシ基、2-メチル-3-クロロフェノキシ基、3-メチル-4-クロロフェノキシ基、2-クロロ-4-メチルフェノキシ基、2-メチル-3-フルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、3,5-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、3,4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2,4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、4-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2-イソプロピルフェノキシ基、3-イソプロピルフェノキシ基、4-イソプロピルフェノキシ基、2-tert-ブチルフェノキシ基、3-tert-ブチルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、2-sec-ブチルフェノキシ基、3-sec-ブチルフェノキシ基、4-sec-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-ペンチルフェノキシ基、4-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、2-メトキシ-3-クロロフェノキシ基、2-フルオロ-3-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシ基、2,3,4-トリクロロフェノキシ基、3,4,5-トリフルオロフェノキシ基、2,4,6-トリクロロフェノキシ基、2,4-ジメチルフェノキシ基、2,3-ジメチルフェノキシ基、3,5-ジメチルフェノキシ基、2,5-ジメチルフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2,4-ジメトキシフェノキシ基、2,3-ジメトキシフェノキシ基、3,5-ジメトキシフェノキシ基、2,5-ジメトキシフェノキシ基、2,4,6-トリメトキシフェノキシ基、3,5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-メチル-4-フ

10

20

30

40

50

ルオロフェノキシ基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基等のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

【0179】

8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクチル基(8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。))が置換していてもよい。)としては、例えば、8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-8-イル基、3-(3-クロロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(4-ブromoフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-8-イル基、3-(2-フルオロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-8-イル基、3-(3-ヨードフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-8-イル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(3-メチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(4-メトキシフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(3-トリフルオロメチル-4-フルオロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(2-トリフルオロメトキシ-3-クロロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(2, 4-ジフルオロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン-1-イル基等の8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクチル基(8-アザビシクロ[3, 2, 1]オクタン環上には、置換基としてフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。))を少なくとも1種が置換していてもよい。)を挙げることができる。

【0180】

ピリジル基[ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基を少なくとも1個が置換していてもよい]としては、例えば、ピリジン-3-イル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-4-イル基、4-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル基、5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル基、2-トリフルオ

10

20

30

40

50

ロメチルピリジン-3-イル基、2, 4-ジメチルピリジン-3-イル基、3, 4, 5-トリメチルピリジン-2-イル基、4-エチルピリジン-2-イル基、3-n-ブチルピリジン-2-イル基、5-n-ペンチルピリジン-2-イル基、4-n-ヘキシルピリジン-2-イル基等のピリジル基（ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0181】

R⁴⁷及びR⁴⁸が隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する5~7員環の飽和複素環（該複素環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい。）としては、例えば、ピロリジニル基、モルホリノ基、チオモルホリノ基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ホモピペラジニル基、4-フェニルピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリジン-1-イル基、4-(3-クロロフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリジン-1-イル基、4-(3-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(4-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(4-メチルフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(3-メトキシフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(3, 4-ジメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(2, 4-ジメチルフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)ピペラジン-1-イル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(4-メチルフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(3-メトキシフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(3, 4-ジメトキシフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(2, 4-ジメチルフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)ピペリジン-1-イル基、4-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)ピペリジン-1-イル基、3-(4-メチルフェニル)モルホリノ基、3-(3-メトキシフェニル)ピロリジニル-1-イル基、2-(4-メチルフェニル)ピロリジニル-1-イル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)ホモピペラジン-1-イル基、4-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)チオモルホリノ基、2, 4-ジフェニルピペラジン-1-イル基、2, 4, 6-トリフェニルピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリジン-1-イル基、3-(3-クロロフェニル)ピロリジン-1-イル基、3-(4-クロロフェニル)モルホリノ基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)ホモピペラジン-1-イル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)チオモルホリノ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピロリジン-1-イル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)モルホリノ基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ホモピペラジン-1-イル基、3-フェニルピロリジン-1-イル基、4-(3-クロロフェニル)モルホリノ基、4-(4-クロロフェニル)ホモピペリジン-1-イル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)チオモルホリノ基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピロリジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ホモピペラジン-1-イル基、3-フェニルチオモルホリノ基、4-フェニルモルホリノ基等の複素環上に置

10

20

30

40

50

換基としてフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していてもよい。）を 1～3 個置換していてもよい上記複素環を挙げることができる。

【0182】

フェニル C 1～6 アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換されていてもよい）とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換されていてもよいフェニル C 1～6 アルコキシ基であって、例えば、ベンジルオキシ基、2-フェニルエトキシ基、3-フェニルプロポキシ基、2-フェニルプロポキシ基、4-フェニルブトキシ基、5-フェニルペントキシ基、4-フェニルペントキシ基、6-フェニルヘキシルオキシ基、2-フルオロベンジルオキシ基、3-フルオロベンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、2-（2-フルオロフェニル）エトキシ基、2-（3-フルオロフェニル）エトキシ基、2-（4-フルオロフェニル）エトキシ基、2-クロロベンジルオキシ基、3-クロロベンジルオキシ基、4-クロロベンジルオキシ基、2-フルオロ-4-ブromoベンジルオキシ基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシ基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシ基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシ基、4-イソプロピルベンジルオキシ基、4-n-ブチルベンジルオキシ基、4-メチルベンジルオキシ基、2-メチルベンジルオキシ基、3-メチルベンジルオキシ基、2, 4-ジメチルベンジルオキシ基、2, 3-ジメチルベンジルオキシ基、2, 6-ジメチルベンジルオキシ基、3, 5-ジメチルベンジルオキシ基、2, 5-ジメチルベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシ基、4-イソプロポキシベンジルオキシ基、4-n-ブトキシベンジルオキシ基、4-メトキシベンジルオキシ基、2-メトキシベンジルオキシ基、3-メトキシベンジルオキシ基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 6-ジメトキシベンジルオキシ基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 5-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-イソプロポキシベンジルオキシ基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシ基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2-（2-クロロフェニル）エトキシ基、2-（3-クロロフェニル）エトキシ基、2-（4-クロロフェニル）エトキシ基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-（2-トリフルオロメチルフェニル）エトキシ基、2-（3-トリフルオロメチルフェニル）エトキシ基、2-（4-トリフルオロメチルフェニル）エトキシ基、2-（2-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシ基、2-（3-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシ基、2-（4-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシ基、3-（2-トリフルオロメチルフェニル）プロポキシ基、3-（3-トリフルオロメチルフェニル）プロポキシ基、3-（4-トリフルオロメチルフェニル）プロポキシ基、3-（2-トリフルオロメチルフェニル）プロポキシ基、3-（3-トリフルオロメトキシフェニル）プロポキシ基、3-（4-トリフルオロメトキシフェニル）プロポキシ基、4-（3-トリフルオロメチルフェニル）ブトキシ基、5-（4-トリフルオロメチルフェニル）ペントキシ基、4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ペントキシ基、4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ペントキシ基、6-（3-トリフルオロメチルフェニル）ヘキシルオキシ基、6-（4-トリフルオロメチルフェニル）ヘキシルオキシ基、6-（4-トリ

10

20

30

40

50

リフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

【0183】

アミノ置換C 2～6 アルケニル基 (該アミノ基には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれる基を少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、アミノビニル基、3-アミノ-2-プロペニル基、3-アミノ-1-プロペニル基、4-アミノ-3-ブテニル基、4-アミノ-3-ブテニル基、5-アミノ-4-ペンテニル基、6-アミノ-5-ヘキセニル基、メチルアミノビニル基、3-メチルアミノ-2-プロペニル基、3-メチルアミノ-1-プロペニル基、4-メチルアミノ-3-ブテニル基、4-メチルアミノ-3-ブテニル基、5-メチルアミノ-4-ペンテニル基、6-メチルアミノ-5-ヘキセニル基、メチルアミノビニル基、3-メチルアミノ-2-プロペニル基、3-ジメチルアミノ-2-プロペニル基、3-エチルアミノ-1-プロペニル基、3-ジエチルアミノ-1-プロペニル基、4-エチルアミノ-3-ブテニル基、4-ジメチルアミノ-3-ブテニル基、4-ジエチルアミノ-3-ブテニル基、5-エチルアミノ-4-ペンテニル基、6-エチルアミノ-5-ヘキセニル基、n-プロピルアミノビニル基、3-n-プロピルアミノ-2-プロペニル基、3-n-プロピルアミノ-1-プロペニル基、4-n-プロピルアミノ-3-ブテニル基、4-n-プロピルアミノ-3-ブテニル基、5-n-プロピルアミノ-4-ペンテニル基、6-n-プロピルアミノ-5-ヘキセニル基、n-ブチルアミノビニル基、3-n-ブチルアミノ-2-プロペニル基、3-n-ブチルアミノ-1-プロペニル基、4-n-ブチルアミノ-3-ブテニル基、4-n-ブチルアミノ-3-ブテニル基、5-n-ブチルアミノ-4-ペンテニル基、6-n-ブチルアミノ-5-ヘキセニル基、n-ペンチルアミノビニル基、3-n-ペンチルアミノ-2-プロペニル基、3-n-ヘキシルアミノ-1-プロペニル基、4-n-ヘキシルアミノ-3-ブテニル基、4-n-ヘキシルアミノ-3-ブテニル基、5-n-ヘキシルアミノ-4-ペンテニル基、6-n-ペンチルアミノ-5-ヘキセニル基、フェニルアミノビニル基、3-フェニルアミノ-2-プロペニル基、3-フェニルアミノ-1-プロペニル基、4-フェニルアミノ-3-ブテニル基、4-フェニルアミノ-3-ブテニル基、5-フェニルアミノ-4-ペンテニル基、6-フェニルアミノ-5-ヘキセニル基、4-クロロフェニルアミノビニル基、3-(4-ブロモフェニル)アミノ-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)アミノ-1-プロペニル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)アミノ-3-ブテニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)アミノ-3-ブテニル基、4-(4-フルオロフェニル)アミノ-3-ブテニル基、5-(4-ヨードフェニル)アミノ-4-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル)アミノ-5-ヘキセニル基、(3-メチルフェニル)アミノビニル基、(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノビニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-2-プロペニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-1-プロペニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-3-ブテニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-3-ブテニル基、5-(3, 4-ジメチルフェニル)アミノ-4-ペンテニル基、6-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)アミノ-5-ヘキセニル基、(2-メトキシフェニル)アミノビニル基、(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノビニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)アミノ-1-プロペニル基、4-(2, 5-ジメトキシフェニル)アミノ-3-ブテニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)アミノ-3-ブテニル基、5-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]-4-ペンテニル基、6-[N-エチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ]-5-ヘキセニル基等のアミノ置換C 2～6 アルケニル基 (該アミノ基には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～

10

20

30

40

50

5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。] からなる群より選ばれる基が1～2個置換していてもよい。) を挙げることができる。

【0184】

オキサゾリジニル基（オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい。）としては、例えば、オキサゾリジン-4-イル基、オキサゾリジン-5-イル基、2-オキソオキサゾリジン-4-イル基、2-オキソオキサゾリジン-5-イル基等を挙げることができる。

【0185】

フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基；アミノ基（アミノ基上には、C1～6アルキル基及びフェニルC1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。〕なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジル基、

10

20

30

40

50

2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフル
 オロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチ
 ルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジ
 ル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-
 ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペ
 ンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、
 2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェ
 ニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリ
 フルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチ
 ル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオ
 ロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基
 、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチル
 フェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-
 トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニ
 ル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペ
 ンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェ
 ニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-ト
 リフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペン
 チル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオ
 ロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、
 6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、2-アミノベンジル基、2, 4-
 ジアミノベンジル基、2, 4, 6-トリアミノベンジル基、2-メチルアミノベンジル
 基、2-ベンジルアミノベンジル基、2-フルオロベンジルアミノベンジル基、3-フル
 オロベンジルアミノベンジル基、4-フルオロベンジルアミノベンジル基、2-クロロベ
 ンジル基、3-クロロベンジルアミノベンジル基、4-クロロベンジルアミノベンジル基
 、2-ブロモベンジルアミノベンジル基、3-ブロモベンジルアミノベンジル基、4-ブ
 ロモベンジルアミノベンジル基、2-ヨードベンジルアミノベンジル基、3-ヨードベン
 ジルアミノベンジル基、4-ヨードベンジルアミノベンジル基、2, 3-ジフルオロベン
 ジルアミノベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジフル
 オロベンジルアミノベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルアミノベ
 ンジル基、2, 4-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル
 アミノベンジル基、2, 3-ジクロロベンジルアミノベンジル基、3, 4-ジクロロベン
 ジルアミノベンジル基、3, 5-ジクロロベンジルアミノベンジル基、2, 4-ジクロロ
 ベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジクロロベンジルアミノベンジル基、2-フルオロ
 -4-ブロモベンジルアミノベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルアミノベン
 ジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルアミノベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロ
 ベンジルアミノベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルアミノベンジル基、4-イ
 ソプロピルベンジルアミノベンジル基、4-n-ブチルベンジルアミノベンジル基、4-
 メチルベンジルアミノベンジル基、2-メチルベンジルアミノベンジル基、3-メチルベ
 ンジルアミノベンジル基、2, 4-ジメチルベンジルアミノベンジル基、2, 3-ジメチ
 ルベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジメチルベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジ
 メチルベンジルアミノベンジル基、2, 5-ジメチルベンジルアミノベンジル基、2, 4
 , 6-トリメチルベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルア
 ミノベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルアミノベンジル基、4-
 イソプロポキシベンジルアミノベンジル基、4-n-ブトキシベンジルアミノベンジル基
 、4-メトキシベンジルアミノベンジル基、2-メトキシベンジルアミノベンジル基、3-
 メトキシベンジルアミノベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、
 2, 3-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジルアミノベン
 ジル基、3, 5-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジルア
 ミノベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジトリ

10

20

30

40

50

フルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、2-イソプロポキシベンジルアミノベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルアミノベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジルアミノベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジルアミノベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、アミノベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジルアミノベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジルアミノベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、3-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)ベンジル基、4-(ジベンジルアミノ)ベンジル基、2-ジメチルアミノベンジル基、3-ジメチルアミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(2-ジメチルアミノフェニル)エチル基、2-(3-ジメチルアミノフェニル)エチル基、2-(4-ジメチルアミノフェニル)エチル基、3-(2-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、3-(3-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、3-(4-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、2-フェノキシベンジル基、2, 3-ジフェノキシベンジル基、2, 4, 6-トリフェノキシベンジル基、2-(2-フルオロフェノキシ)ベンジル基、3-(3-フルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(4-フルオロフェノキシ)ベンジル基、2-(2-クロロフェノキシ)ベンジル基、3-(3-クロロフェノキシ)ベンジル基、4-(4-クロロフェノキシ)ベンジル基、2-(2-ブロモフェノキシ)ベンジル基、3-(3-ブロモフェノキシ)ベンジル基、4-(4-ブロモフェノキシ)ベンジル基、2-(2-ヨードフェノキシ)ベンジル基、3-(3-ヨードフェノキシ)ベンジル基、4-(4-ヨードフェノキシ)ベンジル基、3-(2, 3-ジフルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(3, 4-ジフルオロフェノキシ)ベンジル基、2-(3, 5-ジフルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ)ベンジル基、2-(2, 4-ジフルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 6-ジフルオロフェノキシ)ベンジル基、3-(2, 3-ジクロロフェノキシ)ベンジル基、2-(3, 4-ジクロロフェノキシ)ベンジル基、4-(3, 5-ジクロロフェノキシ)ベンジル基、3-(2, 4-ジクロロフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 6-ジクロロフェノキシ)ベンジル基、4-(2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ)ベンジル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 3, 4-トリクロロフェノキシ)ベンジル基、4-(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)ベンジル基、2-(4-イソプロピルフェノキシ)ベンジル基、3-(4-n-ブチルフェノキシ)ベンジル基、4-(4-メチルフェノキシ)ベンジル基、3-(2-メチルフェノキシ)ベンジル基、2-(3-メチルフェノキシ)ベンジル基、2-(2, 4-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、3-(2, 3-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 6-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、2-(3, 5-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、3-(2, 5-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、2-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)ベンジル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ)ベンジル基、2-(4-イソプロポキシフェノキシ)ベンジル基、2-(4-n-ブトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(4-メトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(2-メトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(3-メトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(2, 4-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(2, 3-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 6-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3, 5-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(2, 5-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、

10

20

30

40

50

シ) ベンジル基、3-(2-イソプロポキシフェノキシ)ベンジル基、4-(3-クロロ-4-メトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3-メチル-4-フルオロフェノキシ)ベンジル基、3-(4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)ベンジル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)ベンジル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)ベンジル基、2-[3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル]エチル基、2-[3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル]エチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル]エチル基、3-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル]プロピル基、4-[3-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)フェニル]ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル]ペンチル基、6-[2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル]ヘキシル基、4-(1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(1-ピペリジニル)ベンジル基、4-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(4-(3-クロロベンジル)-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(4-(2,4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(4-(2,4-ジベンジル-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(2,3,4-トリベンジル-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-(4-アニリノ-1-ピペリジニル)ベンジル基、4-(4-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル)ベンジル基、4-[4-(N-メチルアニリノ)-1-ピペリジニル]ベンジル基、4-[4-(N-メチル-3-クロロアニリノ)-1-ピペリジニル]ベンジル基、4-[4-(2,4-ジメチルアニリノ)-1-ピペリジニル]ベンジル基、4-[4-(N-メチル-2,4,6-トリメトキシアニリノ)-1-ピペリジニル]ベンジル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシアニリノ)-1-ピペリジニル]ベンジル基、4-[4-(N-メチル-3-トリフルオロメチルアニリノ)-1-ピペリジニル]ベンジル基、4-(3,4-ジアニリノ-1-ピペリジニル)ベンジル基、4-(3,4,5-トリアニリノ-1-ピペリジニル)ベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]；ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基；アミノ基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)；ピペラジニル基[ピペラジン環上には、置換基としてフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が1~3個置換していてもよい]及びピペリジル基[ピペリジン環上には、1~3個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換してい

10

20

30

40

50

てもよい) 及び C 1 ～ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基が 1 ～ 2 個置換していてもよい。] なる群より選ばれた基が 1 ～ 5 個、好ましくは 1 ～ 3 個置換していてもよい) を挙げることができる。

【0186】

アミノ C 1 ～ 6 アルキル基 (アミノ基上には、C 1 ～ 6 アルキル基、C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子もしくはハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) としては、例えば、アミノメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチル-3-アミノプロピル基、1, 1-ジメチル-2-アミノエチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、3-(メチルアミノ)プロピル基、4-(メチルアミノ)ブチル基、5-(メチルアミノ)ペンチル基、6-(メチルアミノ)ヘキシル基、2-(N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ)エチル基、3-(N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ)プロピル基、4-(N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ)ブチル基、5-(N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ)ペンチル基、6-(N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ)ヘキシル基、2-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)エチル基、3-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)プロピル基、4-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)ブチル基、5-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)ペンチル基、6-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)ヘキシル基、2-[N-メチル-N-(n-プロポキシカルボニルアミノ)]エチル基、3-[N-メチル-N-(n-プロポキシカルボニルアミノ)]プロピル基、4-[N-メチル-N-(N-プロポキシカルボニルアミノ)]ブチル基、5-[N-メチル-N-(n-プロポキシカルボニルアミノ)]ペンチル基、6-[N-メチル-N-(n-プロポキシカルボニルアミノ)]ヘキシル基、2-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]エチル基、3-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]プロピル基、4-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]ブチル基、5-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]ペンチル基、6-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]ヘキシル基、2-[N-メチル-N-(n-ペントキシカルボニルアミノ)]エチル基、2-[N-メチル-N-(n-ヘキシルオキシカルボニルアミノ)]エチル基、2-(N-メチルアニリノ)エチル基、3-(N-メチルアニリノ)プロピル基、4-(N-メチルアニリノ)ブチル基、2-(N-メチル-4-クロロアニリノ)エチル基、3-(N-メチル-4-クロロアニリノ)プロピル基、4-(N-メチル-4-クロロアニリノ)ブチル基、2-(4-フルオロ-N-メチルアニリノ)エチル基、3-(4-フルオロ-N-メチルアニリノ)プロピル基、2-(3-フルオロ-N-メチルアニリノ)エチル基、3-(3-フルオロ-N-メチルアニリノ)プロピル基、4-(3-フルオロ-N-メチルアニリノ)ブチル基、2-(2-フルオロ-N-メチルアニリノ)エチル基、3-(2-フルオロ-N-メチルアニリノ)プロピル基、4-(2-フルオロ-N-メチルアニリノ)ブチル基、2-(2-クロロ-N-メチルアニリノ)エチル基、3-(2-クロロ-N-メチルアニリノ)プロピル基、4-(2-クロロ-N-メチルアニリノ)ブチル基、2-(3-クロロ-N-メチルアニリノ)エチル基、3-(3-クロロ-N-メチルアニリノ)プロピル基、4-(3-クロロ-N-メチルアニリノ)ブチル基、2-(4-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ)エチル基、2-(4-メチルアニリノ)エチル基、2-(3, 5-ジトリフルオロメチル-N-エトキシカルボニルアニリノ)エチル基、2-(3, 5-ジトリフルオロメチル-N-メチルアニリノ)エチル基、2-(2, 4-ジメチル-N-メチルアニリノ)エチル基、2-(3, 5-ジメトキシ-N-メチルアニリノ)エチル基、2-(2, 4, 6-トリメチルアニリノ)エチル基、2-(3, 4, 5-トリメトキシアニリノ)エチル基、3-(4-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ)ブチル基、2

10

20

30

40

50

ー（3-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（3-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）プロピル基、2-（2-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（2-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（2-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）ブチル基、2-（4-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（4-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（4-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）ブチル基、2-（3-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（3-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（3-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）ブチル基、2-（2-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（2-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（2-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ）ブチル基、2-（4-メトキシ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（4-メトキシ-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（4-メトキシ-N-メチルアニリノ）ブチル基、2-（3-メトキシ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（3-メトキシ-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（3-メトキシ-N-メチルアニリノ）ブチル基、2-（2-メトキシ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（2-メトキシ-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（2-メトキシ-N-メチルアニリノ）ブチル基等のアミノC1～6アルキル基（アミノ基上には、C1～6アルキル基、C1～6アルコキシカルボニル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲンもしくはハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0187】

フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]及びC1～6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、2,3,4-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,4,6-トリフルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2,4,6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、3-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2,4-ジメトキシカルボニルフェニル基、2,4,6-トリメトキシカルボニルフェニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-プロポキシカルボニルフェニル基、3-プロポキシカルボニルフェニル基、4-プロポキシカルボニルフェニル基、2-ブトキシカルボニルフェニル基、3-ブトキシカルボニルフェニル基、4-ブトキシカルボニルフェニル基、4-ペントキシカルボニルフェニル基、4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-（2-クロロフェノキシ）フェニル基、2-（3-クロロフェノキシ）フェニル基、2-（4-クロロフェノキシ）フェニル基、3-（2-クロロフェノキシ）フェニル基、3-（3-クロロフェノキシ）フェニル基、3-（4-クロロフェノキシ）フェニル基、4-（2-クロロフェノキシ）フェニル基、4-（2,4-ジクロロフェノキシ）フェニル基、

10

20

30

40

50

ル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)フェニル基、4-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-メチルフェノキシ)フェニル基、3-(2, 4-ジメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-メトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2, 4-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、等のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）及びC 1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0188】

フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、例えばベンジルオキシカルボニル基、1-フェネチルオキシカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシカルボニル基、4-フェニルペンチルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-ブromoベンジルオキシカルボニル基、3-ブromoベンジルオキシカルボニル基、4-ブromoベンジルオキシカルボニル基、2-ヨードベンジルオキシカルボニル基、3-ヨードベンジルオキシカルボニル基、4-ヨードベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、パーフルオロベンジルオキシカルボニル基、2-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキ

10

20

30

40

50

シカルボニル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-ブromo-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、(2-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、(3-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、等のフェニルC 1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0189】

フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい)としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フ

10

20

30

40

50

エニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペン
 トキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジル
 オキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジル
 オキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、1-(3-
 フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロフェニル)エトキシカル
 ボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニ
 ル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-ブロモフェニル)エトキシカル
 ボニル基、1-(3-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ヨードフェ
 ニル)エトキシカルボニル基、2-(2,3-ジクロロフェニル)エトキシカルボニル基
 、(2,4,6-トリクロロフェニル)メトキシカルボニル基、(2,3,4,5,6-
 ペンタフルオロフェニル)メトキシカルボニル基、2-シアノベンジルオキシカルボニル
 基、3-シアノベンジルオキシカルボニル基、4-シアノベンジルオキシカルボニル基、
 2,4-ジシアノベンジルオキシカルボニル基、3,4,5-トリシアノベンジルオキシ
 カルボニル基、2-シアノフェニルエトキシカルボニル基、3-シアノフェニルエトキシ
 カルボニル基、4-シアノフェニルエトキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカル
 ボニル基、2,4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2,4,6-トリメチルベ
 ンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルキシカルボニル基、3-トリ
 フルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ
 カルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2,4-ジメトキシベンジル
 オキシカルボニル基、2,4,6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリ
 フルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシ
 カルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリ
 フルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニ
 ル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル
 基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリ
 フルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフ
 エニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカル
 ボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-
 トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメ
 トキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)
 プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボ
 ニル基、3-(4-ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ビフェニリル)
 ブトキシカルボニル基、5-(4-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、4-(3-
 トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフ
 エニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシ
 カルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペントキシカルボニル基、6-
 (3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフル
 オロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシ
 フェニル)ヘキシルオキシカルボニル基等のフェニルC1~6アルコキシカルボニル基(

10

20

30

40

【0190】

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もし
 くは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して
 いてもよい)とは、無置換のフェニルC1~6アルキル基及びそれらの基を構成するフェ
 ニル環がハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群
 より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されている基であって、例えば、ベ
 ンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニ
 ルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル

50

基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-メチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0191】

ピペリジニルC1~6アルキル基（ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）が置換していてもよい）としては、例えば、ピペリジン-1-イルメチル基、ピペリジン-2-イルエチル基、ピペリジン-3-イルプロピル基、ピペリジン-4-イルブチル基、ピペリジン-1-イルペンチル基、ピペリジン-2-イルヘキシル基、4-フェノキシピペリジン-1-イルメチル基、2-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)エチル基、3-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)プロピル基、4-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)ブチル基、5-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)ペンチル基、6-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)ヘキシル基、4-(3-メチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2, 5-ジメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチル基、3-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロピル基、4-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ブチル基、5-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル基、6-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ヘキシル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチル基、3-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロピル基、4-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ブチル基、5-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル基、6-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ヘキシル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチル基、3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロピル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル基、6-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ヘキシル基等のピペリジニルC1~6アルキル基（ピペリジン環上には、置換基としてフェノキシ基（フェニル環上には、

10

20

30

40

50

置換基としてハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基が1～5個、好ましくは1～3個有していてもよい)を少なくとも1個有していてもよい)を挙げることができる。

【0192】

フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基;置換基としてC 1～6アルキル基及びフェニルC 1～6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれる基を有することのあるアミノ基;フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];フェニルC 1～6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]及びピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC 1～6アルキル基なる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、3, 4, 5-トリメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-

10

20

30

40

50

ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル
 基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、
 3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェ
 ニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、3-アミノフ
 ェニル基、4-メチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、3-メチルア
 ミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-エチルアミノフェニル基、4-ジ
 エチルアミノフェニル基、4-n-プロピルアミノフェニル基、4-ジ-n-プロピルアミ
 ノフェニル基、4,4-n-ブチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ブチルアミノフェニル
 基、4-n-ペンチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ペンチルアミノフェニル基、4-n
 -ヘキシルアミノフェニル基、4-ジ-n-ヘキシルアミノフェニル基、4-ベンジルア
 ミノフェニル基、4-(2-フルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-フルオロ
 ベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-フルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(
 2,3-ジフルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,4-ジフルオロベンジルア
 ミノ)フェニル基、4-(3,4-ジフルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(3,
 5-ジフルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-クロロベンジルアミノ)フェニ
 ル基、4-(3-クロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-クロロベンジルアミノ
)フェニル基、4-(2-ブロモベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-ブロモベンジ
 ルアミノ)フェニル基、4-(4-ブロモベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,3-
 ジクロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,4-ジクロロベンジルアミノ)フェニ
 ル基、4-(3,4-ジクロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(3,5-ジクロロベ
 ンジルアミノ)フェニル基、4-(2-メチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-
 メチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-メチルベンジルアミノ)フェニル基、4-
 -(2-エチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-エチルベンジルアミノ)フェニ
 ル基、4-(4-エチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-n-プロピルベンジ
 ルアミノ)フェニル基、4-(4-tert-ブチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(
 4-n-ブチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルベンジルア
 ミノ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(
 4-トリフルオロメチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエチル
 ベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ)フェニ
 ル基、4-(2,3-ジメチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3,4,5-トリメ
 チルベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-ペンチルベンジルアミノ)フェニル基、4-
 -(4-ヘキシルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-メトキシベンジルアミノ)フェ
 ニル基、4-(3,5-ジメトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,4,6-
 トリメトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシベンジ
 ルアミノ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-
 -(4-トリフルオロメトキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエ
 トキシベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジルアミ
 ノ)フェニル基、4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ)フェニル基、フェ
 ネチルアミノ)フェニル基、4-(2-フルオロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-
 フルオロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(4-フルオロフェネチルアミノ)フェ
 ニル基、4-(2,3-ジフルオロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2,4-ジフル
 オロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3,4-ジフルオロフェネチルアミノ)フェ
 ニル基、4-(3,5-ジフルオロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2-クロロ
 フェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-クロロフェネチルアミノ)フェニル基、4-
 -(4-クロロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2-ブロモフェネチルアミノ)フェ
 ニル基、4-(3-ブロモフェネチルアミノ)フェニル基、4-(4-ブロモフェネチル
 アミノ)フェニル基、4-(2,3-ジクロロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2,
 4-ジクロロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3,4-ジクロロフェネチルアミ
 ノ)フェニル基、4-(3,5-ジクロロフェネチルアミノ)フェニル基、4-(2-メ
 チルフェネチルアミノ)フェニル基、4-(3-メチルフェネチルアミノ)フェニル基、

10

20

30

40

50

4-（4-メチルフェネチルアミノ）フェニル基、4-（4-エチルフェネチルアミノ）
フェニル基、4-（4-プロピルフェネチルアミノ）フェニル基、4-（4-tert
ブチルフェネチルアミノ）フェニル基、4-（2-トリフルオロメチルフェネチルアミノ
）フェニル基、4-（3-トリフルオロメチルフェネチルアミノ）フェニル基、4-（4
-トリフルオロメチルフェネチルアミノ）フェニル基、4-（2-ペンタフルオロエチル
フェネチルアミノ）フェニル基、4-（3-ペンタフルオロエチルフェネチルアミノ）フ
ェニル基、4-（2，3-ジメチルフェネチルアミノ）フェニル基、4-（2-トリフル
オロメトキシフェネチルアミノ）フェニル基、4-（3-トリフルオロメトキシフェネチ
ルアミノ）フェニル基、4-（4-トリフルオロメトキシフェネチルアミノ）フェニル基
、4-（2-ペンタフルオロエトキシフェネチルアミノ）フェニル基、4-（3-ペンタ
フルオロエトキシフェネチルアミノ）フェニル基、4-（4-ペンタフルオロエトキシフ
ェネチルアミノ）フェニル基、4-（3-フェニルプロピルアミノ）フェニル基、4-[
3-（2-フルオロフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3-フルオロ
フェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（4-フルオロフェニル）プロピル
アミノ] フェニル基、4-[3-（2，3-ジフルオロフェニル）プロピルアミノ] フェ
ニル基、4-[3-（2，4-ジフルオロフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-
[3-（3，4-ジフルオロフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3，
5-ジフルオロフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（2-クロロフェニ
ル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3-クロロフェニル）プロピルアミノ]
フェニル基、4-[3-（4-クロロフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3
-（2-ブロモフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3-ブロモフェニ
ル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（4-ブロモフェニル）プロピルアミノ]
フェニル基、4-[3-（2，3-ジクロロフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4
-[3-（2，4-ジクロロフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3，
4-ジクロロフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3，5-ジクロロフ
ェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（2-メチルフェニル）プロピルアミ
ノ] フェニル基、4-[3-（3-メチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-
[3-（4-メチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（2-エチルフ
ェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3-エチルフェニル）プロピルアミ
ノ] フェニル基、4-[3-（4-エチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-
[3-（4-プロピルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（4-tert
ブチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（4-ブチルフェニル）
プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（2-トリフルオロメチルフェニル）プロピル
アミノ] フェニル基、4-[3-トリフルオロメチルフェニル] プロピルアミノ] フェ
ニル基、4-[3-（4-トリフルオロメチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4
-[3-（2-ペンタフルオロエチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3
-ペンタフルオロエチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（2
，3-ジメチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3，4，5-トリ
メチルフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（4-ペントールフェニル）プ
ロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（4-ヘキシルフェニル）プロピルアミノ] フェ
ニル基、4-[3-（2-トリフルオロメトキシフェニル）プロピルアミノ] フェニル基
、4-[3-トリフルオロメトキシフェニル] プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（4
-トリフルオロメトキシフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（2-
ペンタフルオロエトキシフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（3-ペン
タフルオ

ロエトキシフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-（4-ペンタフルオロエ
トキシフェニル）プロピルアミノ] フェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェ
ノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-（2-クロロフェノキシ）フェニル
基、2-（3-クロロフェノキシ）フェニル基、2-（4-クロロフェノキシ）フェニル
基、3-（2-クロロフェノキシ）フェニル基、3-（3-クロロフェノキシ）フェニル基

10

20

30

40

50

50

ルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ]フェニル基、4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ]フェニル基、4-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシ]フェニル基、3-(ピペリジン-1-イル)フェニル基、2-(4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、2-(3-ベンジルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、2-(4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、2-(4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、2-[4-(4-クロロベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[2-(2,4-ジクロロベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2,4,6-トリクロロベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(4-メチルベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2,4-ジメチルベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2,4,6-トリメチルベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2,4-ジトリフルオロメチルベンジル)ピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-[2,4,6-トリ(トリフルオロメチル)ベンジル]アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(4-メトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2,4-ジメトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(2,4,6-トリメトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(3,5-トリフルオロメトキシベンジル)アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-[2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)ベンジル]アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、4-(4-メチルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-ジメチルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-エチルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-ジエチルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-n-プロピルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-(ジn-プロピルアミノ)ピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-n-ブチルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-[4-(N-エチル-N-メチルアミノ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、4-[4-(N-ベンジル-N-メチルアミノ)ピペリジン-1-イル]フェニル基、4-(4-n-ペンチルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基、4-(4-n-ヘキシルアミノピペリジン-1-イル)フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;置換基としてC1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれる基を1~2個有することのあるアミノ基;フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい];フェニルC1~6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]及びピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれる基が1~2個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0193】

10

20

30

40

50

ビフェニルC 1～6アルコキシ基としては、例えば、1, 1'-ビフェニル-4-イルメトキシ基、2-(1, 1'-ビフェニル-4-イル)エトキシ基、3-(1, 1'-ビフェニル-4-イル)プロポキシ基、4-(1, 1'-ビフェニル-4-イル)ブトキシ基、5-(1, 1'-ビフェニル-4-イル)ペンチルオキシ基、6-(1, 1'-ビフェニル-4-イル)ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

【0194】

フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 3～6アルケニルオキシ基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニルオキシ基（慣用名：シンナミルオキシ基）、4-フェニル-2-ブテニルオキシ基、4-フェニル-3-ブテニルオキシ基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニルオキシ基、4-(2, 3-ジクロロフェニル)-3-ブテニルオキシ基、4-(2, 4-ジクロロフェニル)-3-ブテニルオキシ基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)-3-ブテニルオキシ基、4-(3, 5-ジクロロフェニル)-3-ブテニルオキシ基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニルオキシ基、5-(2, 3-ジクロロフェニル)-4-ペンテニルオキシ基、5-(2, 4-ジクロロフェニル)-4-ペンテニルオキシ基、5-(3, 4-ジクロロフェニル)-4-ペンテニルオキシ基、5-(3, 5-ジクロロフェニル)-4-ペンテニルオキシ基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシ基、6-(2, 3-ジクロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシ基、6-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシ基、6-(3, 4-ジクロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシ基、6-(3, 5-ジクロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシ基等のフェニル環上にハロゲン原子が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよいフェニルC 3～6アルケニルオキシ基を挙げることができる。

【0195】

フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2, 3-ジクロロフェノキシ基、3, 4-ジクロロフェノキシ基、2, 4-ジクロロフェノキシ基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ基、2-シアノフェノキシ基、3-シアノフェノキシ基、4-シアノフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシ基、2, 3-ジシアノフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-エチルフェノキシ基、3-エチルフェノキシ基、4-エチルフェノキシ基、4-n-プロピルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメ

チルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2, 3-ジメチルフェノキシ基、3, 4, 5-トリメチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、2-エトキシフェノキシ基、3-エトキシフェノキシ基、4-エトキシフェノキシ基、4-n-プロポキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ基、4-n-ペンチルオキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基等のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0196】

フェニルC1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-（2-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシカルボニル基、3-（3-トリフルオロメトキシフェニル）プロポキシカルボニル基、3-（4-トリフルオロメトキシフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ペントキシカルボニル基、6-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基等のフェニルC1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0197】

フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1～6アルキルカルバモイル基としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、2-フェネチルカルバモイル基、3-フェニルプロピルカルバモイル基、2-フェニルプロピルカルバモイル基、4-フェニルブチルカルバモイル基、5-フェニルペンチルカルバモイル基、4-フェニルペンチルカルバモイル基、6-フェニルヘキシルカルバモイル基、2-フルオロベンジルカルバモイル基、3-フルオロベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルカルバモイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルカルバモイル基、4-フルオロベンジルカルバモイル基、2-クロロベンジルカルバモイル基、3-クロロベンジルカルバモイル基、4-クロロベンジルカルバモイル基、2-ブロモベンジルカルバモイル基、3-ブロモベンジルカルバモイル基、4-ブロモベンジルカルバモイル基、2-ヨードベンジルカルバモイル基、3-ヨードベンジルカルバモイル基、4-ヨードベンジルカルバモイル基、2, 3-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 5-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 6-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 3-ジクロロベンジルカルバモイル基、3, 4-ジクロロベンジルカルバモイル基、3, 5-ジクロロベンジルカルバモイル基、2, 4-ジクロロベンジルカルバモイル基、2, 6-ジクロロベンジルカルバモイル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1～5個置換し

10

20

30

40

50

ていてもよいフェニルC 1～6アルキルカルバモイルを挙げることができる。

【0198】

フェニルチオ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、フェニルチオ基、2-メトキシフェニルチオ基、3-メトキシフェニルチオ基、4-メトキシフェニルチオ基、2, 4-ジメトキシフェニルチオ基、2, 4, 6-トリメトキシフェニルチオ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルチオ基、2-トリフルオロメトキシフェニルチオ基、3-トリフルオロメトキシフェニルチオ基、4-トリフルオロメトキシフェニルチオ基、4-エトキシフェニルチオ基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルチオ基、4-プロポキシフェニルチオ基、4-ブトキシフェニルチオ基、4-ペンチルオキシフェニルチオ基、4-ヘキシルオキシフェニルチオ基等のフェニルチオ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

10

【0199】

フェニルスルホキシド基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、フェニルスルホキシド基、2-メトキシフェニルスルホキシド基、3-メトキシフェニルスルホキシド基、4-メトキシフェニルスルホキシド基、2, 4-ジメトキシフェニルスルホキシド基、2, 4, 6-トリメトキシフェニルスルホキシド基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基、2-トリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基、3-トリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基、4-トリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基等のフェニルスルホキシド基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

20

【0200】

ピリジルC 1～6アルコキシ基としては、例えば、2-ピリジルメトキシ基、3-ピリジルメトキシ基、4-ピリジルメトキシ基、2-（2-ピリジル）エトキシ基、2-（3-ピリジル）エトキシ基、2-（4-ピリジル）エトキシ基、3-（2-ピリジル）プロポキシ基、3-（3-ピリジル）プロポキシ基、3-（4-ピリジル）プロポキシ基、4-（2-ピリジル）ブトキシ基、4-（3-ピリジル）ブトキシ基、4-（4-ピリジル）ブトキシ基、5-（2-ピリジル）ペンチルオキシ基、5-（3-ピリジル）ペンチルオキシ基、5-（4-ピリジル）ペンチルオキシ基、6-（2-ピリジル）ヘキシルオキシ基、6-（3-ピリジル）ヘキシルオキシ基、6-（4-ピリジル）ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

30

【0201】

フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 2～6アルカノイル基としては、例えば、フェニルアセチル基、3-フェニルプロピオニル基、4-フェニルブチリル基、5-フェニルペンタノイル基、6-フェニルヘキサノイル基、2-フルオロフェニルアセチル基、3-フルオロフェニルアセチル基、4-フルオロフェニルアセチル基、2-クロロフェニルアセチル基、3-クロロフェニルアセチル基、4-クロロフェニルアセチル基、2-ブロモフェニルアセチル基、3-ブロモフェニルアセチル基、4-ブロモフェニルアセチル基、2, 3-ジクロロフェニルアセチル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルアセチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアセチル基、3-（2-フルオロフェニル）プロピオニル基、3-（3-フルオロフェニル）プロピオニル基、3-（4-フルオロフェニル）プロピオニル基、3-（2-クロロフェニル）プロピオニル基、3-（3-クロロフェニル）プロピオニル基、3-（4-クロロフェニル）プロピオニル基、3-（2-ブロモフェニル）プロピオニル基、3-（3-ブロモフェニル）プロピオニル基、3-（4-ブロモフェニル）プロピオニル基、4-（4-フルオロフェニル）ブチリル基、4-（3-クロロフェニル）ブチリル基、4-（4-クロロフェニル）ブチリル基、5-（4-フルオロフェニル）ペンタノイル基、5-（3-クロロフェニル）ペンタノイル基、5-（4-クロロフェニル）ペンタノイル基、6-

40

50

【 0 2 0 2 】

20

【 0 2 0 3 】

50

シカルボニル基、1-(4-n-プロピルフェニル)ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基等のピペリジニルオキシカルボニル基（ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい〕が1～3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

【0204】

R²⁴及びR²⁵が、隣接する窒素を介して形成する5～6員環の飽和複素環とは、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する複素環であり、例えば、ピロリジニル基、ピペラジル基、ピペリジル基、モルホリノ基、チオモルホリノ基等を挙げることができる。

【0205】

C3～8のシクロアルキルC1～6アルキル基としては、例えば、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、3-シクロプロピルプロピル基、4-シクロプロピルブチル基、4-シクロプロピルペンチル基、6-シクロプロピルヘキシル基、シクロブチルメチル基、2-シクロブチルエチル基、3-シクロブチルプロピル基、4-シクロブチルブチル基、4-シクロブチルペンチル基、6-シクロブチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、3-シクロペンチルプロピル基、4-シクロペンチルブチル基、4-シクロペンチルペンチル基、6-シクロペンチルヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、3-シクロヘキシルプロピル基、4-シクロヘキシルブチル基、4-シクロヘキシルペンチル基、6-シクロヘキシルヘキシル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロヘプチルエチル基、3-シクロヘプチルプロピル基、4-シクロヘプチルブチル基、4-シクロヘプチルペンチル基、6-シクロヘプチルヘキシル基、シクロオクチルメチル基、2-シクロオクチルエチル基、3-シクロオクチルプロピル基、4-シクロオクチルブチル基、4-シクロオクチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基等を挙げることができる。

【0206】

フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基；C3～8シクロアルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基；置換基としてC1～6アルキル基を有することのあるアミノ基；C1～6アルコキシカルボニル基；フェノキシ基；フェニルC1～6アルキル基；フェニルC2～6アルケニル基；ピリジル基；イミダゾリル基及びピペリジル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい）としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、4-シアノベンジル基、2, 3-ジシアノベンジル基、2, 4, 6-トリシアノベンジル基、2-(4-シアノフェニル)エチル基、3-(4-シアノフェニル)プロピル基、2-(4-シアノフェニル)プロピル基、4-(4-シアノフェニル)ブチル基、5-(4-シアノフェニル)ペンチル基、4-(4-シアノフェニル)ペンチル基、6-(4-シアノフェニル)ヘキシル基、2-シアノベンジル基、2-(3-シアノフェニル)エチル基、3-(2-シアノフェニル)プロピル基、2-(2-シアノフェニル)プロピル基、4-(3-シアノフェニル)ブチル基、5-(2-シアノフェニル)ペンチル基、4-(3-シアノフェニル)ペンチル基、6-(3-シアノフェニル)ヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、2-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル

10

20

30

40

50

基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメチルベンジル基、3-フルオロ-4-トリクロロメトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、2-シクロヘキシルベンジル基、3-シクロヘキシルベンジル基、4-シクロヘキシルベンジル基、2-(2-シクロヘキシルフェニル)エチル基、2-(3-シクロヘキシルフェニル)エチル基、2-(4-シクロヘキシルフェニル)エチル基、3-(2-シクロヘキシルフェニル)プロピル基、3-(3-シクロヘキシルフェニル)プロピル基、3-(4-シクロヘキシルフェニル)プロピル基、3-アミノベンジル基、2, 4-ジアミノベンジル基、2, 4, 6-トリアミノベンジル基、2-ジメチルアミノベンジル基、3-ジメチルアミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(2-ジメチルアミノフェニル)エチル基、2-(3-ジメチルアミノフェニル)エチル基、2-(4-ジメチルアミノフェニル)エチル基、3-(2-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、3-(3-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、3-(4-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、2-メトキシカルボニルベンジル基、3-メトキシカルボニルベンジル基、4-メトキシカルボニルベンジル基、2-(2-メトキシカルボニルフェニル)エチル基、2-(3-メトキシカルボニルフェニル)エチル基、2-(4-メトキシカルボニルフェニル)エチル基、3-(2-メトキシカルボニルフェニル)プロピル基、3-(3-メトキシカルボニルフェニル)プロピル基、3-(4-メトキシカルボニルフェニル)プロピル基、2-エトキシカルボニルベンジル基、3-エトキシカルボニルベンジル基、4-エトキシカルボニルベンジル基、2-(2-エトキシカルボニルフェニル)エチル基、2-(3-エトキシカルボニルフェニル)エチル基、2-(4-エトキシカルボニルフェニル)エチル基、3-(2-エトキシカルボニルフェニル)プロピル基、3-(3-エトキシカルボニルフェニル)プロピル基、3-(4-エトキシカルボニルフェニル)プロピル基、2-フェノキシベンジル基、3-フェノキシベンジル基、4-フェノキシベンジル基、2-スチリルベンジル基、3-スチリルベンジル基、4-スチリルベンジル基、2-(2-フェノキシフェニル)エチル基、2-(3-フェノキシフェニル)エチル基、2-(4-フェノキシフェニル)エチル基、3-(2-フェノキシフェニル)プロピル基、3-(3-フェノキシフェニル)プロピル基、3-(4-フェノキシフェニル)プロピル基、2-ベンジルベンジル基、3-ベンジルベンジル基、4-ベンジルベンジル基、2-(2-ベンジルフェニル)エチル基、2-(3-

10

20

30

40

50

ベンジルフエニル) エチル基、2-(4-ベンジルフエニル) エチル基、3-(2-ベンジルフエニル) プロピル基、3-(3-ベンジルフエニル) プロピル基、3-(4-ベンジルフエニル) プロピル基、2-(2-フェネチル) ベンジル基、3-(2-フェネチル) ベンジル基、4-(2-フェネチル) ベンジル基、2-(2-(1-フェネチル) フェニル) エチル基、2-(3-(2-フェネチル) フェニル) エチル基、2-(4-(2-フェネチル) フェニル) エチル基、2-(3-(2-フェネチル) フェニル) プロピル基、3-(2-(2-フェネチル) フェニル) プロピル基、3-(4-(1-フェネチル) フェニル) プロピル基、2-(3-ピリジル) ベンジル基、3-(3-ピリジル) ベンジル基、4-(3-ピリジル) ベンジル基、2-(1-イミダゾリル) ベンジル基、3-(1-イミダゾリル) ベンジル基、4-(1-イミダゾリル) ベンジル基、2-(1-ピペリジノ) ベンジル基、3-(1-ピペリジノ) ベンジル基、4-(1-ピペリジノ) ベンジル基等を挙げることができる。

10

【0207】

ビフェニル C 1~6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルコキシ基及び置換基として C 1~6 アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、2-ビフェニルメチル基、3-ビフェニルメチル基、4-ビフェニルメチル基、2-(2-ビフェニル) エチル基、2-(3-ビフェニル) エチル基、2-(4-ビフェニル) エチル基、3-(2-ビフェニル) プロピル基、3-(3-ビフェニル) プロピル基、3-(4-ビフェニル) プロピル基、4-(4-ビフェニル) ブチル基、5-(4-ビフェニル) ペンチル基、6-(4-ビフェニル) ヘキシル基、2'-フルオロ-2-ビフェニルメチル基、2'-フルオロ-3-ビフェニルメチル基、2'-フルオロ-4-ビフェニルメチル基、3'-フルオロ-2-ビフェニルメチル基、3'-フルオロ-3-ビフェニルメチル基、3'-フルオロ-4-ビフェニルメチル基、4'-フルオロ-2-ビフェニルメチル基、4'-フルオロ-3-ビフェニルメチル基、4'-フルオロ-4-ビフェニルメチル基、2'-クロロ-2-ビフェニルメチル基、2'-クロロ-3-ビフェニルメチル基、2'-クロロ-4-ビフェニルメチル基、3'-クロロ-2-ビフェニルメチル基、3'-クロロ-3-ビフェニルメチル基、3'-クロロ-4-ビフェニルメチル基、4'-クロロ-2-ビフェニルメチル基、4'-クロロ-3-ビフェニルメチル基、4'-クロロ-4-ビフェニルメチル基、2', 4'-ジクロロ-4-ビフェニルメチル基、2', 4', 6'-トリクロロ-3-ビフェニルメチル基、3', 5'-ジトリフルオロメチル-4-ビフェニルメチル基、2', 3', 4', 5', 6'-ペンタフルオロ-3-ビフェニルメチル基、2'-メチル-2-ビフェニルメチル基、2'-メチル-3-ビフェニルメチル基、2'-メチル-4-ビフェニルメチル基、3'-メチル-2-ビフェニルメチル基、3'-メチル-3-ビフェニルメチル基、3'-メチル-4-ビフェニルメチル基、4'-メチル-2-ビフェニルメチル基、4'-メチル-3-ビフェニルメチル基、4'-メチル-4-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメチル-2-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメチル-3-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメチル-4-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメチル-2-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメチル-3-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメチル-4-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメチル-2-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメチル-3-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメチル-4-ビフェニルメチル基、2'-メトキシ-2-ビフェニルメチル基、2'-メトキシ-3-ビフェニルメチル基、2'-メトキシ-4-ビフェニルメチル基、3'-メトキシ-2-ビフェニルメチル基、3'-メトキシ-3-ビフェニルメチル基、2', 4'-ジメトキシ-3-ビフェニルメチル基、2', 4', 6'-トリメトキシ-4-ビフェニルメチル基、2'-メトキシ-4'-トリフルオロメチル-2-ビフェニルメチル基、3'-メチル-4'-トリフルオロメトキシ-2-ビフェニルメチル基、2'-ク

20

30

40

50

ロロー 4'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニルメチル基、3'-メトキシ-4-ビフェニルメチル基、4'-メトキシ-2-ビフェニルメチル基、4'-メトキシ-3-ビフェニルメチル基、4'-メトキシ-4-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメトキシ-2-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメトキシ-2-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメトキシ-2-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニルメチル基、2-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)エチル基、3-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)プロピル基、3-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)ブチル基、5-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)ペンチル基、6-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)ヘキシル基、4'-ジメチルアミノ-3-ビフェニルメチル基、4'-ジメチルアミノ-4-ビフェニルメチル基等のビフェニル C1~6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルコキシ基及び置換基として C1~6 アルキル基を 1~2 個有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい) を挙げることができる。

【0208】

ナフチル C1~6 アルキル基としては、例えば、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、2-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、3-(1-ナフチル)プロピル基、3-(2-ナフチル)プロピル基、4-(1-ナフチル)ブチル基、4-(2-ナフチル)ブチル基、5-(1-ナフチル)ペンチル基、5-(2-ナフチル)ペンチル基、6-(1-ナフチル)ヘキシル基、6-(2-ナフチル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0209】

フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子；シアノ基；置換基として C1~6 アルキル基を有することのあるアミノ基；ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルコキシ基；C1~6 アルコキシカルボニル基；カルボキシ基；フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]；アミノ C1~6 アルキル基 [アミノ基上にはフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) 及び C1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種が置換していてもよい] 及びフェニル C1~6 アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,4,6-トリフルオロフェニル基、2,4,6-トリクロ

ロフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、
 2, 4-ジシアノフェニル基、2, 4, 6-トリシアノフェニル基、2-メチルフェニル
 基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2,
 4, 6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-
 クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェ
 ニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-
 トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフル
 オロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニ
 ル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチ
 ルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチル
 フェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェ
 ニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピル
 フェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-
 ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシ
 フェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、
 2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フル
 オロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフル
 オロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフ
 ェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル
 基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、
 2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフ
 ェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-
 tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブト
 キシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシ
 フェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロ
 ポキシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、
 3-アミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、
 3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-メトキシカルボニ
 ルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基
 、2-カルボキシフェニル基、3-カルボキシフェニル基、4-カルボキシフェニル基、
 2, 3-ジカルボキシフェニル基、2, 4, 6-トリカルボキシフェニル基、2-エトキシ
 カルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニル
 フェニル基、2, 3-ジエトキシカルボニルフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシカル
 ボニルフェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノ
 キシフェニル基、2-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(3-クロロフェノキシ)
 フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(2-クロロフェノキシ)
 フェニル基、3-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ)
 フェニル基、4-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(3-クロロフェノキシ)
 フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメ
 チルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、
 2-(3-メチルフェノキシ)フェニル基、2-(2, 3-ジメチルフェノキシ)フェニ
 ル基、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロ
 メチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基
 、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメチ
 ルフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-
 (3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフ
 ェノキシ)フェニル基、2-(3-メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(2, 3-ジ
 メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)フェニ
 ル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオ
 ロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェ

10

20

30

40

50

ニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフル
 オロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェ
 ニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフル
 オロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)
 フェニル基、4-アミノメチルフェニル基、4-メチルアミノメチルフェニル基、4-ジ
 メチルアミノメチルフェニル基、4-ジエチルアミノメチルフェニル基、4-ジ(n-プ
 ロピル)アミノメチルフェニル基、4-(フェニルアミノメチル)フェニル基、4-(2-
 フェニルアミノエチル)フェニル基、4-(3-フェニルアミノプロピル)フェニル基
 、4-(N-メチル-N-フェニルアミノメチル)フェニル基、4-(2-N-メチル-
 N-フェニルアミノエチル)フェニル基、4-(3-N-エチル-N-フェニルアミノプロ
 ピル)フェニル基、4-(4-クロロフェニルアミノメチル)フェニル基、4-[2-
 (4-クロロフェニルアミノ)エチル]フェニル基、4-[3-(4-クロロフェニルア
 ミノ)プロピル]フェニル基、4-[N-メチル-N-4-クロロフェニルアミノ]メチ
 ル]フェニル基、4-[2-(N-メチル-N-4-クロロフェニルアミノ)エチル]フェ
 ニル基、4-[3-(N-エチル-N-4-クロロフェニルアミノ)プロピル]フェニ
 ル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノメチル)フェニル基、4-[2-(
 4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)エチル]フェニル基、4-[2-(4-メチル
 フェニルアミノ)メチル]フェニル基、4-[2-(2, 4-ジメチルフェニルアミノ)
 メチル]フェニル基、4-[2-(2, 4, 6-トリメチルフェニルアミノ)メチル]フェ
 ニル基、4-[3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニルアミノ)プロピル]フェ
 ニル基、4-[N-メチル-N-4-トリフルオロメチルフェニルアミノ]メチル]フェ
 ニル基、4-[2-(N-メチル-N-4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)エチル
]フェニル基、4-[3-(N-エチル-N-4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)
 プロピル]フェニル基、4-[2-(3-メトキシフェニルアミノ)メチル]フェニル基
 、4-[2-(2, 4-ジメトキシフェニルアミノ)メチル]フェニル基、4-[2-(2,
 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ)メチル]フェニル基、4-(4-トリフルオ
 ロメトキシフェニルアミノメチル)フェニル基、4-[2-(3, 5-ジトリフルオロメ
 トキシフェニルアミノ)エチル]フェニル基、4-[3-(4-トリフルオロメトキシフ
 エニルアミノ)プロピル]フェニル基、4-[N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシ
 フェニルアミノ]メチル]フェニル基、4-[2-(N-メチル-N-4-トリフルオ
 ロメトキシフェニルアミノ)エチル]フェニル基、4-[3-(N-エチル-N-4-トリ
 フルオロメトキシフェニルアミノ)プロピル]フェニル基、4-ベンジルオキシフェ
 ニル基、4-(4-クロロベンジルオキシ)フェニル基、4-[2-(2, 3-ジクロロフ
 エニル)エトキシ]フェニル基、4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]フェ
 ニル基、4-[4-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)ブトキシ]フェニル基、4-(4-
 メチルベンジルオキシ)フェニル基、4-(3, 4-ジメチルベンジルオキシ)フェ
 ニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ)フェニル基、4-(4-トリフル
 オロメチルベンジルオキシ)フェニル基、4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル
)エトキシ]フェニル基、4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ]
 フェニル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシ]フェニル基、4-
 (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)フェニル基、4-(4-メトキシベンジ
 ルオキシ)フェニル基、4-(3, 4-ジメトキシベンジルオキシ)フェニル基、4-(
 2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ)フェニル基、4-[2-(4-トリフルオロ
 メトキシフェニル)エトキシ]フェニル基、4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェ
 ニル)プロポキシ]フェニル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブ
 トキシ]フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子;シアノ基;置換基
 としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基;ハロゲン置換もしくは未置換の
 C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基;C1~6
 アルコキシカルボニル基;カルボキシ基;フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン
 原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換

10

20

30

40

50

のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。] ; アミノC 1～6アルキル基 [アミノ基上にはフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。) 及びC 1～6アルキル基なる群より選ばれた基を

1
～2個有していてもよい。] 及びフェニルC 1～6アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。] からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい) を挙げることができる。

10

【0210】

ビフェニリル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) としては、例えば、2-ビフェニリル基、3-ビフェニリル基、4-ビフェニリル基、2'-メチル-2-ビフェニリル基、2'-メチル-3-ビフェニリル基、2'-メチル-4-ビフェニリル基、3'-メチル-2-ビフェニリル基、3'-メチル-3-ビフェニリル基、3'-メチル-4-ビフェニリル基、4'-メチル-2-ビフェニリル基、4'-メチル-3-ビフェニリル基、4'-メチル-4-ビフェニリル基、3', 4'-ジメチル-2-ビフェニリル基、2', 4', 6'-トリメチル-3-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメチル-4', 6'-ジメチル-3-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメチル-2-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメチル-2-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメチル-2-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基等のビフェニリル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい) を挙げることができる。

20

【0211】

C 1～6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基としては、例えば、メトキシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、n-プロポキシカルボニルアミノ基、イソプロポキシカルボニルアミノ基、tert-ブトキシカルボニルアミノ基、N-ペントキシカルボニルアミノ基、N-ヘキシルオキシカルボニルアミノ基、N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ基、N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-(n-プロポキシカルボニル)アミノ基、N-メチル-N-(イソプロポキシカルボニル)アミノ基、N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-(n-ペントキシカルボニル)アミノ基、N-(n-ヘキシルオキシカルボニル)-N-メチルアミノ基、N-エチル-N-メトキシカルボニルアミノ基、N-エチル-N-エトキシカルボニルアミノ基、N-エチル-N-(n-プロポキシカルボニル)アミノ基、N-エチル-N-イソプロポキシカルボニルアミノ基、N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-エチルアミノ基、N-エチル-N-(n-ペントキシカルボニル)アミノ基、N-エチル-N-(n-ヘキシルオキシカルボニル)アミノ基等のC 1～6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基 (アミノ基上には、他の置換基としてC 1～6アルキル基を有していてもよい) を挙げることができる。

30

40

【0212】

フェニルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、フェニルアミノ基、2-メチルフェニルアミノ基、3-メチルフェニルアミノ基、4-メチルフェニルアミノ基、2-エチルフェニルアミノ基、3-エチルフェニルアミノ基、4-エチルフェニルアミノ基、4-プロピルフェニルアミノ基、4-

50

t e r t -ブチルフェニルアミノ基、4-ブチルフェニルアミノ基、2-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、3-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、4-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、2, 3-ジメチルフェニルアミノ基、3, 4, 5-トリメチルフェニルアミノ基、4-ペンチルフェニルアミノ基、4-ヘキシルフェニルアミノ基、N-フェニル-N-(2-フルオロフェニル)アミノ基、2-フルオロフェニルアミノ基、3-フルオロフェニルアミノ基、4-フルオロフェニルアミノ基、2-クロロフェニルアミノ基、3-クロロフェニルアミノ基、4-クロロフェニルアミノ基、2-ブロモフェニルアミノ基、3-ブロモフェニルアミノ基、4-ブロモフェニルアミノ基、2-ヨードフェニルアミノ基、3-ヨードフェニルアミノ基、4-ヨードフェニルアミノ基、2, 3-ジフルオロフェニルアミノ基、3, 4-ジフルオロフェニルアミノ基、3, 5-ジフルオロフェニルアミノ基、2, 4-ジフルオロフェニルアミノ基、2, 6-ジフルオロフェニルアミノ基、2, 3-ジクロロフェニルアミノ基、3, 4-ジクロロフェニルアミノ基、3, 5-ジクロロフェニルアミノ基、2, 4-ジクロロフェニルアミノ基、2, 6-ジクロロフェニルアミノ基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルアミノ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアミノ基、3, 4, 5-トリクロロフェニルアミノ基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルアミノ基、2, 4, 6-トリクロロフェニルアミノ基等のフェニル基を1~2個有するアミノ基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0213】

ベンゾイルC 1~6アルキル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。）としては、例えば、ベンゾイルメチル基、2-フルオロベンゾイルメチル基、3-フルオロベンゾイルメチル基、4-フルオロベンゾイルメチル基、2-クロロベンゾイルメチル基、（2, 3-ジクロロベンゾイル）メチル基、（2, 4, 6-トリクロロベンゾイル）メチル基、（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンゾイル）メチル基、3-クロロベンゾイルメチル基、4-クロロベンゾイルメチル基、2-ブロモベンゾイルメチル基、3-ブロモベンゾイルメチル基、4-ブロモベンゾイルメチル基、2-ベンゾイルエチル基、2-（2-フルオロベンゾイル）エチル基、2-（3-フルオロベンゾイル）エチル基、2-（4-フルオロベンゾイル）エチル基、2-（2-クロロベンゾイル）エチル基、2-（3-クロロベンゾイル）エチル基、2-（4-クロロベンゾイル）エチル基、3-（2-クロロベンゾイル）プロピル基、3-（3-クロロベンゾイル）プロピル基、3-（4-クロロベンゾイル）プロピル基、4-（2-クロロベンゾイル）ブチル基、4-（3-クロロベンゾイル）ブチル基、4-（4-クロロベンゾイル）ブチル基、5-（2-クロロベンゾイル）ペンチル基、5-（3-クロロベンゾイル）ペンチル基、5-（4-クロロベンゾイル）ペンチル基、6-（2-クロロベンゾイル）ヘキシル基、6-（3-クロロベンゾイル）ヘキシル基、6-（4-クロロベンゾイル）ヘキシル基、等のベンゾイルC 1~6アルキル基（フェニル環上には置換基としてハロゲン原子を1~5個有していてもよい。）を挙げることができる。

【0214】

フェニルカルバモイルC 1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、フェニルカルバモイルメチル基、2-メチルフェニルカルバモイルメチル基、3-メチルフェニルカルバモイルメチル基、4-メチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 4-ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 6-ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイルメチル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 6-ジトリフルオロメチル

フェニルカルバモイルメチル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルメチル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルメチル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルメチル基、2-(n-プロピルフェニル)カルバモイルメチル基、3-(n-プロピルフェニル)カルバモイルメチル基、4-(n-プロピルフェニル)カルバモイルメチル基、2-(フェニルカルバモイル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)エチル基、2-(2,3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル)エチル基、2-(2,4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル)エチル基、2-(2,6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル)エチル基、3-(フェニルカルバモイル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(2,3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(2,4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(2,6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)ヘキシル基等のフェニルカルバモイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0215】

チアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-チアゾリルメチル基、2,5-ジメチル-4-チアゾリルメチル基、2,4-ジメチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-ヨードフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2,4,6-トリクロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-

5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(4-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-(2-チアゾリル)エチル基、2-(4-チアゾリル)エチル基、2-(5-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)エチル基、3-(2-チアゾリル)プロピル基、2-(4-チアゾリル)プロピル基、3-(5-チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、2-(2-メチル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)プロピル基、2-(2-フェニル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(3-フェニル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、4-(2-チアゾリル)ブチル基、4-(4-チアゾリル)ブチル基、3-(5-チアゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-4-チアゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)ブチル基、4-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2-フェニル-4-チアゾリル)ブチル基、4-フェニル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)ブチル基、5-(2-チアゾリル)ペンチル基、5-(4-チアゾリル)ペンチル基、5-(5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-4-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)ペンチル基、5-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-フェニル-4-チアゾリル)ペンチル基、5-(4-フェニル-5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-チアゾリル)ヘキシル基、5-(4-チアゾリル)ヘキシル基、5-(5-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2-メチル-4-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2-メチル-5-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2-フェニル-4-チアゾリル)ヘキシル基、4-フェニル-5-チアゾリル)ヘキシル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)ヘキシル基等のチアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0216】

オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置

10

20

30

40

50

換のフェニル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、4-オキサゾリルメチル基、5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2, 5-ジメチル-4-オキサゾリルメチル基、2, 5-ジフェニル-4-オキサゾリルメチル基、2, 4-ジメチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-フェニル-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-フェニル-5-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-4-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-5-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(4-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-プロモフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-ヨードフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(4-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-(4-オキサゾリル)エチル基、2-(5-オキサゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-オキサゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-オキサゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)エチル基、2-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]エチル基、3-(4-オキサゾリル)プロピル基、3-(5-オキサゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-オキサゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-5-オキサゾリル)プロピル基、3-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)プロピル基、3-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]プロピル基、4-(4-オキサゾリル)ブチル基、4-(5-オキサゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-4-オキサゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-5-オキサゾリル)ブチル基、4-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)ブチル基、4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]ブチル基、5-(4-オキサゾリル)ペンチル基、5-(5-オキサゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-4-オキサゾリル)ペンチル基、5-(2-メチ

10

20

30

40

50

ル-5-オキサゾリル)ペンチル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)ペンチル基、5-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]ペンチル基、6-(4-オキサゾリル)ヘキシル基、6-(5-オキサゾリル)ヘキシル基、6-(2-メチル-4-オキサゾリル)ヘキシル基、6-(2-メチル-5-オキサゾリル)ヘキシル基、6-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)ヘキシル基、6-[2-(4-クロロフェニル)-6-メチル-4-オキサゾリル]ヘキシル基等のオキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0217】

インドリルC1~6アルキル基としては、例えば、インドリン-1-イルメチル基、インドリン-2-イルメチル基、インドリン-3-イルメチル基、インドリン-4-イルメチル基、インドリン-5-イルメチル基、インドリン-6-イルメチル基、インドリン-7-イルメチル基、2-(インドリン-3-イル)エチル基、3-(インドリン-3-イル)プロピル基、4-(インドリン-3-イル)ブチル基、5-(インドリン-3-イル)ペンチル基、6-(インドリン-3-イル)ヘキシル基、2-(インドリン-4-イル)エチル基、3-(インドリン-4-イル)プロピル基、4-(インドリン-4-イル)ブチル基、5-(インドリン-4-イル)ペンチル基、6-(インドリン-4-イル)ヘキシル基、2-(インドリン-5-イル)エチル基、3-(インドリン-5-イル)プロピル基、4-(インドリン-5-イル)ブチル基、5-(インドリン-5-イル)ペンチル基、6-(インドリン-5-イル)ヘキシル基、2-(インドリン-6-イル)エチル基、3-(インドリン-6-イル)プロピル基、4-(インドリン-6-イル)ブチル基、5-(インドリン-6-イル)ペンチル基、6-(インドリン-6-イル)ヘキシル基、2-(インドリン-7-イル)エチル基、3-(インドリン-7-イル)プロピル基、4-(インドリン-7-イル)ブチル基、5-(インドリン-7-イル)ペンチル基、6-(インドリン-7-イル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0218】

フリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、2-フリルメチル基、1-(3-フリル)エチル基、2-(2-フリル)エチル基、3-(3-フリル)プロピル基、4-(3-フリル)ブチル基、5-(2-フリル)ペンチル基、6-(2-フリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(3-フリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-フリル)エチル基、3,4-ジフェニル-2-フリルメチル基、3,4,5-トリフェニル-2-フリルメチル基、5-フェニル-2-フリルメチル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(4-フルオロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(2-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(3-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(4-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、5-(2-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、5-(3-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、5-(4-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、4-フェニル-2-フリルメチル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(4-ヨードフェニル)-2-フリルメチル基、4-(2,3-ジクロロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(3-クロロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(2,4,6-トリクロロフェニル)-2-フリルメチル基、4-(2-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、4-(3-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、4-(4-ブロモフェニル)-2-フリルメチル基、5-フェニル-2-フリルメチル基、2-(2-フリル)エチル基、3-(2-フリル)プロピル基、4-(2-フリル)ブチル基、5-(2-フリル)ペンチル基、6-(2-フリル)ヘキシル基、2-[5-(4-クロロフェニル)-2-フリル]エチル基、3-[5-(4-クロロフェニル)-2-フリル]プロピル基、4-[5-(4-クロロフェニル)-2-フリル]ブチル基

10

20

30

40

50

、5-(2-フリル)ペンチル基、6-[5-(4-クロロフェニル)-2-フリル]ヘキシル基等のフリルC1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0219】

イミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、4-イミダゾリルメチル基、2-(4-イミダゾリル)エチル基、3-(2-イミダゾリル)プロピル基、4-(1-イミダゾリル)ブチル基、5-(5-イミダゾリル)ペンチル基、6-(4-イミダゾリル)ヘキシル基、2,5-ジフェニル-1-イミダゾリルメチル基、2-フェニル-4-イミダゾリルメチル基、2-(2-フェニル-4-イミダゾリル)エチル基、3-(2-フェニル-4-イミダゾリル)プロピル基、4-(2-フェニル-5-イミダゾリル)ブチル基、5-(2-フェニル-4-イミダゾリル)ペンチル基、6-(2-フェニル-4-イミダゾリル)ヘキシル基等のイミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

【0220】

キノリルC1~6アルキル基としては、例えば、4-キノリルメチル基、2-(4-キノリル)エチル基、3-(4-キノリル)プロピル基、4-(4-キノリル)ブチル基、5-(4-キノリル)ペンチル基、6-(4-キノリル)ヘキシル基、5-キノリルメチル基、2-(5-キノリル)エチル基、3-(5-キノリル)プロピル基、4-(5-キノリル)ブチル基、5-(5-キノリル)ペンチル基、6-(5-キノリル)ヘキシル基、6-キノリルメチル基、2-(6-キノリル)エチル基、3-(6-キノリル)プロピル基、4-(6-キノリル)ブチル基、5-(6-キノリル)ペンチル基、6-(6-キノリル)ヘキシル基、7-キノリルメチル基、2-(7-キノリル)エチル基、3-(7-キノリル)プロピル基、4-(7-キノリル)ブチル基、5-(7-キノリル)ペンチル基、6-(7-キノリル)ヘキシル基、8-キノリルメチル基、2-(8-キノリル)エチル基、3-(8-キノリル)プロピル基、4-(8-キノリル)ブチル基、5-(8-キノリル)ペンチル基、6-(8-キノリル)ヘキシル基等を挙げることができる。

20

【0221】

テトラゾリル基(テトラゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、5-(1H)-テトラゾリル基、1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリル基等が挙げられる。

30

【0222】

フェニル基が置換していてもよいピリミジル基としては、例えば、2-ピリミジル基、3-ピリミジル基、4-ピリミジル基、4-フェニル-2-ピリミジル基、2-フェニル-4-ピリミジル基、4,6-ジフェニル-2-ピリミジニル基等が挙げられる。

【0223】

ベンゾオキサゾリル基としては、例えば、2-ベンゾオキサゾリル基、4-ベンゾオキサゾリル基、5-ベンゾオキサゾリル基、6-ベンゾオキサゾリル基、7-ベンゾオキサゾリル基等が挙げられる。

【0224】

ベンゾチアゾリル基としては、例えば、ベンゾチアゾール-2-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基等を挙げることができる。

40

【0225】

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2~6アルカノイル基としては、例えば、フェノキシアセチル基、3-フェノキシプロピオニル基、4-フェノキシブチリル基、5-フェノキシペンタノイル基、6-フェノキシヘキサノイル基、4-(4-クロロフェノキシ)ブチリル基、5-(4-クロロフェノキシ)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキサノイル基、2-フルオロフェノキシアセチル基、3-フルオロフェノキシアセチル基、4-フルオロフェノキシアセチル基、2-クロロフェ

50

ノキシアセチル基、3-クロロフェノキシアセチル基、4-クロロフェノキシアセチル基、4-ブロモフェノキシアセチル基、2, 3-ジフルオロフェノキシアセチル基、2-フルオロ-4-クロロフェノキシアセチル基、3, 5-ジフルオロフェノキシアセチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシアセチル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシアセチル基、3-(2-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(2-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-ブロモフェノキシ)プロピオニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(2-フルオロ-4-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェノキシ)プロピオニル基等のフェニル環上にハロゲンが1~5個置換していてもよいフェノキシC 2~6アルカノイル基等を挙げることができる。

10

【0226】

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC 2~6アルカノイル基としては、ハロゲン原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニルチオ基とC 1~6アルカノイル基で構成される基であって、例えば、フェニルチオアセチル基、3-フェニルチオプロピオニル基、4-フェニルチオブチリル基、5-フェニルチオペンタノイル基、6-フェニルチオヘキサノイル基、4-(4-クロロフェニル)チオブチリル基、5-(4-クロロフェニル)チオペンタノイル基、6-(4-クロロフェニル)チオヘキサノイル基、2-フルオロフェニルチオアセチル基、3-フルオロフェニルチオアセチル基、4-フルオロフェニルチオアセチル基、2-クロロフェニルチオアセチル基、2, 4-ジクロロフェニルチオアセチル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルチオアセチル基、2, 3, 4, 5, 6-テトラフルオロフェニルチオアセチル基、3-クロロフェニルチオアセチル基、4-クロロフェニルチオアセチル基、4-ブロモフェニルチオアセチル基、2, 3-ジフルオロフェニルチオアセチル基、2-フルオロ-4-クロロフェニルチオアセチル基、3, 5-ジフルオロフェニルチオアセチル基、3-(2-フルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(3-フルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(4-フルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(2-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(3-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(4-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(4-ブロモフェニル)チオプロピオニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(2-フルオロ-4-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)チオプロピオニル基等を挙げることができる。

20

30

【0227】

ベンゾイル基（フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及び置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンゾイル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-フルオロベンゾイル基、2, 3-ジフルオロベンゾイル基、3, 4-ジフルオロベンゾイル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイル基、2, 3-ジクロロベンゾイル基、3, 4-ジクロロベンゾイル基、2, 4, 6-トリクロロベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2, 3, 4, 5, 6-テトラフルオロベンゾイル基、2-ブロモベンゾイル基、3-ブロモベンゾイル基、4-ブロモベンゾイル基、2, 3-ジブロモベンゾイル基、3, 4-ジブロモベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、2, 3-ジメチルベンゾイル基、3, 4-ジメチルベンゾイル基、3, 4, 5-トリメチルベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル基、2, 3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3, 4-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、2-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、3, 4-ジメトキシベンゾイル基、

40

50

2, 4, 6-トリメトキシベンゾイル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイル基、4-トリフルオロメトキシベンゾイル基、2-アミノベンゾイル基、3-アミノベンゾイル基、4-アミノベンゾイル基、2-メチルアミノベンゾイル基、3-メチルアミノベンゾイル基、4-メチルアミノベンゾイル基、2-エチルアミノベンゾイル基、3-エチルアミノベンゾイル基、4-エチルアミノベンゾイル基、2-プロピルアミノベンゾイル基、3-プロピルアミノベンゾイル基、4-プロピルアミノベンゾイル基、4-ブチルアミノベンゾイル基、4-ペンチルアミノベンゾイル基、4-ヘキシルアミノベンゾイル基、2-ジメチルアミノベンゾイル基、3-ジメチルアミノベンゾイル基、4-ジメチルアミノベンゾイル基、2-ジエチルアミノベンゾイル基、3-ジエチルアミノベンゾイル基、4-ジエチルアミノベンゾイル基、2-ジプロピルアミノベンゾイル基、3-ジプロピルアミノベンゾイル基、4-ジプロピルアミノベンゾイル基、4-ジブチルアミノベンゾイル基、4-ジペンチルアミノベンゾイル基、4-ジヘキシルアミノベンゾイル基等のベンゾイル基（フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及び置換基としてC 1～6アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

10

【0228】

ビフェニルカルボニル基としては、例えば、2-ビフェニルカルボニル基、3-ビフェニルカルボニル基、4-ビフェニルカルボニル基等が挙げられる。

20

【0229】

ピリジルカルボニル基としては、例えば、2-ピリジルカルボニル基、3-ピリジルカルボニル基、4-ピリジルカルボニル基等が挙げられる。

【0230】

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 2～6アルケニルカルボニル基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル基（慣用名：シンナモイル基）、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルカルボニル基、5-フェニル-2-ペンテニルカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテニルカルボニル基、5-フェニル-3-ペンテニルカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセニルカルボニル基、6-フェニル-4-ペンテニルカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルカルボニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルカルボニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基（慣用名では、2-フルオロシンナモイル基とも呼称される）、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、2, 4-ジフルオロシンナモイル基、3-(2, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2, 4-ジブロモフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2, 5-ジブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3, 5-ジブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3, 4-ジブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基等のフェニル環上に

30

40

50

ハロゲン原子が1～5個置換していてもよいフェニルC 2～6アルケニルカルボニル基を挙げることができる。

【0231】

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1～6アルキルスルホニル基とは、上で定義したフェニル環上にハロゲンが1～5個置換することのあるフェニルC 1～6アルキル基とスルホニル基から構成される基であって、例えば、ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基、3-フェニルプロピルスルホニル基、4-フェニルブチルスルホニル基、5-フェニルペンチルスルホニル基、6-フェニルヘキシルスルホニル基、2-フルオロベンジルスルホニル基、3-フルオロベンジルスルホニル基、4-フルオロベンジルスルホニル基、2-クロロベンジルスルホニル基、3-クロロベンジルスルホニル基、4-クロロベンジルスルホニル基、2, 3-ジクロロベンジルスルホニル基、3, 4-ジクロロベンジルスルホニル基、3, 5-ジクロロベンジルスルホニル基、2, 4-ジクロロベンジルスルホニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルスルホニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルスルホニル基、2-(2-フルオロ)フェネチルスルホニル基、2-(3-フルオロ)フェネチルスルホニル基、2-(4-フルオロ)フェネチルスルホニル基、2-(2-クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3-クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(4-クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(2, 3-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3, 4-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3, 5-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(2, 4-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3, 4, 5-トリフルオロ)フェネチルスルホニル基、3-(2-フルオロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3-フルオロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(4-フルオロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(2-クロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3-クロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(4-クロロフェニル)プロピルスルホニル基、2-(2, 3-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)プロピルスルホニル基等を挙げることができる。

【0232】

ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～8アルキル基としては、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、sec-ブチル基、n-ペンチル基、ネオペンチル基、3-メチルペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、1, 3, 5-トリメチルヘキシル基、n-ヘプチル基、6-メチルヘプチル基、1-メチルヘプチル基、n-オクチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2, 2, 3-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロプロピル基、3-ブロモプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブロモブチル基、2-クロロブチル基、5, 5, 5-トリフルオロペンチル基、5-クロロペンチル基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基、6-クロロヘキシル基、7-クロロヘプチル基、8-クロロオクチル基等のハロゲン原子が1～7個置換もしくは未置換のC 1～8アルキル基を挙げることができる。

【0233】

C 3～8シクロアルキル-C 1～6アルキル基とは、炭素数3乃至8個の環状アルキル基と炭素数1乃至6個のアルキル基で構成される基であって、例えば、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、3-シクロプロピルプロピル基、4-シクロプロピルブチル基、4-シクロプロピルペンチル基、6-シクロプロピルヘキシル基、シクロブチルメチル基、2-シクロブチルエチル基、3-シクロブチルプロピル基、4-シクロ

ブチルブチル基、4-シクロブチルペンチルシ基、6-シクロブチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、3-シクロペンチルプロピル基、4-シクロペンチルブチル基、4-シクロペンチルペンチル基、6-シクロペンチルヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、3-シクロヘキシルプロピル基、4-シクロヘキシルブチル基、4-シクロヘキシルペンチル基、6-シクロヘキシルヘキシル基、シクロヘブチルメチル基、2-シクロヘブチルエチル基、3-シクロヘブチルプロピル基、4-シクロヘブチルブチル基、4-シクロヘブチルペンチル基、6-シクロヘブチルヘキシル基、シクロオクチルメチル基、2-シクロオクチルエチル基、3-シクロオクチルプロピル基、4-シクロオクチルブチル基、4-シクロオクチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基等を挙げることができる。

10

【0234】

C1~6アルキル基を有することのあるアミノ-C1~6アルキル基としては、例えば、アミメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチル-3-アミノプロピル基、1, 1-ジメチル-2-アミノエチル基、エチルアミノメチル基、1-(プロピルアミノ)エチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、3-(イソプロピルアミノ)プロピル基、4-(n-ブチルアミノ)ブチル基、5-(n-ペンチルアミノ)ペンチル基、6-(n-ヘキシルアミノ)ヘキシル基、ジメチルアミノメチル基、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチル基、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル基等のC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ-C1~6アルキル基を挙げることができる。

20

【0235】

フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、フェニルC1~6アルコキシ基、ヒドロキシ基、C1~6アルキルスルフィニル基、C1~6アルキルスルホニル基、C1~6アルキルスルホニルオキシ基、シアノ基、C1~6アルカノイル基、ベンゾイル基、アルキル部分にC1~6アルコキシ基を有することのあるフェニルC1~6アルキル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、C1~6アルカノイルアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基、C1~6アルキルアミノカルボニル基、C1~6アルコキシカルボニルアミノ基、トリC1~6アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及びイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1~5個置換していてもよい)としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリフルオロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリクロロベンジル基、パーフルオロベンジル基、2-ジフルオロメチルベンジル基、3-ジフルオロメチルベンジル基、4-ジフルオロメチルベンジル基、4-クロロ-3-ジフルオロメチルベンジル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジル基、3-ブロモ-4-ジフルオロメチルベンジル基、3, 5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロ

30

40

50

メチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンジル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-クロロ-3-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、2-メチルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、2, 3-ジメチルチオベンジル基、2, 4, 6-トリメチルチオベンジル基、2-(2-メチルチオフェニル)エチル基、2-(3-メチルチオフェニル)エチル基、2-(4-メチルチオフェニル)エチル基、3-(4-メチルチオフェニル)プロピル基、4-(4-メチルチオフェニル)ブチル基、5-(4-メチルチオフェニル)ペンチル基、6-(4-メチルチオフェニル)ヘキシル基、2-トリフルオロメチルチオベンジル基、3-トリフルオロメチルチオベンジル基、4-トリフルオロメチルチオベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルチオフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルチオフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)エチル基、3-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルチオフェニル)ヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(3-ベンジルオキシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル)プロピル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル)ブチル基、5-(4-ベンジルオキシフェニル)ペンチル基、6-(4-ベンジルオキシフェニル)ヘキシル基、2-(2-フェニルエトキシ)ベンジル基、3-(2-フェニルエトキシ)ベンジル基、4-(2-フェニルエトキシ)ベンジル基、2-[2-(2-フェニルエトキシフェニル)]エチル基、2-[3-(2-フェニルエトキシフェニル)]エチル基、2-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)]エチル基、3-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)]プロピル基、4-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)]ブチル基、5-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)]ペンチル基、

10

20

30

40

50

6- [4- (2-フェニルエトキシフェニル)] ヘキシル基、2- (3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、3- (3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、4- (3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、2- (4-フェニルブトキシ) ベンジル基、3- (4-フェニルブトキシ) ベンジル基、4- (4-フェニルブトキシ) ベンジル基、2-メトキシカルボニルベンジル基、3-メトキシカルボニルベンジル基、4-メトキシカルボニルベンジル基、2- (2-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、2- (3-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、2- (4-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、3- (4-メトキシカルボニルフェニル) プロピル基、4- (4-メトキシカルボニルフェニル) ブチル基、5- (4-メトキシカルボニルフェニル) ペンチル基、6- (4-メトキシカルボニルフェニル) ヘキシル基、2-ヒドロキシベンジル基、3-ヒドロキシベンジル基、4-ヒドロキシベンジル基、2, 3-ジヒドロキシベンジル基、2, 4, 6-トリヒドロキシベンジル基、2- (2-ヒドロキシフェニル) エチル基、2- (3-ヒドロキシフェニル) エチル基、2- (4-ヒドロキシフェニル) エチル基、3- (4-ヒドロキシフェニル) プロピル基、4- (4-ヒドロキシフェニル) ブチル基、5- (4-ヒドロキシフェニル) ペンチル基、6- (4-ヒドロキシフェニル) ヘキシル基、2-メチルスルフィニルベンジル基、3-メチルスルフィニルベンジル基、4-メチルスルフィニルベンジル基、2, 3-ジメチルスルフィニルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルスルフィニルベンジル基、2- (2-メチルスルフィニルフェニル) エチル基、2- (3-メチルスルフィニルフェニル) エチル基、2- (4-メチルスルフィニルフェニル) エチル基、3- (4-メチルスルフィニルフェニル) プロピル基、4- (4-メチルスルフィニルフェニル) ブチル基、5- (4-メチルスルフィニルフェニル) ペンチル基、6- (4-メチルスルフィニルフェニル) ヘキシル基、2-メタンスルホニルベンジル基、3-メタンスルホニルベンジル基、4-メタンスルホニルベンジル基、2, 3-ジメタンスルホニルベンジル基、2, 4, 6-トリメタンスルホニルベンジル基、2- (2-メタンスルホニルフェニル) エチル基、2- (3-メタンスルホニルフェニル) エチル基、2- (4-メタンスルホニルフェニル) エチル基、3- (4-メタンスルホニルフェニル) プロピル基、4- (4-メタンスルホニルフェニル) ブチル基、5- (4-メタンスルホニルフェニル) ペンチル基、6- (4-メタンスルホニルフェニル) ヘキシル基、2-メタンスルホニルオキシベンジル基、3-メタンスルホニルオキシベンジル基、4-メタンスルホニルオキシベンジル基、2, 3-ジメタンスルホニルオキシベンジル基、2, 4, 6-トリメタンスルホニルオキシベンジル基、2- (2-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、2- (3-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、2- (4-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、3- (4-メタンスルホニルオキシフェニル) プロピル基、4- (4-メタンスルホニルオキシフェニル) ブチル基、5- (4-メタンスルホニルオキシフェニル) ペンチル基、6- (4-メタンスルホニルオキシフェニル) ヘキシル基、2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、2, 3-ジシアノベンジル基、2, 4, 6-トリシアノベンジル基、2- (2-シアノフェニル) エチル基、2- (3-シアノフェニル) エチル基、2- (4-シアノフェニル) エチル基、3- (4-シアノフェニル) プロピル基、4- (4-シアノフェニル) ブチル基、5- (4-シアノフェニル) ペンチル基、6- (4-シアノフェニル) ヘキシル基、2-アセチルベンジル基、3-アセチルベンジル基、4-アセチルベンジル基、2- (2-アセチルフェニル) エチル基、2- (3-アセチルフェニル) エチル基、2- (4-アセチルフェニル) エチル基、3- (4-アセチルフェニル) プロピル基、4- (4-アセチルフェニル) ブチル基、5- (4-アセチルフェニル) ペンチル基、6- (4-アセチルフェニル) ヘキシル基、2-ベンゾイルベンジル基、3-ベンゾイルベンジル基、4-ベンゾイルベンジル基、2- (2-ベンゾイルフェニル) エチル基、2- (3-ベンゾイルフェニル) エチル基、2- (4-ベンゾイルフェニル) エチル基、3- (4-ベンゾイルフェニル) プロピル基、4- (4-ベンゾイルフェニル) ブチル基、5- (4-ベンゾイルフェニル) ペンチル基、6- (4-ベンゾイルフェニル) ヘキシル基、2- α , α -ジメトキシベンジルベンジル基、3- α , α -ジメトキシベンジルベンジル基、4- α , α -ジメトキシベンジ

10

20

30

40

50

ルベンジル基、2-(2- α , α -ジメトキシベンジルフェニル)エチル基、2-(3-(α , α -ジメトキシベンジル)フェニル)エチル基、2-(4-(α , α -ジメトキシベンジル)フェニル)エチル基、3-(4-(α , α -ジメトキシベンジル)フェニル)プロピル基、4-(4-(α , α -ジメトキシベンジル)フェニル)ブチル基、5-(4-(α , α -ジメトキシベンジル)フェニル)ペンチル基、6-(4-(α , α -ジメトキシベンジル)フェニル)ヘキシル基、2-アミノベンジル基、3-アミノベンジル基、4-アミノベンジル基、2, 3-ジアミノベンジル基、2, 4, 6-トリアミノベンジル基、2-(2-アミノフェニル)エチル基、2-(3-アミノフェニル)エチル基、2-(4-アミノフェニル)エチル基、3-(4-アミノフェニル)プロピル基、4-(4-アミノフェニル)ブチル基、5-(4-アミノフェニル)ペンチル基、6-(4-アミノフェニル)ヘキシル基、2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、2, 4-ジニトロベンジル基、2, 4, 6-トリニトロベンジル基、2-(2-ニトロフェニル)エチル基、2-(3-ニトロフェニル)エチル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基、3-(4-ニトロフェニル)プロピル基、4-(4-ニトロフェニル)ブチル基、5-(4-ニトロフェニル)ペンチル基、6-(4-ニトロフェニル)ヘキシル基、2-カルバモイルベンジル基、3-カルバモイルベンジル基、4-カルバモイルベンジル基、2-(2-カルバモイルフェニル)エチル基、2-(3-カルバモイルフェニル)エチル基、2-(4-カルバモイルフェニル)エチル基、3-(4-カルバモイルフェニル)プロピル基、4-(4-カルバモイルフェニル)ブチル基、5-(4-カルバモイルフェニル)ペンチル基、6-(4-カルバモイルフェニル)ヘキシル基、2-アセチルアミノベンジル基、3-アセチルアミノベンジル基、4-アセチルアミノベンジル基、2-(2-アセチルアミノフェニル)エチル基、2-(3-アセチルアミノフェニル)エチル基、2-(4-アセチルアミノフェニル)エチル基、3-(4-アセチルアミノフェニル)プロピル基、4-(4-アセチルアミノフェニル)ブチル基、5-(4-アセチルアミノフェニル)ペンチル基、6-(4-アセチルアミノフェニル)ヘキシル基、2-エトキシカルボニルベンジル基、3-エトキシカルボニルベンジル基、4-エトキシカルボニルベンジル基、2-(2-エトキシカルボニルフェニル)エチル基、2-(3-エトキシカルボニルフェニル)エチル基、2-(4-エトキシカルボニルフェニル)エチル基、3-(4-エトキシカルボニルフェニル)プロピル基、4-(4-エトキシカルボニルフェニル)ブチル基、5-(4-エトキシカルボニルフェニル)ペンチル基、6-(4-エトキシカルボニルフェニル)ヘキシル基、2-メチルアミノカルボニルベンジル基、3-メチルアミノカルボニルベンジル基、4-メチルアミノカルボニルベンジル基、2-ジメチルアミノカルボニルベンジル基、3-ジメチルアミノカルボニルベンジル基、2-エチルアミノカルボニルベンジル基、3-エチルアミノカルボニルベンジル基、4-エチルアミノカルボニルベンジル基、4-ジメチルアミノカルボニルベンジル基、2-ジエチルアミノカルボニルベンジル基、3-ジエチルアミノカルボニルベンジル基、4-ジエチルアミノカルボニルベンジル基、2-(α -n-プロピルアミノカルボニル)ベンジル基、3-(α -n-プロピルアミノカルボニル)ベンジル基、4-(α -n-プロピルアミノカルボニル)ベンジル基、2-メトキシカルボニルアミノベンジル基、3-メトキシカルボニルアミノベンジル基、4-メトキシカルボニルアミノベンジル基、2-エトキシカルボニルアミノベンジル基、3-エトキシカルボニルアミノベンジル基、4-エトキシカルボニルアミノベンジル基、2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジル基、3-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジル基、4-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジル基、4-トリメチルシロキシベンジル基、4-トリエチルシロキシベンジル基、2-ピロリルベンジル基、3-ピロリルベンジル基、4-ピロリルベンジル基、2-(1-イミダゾリル)ベンジル基、3-(1-イミダゾリル)ベンジル基、4-(1-イミダゾリル)ベンジル基、2-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基、3-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基、4-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基等を挙げることができる。

【0236】

10

20

30

40

50

ベンズヒドリル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンズヒドリル基、4, 4'-ジクロロベンズヒドリル基、4, 4'-ジフルオロベンズヒドリル基、4, 4'-ジトリフルオロメチルベンズヒドリル基、4, 4'-ジトリフルオロメトキシベンズヒドリル基等を挙げることができる。

【0237】

フェニルC2～6アルキニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい）としては、例えば、2-フェニルエチニル基、3-フェニル-2-プロピニル基、4-フェニル-3-ブチニル基、4-フェニル-2-ブチニル基、5-フェニル-4-ペンチニル基、6-フェニル-5-ヘキシニル基、2-メチルフェニル-2-プロピニル基、3-メチルフェニル-3-ブチニル基、4-メチルフェニル-2-ブチニル基、2, 4-ジチルフェニル-4-ペンチニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル-5-ヘキシニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル-2-プロピニル基、2-トリフルオロメチルフェニル-3-ブチニル基、3-トリフルオロメチルフェニル-2-ブチニル基、4-トリフルオロメチルフェニル-2-プロピニル基等のフェニルC2～6アルキニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基を1～3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

10

【0238】

フェニルC2～6アルキニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい。）としては、例えば、2-フェニルエチニル基、3-フェニル-2-プロピニル基、4-フェニル-3-ブチニル基、4-フェニル-2-ブチニル基、5-フェニル-4-ペンチニル基、6-フェニル-5-ヘキシニル基、2-メチルフェニル-2-プロピニル基、3-メチルフェニル-3-ブチニル基、4-メチルフェニル-2-ブチニル基、2, 4-ジチルフェニル-4-ペンチニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル-5-ヘキシニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル-2-プロピニル基、2-トリフルオロメチルフェニル-3-ブチニル基、3-トリフルオロメチルフェニル-2-ブチニル基、4-トリフルオロメチルフェニル-2-プロピニル基等のフェニルC2～6アルキニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基を1～3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

20

30

【0239】

ピリジルC1～6アルキル基としては、例えば、2-ピリジルメチル基、2-（3-ピリジル）エチル基、1-（4-ピリジル）エチル基、3-（2-ピリジル）プロピル基、4-（3-ピリジル）ブチル基、5-（4-ピリジル）ペンチル基、6-（2-ピリジル）ヘキシル基、2-メチル-3-（3-ピリジル）プロピル基、1, 1-ジメチル-2-（2-ピリジル）エチル等を挙げることができる。

【0240】

ピペリジノC1～6アルキル基（ピペリジン環上には、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を少なくとも1個有することのあるフェノキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、ピペリジン-1-イルメチル基、2-（ピペリジン-2-イル）エチル基、3-（ピペリジン-3-イル）プロピル基、4-（ピペリジン-4-イル）ブチル基、5-（ピペリジン-1-イル）ペンチル基、6-（ピペリジン-1-イル）ヘキシル基、4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン-1-イルメチル基、4-フェノキシピペリジン-1-イルメチル基、4-（4-メチルフェノキシ）ピペリジン-1-イルメチル基、4-（2, 4-ジメチルフェノキシ）ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン-1-イル]エチル基、3-[4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン-1-イル]プロピル基、4-[4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン-1-イル]ブ

40

50

チル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル基、6-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ヘキシル基等のピペリジノC1~6アルキル基（ピペリジン環上には、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を1~3個有することのあるフェノキシ基が置換していてもよい）を挙げることができる。

【0241】

アミノC1~6アルキル基（アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、アミノメチル基、2-アミノエチル基、2-アミノプロピル基、3-アミノプロピル基、3-アミノブチル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチルアミノエチル基、2-メチルアミノプロピル基、3-メチルアミノプロピル基、3-メチルアミノブチル基、4-メチルアミノブチル基、5-メチルアミノペンチル基、6-メチルアミノヘキシル基、2-(エチルアミノ)エチル基、3-(エチルアミノ)プロピル基、4-(エチルアミノ)ブチル基、5-(エチルアミノ)ペンチル基、6-(エチルアミノ)ヘキシル基、2-(n-プロピルアミノ)エチル基、3-(n-プロピルアミノ)プロピル基、4-(n-プロピルアミノ)ブチル基、5-(n-プロピルアミノ)ペンチル基、6-(n-プロピルアミノ)ヘキシル基、2-(n-ブチルアミノ)エチル基、3-(n-ブチルアミノ)プロピル基、2-(n-ペンチルアミノ)エチル基、3-(n-ペンチルアミノ)プロピル基、2-(n-ヘキシルアミノ)エチル基、3-(n-ヘキシルアミノ)プロピル基、2-ジメチルアミノエチル基、2-ジメチルアミノプロピル基、3-ジメチルアミノプロピル基、3-ジメチルアミノブチル基、4-ジメチルアミノブチル基、5-ジメチルアミノペンチル基、6-ジメチルアミノヘキシル基、2-(ジエチルアミノ)エチル基、3-(ジエチルアミノ)プロピル基、4-(ジエチルアミノ)ブチル基、5-(ジエチルアミノ)ペンチル基、6-(ジエチルアミノ)ヘキシル基、2-(ジ-n-プロピルアミノ)エチル基、3-(ジ-n-プロピルアミノ)プロピル基、4-(ジ-n-プロピルアミノ)ブチル基、5-(ジ-n-プロピルアミノ)ペンチル基、6-(ジ-n-プロピルアミノ)ヘキシル基、2-(フェニルアミノ)エチル基、3-(フェニルアミノ)プロピル基、4-(フェニルアミノ)ブチル基、5-(フェニルアミノ)ペンチル基、6-(フェニルアミノ)ヘキシル基、2-(N-メチル-N-フェニルアミノ)エチル基、3-(N-メチル-N-フェニルアミノ)プロピル基、4-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ブチル基、5-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ペンチル基、6-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ヘキシル基、(4-メトキシフェニル)アミノメチル基、(3, 4-ジメトキシフェニル)アミノメチル基、(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)アミノメチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ブチル基、5-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ヘキシル基、2-(N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)エチル基、3-(N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)プロピル基、4-(N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ブチル基、5-(N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ペンチル基、6-(N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ヘキシル基等の置換基としてC1~6アルキル基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を1~3個有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノC1~6アルキル基を挙げることができる。

【0242】

1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジルC1~6アルキル基（1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい〕が置換

10

20

30

40

50

していてもよい)としては、例えば、(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)メチル基、1-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-2-イル)エチル基、2-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-3-イル)エチル基、3-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)プロピル基、4-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)ブチル基、5-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-2-イル)ペンチル基、6-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-3-イル)ヘキシル基、2-メチル-3-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)エチル基、4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、3, 4, 5-トリフェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、3, 4-ジフェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(2-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(3-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(2, 4-ジメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、3-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、2-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)エチル基、2-[4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]エチル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]エチル基、3-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロピル基、3-[4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]プロピル基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]プロピル基、4-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)ブチル基、4-[4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]ブチル基、5-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)ペンチル基、5-[4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]ペンチル基、5-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]ペンチル基、6-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)ヘキシル基、6-[4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]ヘキシル基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル]ヘキシル基等の1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンC1~6アルキル基(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、置換基としてフェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を1~3個有することのあるフェニル基が1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

【0243】

フルオレニルC1~6アルキル基としては、例えば、1-フルオレニルメチル基、2-フルオレニルメチル基、3-フルオレニルメチル基、4-フルオレニルメチル基、9-フルオレニルメチル基、2-(1-フルオレニル)エチル基、2-(2-フルオレニル)エチル基、2-(3-フルオレニル)エチル基、2-(4-フルオレニル)エチル基、2-(9-フルオレニル)エチル基、3-(1-フルオレニル)プロピル基、3-(2-フルオレニル)プロピル基、3-(3-フルオレニル)プロピル基、3-(4-フルオレニル

10

20

30

40

50

）プロピル基、3-（9-フルオレニル）プロピル基、4-（1-フルオレニル）ブチル基、4-（2-フルオレニル）ブチル基、5-（1-フルオレニル）ペンチル基、5-（2-フルオレニル）ペンチル基、6-（1-フルオレニル）ヘキシル基、6-（2-フルオレニル）ヘキシル基等を挙げることができる。

【0244】

フリルC 1～6 アルキル基（フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）としては、例えば、2-フリルメチル基、3-フリルメチル基、2-（2-フリル）エチル基、1-（3-フリル）エチル基、3-（2-フリル）プロピル基、3-（3-フリル）プロピル基、4-（2-フリル）ブチル基、4-（3-フリル）ブチル基、5-（2-フリル）ペンチル基、5-（3-フリル）ペンチル基、6-（2-フリル）ヘキシル基、6-（3-フリル）ヘキシル基、4-フェニル-2-フリルメチル基、4-（2-フルオロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（3-フルオロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（4-フルオロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（2-クロロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（3-クロロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（4-クロロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（2-ブロモフェニル）-2-フリルメチル基、4-（3-ブロモフェニル）-2-フリルメチル基、4-（4-ブロモフェニル）-2-フリルメチル基、4-フェニル-3-フリルメチル基、4-（2, 3-ジクロロフェニル）-3-フリルメチル基、4-（4-クロロフェニル）-3-フリルメチル基、4-（2-ブロモフェニル）-3-フリルメチル基、4-（3-ブロモフェニル）-3-フリルメチル基、4-（4-ブロモフェニル）-3-フリルメチル基、4-フェニル-3-フリルエチル基、2-〔4-（3-クロロフェニル）-3-フリル〕エチル基、2-〔4-（4-クロロフェニル）-3-フリル〕エチル基、2-〔4-（2-ブロモフェニル）-3-フリル〕エチル基、2-〔4-（3-ブロモフェニル）-3-フリル〕エチル基、2-〔4-（2, 4-ジブロモフェニル）-3-フリル〕エチル基、2-（4-フェニル-2-フリル）エチル基、2-〔4-（3-クロロフェニル）-2-フリル〕エチル基、2-〔4-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕エチル基、2-〔4-（4-ブロモフェニル）-2-フリル〕エチル基、3-（4-フェニル-3-フリル）プロピル基、3-〔4-（3-クロロフェニル）-3-フリル〕プロピル基、3-〔4-（2, 4, 6-トリクロロフェニル）-3-フリル〕プロピル基、3-〔4-（4-ブロモフェニル）-3-フリル〕プロピル基、3-（4-フェニル-2-フリル）プロピル基、3-〔4-（3-クロロフェニル）-2-フリル〕プロピル基、3-〔4-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕プロピル基、4-（4-フェニル-3-フリル）ブチル基、4-〔4-（3-クロロフェニル）-3-フリル〕ブチル基、4-〔4-（4-クロロフェニル）-3-フリル〕ブチル基、4-〔4-（4-ブロモフェニル）-3-フリル〕ブチル基、4-（4-フェニル-2-フリル）ブチル基、4-〔4-（3-クロロフェニル）-2-フリル〕ブチル基、4-〔4-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕ブチル基、4-〔4-（4-ブロモフェニル）-2-フリル〕ブチル基、5-（4-フェニル-3-フリル）ペンチル基、5-〔4-（3-クロロフェニル）-3-フリル〕ペンチル基、5-〔4-（4-クロロフェニル）-3-フリル〕ペンチル基、5-（4-フェニル-2-フリル）ペンチル基、5-〔4-（3-クロロフェニル）-2-フリル〕ペンチル基、5-〔4-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕ペンチル基、5-〔4-（4-ブロモフェニル）-2-フリル〕ペンチル基、6-（4-フェニル-3-フリル）ヘキシル基、6-〔4-（3-クロロフェニル）-3-フリル〕ヘキシル基、6-〔4-（4-クロロフェニル）-3-フリル〕ヘキシル基、6-〔4-（4-ブロモフェニル）-3-フリル〕ヘキシル基、6-（4-フェニル-2-フリル）ヘキシル基、6-〔4-（3-クロロフェニル）-2-フリル〕ヘキシル基、6-〔4-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕ヘキシル基、6-〔4-（4-ブロモフェニル）-2-フリル〕ヘキシル基等のフリルC 1～6 アルキル基（フラン環上には、ハロゲン

10

20

30

40

50

原子が1～5個置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0245】

チエニル置換C1～6アルキル基としては、例えば、2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-(2-チエニル)エチル基、1-(3-チエニル)エチル基、4-(2-チエニル)ブチル基、4-(3-チエニル)ブチル基、5-(2-チエニル)ペンチル基、5-(3-チエニル)ペンチル基、6-(2-チエニル)ヘキシル基、6-(3-チエニル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0246】

オキサゾリルC1～6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン原子又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、2-オキサゾリルメチル基、4-オキサゾリルメチル基、5-オキサゾリルメチル基、2-(2-オキサゾリル)エチル基、1-(4-オキサゾリル)エチル基、3-(2-オキサゾリル)プロピル基、4-(2-オキサゾリル)ブチル基、5-(2-オキサゾリル)ペンチル基、6-(2-オキサゾリル)ヘキシル基、2-(4-オキサゾリル)エチル基、3-(4-オキサゾリル)プロピル基、4-(4-オキサゾリル)ブチル基、5-(4-オキサゾリル)ペンチル基、6-(4-オキサゾリル)ヘキシル基、2-クロロ-4-オキサゾリルメチル基、2,5-ジクロロ-4-オキサゾリルメチル基、2,5-ジフェニル-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロ-4-オキサゾリル)エチル基、3-(2-クロロ-4-オキサゾリル)プロピル基、4-(2-ヨード-4-オキサゾリル)ブチル基、5-(2-ブロモ-4-オキサゾリル)ペンチル基、6-(2-フルオロ-4-オキサゾリル)ヘキシル基、2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]エチル基、3-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]プロピル基、4-[2-(2,4,6-トリクロロフェニル)-4-オキサゾリル]ブチル基、5-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]ペンチル基、6-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]ヘキシル基、[2-クロロ-4-(3-クロロフェニル)-5-オキサゾリル]メチル基等のオキサゾリルC1～6アルキル基(オキサゾール環上にはハロゲン原子又はフェニル環上にハロゲン原子が1～5個置換することのあるフェニル基が1～2個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0247】

オキサジアゾリルC1～6アルキル基(オキサジアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、5-オキサジアゾリルメチル基、2-(5-オキサジアゾリル)エチル基、1-(2-オキサジアゾリル)エチル基、3-(5-オキサジアゾリル)プロピル基、4-(2-オキサジアゾリル)ブチル基、5-(5-オキサジアゾリル)ペンチル基、6-(2-オキサジアゾリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(2-オキサジアゾリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(5-オキサジアゾリル)エチル基、2-フェニル-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2,4-ジクロロフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2-ブロモフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2,4,6-トリブロモフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(4-ブロモフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(5-オキサジアゾリル)エチル基、3-(5-オキサジアゾリル)プロピル基、4-(5-オキサジアゾリル)ブチル基、5-(5-オキサジアゾリル)ペンチル基、6-(5-オキサジアゾリル)ヘキシル基、2-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル)エチル基、3-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル)プロピル基、4-(2-フ

10

20

30

40

50

フェニル-5-オキサジアゾリル) ブチル基、5-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル) ペンチル基、6-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル) ヘキシル基、2-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] エチル基、3-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] プロピル基、4-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] ブチル基、5-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] ペンチル基、6-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] ヘキシル基等のオキサジアゾリルC1~6アルキル基(オキサジアゾール環上にはハロゲン原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0248】

ピラゾリルC1~6アルキル基(ピラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、3-ピラゾリルメチル基、2-(4-ピラゾリル) エチル基、1-(5-ピラゾリル) エチル基、3-(3-ピラゾリル) プロピル基、4-(4-ピラゾリル) ブチル基、5-(1-ピラゾリル) ペンチル基、6-(5-ピラゾリル) ヘキシル基、2-メチル-3-(1-ピラゾリル) プロピル基、1,1-ジメチル-2-(3-ピラゾリル) エチル基、1-(1-フェニル-3-ピラゾリル) メチル基、1-(2-フルオロフェニル)-4-ピラゾリルメチル基、1-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、3-フェニル-1-ピラゾリルメチル基、3,4,5-トリフェニル-1-ピラゾリルメチル基、3,4-ジフェニル-1-ピラゾリルメチル基、1-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(2-クロロフェニル)-5-ピラゾリルメチル基、1-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(2-ブロモフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(3-ブロモフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(4-ブロモフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、2-(3-ピラゾリル) エチル基、3-(3-ピラゾリル) プロピル基、4-(3-ピラゾリル) ブチル基、5-(3-ピラゾリル) ペンチル基、6-(3-ピラゾリル) ヘキシル基、2-[1-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル] エチル基、3-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-3-ピラゾリル] プロピル基、4-[1-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル] ブチル基、5-[1-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル] ペンチル基、6-[1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-3-ピラゾリル] ヘキシル基等のピラゾリルC1~6アルキル基(ピラゾール環上にはハロゲン原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0249】

ベンゾチエニルC1~6アルキル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-ベンゾチエニルメチル基、2-(3-ベンゾチエニル) エチル基、1-(4-ベンゾチエニル) エチル基、3-(5-ベンゾチエニル) プロピル基、4-(6-ベンゾチエニル) ブチル基、5-(7-ベンゾチエニル) ペンチル基、6-(2-ベンゾチエニル) ヘキシル基、2-メチル-3-(3-ベンゾチエニル) プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-ベンゾチエニル) エチル基、4-フルオロ-2-ベンゾチエニルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾチエニルメチル基、7-フルオロ-2-ベンゾチエニルメチル基、4-クロロ-2-ベンゾチエニルメチル基、5-クロロ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-クロロ-2-ベンゾチエニルメチル基、7-クロロ-2-ベンゾチエニルメチル基、4-ブロモ-2-ベンゾチエニルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-ブロモ-2-ベンゾチエニルメチル基、7-ブロモ-2-ベンゾチエニルメチル基、4-メトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、5-メトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-メトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、6,7-ジメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、3,6,7-トリメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、7-

10

20

30

40

50

メトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、4-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、7-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、4-エトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、5-エトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-エトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、7-エトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニルメチル基、3-ベンゾチエニルメチル基、4-フルオロ-3-ベンゾチエニルメチル基、5-フルオロ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-フルオロ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-フルオロ-3-ベンゾチエニルメチル基、4-クロロ-3-ベンゾチエニルメチル基、5-クロロ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-クロロ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-クロロ-3-ベンゾチエニルメチル基、4-ブロモ-3-ベンゾチエニルメチル基、5-ブロモ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-ブロモ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-ブロモ-3-ベンゾチエニルメチル基、4-メトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、5-メトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-メトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-メトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、4-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、4-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、5-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、2-(2-ベンゾチエニル)エチル基、3-(2-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(2-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(2-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(2-ベンゾチエニル)ヘキシル基、2-(3-ベンゾチエニル)エチル基、3-(3-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(3-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(3-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(3-ベンゾチエニル)ヘキシル基、2-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)エチル基、3-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)ヘキシル基、2-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)エチル基、3-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)ヘキシル基等のベンゾチエニルC1~6アルキル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0250】

チオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニルC1~6アルキル基としては、例えば、2-チエニルメチル基、2-(3-チエニル)エチル基、1-(2-チエニル)エチル基、3-(2-チエニル)プロピル基、4-(3-チエニル)ブチル基、5-(2-チエニル)ペンチル基、6-(2-チエニル)ヘキシル基、2-メチル-3-(3-チエニル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-チエニル)エチル基、3-フルオロ-2-チエニルメチル基、4-フルオロ-2-チエニルメチル基、3,4-ジフルオロ-2-チエニルメチル基、3,4,5-トリクロロ-2-チエニルメチル基、5-フルオロ-2-チエニルメチル基、3-クロロ-2-チエニルメチル基、4-クロロ-2-チエニルメチル基、5-クロロ-2-チエニルメチル基、3-ブロモ-2-チエニルメチル基、4-ブロモ-2-チエニルメチル基、5-ブロモ-2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-フルオロ-3-チエニルメチル基、4-フルオロ-3-チエニルメチル基、5-フルオロ-3-チエニルメチル基、2-クロロ-3-チエニルメチル基、4

10

20

30

40

50

ークロロ-3-チエニルメチル基、5-クロロ-3-チエニルメチル基、2-ブロモ-3-チエニルメチル基、4-ブロモ-3-チエニルメチル基、5-ヨード-3-チエニルメチル基、2-(5-クロロ-2-チエニル)エチル基、3-(5-クロロ-2-チエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-2-チエニル)ブチル基、5-(5-クロロ-2-チエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ-2-チエニル)ヘキシル基、2-(5-クロロ-3-チエニル)エチル基、3-(5-クロロ-3-チエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-3-チエニル)ブチル基、5-(5-クロロ-3-チエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ-3-チエニル)ヘキシル基等のチオフェン環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいチエニルC1~6アルキル基を挙げることができる。

【0251】

ベンゾチアゾリルC1~6アルキル基としては、例えば、ベンゾチアゾール-2-イルメチル基、ベンゾチアゾール-4-イルメチル基、ベンゾチアゾール-5-イルメチル基、ベンゾチアゾール-6-イルメチル基、ベンゾチアゾール-7-イルメチル基、2-(ベンゾチアゾール-4-イル)エチル基、(ベンゾチアゾール-5-イル)メチル基、2-(ベンゾチアゾール-6-イル)エチル基、2-(ベンゾチアゾール-7-イル)エチル基、3-(ベンゾチアゾール-4-イル)プロピル基、3-(ベンゾチアゾール-5-イル)プロピル基、3-(ベンゾチアゾール-6-イル)プロピル基、3-(ベンゾチアゾール-7-イル)プロピル基、4-(ベンゾチアゾール-2-イル)ブチル基、4-(ベンゾチアゾール-4-イル)ブチル基、4-(ベンゾチアゾール-5-イル)ブチル基、4-(ベンゾチアゾール-6-イル)ブチル基、4-(ベンゾチアゾール-7-イル)ブチル基、5-(ベンゾチアゾール-2-イル)ペンチル基、5-(ベンゾチアゾール-4-イル)ペンチル基、5-(ベンゾチアゾール-5-イル)ペンチル基、5-(ベンゾチアゾール-6-イル)ペンチル基、5-(ベンゾチアゾール-7-イル)ペンチル基、6-(ベンゾチアゾール-2-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾチアゾール-4-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾチアゾール-5-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾチアゾール-6-イル)ヘキシル基、6-(ベンゾチアゾール-7-イル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0252】

ベンゾフラン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾフリルC1~6アルキル基としては、例えば、2-ベンゾフリルメチル基、2-(3-ベンゾフリル)エチル基、1-(4-ベンゾフリル)エチル基、3-(5-ベンゾフリル)プロピル基、4-(6-ベンゾフリル)ブチル基、5-(7-ベンゾフリル)ペンチル基、6-(2-ベンゾフリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(3-ベンゾフリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-ベンゾフリル)エチル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、5,6-ジフルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、3,5,6-トリクロロ-3-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基等のベンゾフラン環上に置換基としてハロゲン原子が1~3個置換していてもよいベ

10

20

30

40

50

ンゾフリルC 1～6 アルキル基を挙げることができる。

【0253】

インドリニルC 1～6 アルキル基（インドリン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、2-インドリニルメチル基、2-（3-インドリニル）エチル基、1-（4-インドリニル）エチル基、3-（5-インドリニル）プロピル基、4-（6-インドリニル）ブチル基、5-（7-インドリニル）ペンチル基、6-（1-インドリニル）ヘキシル基、2-メチル-3-（3-インドリニル）プロピル基、1, 1-ジメチル-2-（2-インドリニル）エチル基、3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1, 3, 3-トリメチル-5-インドリニルメチル基、1-エチル-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-メチル-5-インドリニルメチル基、1, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1, 3, 3, 6, 7-ペンタメチル-5-インドリニルメチル基、3, 3-ジメチル-1-（n-プロピル）-5-インドリニルメチル基、3, 3-ジメチル-1-（イソプロピル）-5-インドリニルメチル基、1-（n-ブチル）-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-（sec-ブチル）-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-（tert-ブチル）-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-（n-ペンチル）-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-（n-ヘキシル）-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、1, 3, 3-トリメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、1-エチル-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、3, 3-ジメチル-2-オキソ-1-（n-プロピル）-5-インドリニルメチル基、3, 3-ジメチル-2-オキソ-1-（イソプロピル）-5-インドリニルメチル基、1-（n-ブチル）-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、1-（sec-ブチル）-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、1-（tert-ブチル）-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、1-（n-ペンチル）-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、1-（n-ヘキシル）-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、2-オキソ-5-インドリニルメチル基等のインドリニルC 1～6 アルキル基（インドリン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基が1～5個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0254】

ベンゾオキサゾリルC 1～6 アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、ハロゲン原子、C 1～6 アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-7-イルメチル基、2-（ベンゾオキサゾール-2-イル）エチル基、1-（ベンゾオキサゾール-4-イル）エチル基、3-（ベンゾオキサゾール-5-イル）プロピル基、4-（ベンゾオキサゾール-6-イル）ブチル基、5-（ベンゾオキサゾール-7-イル）ペンチル基、6-（ベンゾオキサゾール-2-イル）ヘキシル基、2-メチル-3-（ベンゾオキサゾール-4-イル）プロピル基、1, 1-ジメチル-2-（ベンゾオキサゾール-5-イル）エチル基、2, 5-ジメチルベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、2, 5, 6-トリメチルベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、4, 5-ジクロロベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、2, 4, 5-トリクロロベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル）メチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル）メチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル）メチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル）メチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル）メチル基、2-（ベンゾオキサゾール-4-イル）エチル基、（ベンゾオキサゾール-5-イル）メチル基、2-（ベンゾオキサゾール-6-イル）エチル基、2-（ベンゾオ

50

キソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、5-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、6-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、7-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、4-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、5-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、6-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、7-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、4-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、5-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、6-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、7-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、4-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、5-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、6-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、7-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、4-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、5-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、6-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、7-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、4-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、5-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、6-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、7-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、4-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、5-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、6-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、7-フルオロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、4-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、5-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、6-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、7-クロロ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、4-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、5-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、6-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、7-ブロモ-2-オキサソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基等のベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、ハロゲン原子、C1~6アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0255】

クロメニルC1~6アルキル基としては、例えば、2-クロメニルメチル基、3-クロメニルメチル基、4-クロメニルメチル基、5-クロメニルメチル基、6-クロメニルメチル基、7-クロメニルメチル基、8-クロメニルメチル基、2-(2-クロメニル)エチル基、1-(3-クロメニル)エチル基、3-(4-クロメニル)プロピル基、4-(5-クロメニル)ブチル基、5-(6-クロメニル)ペンチル基、6-(7-クロメニル)ヘキシル基、2-メチル-3-(8-クロメニル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(6-クロメニル)エチル基等を挙げることができる。

【0256】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルC1~6アルキル基（キノリン環上には、C1~6アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)メチル基、2

10

20

30

40

50

ー（１，２，３，４－テトラヒドロ－２－キノリル）エチル基、１－（１，２，３，４－
 テトラヒドロ－１－キノリル）エチル基、３－（１，２，３，４－テトラヒドロ－３－キノ
 リル）プロピル基、４－（１，２，３，４－テトラヒドロ－４－キノリル）ブチル基、
 ５－（１，２，３，４－テトラヒドロ－５－キノリル）ペンチル基、６－（１，２，３，
 ４－テトラヒドロ－６－キノリル）ヘキシル基、２－メチル－３－（１，２，３，４－テ
 トラヒドロ－７－キノリル）プロピル基、１，１－ジメチル－２－（１，２，３，４－テ
 トラヒドロ－８－キノリル）エチル基、２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６
 －キノリルメチル基、４－メチル－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル
 基、４－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、４，６－ジメ
 チル－１，２，３，４－テトラヒドロ－５－キノリルメチル基、１，４，８－トリメチル
 ー１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、１－メチル－２－オキソ－１
 ，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、１－エチル－２－オキソ－１，２
 ，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、２－オキソ－１－（*n*－プロピル）－
 １，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、２－オキソ－１－（イソプロピ
 ル）－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、１－（*n*－ブチル）－２
 －オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、１－（*sec*－ブチ
 ル）－２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、１－（*ter*
t－ブチル）－２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチル基、
 １－（*n*－ペンチル）－２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリルメチ
 ル基、１－（*n*－ヘキシル）－２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリ
 ルメチル基、２－（２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）エチル
 基、３－（２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）プロピル基、４
 －（２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）ブチル基、５－（２
 －オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）ペンチル基、６－（２－オキ
 ソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）ヘキシル基、２－（１－メチル－２
 －オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）エチル基、３－（１－メチル
 ー２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）プロピル基、４－（１
 －メチル－２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）ブチル基、５
 －（１－メチル－２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）ペンチル
 基、６－（１－メチル－２－オキソ－１，２，３，４－テトラヒドロ－６－キノリル）ヘ
 キシル基等の１，２，３，４－テトラヒドロキノリルＣ１～６アルキル基（キノリン環上には、
 Ｃ１～６アルキル基及びオキシ基なる群より選ばれた基が１～３個置換していてもよい）
 を挙げることができる。

【０２５７】

チアゾリルＣ１～６アルキル基（チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換も
 しくは未置換のフェニル基及びＣ１～６アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくと
 も１種が置換していてもよい）としては、例えば、２－チアゾリルメチル基、４－チアゾ
 リルメチル基、５－チアゾリルメチル基、２－（２－チアゾリル）エチル基、１－（４
 －チアゾリル）エチル基、３－（５－チアゾリル）プロピル基、４－（２－チアゾリル）ブ
 チル基、５－（４－チアゾリル）ペンチル基、６－（５－チアゾリル）ヘキシル基、２
 －メチル－３－（２－チアゾリル）プロピル基、１，１－ジメチル－２－（４－チアゾリ
 ル）エチル基、２－クロロ－４－チアゾリルメチル基、２，５－ジクロロ－４－チアゾリ
 ルメチル基、２－クロロ－５－チアゾリルメチル基、２－クロロ－６－チアゾリルメチル
 基、６－クロロ－２－チアゾリルメチル基、５－クロロ－２－チアゾリルメチル基、４
 －クロロ－２－チアゾリルメチル基、５－クロロ－４－チアゾリルメチル基、４－クロロ
 －５
 －チアゾリルメチル基、２－エチル－４－チアゾリルメチル基、２，５－ジメチル－４
 －チアゾリルメチル基、２－メチル－４－チアゾリルメチル基、２－メチル－５－チアゾ
 リルメチル基、２－メチル－６－チアゾリルメチル基、６－メチル－２－チアゾリルメチ
 ル基、５
 －メチル－２－チアゾリルメチル基、４－メチル－２－チアゾリルメチル基、５－メ
 チル
 ー４－チアゾリルメチル基、４－メチル－５－チアゾリルメチル基、２－エチル－４

10

20

30

40

50

ーチアゾリルメチル基、2-エチル-5-チアゾリルメチル基、2-エチル-6-チアゾリルメチル基、6-エチル-2-チアゾリルメチル基、5-エチル-2-チアゾリルメチル基、4-エチル-2-チアゾリルメチル基、5-エチル-4-チアゾリルメチル基、4-エチル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-6-チアゾリルメチル基、6-フェニル-2-チアゾリルメチル基、5-フェニル-2-チアゾリルメチル基、4-フェニル-2-チアゾリルメチル基、5-フェニル-4-チアゾリルメチル基、4-フェニル-5-チアゾリルメチル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-チアゾリルメチル基、5-(2,4-ジフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基等のチアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

20

【0258】

テトラゾリルC1~6アルキル基(テトラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、5-(1H)-テトラゾリルメチル基、2-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、1-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、3-(5-(1H)-テトラゾリル)プロピル基、4-(5-(1H)-テトラゾリル)ブチル基、5-(5-(1H)-テトラゾリル)ペンチル基、6-(5-(1H)-テトラゾリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(5-(1H)-テトラゾリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、1-メチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-エチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-プロピル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-ブチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(2-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(3-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(2-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(3-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(2,4,6-トリクロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(2-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(2,3-ジブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-(4-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、2-(1-メチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-エチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-プロピル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-ブチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(2-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(3-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(4-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(2-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(3-クロロフェニル)-5-

30

40

50

(1H) - テトラゾリル) エチル基、2 - (1 - (4 - クロロフェニル) - 5 - (1H) - テトラゾリル) エチル基、2 - (1 - (2 - ブロモフェニル) - 5 - (1H) - テトラゾリル) エチル基、2 - (1 - (3 - ブロモフェニル) - 5 - (1H) - テトラゾリル) エチル基、2 - (1 - (4 - ブロモフェニル) - 5 - (1H) - テトラゾリル) エチル基等のテトラゾリルC 1 ~ 6 アルキル基 (テトラゾール環上には、ハロゲン原子が1 ~ 5個置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基が置換していてもよい) を挙げることができる。

【0259】

R^{32'} 及び R^{33'} が隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合して形成するピペリジン環又は1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン環 (ピペリジン環及び1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) としては、例えば、ピペリジン、4 - フェニルピペリジン、4 - (2 - フルオロフェニル) ピペリジン、4 - (3 - フルオロフェニル) ピペリジン、4 - (3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン、4 - (3, 4, 5 - トリクロロフェニル) ピペリジン、4 - (2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロフェニル) ピペリジン、4 - (2, 4 - ジメチルフェニル) ピペリジン、4 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニル) ピペリジン、4 - (2 - トリフルオロメチル - 4 - メチルフェニル) ピペリジン、4 - (4 - フルオロフェニル) ピペリジン、4 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) ピペリジン、4 - (2 - クロロフェニル) ピペリジン、4 - (3 - クロロフェニル) ピペリジン、4 - (4 - クロロフェニル) ピペリジン、4 - (3, 4 - ジクロロフェニル) ピペリジン、4 - (2 - メチルフェニル) ピペリジン、4 - (3 - メチルフェニル) ピペリジン、4 - (4 - メチルフェニル) ピペリジン、4 - (2 - トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン、4 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン、4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン、4 - フェニル - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2 - フルオロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (3 - フルオロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (4 - フルオロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2 - クロロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (3 - クロロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (4 - クロロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2 - メチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (3 - メチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (4 - メチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2 - トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (3, 4, 5 - トリクロロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン、4 - (2 - トリフルオロメチル - 4 - メチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン等のピペリジン環又は1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン環 (ピペリジン環上又は1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基が1 ~ 5個、好ましくは1 ~ 3個置換していてもよい。) を挙げることができる。

【0260】

C 3～8シクロアルケニル基としては、例えば、シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、シクロヘプテニル基、シクロオクテニル基等を挙げることができる。

【0261】

フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～4アルキレンジオキシ基、C 1～6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が1～5個置換していてもよい〕としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペントキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2, 3-メチレンジオキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、3-ニトロフェニル基、2, 3-ジニトロフェニル基、2, 4, 6-トリニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、3-トリフルオロメチルチオフェニル基、4-トリフルオロメチルチオフェニル基、3-メタンスルホニルフェニル基、4-メタンスルホニルフェニル基、2-メタンスルホニルフェニル基、2-アミノフェニル、2, 4-ジアミノフェニル、2, 4, 6-トリアミノフェニル、2-アセチルアミノフェニル基、3-アセチルアミノフェニル基、4-アセチルアミノフェニル

10

20

30

40

50

基等のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～4アルキレンジオキシ基、C 1～6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC 1～6アルカノイル基1～2個を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。置換基がC 1～4アルキレンジオキシ基の場合は、1～3個置換するのがよい。〕を挙げることができる。

【0262】

ベンゾフリル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、無置換の2-ベンゾフリル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリル基、4-クロロ-2-ベンゾフリル基、5-クロロ-2-ベンゾフリル基、6-クロロ-2-ベンゾフリル基、7-クロロ-2-ベンゾフリル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリル基、4-メチル-2-ベンゾフリル基、5-メチル-2-ベンゾフリル基、6-メチル-2-ベンゾフリル基、7-メチル-2-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、4-エチル-2-ベンゾフリル基、5-エチル-2-ベンゾフリル基、6-エチル-2-ベンゾフリル基、7-エチル-2-ベンゾフリル基、4-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾフリル基、5-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾフリル基、6-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾフリル基、7-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾフリル基、4-メトキシ-2-ベンゾフリル基、5-メトキシ-2-ベンゾフリル基、6-メトキシ-2-ベンゾフリル基、7-メトキシ-2-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、4-イソプロピル-2-ベンゾフリル基、5-イソプロピル-2-ベンゾフリル基、6-イソプロピル-2-ベンゾフリル基、7-イソプロピル-2-ベンゾフリル基、4-ヘキシル-2-ベンゾフリル基、5-ヘキシル-2-ベンゾフリル基、6-ヘキシル-2-ベンゾフリル基、7-ヘキシル-2-ベンゾフリル基、4-エトキシ-2-ベンゾフリル基、5-エトキシ-2-ベンゾフリル基、6-エトキシ-2-ベンゾフリル基、7-エトキシ-2-ベンゾフリル基、4-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、6-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、7-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、3-ベンゾフリル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリル基、6-フルオロ-3-ベンゾフリル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリル基、4-クロロ-3-ベンゾフリル基、5-クロロ-3-ベンゾフリル基、6-クロロ-3-ベンゾフリル基、7-クロロ-3-ベンゾフリル基、4-ブロモ-3-ベンゾフリル基、5-ブロモ-3-ベンゾフリル基、6-ブロモ-3-ベンゾフリル基、7-ブロモ-3-ベンゾフリル基、4-メチル-3-ベンゾフリル基、5-メチル-3-ベンゾフリル基、6-メチル-3-ベンゾフリル基、7-メチル-3-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、4-エチル-3-ベンゾフリル基、5-エチル-3-ベンゾフリル基、6-エチル-3-ベンゾフリル基、7-エチル-3-ベン

10

20

30

40

50

ゾフリル基、4-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾフリル基、5-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾフリル基、6-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾフリル基、7-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾフリル基、4-メトキシ-3-ベンゾフリル基、5-メトキシ-3-ベンゾフリル基、6-メトキシ-3-ベンゾフリル基、7-メトキシ-3-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、4-イソプロピル-3-ベンゾフリル基、5-イソプロピル-3-ベンゾフリル基、6-イソプロピル-3-ベンゾフリル基、7-イソプロピル-3-ベンゾフリル基、4-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、5-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、6-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、7-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、4-エトキシ-3-ベンゾフリル基、5-エトキシ-3-ベンゾフリル基、6-エトキシ-3-ベンゾフリル基、7-エトキシ-3-ベンゾフリル基、4-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、6-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、7-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、5, 6, 7-トリクロロ-2-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基等のベンゾフリル基〔ベンゾフラン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

10

20

【0263】

フリル基〔フラン環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい。〕としては、例えば、2-フリル基、3, 5-ジフェニル-2-フリル基、2, 4, 5-トリフェニル-3-フリル基、5-(4-クロロフェニル)-2-フリル基、4-(4-フルオロフェニル)-2-フリル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-フリル基、3-(4-ブromoフェニル)-2-フリル基、3-フリル基、5-(2, 4-ジクロロフェニル)-3-フリル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-3-フリル基、3-(4-ヨードフェニル)-3-フリル基等のフリル基〔フラン環上には、置換基としてハロゲン原子1～5個有することのあるフェニル基が1～3個置換していてもよい。〕を挙げることができる。

30

【0264】

フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6のアルキル基；C 3～8シクロアルキル基；ヒドロキシル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～8のアルコキシ基；C 3～8シクロアルコキシ基；C 1～4アルキレンジオキシ基；シアノ基；ニトロ基；フェニルC 2～6アルケニル基；C 2～6アルカノイルオキシ基；置換基としてC 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基；C 1～6アルキルスルホニルアミノ基；フェニルC 1～6アルコキシ基；フェノキシ基；C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換したアミノ基；フェニル基が少なくとも1個置換したアミノ基；アミノC 1～6アルコキシ基〔アミノ基上には、C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕；C 1～6アルコキシカルボニル基；C 1～6アルコキシカルボニルC 1～6アルコキシ基；C 1～6アルキルチオ基；ピロリル基；イミダゾリル基；ピペリジル基；モルホリノ基；ピロリジニル基；チエニル基；ベンゾフリル基；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、置換基としてC 1～6アルキル基、フェニルC 1～6アルキル基及びC 1～6アルキル基を少なくとも1種有することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置換していてもよい〕；キノリル基〔キノリン環上にC 1～6アルコキシ基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；ピペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカ

40

50

ルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、3-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3, 5-ジ(トリフルオロメチル)フェニル基、3, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、4-n-ペンチルフェニル基、4-n-ヘキシルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、4-シクロプロピルフェニル基、4-シクロブチルフェニル基、4-シクロペンチルフェニル基、4-シクロヘキシルフェニル基、4-シクロヘプチルフェニル基、4-シクロオクチルフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3, 5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基、4-n-ヘプチルオキシフェニル基、4-n-オクチルオキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-シクロプロポキシフェニル基、4-シクロブトキシフェニル基、4-シクロペントキシフェニル基、4-シクロヘキシルオキシフェニル基、4-シクロヘプチルオキシフェニル基、4-シクロオクチルオキシフェニル基、4-ペントキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2-ヒドロキシフェニル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、2, 4-ジヒドロキシフェニル基、2, 4, 6-トリヒドロキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル基、2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル基、2, 3-メチレンジオキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシ

10

20

30

40

50

フェニル基、2, 3-エチレンジオキシフェニル基、3, 4-エチレンジオキシフェニル
 基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2, 3-ジ
 シアノフェニル基、2, 4, 6-トリシアノフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニ
 トロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2, 4-ジニトロフェニル基、2, 4, 6-トリ
 ニトロフェニル基、2-シンナミルフェニル基、3-シンナミルフェニル基、4-シン
 ナミルフェニル基、2-アセチルオキシフェニル基、3-アセチルオキシフェニル基、2
 -アミノフェニル基、2, 4-ジアミノフェニル基、2, 4, 6-トリアミノフェニル基
 、4-アセチルオキシフェニル基、2-プロピオニルオキシフェニル基、3-プロピオニ
 ルオキシフェニル基、4-プロピオニルオキシフェニル基、2-ブチリルオキシフェニル
 基、3-ブチリルオキシフェニル基、4-ブチリルオキシフェニル基、4-ペンタノイル
 オキシフェニル基、4-ヘキサノイルオキシフェニル基、2-アセチルアミノフェニル基
 、3-アセチルアミノフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基、2-プロピオニルア
 ミノフェニル基、3-プロピオニルアミノフェニル基、4-プロピオニルアミノフェニル
 基、2-ブチリルアミノフェニル基、3-ブチリルアミノフェニル基、4-ブチリルアミ
 ノフェニル基、4-ペンタノイルアミノフェニル基、4-ヘキサノイルアミノフェニル基
 、2-メタンスルホニルアミノフェニル基、3-メタンスルホニルアミノフェニル基、4
 -メタンスルホニルアミノフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルオ
 キシフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、2-(2-フェニルエトキシ)フェニ
 ル基、3-(2-フェニルエトキシ)フェニル基、4-(2-フェニルエトキシ)フェニ
 ル基、2-(3-フェニルプロポキシ)フェニル基、3-(3-フェニルプロポキシ)フェ
 ニル基、4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル基、2-(4-フェニルブトキシ)
 フェニル基、3-(4-フェニルブトキシ)フェニル基、4-(4-フェニルブトキシ)
 フェニル基、2-(5-フェニルペントキシ)フェニル基、3-(5-フェニルペントキシ)
 フェニル基、4-(5-フェニルペントキシ)フェニル基、2-(6-フェニルヘキ
 シルオキシ)フェニル基、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル基、4-(6-
 フェニルヘキシルオキシ)フェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェ
 ニル基、4-フェノキシフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3-エチルアミノフ
 ェニル基、4-プロピルアミノフェニル基、2-n-ブチルアミノフェニル基、3-n-
 ペンチルアミノフェニル基、4-n-ヘキシシルアミノフェニル基、2-ジメチルアミノ
 フェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-ジエ
 チルアミノフェニル基、3-ジエチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基
 、2-ジー(n-プロピル)アミノフェニル基、3-ジー(n-プロピル)アミノフェニ
 ル基、4-ジー(n-プロピル)アミノフェニル基、3-フェニルアミノフェニル基、2
 -ジフェニルアミノフェニル基、3-ジフェニルアミノフェニル基、4-ジフェニルアミ
 ノフェニル基、2-(2-メチルアミノエトキシ)フェニル基、3-エチルアミノメトキ
 シフェニル基、2-(2-ジメチルアミノエトキシ)フェニル基、3-(2-ジメチルア
 ミノエトキシ)フェニル基、4-(2-ジメチルアミノエトキシ)フェニル基、2-(3
 -ジメチルアミノプロポキシ)フェニル基、3-(3-ジメチルアミノプロポキシ)フェ
 ニル基、4-(3-ジメチルアミノプロポキシ)フェニル基、4-(4-ジメチルアミノ
 ブトキシ)フェニル基、4-(5-ジメチルアミノペントキシ)フェニル基、4-(6-
 ジメチルアミノヘキシルオキシ)フェニル基、2-(2-ジエチルアミノエトキシ)フェ
 ニル基、3-(2-ジエチルアミノエトキシ)フェニル基、4-(2-ジエチルアミノエ
 トキシ)フェニル基、2-(3-ジエチルアミノプロポキシ)フェニル基、3-(3-ジエ
 チルアミノプロポキシ)フェニル基、4-(3-ジエチルアミノプロポキシ)フェニル
 基、4-(4-ジエチルアミノブトキシ)フェニル基、4-(5-ジエチルアミノペント
 キシ)フェニル基、4-(6-ジエチルアミノヘキシルオキシ)フェニル基、2-メトキ
 シカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニル
 フェニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、
 4-エトキシカルボニルフェニル基、4-(3-プロポキシカルボニル)フェニル基、4
 -(4-ブトキシカルボニル)フェニル基、4-(5-ペントキシカルボニル)フェニル

10

20

30

40

50

基、4-(6-ヘキシルオキシカルボニル)フェニル基、2-メトキシカルボニルメトキシフェニル基、3-メトキシカルボニルメトキシフェニル基、4-メトキシカルボニルメトキシフェニル基、2-エトキシカルボニルメトキシフェニル基、3-エトキシカルボニルメトキシフェニル基、4-エトキシカルボニルメトキシフェニル基、4-(3-プロポキシカルボニル)メトキシフェニル基、4-(4-ブトキシカルボニル)メトキシフェニル基、4-(5-ペントキシカルボニル)メトキシフェニル基、4-(6-ヘキシルオキシカルボニル)メトキシフェニル基、4-(2-メトキシカルボニルエトキシ)フェニル基、4-(2-エトキシカルボニル)エトキシフェニル基、4-(2-(3-プロポキシカルボニル)エトキシ)フェニル基、4-(2-(4-ブトキシカルボニル)エトキシ)フェニル基、4-(2-(5-ペントキシカルボニル)エトキシ)フェニル基、4-(2-(6-ヘキシルオキシカルボニル)エトキシ)フェニル基、4-(3-メトキシカルボニルプロポキシ)フェニル基、4-(3-(2-エトキシカルボニル)プロポキシ)フェニル基、4-(3-(3-プロポキシカルボニル)プロポキシ)フェニル基、4-(3-(4-ブトキシカルボニル)プロポキシ)フェニル基、4-(3-(5-ペントキシカルボニル)プロポキシ)フェニル基、4-(3-(6-ヘキシルオキシカルボニル)プロポキシ)フェニル基、4-(4-メトキシカルボニルブトキシ)フェニル基、4-(4-(2-エトキシカルボニル)ブトキシ)フェニル基、4-(5-メトキシカルボニルペントキシ)フェニル基、4-(5-(2-エトキシカルボニル)ペントキシ)フェニル基、4-(6-(2-エトキシカルボニル)ヘキシルオキシ)フェニル基、2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-エチルチオフェニル基、4-n-プロピルチオフェニル基、4-イソプロピルチオフェニル基、4-n-ブチルチオフェニル基、4-tert-ブチルチオフェニル基、4-n-ペンチルチオフェニル基、4-n-ヘキシルチオフェニル基、2-(1-ピロリル)フェニル基、3-(1-ピロリル)フェニル基、4-(1-ピロリル)フェニル基、2-(1-イミダゾリル)フェニル基、3-(1-イミダゾリル)フェニル基、4-(1-イミダゾリル)フェニル基、2-ピペリジノフェニル基、3-ピペリジノフェニル基、4-ピペリジノフェニル基、4-モルホリノフェニル基、3-モルホリノフェニル基、2-モルホリノフェニル基、2-(1-ピロリジニル)フェニル基、3-(1-ピロリジニル)フェニル基、4-(1-ピロリジニル)フェニル基、2-(2-チエニル)フェニル基、3-(2-チエニル)フェニル基、4-(2-チエニル)フェニル基、2-(2-ベンゾフリル)フェニル基、3-(2-ベンゾフリル)フェニル基、4-(2-ベンゾフリル)フェニル基、2-(1-ピペラジニル)フェニル基、3-(1-ピペラジニル)フェニル基、4-(1-ピペラジニル)フェニル基、2-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニル基、3-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-エチル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-n-プロピル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-イソプロピル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-n-ブチル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-tert-ブチル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-n-ペンチル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-n-ヘキシル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(2-フェネチル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-ベンゾイル-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(2-メチルベンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(2,3-ジメチルベンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(2,4,6-トリメチルベンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(3-メチルベンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(4-メチルベンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、4-(4-(4-エチルベンゾイル)-1-ピペラジニル)フェニル基、

10

20

30

40

50

) フェニル基、4-(4-(4-イソプロピルベンゾイル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-(4-n-ブチルベンゾイル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-(4-n-ペンチルベンゾイル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-n-ヘキシルベンゾイル)-1-ピペラジニル) フェニル基、3-(2-キノリル) フェニル、4-(4, 5, 6-トリメトキシ-3-キノリル) フェニル基、4-(6-メトキシ-2-キノリル) フェニル基、2-(5, 6-ジメトキシ-4-キノリル) フェニル基、3-(2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(5-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(5-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(6-メトキシ-2-オキソ-7-キノリル) フェニル基、4-(6-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(7-メトキシ-2-オキソ-6-キノリル) フェニル基、4-(7-メトキシ-2-オキソ-8-キノリル) フェニル基、3-(8-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(8-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(5, 6-ジエトキシ-2-オキソ-4-キノリル) フェニル基、4-(5-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(6-エトキシ-2-オキソ-5-キノリル) フェニル基、4-(6-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(7-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(7-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(8-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(8-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(1-ピペリジニルカルボニル) フェニル、4-(4-(カルボスチリル-1-イル) ピペリジニル-1-カルボニル) フェニル基、4-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6のアルキル基; C3~8シクロアルキル基; ヒドロキシ基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8のアルコキシ基; C3~8シクロアルコキシ基; C1~4アルキレンジオキシ基; シアノ基; ニトロ基; フェニルC2~6アルケニル基; C2~6アルカノイルオキシ基; 置換基としてC1~6アルカノイル基を1~2個有することのあるアミノ基; C1~6アルキルスルホニルアミノ基; フェニルC1~6アルコキシ基; フェノキシ基; 置換基としてC1~6アルキル基が1~2個置換したアミノ基; フェニル基が1~2個置換したアミノ基; 置換基としてC1~6アルキル基が1~2個置換していてもよいアミノC1~6アルコキシ基; C1~6アルコキシカルボニル基; C1~6アルコキシカルボニルC1~6アルコキシ基; C1~6アルキルチオ基; ピロリル基; イミダゾリル基; ピペリジル基; モルホリノ基; ピロリジニル基; チエニル基; ベンゾフリル基; ピペラジニル基[ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個有することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置換していてもよい]; キノリン環上にC1~6アルコキシ基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいキノリル基; ピペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。置換基がC1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~3個置換するのがよい。)を挙げることができる。

【0265】

ナフチル基(ナフタレン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、1-ナフチルメチル基、2-(2-ナフチル)エチル基、1-(3-ナフチル)エチル基、3-(4-ナフチル)プロピル基、4-(5-ナフチル)ブチル基、5-(6-ナフチル)ペンチル基、6-(7-ナフチル)ヘキシル基、2-メチル-3-(8-ナフチル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(3-ナフチル)エチル基、2-フルオロ-1-ナフチル基、2-クロロ-1-ナフチル基、2-ブロモ-1-ナフチル基、3-フルオロ-1-ナフチル基、3-クロロ-1-ナフチル基、3-ブロモ-1-ナフチル基、4-フルオロ-1

ーナフチル基、4-クロロ-1-ナフチル基、4-ブロモ-1-ナフチル基、5-フルオ
 ロ-1-ナフチル基、5-クロロ-1-ナフチル基、5-ブロモ-1-ナフチル基、6-
 フルオロ-1-ナフチル基、6-クロロ-1-ナフチル基、6-ブロモ-1-ナフチル基
 、7-フルオロ-1-ナフチル基、7-クロロ-1-ナフチル基、7-ブロモ-1-ナフ
 チル基、1-フルオロ-2-ナフチル基、8-フルオロ-1-ナフチル基、8-クロロ-
 1-ナフチル基、8-ブロモ-1-ナフチル基、1-フルオロ-2-ナフチル基、1-ク
 ロロ-2-ナフチル基、1-ブロモ-2-ナフチル基、3-フルオロ-2-ナフチル基、
 3-クロロ-2-ナフチル基、3-ブロモ-2-ナフチル基、4-フルオロ-2-ナフチ
 ル基、4-クロロ-2-ナフチル基、4-ブロモ-2-ナフチル基、4-ジメチルアミノ
 -1-ナフチル基、2-メトキシ-1-ナフチル基、3-メトキシ-1-ナフチル基、4
 -メトキシ-1-ナフチル基、5-メトキシ-1-ナフチル基、6-メトキシ-1-ナフ
 チル基、7-メトキシ-1-ナフチル基、8-メトキシ-1-ナフチル基、2-トリフル
 オロメトキシ-1-ナフチル基、3-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、4-トリ
 フルオロメトキシ-1-ナフチル基、5-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、6-
 トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、7-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、
 8-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、3-アミノ-2-ナフチル基、2-メチル
 アミノ-1-ナフチル基、4-エチルアミノ-2-ナフチル基、5-プロピルアミノ-1-
 ナフチル基、6-n-ブチルアミノ-2-ナフチル基、7-n-ペンチルアミノ-1-
 ナフチル基、8-ヘキシルアミノ-2-ナフチル基、2, 3-ジクロロ-1-ナフチル基
 、2, 4, 6-トリクロロ-1-ナフチル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシ-
 1-ナフチル基、2-クロロ-6-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、2-ジメチルアミ
 ノ-1-ナフチル基、3-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-1-
 ナフチル基、5-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-1-ナフチ
 ル基、7-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、8-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、1-
 メトキシ-2-ナフチル基、3-メトキシ-2-ナフチル基、4-メトキシ-2-ナフチ
 ル基、5-メトキシ-2-ナフチル基、6-メトキシ-2-ナフチル基、7-メトキシ-
 2-ナフチル基、8-メトキシ-2-ナフチル基、1-トリフルオロメトキシ-2-ナフ
 チル基、3-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、4-トリフルオロメトキシ-2-
 ナフチル基、5-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、6-トリフルオロメトキシ-
 2-ナフチル基、7-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、8-トリフルオロメトキ
 シ-2-ナフチル基、1-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、3-ジメチルアミノ-2-
 ナフチル基、4-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-2-ナフチ
 ル基、6-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、8-
 ジメチルアミノ-2-ナフチル基等のナフトレン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換も
 しくは未置換のC 1~6 アルコキシ基及び置換基としてC 1~6 アルキル基を1~2 個有す
 ることのあるアミノ基なる群から選ばれた基が1~3 個置換していてもよいナフチル基を
 挙げることができる。

【0266】

ビフェニリル基（ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換
 のC 1~9 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる
 群より選ばれた基の少なくとも1 種が置換していてもよい）としては、例えば、3-ビフ
 ェニリル基、4-ビフェニリル基、2'-フルオロ-3-ビフェニリル基、3'-フルオ
 ロ-3-ビフェニリル基、4'-フルオロ-3-ビフェニリル基、3', 4'-ジフルオ
 ロ-3-ビフェニリル基、3', 4', 5'-トリクロロ-3-ビフェニリル基、2',
 3', 4', 5', 6'-ペンタフルオロ-4-ビフェニリル基、2'-フルオロ-3',
 4'-ジトリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、2', 4'-ジフルオロ-3-ビ
 フェニリル基、3', 5'-ジフルオロ-3-ビフェニリル基、2'-クロロ-3-ビフ
 ェニリル基、3'-クロロ-3-ビフェニリル基、4'-クロロ-3-ビフェニリル基、
 3', 4'-ジクロロ-3-ビフェニリル基、2', 4'-ジクロロ-3-ビフェニリル
 基、3', 5'-ジクロロ-3-ビフェニリル基、2'-メチル-3-ビフェニリル基、

3'-メチル-3-ビフェニリル基、4'-メチル-3-ビフェニリル基、3', 4'-ジメチル-3-ビフェニリル基、2', 4'-ジメチル-3-ビフェニリル基、3', 5'-ジメチル-3-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、3', 4'-ジトリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、2', 4'-ジトリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、3', 5'-ジトリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、2'-メトキシ-3-ビフェニリル基、3'-メトキシ-3-ビフェニリル基、4'-メトキシ-3-ビフェニリル基、3', 4'-ジメトキシ-3-ビフェニリル基、2', 4'-ジメトキシ-3-ビフェニリル基、3', 4', 5'-トリメトキシ-3-ビフェニリル基、3', 5'-ジメトキシ-3-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、3', 4'-ジトリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、2', 4'-ジトリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、3', 5'-ジトリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、2'-フルオロ-4-ビフェニリル基、3'-フルオロ-4-ビフェニリル基、4'-フルオロ-4-ビフェニリル基、3', 4'-ジフルオロ-4-ビフェニリル基、2', 4'-ジフルオロ-4-ビフェニリル基、3', 5'-ジフルオロ-4-ビフェニリル基、2'-クロロ-4-ビフェニリル基、3'-クロロ-4-ビフェニリル基、4'-クロロ-4-ビフェニリル基、3', 4'-ジクロロ-4-ビフェニリル基、2', 4'-ジクロロ-4-ビフェニリル基、3', 5'-ジクロロ-4-ビフェニリル基、2'-メチル-4-ビフェニリル基、3'-メチル-4-ビフェニリル基、4'-メチル-4-ビフェニリル基、4'-エチル-4-ビフェニリル基、4'-n-プロピル-4-ビフェニリル基、4'-n-ブチル-4-ビフェニリル基、4'-n-ペンチル-4-ビフェニリル基、4'-n-ヘキシル-4-ビフェニリル基、4'-n-ヘプチル-4-ビフェニリル基、4'-n-オクチル-4-ビフェニリル基、4'-n-ノニル-4-ビフェニリル基、3', 4'-ジメチル-4-ビフェニリル基、2', 4'-ジメチル-4-ビフェニリル基、3', 5'-ジメチル-4-ビフェニリル基、3', 4', 5'-トリメチル-4-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、3', 4'-ジトリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、2', 4'-ジトリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、3', 5'-ジトリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、2'-メトキシ-4-ビフェニリル基、3'-メトキシ-4-ビフェニリル基、4'-メトキシ-4-ビフェニリル基、3', 4'-ジメトキシ-4-ビフェニリル基、2', 4'-ジメトキシ-4-ビフェニリル基、3', 4'-ジメトキシ-2'-クロロ-4-ビフェニリル基、3', 5'-ジメトキシ-4-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、3', 4'-ジトリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、2', 4'-ジトリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、3', 5'-ジトリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基等のビフェニリル基（ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0267】

ベンゾチエニル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）としては、例えば、2-ベンゾチエニル基、3-ベンゾチエニル基、3-メチル-2-ベンゾチエニル基、2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、4, 5, 6-トリクロロ-2-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、4-クロロ-2-ベン

10

20

30

40

50

50

ンゾチエニル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-3-ベンゾチエニル基、5-クロロ-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-3-ベンゾチエニル基、7-クロロ-3-ベンゾチエニル基、4-ブロモ-3-ベンゾチエニル基、5-ブロモ-3-ベンゾチエニル基、6-ブロモ-3-ベンゾチエニル基、7-ブロモ-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、5-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、6-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、7-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-クロロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-クロロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-ブロモ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-ブロモ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-ブロモ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-ブロモ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-メチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-メチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-メチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-トリフルオロメチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-トリフルオロメチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-エチル-3-ベンゾチエニル基、5-エチル-3-ベンゾチエニル基、6-エチル-3-ベンゾチエニル基、7-エチル-3-ベンゾチエニル基、4-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾチエニル基、5-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾチエニル基、6-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾチエニル基、7-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、5-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、4-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、5-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、6-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、7-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、4-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、5-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、6-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、7-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、4-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、5-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、7-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、5-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基等のベンゾチエニル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基 1～3 個が置換していてもよい。）を挙げることができる。

【0268】

ピリジル基（ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基から

10

20

30

40

50

なる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい]、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、無置換の2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオロ-2-ピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、3-クロロ-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、5-クロロ-2-ピリジル基、6-クロロ-2-ピリジル基、6-クロロ-4-メチル-2-ピリジル基、3, 4, 5-トリクロロ-2-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-メチル-2-ピリジル基、3-エチル-2-ピリジル基、4-エチル-2-ピリジル基、5-エチル-2-ピリジル基、6-エチル-2-ピリジル基、3-n-プロピル-2-ピリジル基、4-n-プロピル-2-ピリジル基、5-n-プロピル-2-ピリジル基、6-n-プロピル-2-ピリジル基、5-tert-ブチル-2-ピリジル基、4-n-ペンチル-2-ピリジル基、5-n-ヘキシル-2-ピリジル基、6-n-ヘキシル-2-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、4-クロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-3-ピリジル基、6-クロロ-3-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-メチル-3-ピリジル基、4-メチル-3-ピリジル基、5-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、4-エチル-3-ピリジル基、5-エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、2-プロピル-3-ピリジル基、4-プロピル-3-ピリジル基、5-プロピル-3-ピリジル基、6-プロピル-3-ピリジル基、5-tert-ブチル-3-ピリジル基、4-ペンチル-3-ピリジル基、5-ヘキシル-3-ピリジル基、6-ヘキシル-3-ピリジル基、3-クロロ-4-ピリジル基、2-クロロ-4-ピリジル基、3-メチル-4-ピリジル基、2-メチル-4-ピリジル基、3-トリフルオロメチル-4-ピリジル基、3-エチル-4-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル基、3-プロピル-4-ピリジル基、6-n-プロピル-4-ピリジル基、5-tert-ブチル-4-ピリジル基、2-n-ヘキシル-4-ピリジル基、3-フェニル-2-ピリジル基、4-フェニル-2-ピリジル基、5-フェニル-2-ピリジル基、6-フェニル-2-ピリジル基、2-フェニル-3-ピリジル基、2-フェニル-4-ピリジル基、2-フェニル-5-ピリジル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-ピリジル基、3-(3-フルオロ-4-クロロフェニル)-2-ピリジル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-ピリジル基、3-(4-ブromoフェニル)-4-ピリジル基、3-(3-フルオロフェニル)-4-ピリジル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-ピリジル基、4-(3-フルオロ-4-クロロフェニル)-2-ピリジル基、4-(3-フルオロフェニル)-2-ピリジル基、3-(4-クロロフェニル)-2-ピリジル基、4-(4-クロロフェニル)-2-ピリジル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ピリジル基、6-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-ピリジル基、2-(4-クロロフェニル)-3-ピリジル基、2-(4-クロロフェニル)-4-ピリジル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ピリジル基、4-(3-フルオロ-4-クロロフェニル)-2-ピリジル基、5-(4-ヨード-3-クロロフェニル)-2-ピリジル基、6-(4-フルオロ-3-クロロフェニル)-2-ピリジル基、2-(4-フルオロ-3-クロロフェニル)-3-ピリジル基、2-(4-フルオロ-3-クロロフェニル)-4-ピリジル基、6-(4-フルオロ-3-クロロフェニル)-3-ピリジル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリジル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピリジル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-ピリジル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピリジル基、5-(4-メチルフェニル)-2-ピリジル基、6-(4-メチルフェニル)-2-ピリジル基、2-(4-メチルフェニル)-3-ピリジル基、2-(4-メチルフェニル)-4-ピリジル基、6-(4-メチルフェニル)-3-ピリジル基、4-フルオロ-2-(4-メトキシフェニル)-3-ピリジル基、4-メチル-5-フェニル-3-クロロ-2-ピリジル基、5-(4-メトキシフェニル)-2-ピリジル基、6-(4-メトキシフェニル)-2-ピリジル基、2-(4-メトキ

10

20

30

40

50

シフェニル) - 3-ピリジル基、2-(4-メトキシフェニル) - 4-ピリジル基、6-(4-メトキシフェニル) - 3-ピリジル基、5-(4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) - 4-ピリジル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、5-(3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、6-(3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、2-(3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、2-(3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 4-ピリジル基、6-(3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、5-(3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、6-(3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、2-(3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、2-(3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 4-ピリジル基、6-(3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、5-(3, 4-ジメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、6-(3, 4-ジメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、2-(3, 4-ジメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、2-(3, 4-ジメトキシフェニル) - 4-ピリジル基、6-(3, 4-ジメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、5-(3, 4-ジフルオロフェニル) - 2-ピリジル基、6-(3, 4-ジフルオロフェニル) - 2-ピリジル基、2-(3, 4-ジフルオロフェニル) - 3-ピリジル基、2-(3, 4-ジフルオロフェニル) - 4-ピリジル基、6-(3, 4-ジフルオロフェニル) - 3-ピリジル基、5-(3, 4-ジクロロフェニル) - 2-ピリジル基、6-(3, 4-ジクロロフェニル) - 2-ピリジル基、2-(3, 4-ジクロロフェニル) - 3-ピリジル基、2-(3, 4-ジクロロフェニル) - 4-ピリジル基、6-(3, 4-ジクロロフェニル) - 3-ピリジル基、5-(2-フリル) - 2-ピリジル基、6-(2-フリル) - 2-ピリジル基、5-(2-フリル) - 3-ピリジル基、6-(2-フリル) - 3-ピリジル基、5-(3-フリル) - 2-ピリジル基、6-(3-フリル) - 2-ピリジル基、5-(3-フリル) - 3-ピリジル基、6-(3-フリル) - 3-ピリジル基、5-(2-チエニル) - 2-ピリジル基、6-(2-チエニル) - 2-ピリジル基、5-(2-チエニル) - 3-ピリジル基、6-(2-チエニル) - 3-ピリジル基、5-(3-チエニル) - 2-ピリジル基、6-(3-チエニル) - 2-ピリジル基、5-(3-チエニル) - 3-ピリジル基、6-(3-チエニル) - 3-ピリジル基等のピリジル基(ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基が1~3個が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0269】

フリル基(フラン環上には、C1~6のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6のアルコキシ基及びニトロ基なる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)としては、例えば、2-フリル基、3-フリル基、3-メチル-2-フリル基、3, 4-ジメチル-2-フリル基、3, 4, 5-トリメチル-2-フリル基、4-メチル-2-フリル基、5-メチル-2-フリル基、3-エチル-2-フリル基、4-エチル-2-フリル基、5-エチル-2-フリル基、3-n-プロピル-2-フリル基、4-n-プロピル-2-フリル基、5-n-プロピル-2-フリル基、3-n-ブチル-2-フリル基、4-n-ブチル-2-フリル基、5-n-ブチル-2-フリル基、3-n-ペンチル-2-フリル基、4-n-ペンチル-2-フリル基、5-n-ペンチル-2-フリル基、3-n-ヘキシル-2-フリル基、4-n-ヘキシル-2-フリル基、5-n-ヘキシ

10

20

30

40

50

ルー 2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、4-メチル-3-フリル基、5-メチル-
 3-フリル基、2-エチル-3-フリル基、4-エチル-3-フリル基、5-エチル-
 3-フリル基、2-n-プロピル-3-フリル基、4-n-プロピル-3-フリル基、5-
 n-プロピル-3-フリル基、2-n-ブチル-3-フリル基、4-n-ブチル-3-
 フリル基、5-n-ブチル-3-フリル基、2-n-ペンチル-3-フリル基、4-n-
 ペンチル-3-フリル基、5-n-ペンチル-3-フリル基、2-n-ヘキシル-3-フ
 リル基、4-n-ヘキシル-3-フリル基、5-n-ヘキシル-3-フリル基、3-ニト
 ロ-2-フリル基、4-ニトロ-2-フリル基、5-ニトロ-2-フリル基、2-ニトロ
 -3-フリル基、4-ニトロ-3-フリル基、3-フェニル-2-フリル基、4-フェニ
 ル-2-フリル基、5-フェニル-2-フリル基、3-フェニル-4-フリル基、4-フ
 ェニル-3-フリル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-フリル基、4-(3-フル
 オロフェニル)-2-フリル基、5-(3-フルオロフェニル)-2-フリル基、2-(
 3-フルオロフェニル)-3-フリル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-フリル基
 、4-(2-フルオロフェニル)-2-フリル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-フ
 リル基、2-(2-フルオロフェニル)-3-フリル基、4-ニトロ-3-フリル基、
 3-(4-フルオロフェニル)-2-フリル基、4-(4-フルオロフェニル)-2-フ
 リル基、5-(4-フルオロフェニル)-2-フリル基、2-(4-フルオロフェニル)
 -3-フリル基、4-(4-フルオロフェニル)-3-フリル基、3-(3,4-ジフル
 オロフェニル)-2-フリル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)
 -2-フリル基、5-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-フリル基、2-(3,4-
 ジフルオロフェニル)-3-フリル基、4-(3,4-ジフルオロフェニル)-3-フリ
 ル基、3-(4-クロロフェニル)-2-フリル基、4-(4-クロロフェニル)-2-フ
 リル基、5-(4-クロロフェニル)-2-フリル基、2-(4-クロロフェニル)-
 3-フリル基、4-(4-クロロフェニル)-3-フリル基、3-(2-クロロフェニル)
 -2-フリル基、4-(2-クロロフェニル)-2-フリル基、5-(2-クロロフェ
 ニル)-2-フリル基、2-(2-クロロフェニル)-3-フリル基、4-(2-クロロ
 フェニル)-3-フリル基、5-(2-クロロフェニル)-3-フリル基、3-(3-ク
 ロロフェニル)-2-フリル基、4-(3-クロロフェニル)-2-フリル基、5-(3
 -クロロフェニル)-2-フリル基、2-(3-クロロフェニル)-3-フリル基、4-
 (3-クロロフェニル)-3-フリル基、3-(3,4,5-トリクロロフェニル)-2
 -フリル基、4-(3,4-ジクロロフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジクロ
 ロフェニル)-2-フリル基、2-(3,4-ジクロロフェニル)-3-フリル基、4-
 (3,4-ジクロロフェニル)-3-フリル基、3-(4-メチルフェニル)-2-フリ
 ル基、4-(4-メチルフェニル)-2-フリル基、5-(4-メチルフェニル)-2-
 フリル基、2-(4-メチルフェニル)-3-フリル基、4-(4-メチルフェニル)-
 3-フリル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-フリル基、4-(4-ト
 リフルオロメチルフェニル)-2-フリル基、5-(4-トリフルオロメチルフェ
 ニル)-2-フリル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-フリル基、4-
 (4-トリフルオロメチルフェニル)-3-フリル基、3-(2-トリフルオロメチ
 ルフェニル)-2-フリル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-フリ
 ル基、5-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-フリル基、2-(2-トリフル
 オロメチルフェニル)-3-フリル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-
 3-フリル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-フリル基、4-(3-ト
 リフルオロメチルフェニル)-2-フリル基、5-(4-トリフルオロメチルフェ
 ニル)-2-フリル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-3-フリル基、4-
 (3-トリフルオロメチルフェニル)-3-フリル基、3-(2-クロロ-5-トリフル
 オロメチルフェニル)-2-フリル基、4-(2-クロロ-5-トリフルオロメチ
 ルフェニル)-2-フリル基、5-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニ
 ル)-2-フリル基、2-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)-3-フリ
 ル基、4-(2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル)-3-フリル基、3-
 (4-メトキシフェニル)-2-フリル基、4

10

20

30

40

50

ー（４－メトキシフェニル）－２－フリル基、５－（４－メトキシフェニル）－２－フリル基、３－（４－メトキシフェニル）－４－フリル基、４－（４－メトキシフェニル）－３－フリル基、３－（２－メトキシフェニル）－２－フリル基、４－（２－メトキシフェニル）－２－フリル基、５－（２－メトキシフェニル）－２－フリル基、２－（２－メトキシフェニル）－３－フリル基、４－（２－メトキシフェニル）－３－フリル基、３－（２－トリフルオロメトキシフェニル）－２－フリル基、４－（２－トリフルオロメトキシフェニル）－２－フリル基、５－（２－トリフルオロメトキシフェニル）－２－フリル基、３－（４－トリフルオロメトキシフェニル）－２－フリル基、４－（４－トリフルオロメトキシフェニル）－２－フリル基、５－（４－トリフルオロメトキシフェニル）－２－フリル基、２－（４－トリフルオロメトキシフェニル）－３－フリル基、４－（４－トリフルオロメトキシフェニル）－３－フリル基、３－（３，４－ジメトキシフェニル）－２－フリル基、４－（３，４－ジメトキシフェニル）－２－フリル基、５－（３，４－ジメトキシフェニル）－２－フリル基、３－（３，４－ジメトキシフェニル）－３－フリル基、４－（３，４－ジメトキシフェニル）－３－フリル基、３－（４－ニトロフェニル）－２－フリル基、４－（４－ニトロフェニル）－２－フリル基、５－（４－ニトロフェニル）－２－フリル基、２－（４－ニトロフェニル）－３－フリル基、４－（４－ニトロフェニル）－３－フリル基、３－（３－ニトロフェニル）－２－フリル基、４－（３－ニトロフェニル）－２－フリル基、５－（３－ニトロフェニル）－２－フリル基、２－（３－ニトロフェニル）－３－フリル基、４－（３－ニトロフェニル）－３－フリル基、４－メチル－５－ニトロ－２－フリル基、４－フェニル－３，５－ジメチル－２－フリル基等のフリル基（フラン環上には、Ｃ１～６のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６のアルコキシ基及びニトロ基なる群より選ばれた基が１～５個、好ましくは１～３個置換していてもよい）からなる群より選ばれた基が１～３個置換していてもよい）を挙げることができる。

【０２７０】

ベンゾチアゾール基（ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上にＣ１～６のアルコキシ基を有することのあるフェニル基が少なくとも１個置換していてもよい。）としては、例えば、ベンゾチアゾール－２－イル基、ベンゾチアゾール－４－イル基、ベンゾチアゾール－５－イル基、ベンゾチアゾール－６－イル基、ベンゾチアゾール－７－イル基、２－フェニルベンゾチアゾール－４－イル基、２，５－ジフェニルベンゾチアゾール－４－イル基、４，５，６－トリフェニルベンゾチアゾール－２－イル基、２－フェニルベンゾチアゾール－５－イル基、２－フェニルベンゾチアゾール－６－イル基、２－フェニルベンゾチアゾール－７－イル基、２－（３－エトキシフェニル）ベンゾチアゾール－７－イル基、２－（４－プロポキシフェニル）ベンゾチアゾール－４－イル基、２－（４－ｎ－ブトキシフェニル）ベンゾチアゾール－５－イル基、２－（４－ｎ－ヘキシルオキシフェニル）ベンゾチアゾール－６－イル基、２－（４－ｎ－ペンチルオキシフェニル）ベンゾチアゾール－７－イル基、４－フェニルベンゾチアゾール－２－イル基、５－フェニルベンゾチアゾール－２－イル基、６－フェニルベンゾチアゾール－２－イル基、７－フェニルベンゾチアゾール－２－イル基、４－（３，４－ジメトキシフェニル）ベンゾチアゾール－２－イル基、５－（３，４，５－トリメトキシフェニル）ベンゾチアゾール－２－イル基、７－（３－メトキシフェニル）ベンゾチアゾール－２－イル基、４－（４－メトキシフェニル）ベンゾチアゾール－２－イル基、５－（４－メトキシフェニル）ベンゾチアゾール－２－イル基、６－（４－メトキシフェニル）ベンゾチアゾール－２－イル基、７－（４－メトキシフェニル）ベンゾチアゾール－２－イル基等のベンゾチアゾール基（ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上にＣ１～６のアルコキシ基を１～３個有することのあるフェニル基を１～３個有していてもよい。）を挙げることができる。

【０２７１】

チエニル基（チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、Ｃ１～６アルキル基、ピ

10

20

30

40

50

ラゾール環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子を有していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-チエニル基、3-フルオロ-2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-チエニル基、3-クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基、3-ブロモ-2-チエニル基、4-ブロモ-2-チエニル基、5-ブロモ-2-チエニル基、3-チエニル基、2-フルオロ-3-チエニル基、4-フルオロ-3-チエニル基、5-フルオロ-3-チエニル基、2-クロロ-3-チエニル基、4-クロロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニル基、2-ブロモ-3-チエニル基、4-ブロモ-3-チエニル基、5-ブロモ-3-チエニル基、3-ニトロ-2-チエニル基、4-ニトロ-2-チエニル基、5-ニトロ-2-チエニル基、2-ニトロ-3-チエニル基、4-ニトロ-3-チエニル基、5-ニトロ-3-チエニル基、3-メチル-2-チエニル基、4-メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、5-エチル-2-チエニル基、2-メチル-3-チエニル基、4-メチル-3-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、2, 5-ジメチル-3-チエニル基、2, 4, 5-トリメチル-3-チエニル基、2, 4-ジメチル-3-チエニル基、3-(ピラゾール-1-イル)-2-チエニル基、4-(ピラゾール-1-イル)-2-チエニル基、5-(ピラゾール-1-イル)-2-チエニル基、2-(ピラゾール-1-イル)-3-チエニル基、4-(ピラゾール-1-イル)-3-チエニル基、5-(ピラゾール-1-イル)-3-チエニル基、3-(3-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル)-2-チエニル基、4-(3-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル)-2-チエニル基、5-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-2-チエニル基、2-(1, 4, 5-トリメチルピラゾール-3-イル)-3-チエニル基、4-(1, 5-ジメチルピラゾール-3-イル)-3-チエニル基、5-(1-メチル-ピラゾール-3-イル)-3-チエニル基、5-(1-n-ペンチル-ピラゾール-5-イル)-2-チエニル基、5-(1-n-ヘキシル-ピラゾール-5-イル)-2-チエニル基、3-(5-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル)-2-チエニル基、4-(5-n-プロピル-ピラゾール-1-イル)-2-チエニル基、5-(5-n-ブチル-ピラゾール-1-イル)-2-チエニル基、2-(5-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル)-3-チエニル基、4-(5-エチル-ピラゾール-1-イル)-3-チエニル基、5-(5-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル)-3-チエニル基、3-(2-チエニル)-2-チエニル基、4-(2-チエニル)-2-チエニル基、3-クロロ-4-(2-チエニル)-2-チエニル基、5-(2-チエニル)-2-チエニル基、2-(2-チエニル)-3-チエニル基、4-(2-チエニル)-3-チエニル基、5-(2-チエニル)-3-チエニル基、3-(5-クロロ-2-チエニル)-2-チエニル基、4-(5-ブロモ-2-チエニル)-2-チエニル基、5-(5-クロロ-2-チエニル)-2-チエニル基、2-(5-クロロ-2-チエニル)-3-チエニル基、4-(5-クロロ-2-チエニル)-3-チエニル基、5-(5-クロロ-2-チエニル)-3-チエニル基、3-(4-クロロ-2-チエニル)-2-チエニル基、4-(3, 4-ジクロロ-2-チエニル)-2-チエニル基、5-(3, 4, 5-トリクロロ-2-チエニル)-2-チエニル基、2-(4-ブロモ-2-チエニル)-3-チエニル基、4-(4-クロロ-2-チエニル)-3-チエニル基、5-(4-ブロモ-2-チエニル)-3-チエニル基等のチエニル基(チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C 1～6アルキル基、ピラゾール環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が1～3個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子を1～3個有していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい。)を挙げることができる。

【0272】

インドリル基(インドール環上には、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニルC 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシカルボニ

10

20

30

40

50

ル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、インドール-1-イル、インドール-2-イル、インドール-3-イル、インドール-4-イル、インドール-5-イル、インドール-6-イル、インドール-7-イル、1-(ベンゼンスルホニル)インドール-3-イル基、1-(4-メチルベンゼンスルホニル)インドール-3-イル基、1-(3, 4-ジメチルベンゼンスルホニル)インドール-3-イル基、1-(3, 4, 6-トリメチルベンゼンスルホニル)インドール-3-イル基、1-ベンジルインドール-3-イル基、1-(2-フェネチル)インドール-3-イル基、1-(1-フェネチル)インドール-3-イル基、1-(3-フェニルプロピル)インドール-3-イル基、1-(4-フェニルブチル)インドール-3-イル基、1-(5-フェニルペンチル)インドール-3-イル基、1-(6-フェニルヘキシル)インドール-3-イル基、6-メトキシカルボニルインドール-3-イル基、6-エトキシカルボニルインドール-3-イル基、6-n-プロポキシカルボニルインドール-3-イル基、6-n-ブトキシカルボニルインドール-3-イル基、6-n-ペンチルオキシカルボニルインドール-3-イル基、6-n-ヘキシルオキシカルボニルインドール-3-イル基、2-フェニルインドール-3-イル基、1-ベンジル-6-フェニル-6-メトキシカルボニルインドール-3-イル基、1-ベンジル-6-メトキシカルボニルインドール-3-イル基、2-フェニル-1-(4-メチルベンゼンスルホニル)インドール-3-イル基等のインドリル基(インドール環上には、置換基としてC1~6アルキル基を1~3個有することのあるフェニルスルホニル基、フェニルC1~6アルキル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

【0273】

ピロリル基(ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-ピロリル基、1-メチル-2-ピロリル基、1-エチル-2-ピロリル基、1-n-プロピル-2-ピロリル基、1-n-ブチル-2-ピロリル基、1-n-ペンチル-2-ピロリル基、1-n-ヘキシル-2-ピロリル基、3-ピロリル基、1-メチル-3-ピロリル基、1-エチル-3-ピロリル基、1-n-プロピル-3-ピロリル基、1-n-ブチル-3-ピロリル基、1-n-ペンチル-3-ピロリル基、1-n-ヘキシル-3-ピロリル基、2, 5-ジメチル-3-ピロリル基、1-(3-メチルフェニル)-2, 5-ジメチル-3-ピロリル基、1-(4-メチルフェニル)-2, 5-ジメチル-3-ピロリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2, 5-ジメチル-3-ピロリル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2, 5-ジメチル-3-ピロリル基、1-(2, 3-ジメチルフェニル)-3-ピロリル基、1-(4-メチルフェニル)-3-ピロリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピロリル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピロリル基、1-(3-メチルフェニル)-3, 5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(4-メチルフェニル)-3, 5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-3, 5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3, 5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(3-メチルフェニル)-2-ピロリル基、1-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-ピロリル基、1-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-ピロリル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ピロリル基等のピロリル基(ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換することのあるフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0274】

クマリル基は、4-クマリル基、5-クマリル基、6-クマリル基、7-クマリル基及び8-クマリル基を含む。

【0275】

ベンゾイミダゾリル基（ベンゾイミダゾール環上には、少なくとも1個のチエニル基が置換していてもよい）としては、例えば、2-ベンゾイミダゾリル基、4-ベンゾイミダゾリル基、5-ベンゾイミダゾリル基、6-ベンゾイミダゾリル基、2-（2-チエニル）-4-ベンゾイミダゾリル基、2-（2-チエニル）-5-ベンゾイミダゾリル基、2-（2-チエニル）-6-ベンゾイミダゾリル基、2-（2-チエニル）-7-ベンゾイミダゾリル基、2-（3-チエニル）-4-ベンゾイミダゾリル基、2-（3-チエニル）-5-ベンゾイミダゾリル基、2-（3-チエニル）-6-ベンゾイミダゾリル基、2-（3-チエニル）-7-ベンゾイミダゾリル基等を挙げることができる。

【0276】

オキサゾリル基（オキサゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、2-オキサゾリル基、4-オキサゾリル基、5-オキサゾリル基、2-フェニル-4-オキサゾリル基、2-（4-フルオロフェニル）-4-オキサゾリル基、2, 4-ジ（4-クロロフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-クロロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-ヨードフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-フルオロフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-クロロフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-ヨードフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-フルオロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（3, 4-クロロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-ヨードフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（2, 4, 6-トリクロロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-ヨードフェニル）-5-オキサゾリル基等のオキサゾリル基（オキサゾール環上には、ハロゲン原子を1～5個有することのあるフェニル基を置換基として1～2個が置換していてもよい）を挙げるすることができる。

【0277】

チアゾリル基（チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が置換していてもよい。該フェニル環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）としては、例えば、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、2-フェニル-4-チアゾリル基、2-フェニル-5-チアゾリル基、2, 4-ジフェニル-5-チアゾリル基、2, 5-ジフェニル-4-チアゾリル基、2-（4-クロロフェニル）-4-チアゾリル基、2-（4-フルオロフェニル）-5-チアゾリル基、2-（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル）-4-チアゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-4-チアゾリル基、2-（3, 4-ジクロロフェニル）-4-チアゾリル基、2-（3, 4-ジクロロフェニル）-5-チアゾリル基、2-（3, 4-ジフルオロフェニル）-5-チアゾリル基、2-（2, 4, 6-トリクロロフェニル）-4-チアゾリル基、2-（3-クロロ-4-ニトロフェニル）-4-チアゾリル基、2-（4-フェニル-3-ブロモフェニル）-4-チアゾリル基、2-（4-ニトロフェニル）-4-チアゾリル基、2-（4-ニトロフェニル）-5-チアゾリル基、2-（2, 4, 6-トリニトロフェニル）-5-チアゾリル基、2-（2, 4-ジニトロフェニル）-4-チアゾリル基、2-（4-ビフェニル）-4-チアゾリル基、2-（4-ビフェニル）-5-チアゾリル基、4-（4-ビフェニル）-2-チアゾリル基、2-（4-ビフェニル）-4-チアゾリル基等のチアゾリル基（チアゾール環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよいフェニル基が1～2個置換していてもよい。）を挙げるすることができる。

【0278】

キノリル基は、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、5-キノリル基、6-キノリル基、7-キノリル基及び8-キノリル基を含む。

【0279】

10

20

30

40

50

3, 4-ジヒドロカルボスチリル基 (3, 4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキル基及びフェニル C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びカルボスチリル基 (カルボスチリル環上には、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキル基及びフェニル C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-1-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-3-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-4-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-8-イル基、カルボスチリル-1-イル基、カルボスチリル-3-イル基、カルボスチリル-4-イル基、カルボスチリル-5-イル基、カルボスチリル-6-イル基、カルボスチリル-7-イル基、カルボスチリル-8-イル基、6-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、7-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシ-1-メチルカルボスチリル-5-イル基、8-ベンジルオキシカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基、6-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、6, 7-ジメチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、1, 5, 6-トリメチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、6-メチルカルボスチリル-5-イル基、6, 7-ジメチルカルボスチリル-5-イル基、1, 5, 6-トリメチルカルボスチリル-7-イル基、8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基、8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基、8-メトキシカルボスチリル-6-イル基、8-メトキシ-1-メチルカルボスチリル-6-イル基、8-ベンジルオキシカルボスチリル-6-イル基、8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、8-エトキシカルボスチリル-7-イル基、8-メトキシ-1-プロピルカルボスチリル-7-イル基、8-(2-フェニルエトキシ)カルボスチリル-7-イル基等の3, 4-ジヒドロカルボスチリル基 (3, 4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキル基及びフェニル C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) 及びカルボスチリル基 (カルボスチリル環上には、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキル基及びフェニル C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) を挙げることができる。

【0280】

イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基としては、例えば、6-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基、5-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基、3-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基、2-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基等を挙げるすることができる。

【0281】

イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基としては、例えば、2-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基、3-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基、5-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基、6-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基、7-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基等を挙げるすることができる。

【0282】

クロマニル基 (クロマン環上には、少なくとも1個の C 1～6 アルキル基が置換していてもよい) としては、例えば、2-メチル-5-クロマニル基、2, 2-ジメチル-5-クロマニル基、2-メチル-6-クロマニル基、2-エチル-6-クロマニル基、2-n-プロピル-6-クロマニル基、2-n-ブチル-6-クロマニル基、2-n-ペンチル-6-クロマニル基、2-n-ヘキシル-6-クロマニル基、2, 2-ジメチル-6-ク

10

20

30

40

50

ロマンニル基、2, 2-ジエチル-6-クロマンニル基、2-メチル-7-クロマンニル基、2, 2-ジメチル-7-クロマンニル基、2, 2, 4-トリメチル-6-クロマンニル基、2-メチル-8-クロマンニル基、2, 2-ジメチル-8-クロマンニル基等のクロマンニル基（クロマン環上にはC 1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0283】

2, 3-ジヒドロベンゾフリル基としては、例えば、2, 3-ジヒドロ-4-ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-5-ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-6-ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-7-ベンゾフリル基等を挙げることができる。

【0284】

アミノ置換C 1～6アルキル基〔アミノ基上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びC 1～6アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、アミメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチル-3-アミノプロピル基、1, 1-ジメチル-2-アミノエチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、3-(メチルアミノ)プロピル基、4-(メチルアミノ)ブチル基、5-(メチルアミノ)ペンチル基、6-(メチルアミノ)ヘキシル基、ジメチルアミノメチル基、2-(ジエチルアミノ)エチル基、3-(ジ n -プロピルアミノ)プロピル基、4-(ジ n -ブチルアミノ)ブチル基、5-(ジ n -ペンチルアミノ)ペンチル基、2-(ジ n -ヘキシルアミノ)ヘキシル基、アニリノメチル基、2-(N -メチルアニリノ)エチル基、3-(N -メチルアニリノ)プロピル基、4-アニリノブチル基、2-(N -メチル-4-クロロアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-4-クロロアニリノ)プロピル基、4-(N -メチル-4-クロロアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-4-フルオロアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロアニリノ)プロピル基、2-(3-フルオロアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-3-フルオロアニリノ)プロピル基、4-(3-フルオロアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-2-フルオロアニリノ)エチル基、3-(2-フルオロアニリノ)プロピル基、4-(N -メチル-2-フルオロアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-2-クロロアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-2-クロロアニリノ)プロピル基、4-(N -メチル-2-クロロアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-2, 3-ジクロロアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-2, 4, 6-トリクロロアニリノ)プロピル基、4-(N -メチル-3-クロロアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-4-トリフルオロメチルアニリノ)エチル基、2-(4-メチルアニリノ)エチル基、2-(N -エチル-3, 5-ジトリフルオロメチルアニリノ)エチル基、2-(N -メチル-3, 5-ジトリフルオロメチルアニリノ)エチル基、2-(N -メチル-2, 4-ジメチルアニリノ)エチル基、2-(N -メチル-3, 5-ジメトキシアニリノ)エチル基、2-(2, 4, 6-トリメチルアニリノ)エチル基、2-(3, 4, 5-トリメトキシアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-4-トリフルオロメチルアニリノ)プロピル基、4-(N -メチル-4-トリフルオロメチルアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-3-トリフルオロメチルアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-3-トリフルオロメチルアニリノ)プロピル基、2-(N -メチル-2-トリフルオロメチルアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-2-トリフルオロメチルアニリノ)プロピル基、4-(N -メチル-2-トリフルオロメチルアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-4-トリフルオロメトキシアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-4-トリフルオロメトキシアニリノ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメトキシアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-3-トリフルオロメトキシアニリノ)エチル基、3-(N -メチル-3-トリフルオロメトキシアニリノ)プロピル基、4-(N -メチル-3-トリフルオロメトキシアニリノ)ブチル基、2-(N -メチル-2-トリフルオロメトキシアニリノ)エチル基、3-(N -メ

10

20

30

40

50

チル-2-トリフルオロメトキシアニリノ) プロピル基、4-(N-メチル-2-トリフルオロメトキアニリノ) ブチル基、2-(N-メチル-4-メトキシアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-4-メトキシアニリノ) プロピル基、4-(N-メチル-4-メトキシアニリノ) ブチル基、2-(N-メチル-3-メトキシアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-3-メトキシアニリノ) プロピル基、4-(3-メトキシアニリノ) ブチル基、2-(2-メトキシアニリノ) エチル基、3-(N-メチル-2-メトキシアニリノ) プロピル基、4-(N-メチル-2-メトキシアニリノ) ブチル基等の置換基としてフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは、1~3個置換していてもよい。)及びC1~6アルキル基なる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ置換C1~6アルキル基を挙げることができる。

10

【0285】

1,4-ジオキサアザスピロ[4,5]デシル基(1,4-ジオキサアザスピロ[4,5]デカン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]デシ-8-イル基、7-オキソ-1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]デシ-8-イル基、6-オキソ-1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]デシ-8-イル基等を挙げることができる。

【0286】

ホモペラジニル基(ホモペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、1-ホモペラジニル基、2-ホモペラジニル基、3-ホモペラジニル基、4-ホモペラジニル基、5-ホモペラジニル基、6-ホモペラジニル基、7-ホモペラジニル基、4-メトキシカルボニル-1-ホモペラジンニル基、4-エトキシカルボニル-1-ホモペラジンニル基、4-n-プロポキシカルボニル-1-ホモペラジンニル基、4-tert-ブトキシカルボニル-1-ホモペラジンニル基、4-n-ペンチルオキシカルボニル-1-ホモペラジンニル基、4-n-ヘキシルオキシカルボニル-1-ホモペラジンニル基、4-ベンジルオキシカルボニル-1-ホモペラジンニル基、4-(2-フェニルエトキシカルボニル)-1-ホモペラジンニル基、4-(3-フェニルプロポキシカルボニル)-1-ホモペラジンニル基、4-(4-フェニルブトキシカルボニル)-1-ホモペラジンニル基、4-(5-フェニルペンチルオキシカルボニル)-1-ホモペラジンニル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシカルボニル)-1-ホモペラジンニル基、4-(4-ビフェニル)-1-ホモペラジニル基、3,4-ジフェニル-1-ホモペラジニル基、3,4,5-トリフェニル-1-ホモペラジニル基、3-フェニル-4-メトキシカルボニル-1-ホモペラジニル基等のホモペラジニル基(ホモペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

20

30

【0287】

ピペラジニル基(ピペラジン環上には、オキソ基、C1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ピペラジン-1-イル基、ピペラジン-2-イル基、ピペラジン-3-イル基、ピペラジン-4-イル基、1-メチル-ピペラジン-4-イル基、1-ベンジル-ピペラジン-4-イル基、1,2-ジメチル-ピペラジン-4-イル基、1-ベンジル-2,6-ジメチル-ピペラジン-4-イル基、1-エチル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-n-プロピル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-イソプロピル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-n-ブチル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-tert-ブチル-2-オキソピペラジン-4-イル基

40

50

、1-n-ペンチル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-n-ヘキシル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-(4-ベンジル)-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-(2,4-ジメチルベンジル)ピペラジン-4-イル基、1-(2,4,6-トリメチルベンジル)ピペラジン-4-イル基、1-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-4-イル基、1-(4-メチルベンジル)-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-(4-トリフルオロメチルベンジル)-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-2-オキソピペラジン-4-イル基等のピペラジニル基(ピペラジン環上には、オキソ基、C1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

【0288】

ピペリジニル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、1-ピペリジニル基、2-ピペリジニル基、3-ピペリジニル基、4-ピペリジニル基、2-オキソ-1-ピペリジニル基、3-オキソ-1-ピペリジニル基、4-オキソ-1-ピペリジニル基等を挙げることができる。

20

【0289】

ピロリジニル基(ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を有することのあるフェノキシC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、ピロリジン-1-イル基、ピロリジン-2-イル基、ピロリジン-3-イル基、2-フェノキシメチルピロリジン-1-イル基、3-フェノキシメチルピロリジン-1-イル基、2-(2,4-ジメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、2-(2,4,6-トリメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、2,3-ジフェノキシメチルピロリジン-1-イル基、1,3,4-フェノキシメチルピロリジン-2-イル基、2-(4-メトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、2-[2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]ピロリジン-1-イル基、2-[3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピル]ピロリジン-1-イル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ブチル]ピロリジン-1-イル基、2-[5-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ペンチル]ピロリジン-1-イル基、2-[6-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ヘキシル]ピロリジン-1-イル基、3-(4-メトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基等のピロリジニル基(ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を1~3個有することのあるフェノキシC1~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

30

40

【0290】

イソインドリニル基としては、例えば、2-イソインドリニル基、1-イソインドリニル基、3-イソインドリニル基、4-イソインドリニル基、5-イソインドリニル基、6-イソインドリニル基等を挙げることができる。

【0291】

オキサゾリジニル基(オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、2-オキサゾリジニル基、3-オキサゾリジニル基、4-オキサゾリジニル基、5-オキサゾリジニル基、2-オキソ-3-オキサゾリジニル基等を挙げることができる。

50

【0292】

ベンゾー1, 3-オキサゾリジニル基(ベンゾー1, 3-オキサゾリジン環上には、置換基としてオキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-2-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-4-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-5-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-6-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-7-イル基、2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、4-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-ブロモ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-フルオロ-ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、6-フェニル-ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-ブロモ-6-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、6-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、7-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-ブロモ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、4-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、6-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、7-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基等のベンゾー1, 3-オキサゾリジニル基(ベンゾー1, 3-オキサゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0293】

イミダゾリジニル基(イミダゾリジン環上には、オキソ基、フェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子及びC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい]及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、イミダゾリジン-1-イル基、イミダゾリジン-2-イル基、イミダゾリジン-3-イル基、イミダゾリジン-4-イル基、イミダゾリジン-5-イル基、3-ベンジル-イミダゾリジン-1-イル基、3, 4-ジベンジル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-ベンジル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2-フルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3-フルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3, 4-ジフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3, 5-ジフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3, 4, 5-トリフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2, 3-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3, 4-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3, 5-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2-ブロモベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3-ブロモベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-ブロモベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2-メトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3-メトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-メトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2, 4-ジメトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2, 4, 6-トリメトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3, 5-ジメトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-エトキシ

ベンジル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - (4 - イソプロポキシベンジル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - (4 - n - ブトキシベンジル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - (4 - n - ペンチルオキシベンジル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - (4 - ヘキシルオキシベンジル) - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - [2 - (3 - メトキシ - 4 - クロロフェニル) エチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - [3 - (4 - クロロフェニル) プロピル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - [4 - (4 - クロロフェニル) ブチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - [5 - (4 - クロロフェニル) ペンチル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - [6 - (4 - クロロフェニル) ヘキシル] - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、2 - フェニルイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - フェニル - 2 - ベンジルイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - フェニル - 4 - ベンジル - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - フェニル - 5 - ベンジル - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基、4 - フェニル - 2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル基等のイミダゾリジニル基 (イミダゾリジン環上には、オキソ基、フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子及び C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい] 及びフェニル基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい。) を挙げることができる。

【0294】

ベンゾイミダゾリジニル基 (ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基、置換基として C 1 ~ 6 アルキル基を有することのあるアミノ基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、C 1 ~ 6 アルキル基、フェニル環上にハロゲン原子が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基及びフェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種が置換していてもよい) としては、例えば、ベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、ベンゾイミダゾリジン - 2 - イル基、ベンゾイミダゾリジン - 3 - イル基、ベンゾイミダゾリジン - 4 - イル基、ベンゾイミダゾリジン - 5 - イル基、ベンゾイミダゾリジン - 6 - イル基、ベンゾイミダゾリジン - 7 - イル基、2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - ベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、6 - ジメチルアミノベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、6 - エトキシカルボニルベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - (4 - フェニルピペリジン - 4 - イル) ベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、4 - フルオロ - ベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - エチル - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - n - プロピル - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - n - ブチル - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - n - ペンチル - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - n - ヘキシル - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 6 - フルオロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 4 - フルオロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 5 - フルオロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 7 - フルオロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 6 - クロロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 5 - クロロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 4 - クロロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 5 - クロロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 7 - クロロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 6 - ブロモ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 4 - ブロモ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 5 - ブロモ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - メチル - 7 - ブロモ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - エチル - 6 - フルオロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - イソプロピル - 6 - フルオロ - 2 - オキソベンゾイミダゾリジン - 1 - イル基、3 - n - ヘキシル - 6 - フルオロ - 2 - オキソゾンズ

10

20

30

40

50

イミダゾリジン-1-イル基、3-エチル-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロピル-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-ヘキシル-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-エチル-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロピル-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-tert-ブチル-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-6-エトキシカルボニル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロピル-6-エトキシカルボニル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-プロピル-6-エトキシカルボニル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-6-トリフルオロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、5-トリフルオロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-5-トリフルオロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロピル-5-トリフルオロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)-5-トリフルオロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)-6-トリフルオロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-6-ジメチルアミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-エチル-6-ジメチルアミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-6-アミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロピル-6-ジメチルアミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(3-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(3-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(2,3-ジフルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(2,4,6-トリクロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(3-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-ヨードフェニル)ピペリジン-1-イル]-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(3-ブロモフェニル)ピペリジン-1-イル]-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[1-メチルピペリジン-4-イル]-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(ピペリジン-4-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(ベンジルオキシカルボニルピペリジン-4-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(ピペリジン-4-イル)-6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニルピペリジン-4-イル)-6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(ピペリジン-4-イル)-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニル-4-ピペリジニル)-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(1,2-ジメチルピペリジン-4-イル)ベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニル-2-メチルピペリジン-

10

20

30

40

50

4-イル) ベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(1, 2, 6-トリメチルピペリジン-4-イル) ベンゾイミダゾリジン-1-イル基等のベンゾイミダゾリジニル基(ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基及びピペリジル基[ピペリジン環上には、C1~6アルキル基、フェニル環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

【0295】

フタルイミド基としては、例えば、フタルイミド-2-イル基等が挙げられる。

【0296】

インドリニル基(インドリン環上には、C1~6アルキル基、ハロゲン原子及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、インドリニン-1-イル基、インドリニン-2-イル基、インドリニン-3-イル基、インドリニン-4-イル基、インドリニン-5-イル基、インドリニン-6-イル基、インドリニン-7-イル基、3-メチル-インドリニン-1-イル基、3, 8-ジブロモインドリニン-1-イル基、2-オキソインドリニン-1-イル基(別名:オキシインドール-1-イル基)、3-メチル-2-オキソインドリニン-1-イル基、3, 3-ジメチル-2-オキソインドリニン-1-イル基、3-エチル-2-オキソインドリニン-1-イル基、3-n-プロピル-2-オキソインドリニン-1-イル基、3-n-ブチル-2-オキソインドリニン-1-イル基、3-n-ペンチル-2-オキソインドリニン-1-イル基、3-フルオロ-2-オキソインドリニン-1-イル基、3, 3-ジフルオロ-2-オキソインドリニン-1-イル基、3-クロロ-2-オキソインドリニン-1-イル基、3, 3-ジクロロ-2-オキソインドリニン-1-イル基、等のインドリニル基(インドリン環上には、C1~6アルキル基、ハロゲン原子及びオキソ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0297】

2, 3-ジヒドロベンゾイソチアゾリル基(2, 3-ジヒドロベンゾイソチアゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、3-ベンゾイソチアゾリジノン-1, 1-ジオキサイド-2-イル基等を挙げることができる。

【0298】

1H-2, 4-ベンゾオキサジニル基(1H-2, 4-ベンゾオキサジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、1H-2, 4-ベンゾオキサジン-3(4H)-オン-4-イル基及び1H-2, 4-ベンゾオキサジン-1, 3(4H)-ジオン-4-イル基等を挙げることができる。

【0299】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシC1~6アルキル基としては、例えば、フェノキシメチル基、2-フルオロフェノキシメチル基、3-フルオロフェノキシメチル基、3, 4-ジフルオロフェノキシメチル基、3, 5-ジフルオロフェノキシメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシメチル基、2-クロロフェノキシメチル基、3-クロロフェノキシメチル基、4-クロロフェノキシメチル基、3, 4-ジクロロフェノキシメチル基、3, 5-ジクロロフェノキシメチル基、2-フェノキシエチル基、1-フェノキシエチル基、3-フェノキシプロピル基、4-フェノキシブチル基、5-フェノキシペンチル基、6-フェノキシヘキシル基、2-(2, 4, 6-クロロフェノキシ)エチル基、3-(4-ヨードフェノキシ)プロピル基、4-(4-プロモフェノキシ)ブチル基、5-(4-クロロフェノキシ)ペンチル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキシル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1~5個置換していてもよいフェノキシC1~6アルキル基を挙げることができる。

【0300】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC 2～6アルケニル基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニル基（慣用名：シンナミル基）、4-フェニル-2-ブテニル基、4-フェニル-3-ブテニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニル基、5-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニル基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニル基等のフェニル環上にハロゲン原子を1～5個有することがあり、二重結合を1～2個有するフェニルC 2～6アルケニル基を挙げることができる。

【0301】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリブロモフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェ

ニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基、4-ビフェニル基、3-ビフェニル基、2-ビフェニル基等のフェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニル基を挙げることができる。

【0302】

1, 3-チアゾリジニル基 (1, 3-チアゾリジン環上には、置換基としてオキソ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基を有していてもよいフェニルC1~6アルキリデン基からなる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、1, 3-チアゾリジン-2-イル基、1, 3-チアゾリジン-3-イル基、1, 3-チアゾリジン-4-イル基、1, 3-チアゾリジン-5-イル基、1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-2, オン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-4-オン-3-イル基、5-(2-メチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-(2, 4-ジメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-(2, 4, 6-トリメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-(2-トリフルオロメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-(3, 5-ジトリフルオロメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)

ヘキシリデン] - 1, 3-チアゾリジン- 2, 4-ジオン- 3-イル基等の 1, 3-チアゾリジニル基 (1, 3-チアゾリジン環上には、置換基としてオキソ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基を 1~3 個有していてもよいフェニル C 1~6 アルキルデン基からなる群より選ばれる基が 1~3 個置換していてもよい) を挙げることができる。

【0303】

ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基等のフェニル環上にハロゲン原子が 1~5 個置換していてもよいフェニル基を挙げることができる。

【0304】

フェニル環上に置換基としてフェニル基を有することのあるフェニル C 1~6 アルキル基としては、例えば、ベンジル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-メチル-3-フェニルプロピル基、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル基、3-フェニルベンジル基、2-フェニルベンジル基、4-フェニルベンジル基、2, 4-ジフェニルベンジル基、2, 4, 6-トリフェニルベンジル基等のフェニル環上に置換基としてフェニル基を 1~3 個有することのあるフェニル C 1~6 アルキル基を挙げることができる。

【0305】

フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルコキシ基、アミノ基 [アミノ基上には、C 1~6 アルキル基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロ

フェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2-アミノフェニル基、3-アミノフェニル基、4-アミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-エチルアミノフェニル基、4-ジェチルアミノフェニル基、4-n-プロピルアミノフェニル基、4-ジ-n-プロピルアミノフェニル基、4-n-ブチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ブチルアミノフェニル基、4-n-ペンチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ペンチルアミノフェニル基、4-n-ヘキシルアミノフェニル基、4-ジ-n-ヘキシルアミノフェニル基、4-フェニルアミノフェニル基、4-(2-フルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-フルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-フルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2, 4-ジフルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(3, 4-ジフルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(3, 5-ジフルオロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2-クロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-クロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-クロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2-ブロモフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-ブロモフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-ブロモフェニルアミノ)フェニル基、4-(2, 3-ジクロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2, 4-ジクロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(3, 5-ジクロロフェニルアミノ)フェニル基、4-(2-メチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-メチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-メチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(2-エチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(3-エチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-エチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-n-プロピルフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-tert-ブチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(4-n-ブチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)フェニル基、4-(3

10

20

30

40

50

ートリフルオロメチルフェニルアミノ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメチルフェ
 ニルアミノ) フェニル基、4- (2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) フェニル基
 、4- (3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) フェニル基、4- (2, 3-ジメチ
 ルフェニルアミノ) フェニル基、4- (3, 4, 5-トリメチルフェニルアミノ) フェニ
 ル基、4- (4-ペンチルフェニルアミノ) フェニル基、4- (4-ヘキシルフェニルア
 ミノ) フェニル基、4- (2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4-
 (3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4- (3-メトキシフェニル
 アミノ) フェニル基、4- (2, 4-ジメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4- (2
 , 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメトキシ
 フェニルアミノ) フェニル基、4- (2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) フェ
 ニル基、4- (3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) フェニル基、4- (4-ペ
 ンタフルオロエトキシフェニルアミノ) フェニル基、3- (N-メチル-N-フェニルア
 ミノ) フェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノ
 キシフェニル基、2- (2-クロロフェノキシ) フェニル基、2, 4-ジフェノキシフェ
 ニル基、2- (3-クロロフェノキシ) フェニル基、2- (4-クロロフェノキシ) フェ
 ニル基、3- (2-クロロフェノキシ) フェニル基、3- (3-クロロフェノキシ) フェ
 ニル基、3- (4-クロロフェノキシ) フェニル基、4- (2-クロロフェノキシ) フェ
 ニル基、4- (2, 3-ジクロロフェノキシ) フェニル基、4- (2, 4, 6-トリクロ
 ロフェノキシ) フェニル基、2- (2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、2
 - (3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、2- (4-トリフルオロメチルフ
 エノキシ) フェニル基、3- (2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、3- (3
 -トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、3- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフル
 オロメチルフェノキシ) フェニル基、4- (2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェ
 ニル基、4- (3-メチルフェノキシ) フェニル基、4- (2, 4-ジメチルフェノキシ)
 フェニル基、4- (2, 4, 6-トリメチルフェノキシ) フェニル基、4- (3-トリ
 フルオロメチルフェノキシ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) フ
 エニル基、2- (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2- (3-トリフ
 ルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)
 フェニル基、2- (4-メトキシフェノキシ) フェニル基、2- (2, 4-ジメトキシフ
 エノキシ) フェニル基、2- (2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) フェニル基、3-
 (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、3- (3-トリフルオロメトキシ
 フェノキシ) フェニル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4
 - (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4- (3-トリフルオロメトキシ
 フェノキシ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、
 2- (4-フェノキシピペリジン-1-イル) フェニル基、3- (4-フェノキシピペリ
 ジン-1-イル) フェニル基、4- (4-フェノキシピペリジン-1-イル) フェニル基
 、2- [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4-
 (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、3- [4- (2, 4, 6
 -トリクロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (3, 4-ジ
 クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (2, 3, 4, 5,
 6-ペンタフルオロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (4-
 プロモフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、3- [4- (4-クロロフェノ
 キシピペリジン-1-イル) フェニル基、2- [4- (4-メチルフェノキシ) ピペリジ
 ン-1-イル] フェニル基、2- [4- (3, 4-ジメチルフェノキシ) ピペリジン-1
 -イル] フェニル基、2- [4- (3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) ピペリジン-1
 -イル] フェニル基、3- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1
 -イル] フェニル基、4- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1
 -イル] フェニル基、3- [4- (4-ペンタフルオロエチルフェノキシ) ピペリジン-
 1-イル] フェニル基、4- [4- (4-ペンタフルオロエチルフェノキシ) ピペリジン
 -1-イル] フェニル基、2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシピペリジン

10

20

30

40

50

ー1-イル) フェニル基、3- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (4-メトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (2, 4-ジメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、2- [4- (4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、(3, 4-ジフェノキシピペリジン-1-イル) フェニル基、
ピ

ペリジン-1-イルフェニル基、(3, 4, 5-トリフェノキシピペリジン-1-イル) フェニル基、ピペリジン-4-イルフェニル基等のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基、アミノ基 [アミノ基上には、C 1~6アルキル基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、置換基としてフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) が1~3個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

【0306】

ピペラジニルC 1~6アルキル基 (ピペラジン環上には、C 1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、1-ピペラジニルメチル基、2- (2-ピペラジニル) エチル基、1- (3-ピペラジニル) エチル基、3- (4-ピペラジニル) プロピル基、4- (1-ピペラジニル) ブチル基、5- (2-ピペラジニル) ペンチル基、6- (3-ピペラジニル) ヘキシル基、4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニルメチル基、2- (4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エチル基、3- (4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、4- (4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5- (4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6- (4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニルメチル基、2- (4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エチル基、3- (4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、4- (4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5- (4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6- (4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニルメチル基、2- (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エチル基、3- (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、4- (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5- (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6- (4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、2- (4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エチル基、3- (4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、4- (4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5- (4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペ

10

20

30

40

50

50

ルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)エチル基、2－(4－(2－メトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)メチル基、2－(4－(2，4－ジメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)メチル基、2－(4－(2，4，6－トリメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)メチル基、3－(4－(2－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)プロピル基、4－(4－(2－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)ブチル基、5－(4－(2－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)ペンチル基、6－(4－(2－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)ヘキシル基、3－(4－(3－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)プロピル基、4－(4－(3－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)ブチル基、5－(4－(3－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)ペンチル基、3－(4－(4－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)プロピル基、4－(4－(4－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)ブチル基、5－(4－(4－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)ペンチル基、6－(4－(4－トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)－1－ピペラジニル)ヘキシル基、(3，4－ジエトキシカルボニル－1－ピペラジニル)メチル基、4－フェニルメトキシカルボニル－2，5－ジメトキシカルボニル－1－ピペラジニル)メチル基等のピペラジニルC1～6アルキル基(ピペラジン環上には、C1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい)が挙げられる。

【 0 3 0 7 】

ピペラジニルカルボニルC 1～6アルキル基（ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基を有していてもよいフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、1－ピペラジニルカルボニルメチル基、2－（2－ピペラジニルカルボニル）エチル基、1－（3－ピペラジニルカルボニル）エチル基、3－（4－ピペラジニルカルボニル）プロピル基、4－（1－ピペラジニルカルボニル）ブチル基、5－（2－ピペラジニルカルボニル）ペンチル基、6－（3－ピペラジニルカルボニル）ヘキシル基、4－tert－ブトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニルメチル基、2－（4－tert－ブトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）エチル基、3－（4－tert－ブトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）プロピル基、4－（4－tert－ブトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）ブチル基、5－（メトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）ペンチル基、6－（4－tert－ブトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）ヘキシル基、4－エトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニルメチル基、2－（4－エトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）エチル基、3－（4－n－プロポキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）プロピル基、4－（4－エトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）ブチル基、5－（4－n－ペンチルオキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）ペンチル基、6－（4－n－ヘキシルオキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル）ヘキシル基、4－（ベンジルオキシカルボニル）－1－ピペラジニルカルボニルメチル基、2－（4－（ベンジルオキシカルボニル）－1－ピペラジニルカルボニル）エチル基、3－（4－（ベンジルオキシカルボニル）－1－ピペラジニルカルボニル）プロピル基、4－（4－（ベンジルオキシカルボニル）－1－ピペラジニルカルボニル）ブチル基、5－（4－（ベンジルオキシカルボニル）－1－ピペラジニルカルボニル）ペンチル基、6－（4－（ベンジルオキシカルボニル）－1－ピペラジニルカルボニル）ヘキシル基。

カルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ブチル基、 5 - (4 - (ベンジルオキシカ

カルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ブチル基、 5 - (4 - (ベンジルオキシカ

ルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ペンチル基、6 - (4 - (ベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、4 - (4 - メチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - (2, 4 - ジメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - (2, 4, 6 - トリメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、2 - (4 - (3, 5 - ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) エチル基、3 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) プロピル基、4 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ブチル基、5 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ペンチル基、6 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、4 - (2 - フェニルエトキシカルボニル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、2 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル] - 1 - ピペラジニルカルボニル} エチル基、3 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル] - 1 - ピペラジニルカルボニル} プロピル基、4 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル] - 1 - ピペラジニルカルボニル} ブチル基、5 - {4 - [2 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニル) エトキシカルボニル] - 1 - ピペラジニルカルボニル} ペンチル基、6 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル] - 1 - ピペラジニルカルボニル} ヘキシル基、4 - ベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、2 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) エチル基、3 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) プロピル基、4 - (4 - メチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - (2, 4 - ジメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - (2, 4, 6 - トリメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ブチル基、5 - (4 - (3, 5 - ジトリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ペンチル基、6 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、4 - (4 - ビフェニルメチル) - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、2 - (4 - (4 - ビフェニルメチル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) エチル基、3 - (4 - (4 - ビフェニルメチル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) プロピル基、4 - (4 - (4 - ビフェニルメチル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ブチル基、5 - (4 - (4 - ビフェニルメチル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ペンチル基、6 - (4 - (4 - ビフェニルメチル) - 1 - ピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、2, 4 - ジベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - ベンジルオキシカルボニル - 3 - ベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基、4 - エトキシカルボニル - 2, 6 - ジベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニルメチル基等のピペラジニルカルボニル C 1 ~ 6 アルキル基 (ピペラジン環上には、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基を 1 ~ 3 個有していてもよいフェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基並びにフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個有することのあるフェニル C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい) を挙げることができる。

【0308】

フェニルカルバモイル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい) としては、例えば、4 - メチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 4 - ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2, 4, 6 - トリメチルフェニルカルバモイルメチル基、3 - エチルフェニルカル

10

20

30

40

50

バモイルメチル基、2-n-プロピルフェニルカルバモイルメチル基、4-n-ブチルフェニルカルバモイルメチル基、4-n-ペンチルフェニルカルバモイルメチル基、4-n-ヘキシルフェニルカルバモイルメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)エチル基、3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)ヘキシル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個有していてもよいフェニルカルバモイルC1~6アルキル基を挙げることができる。

10

【0309】

ベンゾオキサゾールC1~6アルキル基(ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい。)としては、例えば、ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-7-イルメチル基、2-(ベンゾオキサゾール-2-イル)エチル基、1-(ベンゾオキサゾール-4-イル)エチル基、3-(ベンゾオキサゾール-5-イル)プロピル基、4-(ベンゾオキサゾール-6-イル)ブチル基、5-(ベンゾオキサゾール-7-イル)ペンチル基、6-(ベンゾオキサゾール-2-イル)ヘキシル基、2-メチル-3-(ベンゾオキサゾール-4-イル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(ベンゾオキサゾール-5-イル)エチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル)メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル)メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル)メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)メチル基、(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)メチル基等を挙げることができる。

20

【0310】

フェニルチオカルバモイル基(フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、フェニルチオカルバモイル基、4-フルオロフェニルチオカルバモイル基、4-クロロフェニルチオカルバモイル基、4-ブロモフェニルチオカルバモイル基、3,4-ジクロロフェニルチオカルバモイル基、3,4,6-トリクロロフェニルチオカルバモイル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルチオカルバモイル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲンが1~5個置換していてもよいフェニルチオカルバモイル基が挙げられる。

30

【0311】

C1~8のアルコキシカルボニル基としては、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、n-ヘプチルオキシカルボニル基、n-オクチルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0312】

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、C1~6アルコキシカルボニル基、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基及びC1~6アルキルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェネチルオキシカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシカルボニル基、4-フェニルペンチルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ

40

50

50

ルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、3-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、4-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、2-(2-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-メチルチオフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-メチルチオフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-メチルチオフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-メチルチオフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-メトキシカルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-メトキシカルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-メトキシカルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-メトキシカルボニルフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-メトキシカルボニルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-メトキシカルボニルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-メトキシカルボニルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、4-n-ペンチルオキシカルボニルアミノベンジルオキシカルボニル基、4-エトキシカルボニルアミノベンジルオキシカルボニル基、4-プロポキシカルボニルアミノベンジルオキシカルボニル基、4-tert-ブトキシカルボニルアミノベンジルオキシカルボニル基、2-(n-ヘキシルオキシカルボニルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-ニトロベンジルオキシカルボニル基、3-ニトロベンジルオキシカルボニル基、4-ニトロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-ニトロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-ニトロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ニトロフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2, 4-ジニトロフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ニトロフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ニトロフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2, 4, 6-トリニトロフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-アミノベンジルオキシカルボニル基、3-アミノベンジルオキシカルボニル基、4-アミノベンジルオキシカルボニル基、2-(2-アミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2, 3-ジアミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-アミノフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2, 4, 6-トリアミノフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-アミノフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-アミノフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-アミノフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、3-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-エトキシカルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-エトキシカルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-エトキシカルボニルフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-n-ブトキシカルボニルフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-n-ペンチルオキシカルボニルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-n-ヘキシルオキシカルボニルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-エトキシカルボニルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基等のフェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、C1~6アルコキシカルボニル基、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基及びC1~6アルキルチオ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

20

30

40

50

【0313】

ベンズヒドリルオキシカルボニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）としては、例えば、ベンズヒドリルオキシカルボニル基、3-フルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4-フルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3'-ジフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 4'-ジフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4, 4'-ジフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 4, 4'-トリフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3', 4, 4'-テトラフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、2, 2', 4, 4'-テトラフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3', 5, 5'-テトラフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3-クロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4-クロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3'-ジクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 4'-ジクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4, 4'-ジクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 4, 4'-トリクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3', 4, 4'-テトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、2, 2', 4, 4'-テトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3', 5, 5'-テトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基等のベンズヒドリルオキシカルボニル基（フェニル環上にはハロゲン原子が1～4個置換していてもよい）を挙げることができる。

10

【0314】

フェニル置換もしくは非置換のフェニルC1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェニルエトキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-ビフェニリルメトキシカルボニル基、2-(2-ビフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(2-ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(2-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(2-ビフェニリル)ヘキシルオキシカルボニル基、3-ビフェニリルメトキシカルボニル基、2-(3-ビフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(3-ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(3-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(3-ビフェニリル)ヘキシルオキシカルボニル基、4-ビフェニリルメトキシカルボニル基、2-(4-ビフェニリル)エトキシカルボニル基、3-(4-ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、6-(4-ビフェニリル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

20

30

【0315】

ピリジルC1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、2-ピリジルメトキシカルボニル基、3-ピリジルメトキシカルボニル基、4-ピリジルメトキシカルボニル基、2-(2-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(3-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(4-ピリジル)エトキシカルボニル基、3-(2-ピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ピリジル)プロポキシカルボニル基、3-(4-ピリジル)プロポキシカルボニル基、4-(2-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(3-ピリジル)ブトキシカルボニル基、4-(4-ピリジル)ブトキシカルボニル基、5-(2-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(4-ピリジル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ピリジル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

40

【0316】

C1～6アルコキシ置換C1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、メトキシメトキシカルボニル基、2-メトキシエトキシカルボニル基、エトキシメトキシカルボニル基、

50

ル基、*n*-プロポキシメトキシカルボニル基、*n*-ブトキシメトキシカルボニル基、*n*-ペンチルオキシメトキシカルボニル基、*n*-ヘキシルオキシメトキシカルボニル基、1-メトキシエトキシカルボニル基、2-エトキシエトキシカルボニル基、2-*n*-プロポキシエトキシカルボニル基、*n*-ブトキシメトキシカルボニル基、*n*-ペンチルオキシメトキシカルボニル基、*n*-ヘキシルオキシメトキシカルボニル基、3-メトキシプロポキシカルボニル基、4-メトキシブトキシカルボニル基、5-メトキシペンチルオキシカルボニル基、6-メトキシヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0317】

ピペラジニルC1～6アルコキシカルボニル基（ピペラジン環上には、C1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、（1-ピペラジニル）メトキシカルボニル基、2-（2-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、1-（3-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、3-（4-ピペラジニル）プロポキシカルボニル基、4-（1-ピペラジニル）ブトキシカルボニル基、5-（2-ピペラジニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（3-ピペラジニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-メチル-3-（1-ピペラジニル）プロポキシカルボニル基、1, 1-ジメチル-2-（4-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-*n*-プロポキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-*tert*-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-*sec*-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-*n*-ペンチルオキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-*n*-ヘキシルオキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-フェニルエトキシカルボニル-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（3-フェニルプロポキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（2-フルオロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（4-フルオロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（4-クロロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（3-クロロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（2-ブromoベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（2-クロロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（3, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）メトキシカルボニル基、2-（4-（2, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、2-（4-（2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル）-1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基、（3, 4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル）メトキシカルボニル基、（2, 5-メトキシカルボニル-4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル）メトキシカルボニル基等のピペラジニルC1～6アルコキシカルボニル基（ピペラジン環上には、置換基としてC1～6アルコキシカルボニル基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～5個有することのあるフェニルC1～6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

【0318】

フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、C1～6アルキル基及びC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい）としては、例えば、フェノキシカルボニル基、2-メチルフェノキシカルボニル基、3-メチルフェ

10

20

30

40

50

ノキシカルボニル基、4-メチルフェノキシカルボニル基、2-エチルフェノキシカルボニル基、3-エチルシフェノキシカルボニル基、4-エチルフェノキシカルボニル基、4-プロピルフェノキシカルボニル基、4-tert-ブチルフェノキシカルボニル基、4-ブチルフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメチルフェノキシカルボニル基、3, 4, 5-トリメチルフェノキシカルボニル基、4-ペンチルフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルフェノキシカルボニル基、2-メトキシフェノキシカルボニル基、3-メトキシフェノキシカルボニル基、4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-エトキシフェノキシカルボニル基、3-エトキシフェノキシカルボニル基、4-エトキシフェノキシカルボニル基、4-プロポキシフェノキシカルボニル基、4-tert-ブトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェノキシカルボニル基、4-ペントキシフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルオキシフェノキシカルボニル基、2-メチル-4-メトキシフェノキシカルボニル基等のフェノキシカルボニル基（フェニル環上には、C1～6アルキル基及びC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換されていてもよい）を挙げることができる。

【0319】

ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、ベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、4-エチルベンゾイル基、4-n-プロピルベンゾイル基、4-tert-ブチルベンゾイル基、4-n-ペンチルベンゾイル基、4-n-ヘキシルベンゾイル基、2, 3-ジメチルベンゾイル基、3, 4-ジメチルベンゾイル基、2, 4, 6-トリメチルベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-ペンタフルオロエチルベンゾイル基、2, 3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3, 4-ジトリフルオロメチルベンゾイル基等のベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0320】

フェニルC2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、フェニルアセチル基、3-フェニルプロピオニル基、4-フェニルブチリル基、5-フェニルペンタノイル基、6-フェニルヘキサノイル基、2-メチルフェニルアセチル基、3-メチルフェニルアセチル基、4-メチルフェニルアセチル基、2-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、3-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、4-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、3-（2, 4-ジメチルフェニル）プロピオニル基、（2, 4, 6-トリメチルフェニル）アセチル基、3-（2-メチルフェニル）プロピオニル基、3-（3-メチルフェニル）プロピオニル基、3-（4-メチルフェニル）プロピオニル基、3-（2-トリフルオロメチルフェニル）プロピオニル基、3-（3-トリフルオロメチルフェニル）プロピオニル基、3-（4-トリフルオロメチルフェニル）プロピオニル基、3-（3, 5-ジメチルフェニル）プロピオニル基、4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ブチリル基、5-（4-トリフルオロメチルフェニル）ペンタノイル基、6-（3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル）ヘキサノイル基、4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ブチリル基、5-（4-ペンタフルオロエチルフェニル）ペンタノイル基、6-（4-ペンタフルオロエチルフェニル）ヘキサノイル基等のフェニルC2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が1～3個置換されていてもよい）を挙げることができる。

【0321】

フェノキシC2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子が1～3個置換していてもよい）としては、例えば、フェノキシアセチル基、3-フェノキシプロピオニル基、4-フェノキシブチリル基、5-フェノキシペンタノイル基、6-フェノキシヘキ

10

20

30

40

50

サノイル基、4-（4-クロロフェノキシ）ブチリル基、5-（4-クロロフェノキシ）
 ペンタノイル基、6-（4-クロロフェノキシ）ヘキサノイル基、2-フルオロフェノキ
 シアセチル基、3-フルオロフェノキシアセチル基、4-フルオロフェノキシアセチル基
 、2-クロロフェノキシアセチル基、3-クロロフェノキシアセチル基、4-クロロフェ
 ノキシアセチル基、4-ブロモフェノキシアセチル基、2, 3-ジフルオロフェノキシ
 アセチル基、2-フルオロ-4-クロロフェノキシアセチル基、3, 5-ジフルオロフェ
 ノキシアセチル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシアセチル基、3-（2-フルオロフ
 ェノキシ）プロピオニル基、3-（3-フルオロフェノキシ）プロピオニル基、3-（4
 -フルオロフェノキシ）プロピオニル基、3-（2-クロロフェノキシ）プロピオニル基
 、3-（3-クロロフェノキシ）プロピオニル基、3-（4-クロロフェノキシ）プロピ
 オニル基、3-（4-ブロモフェノキシ）プロピオニル基、3-（2, 3-ジフルオロフ
 ェノキシ）プロピオニル基、3-（2-フルオロ-4-クロロフェノキシ）プロピオニル
 基、3-（3, 5-ジフルオロフェノキシ）プロピオニル基、4-（4-フルオロフェノ
 キシ）ブチリル基、5-（4-ブロモフェノキシ）ペンタノイル基、6-（4-クロロフ
 ェノキシ）ヘキサノイル基、4-（4-クロロフェノキシ）ブチリル基、5-（4-ヨード
 フェノキシ）ペンタノイル基、6-（4-クロロフェノキシ）ヘキサノイル基等を挙げ
 ることができる。

【0322】

ピペラジニルC 2～6アルカノイル基（ピペラジン環上には、C 1～6アルカノイル基
 、フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲ
 ン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6
 アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい〕、フェ
 ニルC 1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換
 もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコ
 キシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい〕、フェニルカル
 バモイルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは
 未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基
 からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい〕、フェニルカルバモ
 イル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アル
 キル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた
 基を少なくとも1種が置換していてもよい〕及びベンゾオキサゾリル基からなる群より選
 ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、1-ピペラジニル
 アセチル基、3-（2-ピペラジニル）プロパノイル基、4-（3-ピペラジニル）ブチ
 リル基、4-（4-ピペラジニル）ペンタノイル基、5-（1-ピペラジニル）ペンタノ
 イル基、6-（2-ピペラジニル）ヘキサノイル基、4-アセチル-1-ピペラジニルア
 セチル基、3-（4-プロピオニル-1-ピペラジニル）プロピオニル基、3-（4-ブ
 チリル-1-ピペラジニル）ブチリル基、4-（4-ペンタノイル-1-ピペラジニル）
 ブチリル基、5-（4-ヘキサノイル-1-ピペラジニル）ペンタノイル基、6-（4-
 アセチル-1-ピペラジニル）ヘキサノイル基、4-ベンジル-1-ピペラジニルアセチ
 ル基、3-〔4-（2-フェニルエチル）-1-ピペラジニル〕プロピオニル基、（4-
 アセチル-3-ベンジル-1-ピペラジニル）アセチル基、（4-ベンジロキシカルボ
 ニル-2-ベンジル-1-ピペラジニル）アセチル基、（4-フェニルカルバモイル-2
 , 6-ジベンジル-1-ピペラジニル）アセチル基、4-〔4-（1-フェニルエチル）
 -1-ピペラジニル〕ブチリル基、〔4-（3-フェニルプロピル）1-ピペラジニル〕
 ブチリル基、5-〔4-（5-フェニルペンチル）-1-ピペラジニル〕ペンタノイル基
 、6-〔4-（6-フェニルヘキシル）-1-ピペラジニル〕ヘキサノイル基、4-（4-
 フェニルベンジル）-1-ピペラジニルアセチル基、3-〔4-（3-フルオロベンジ
 ル）-1-ピペラジニル〕プロピオニル基、4-〔4-（2, 3, 4, 5, 6-ペンタ
 フルオロベンジル）-1-ピペラジニル〕ブチリル基、4-〔4-（2, 4-ジクロロベ
 ンジル）-1-ピペラジニル〕ブチリル基、5-〔4-（2, 4, 6-トリクロロベンジ

10

20

30

40

50

ル) - 1 - ピペラジニル] ペンタノイル基、6 - [4 - (4 - メチルベンジル) - 1 - ピ
 ペラジニル] ヘキサノイル基、[4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラ
 ジニル] アセチル基、[4 - (3, 5 - ジトリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジ
 ニル] アセチル基、[4 - (2, 3 - ジメチルベンジル) - 1 - ピペラジニル] アセチル
 基、[4 - (2, 4, 6 - トリメチルベンジル) - 1 - ピペラジニル] アセチル基、6 -
 [4 - (4 - メトキシベンジル) - 1 - ピペラジニル] ヘキサノイル基、[4 - (4 - ト
 リフルオロメトキシベンジル) - 1 - ピペラジニル] アセチル基、[4 - (3, 5 - ジト
 リフルオロメトキシベンジル) - 1 - ピペラジニル] アセチル基、[4 - (2, 3 - ジメ
 トキシベンジル) - 1 - ピペラジニル] アセチル基、[4 - (2, 4, 6 - トリメトキシ
 ベンジル) - 1 - ピペラジニル] アセチル基、3 - (4 - ベンジルオキシカルボニル - 1
 - ピペラジニル) プロピオニル基、4 - (2, 4 - ジクロロベンジルオキシカルボニル - 1
 - ピペラジニル) アセチル基、3 - (4 - ベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニ
 ル) ブチリル基、4 - (4 - ベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ブチリル基
 、5 - (4 - ベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4
 - ベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、3 - (4 - (2 - フ
 ルオロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) プロピオニル基、3 - (4 - (2
 - フルオロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 -
 (2 - フルオロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4
 - (2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニ
 ル) ペンタノイル基、6 - (4 - フルオロベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) 20
 ヘキサノイル基、3 - (4 - (2, 3 - ジフルオロベンジルオキシカルボニル) - 1 -
 ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (3 - フルオロベンジルオキシカルボニル) - 1
 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (3 - フルオロベンジルオキシカルボニル) -
 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、3 - (4 - (4 - フルオロベンジルオキシカルボ
 ニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (4 - フルオロベンジルオキシカル
 ボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (4 - フルオロベンジルオキシカル
 ボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4 - (4 - フルオロベンジルオキ
 シカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、3 - (4 - (2 - クロロベンジ
 ルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) プロピオニル基、3 - (4 - (2 - クロロベン
 ジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (2 - クロロベン
 ジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (2 - クロロベン
 ジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (2, 4, 6 - トリ
 クロロベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、3 - (4 - (3
 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) プロピオニル基、3 - (4 -
 (3 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 -
 (3 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 -
 (3 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4
 - (3 - クロロベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、2 - (4 -
 (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) プロピオニル基、3 - (4
 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4
 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4
 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6
 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、(4 -
 (2 - メチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、(4 - (2
 , 4 - ジメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、(4 - (2
 , 4, 6 - トリメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、
 (4 - (2 - メトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、(4
 - (2, 4 - ジメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基
 、(4 - (2, 4, 6 - トリメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル)
 アセチル基、4 - (3, 5 - ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピ

10

20

30

40

50

ペラジニル) アセチル基、4-(3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボ
 ニル)-1-ピペラジニル) アセチル基、3-(4-(2-トリフルオロメチルベンジル
 オキシカルボニル)-1-ピペラジニル) プロピオニル基、3-(4-(2-トリフルオ
 ロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4-(2
 -トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、5
 -(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペ
 ンタノイル基、6-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジ
 ニル) ヘキサノイル基、3-(4-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)
)-1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4-(3-トリフルオロメチルベンジルオキ
 シカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(3-トリフルオロメチル
 ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンタノイル基、3-(4-(4-トリ
 フルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(
 4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリ
 ル基、5-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジ
 ニル) ペンタノイル基、6-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)
)-1-ピペラジニル) ヘキサノイル基、2-(4-(2-トリフルオロメトキシベンジ
 ルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) プロピオニル基、3-(4-(2-トリフル
 オロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4-
 (2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル
 基、5-(4-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジ
 ニル) ペンタノイル基、6-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル-1
 -ピペラジニル) ヘキサノイル基、3-(4-(3-トリフルオロメトキシベンジルオキ
 シカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、4-(4-(3-トリフルオロメトキシ
 ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(3-トリ
 フルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンタノイル基、3
 -(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)
 ブチリル基、4-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-
 ピペラジニル) ブチリル基、5-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル
 ボニル)-1-ピペラジニル) ペンタノイル基、6-(4-(4-トリフルオロメトキシ
 ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ヘキサノイル基、4-フェニルカルバ
 モイルメチル-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-フェニルカルバモイルメチル-
 1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(4-フルオロフェニルカルバモイルメチル)
 -1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェ
 ニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(4-クロロフェ
 ニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(3, 4-ジクロ
 ロフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(4-メチ
 ルフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2, 4-
 ジメチルフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(4-
 -メトキシフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(
 2, 4, 6-トリメトキシフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル) プロピオ
 ニル基、3-(4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペ
 ラジニル) プロピオニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルメチ
 ル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシフェニルカル
 バモイルメチル)-1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-フェニルカルバモイル-
 1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-フェニルカルバモイル-1-ピペラジニル) プ
 ロピオニル基、4-(4-フルオロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル
 基
 、3-(4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルカルバモイル)-1-ピペ
 ラジニル) プロピオニル基、4-(4-クロロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニ
 ルアセチル基、4-(2, 4-ジクロロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセ

10

20

30

40

50

チル基、4-(2, 6-トリクロロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル
 基、3-(4-(4-クロロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル)プロピオニル
 基、4-(4-メチルフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-
 -(3, 4-ジメチルフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-
 -(4-メトキシフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-[4-(
 2, 4, 6-トリメトキシフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル]プロピオニル基
 、3-(4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル)プロ
 ピオニル基、4-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルカルバモイル)-1-ピ
 ペラジニルアセチル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル)
 -1-ピペラジニル)プロピオニル基、3-(4-(4-フルオロフェニルカルバモイル)
 -1-ピペラジニル)プロピオニル基、3-(4-(4-メチルフェニルカルバモイル)
 -1-ピペラジニル)プロピオニル基、3-(4-(4-メトキシフェニルカルバモイ
 ル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペ
 ラジニルアセチル基、3-(4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペラジニル)プロ
 ピオニル基、4-(4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペラジニル)プチリル基、
 5-(4-(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、6-(4-
 -(2-ベンゾオキサゾリル)-1-ピペラジニル)ヘキサノイル基等のピペラジニルC
 2~6アルカノイル基(ピペラジン環上には、C1~6アルカノイル基、フェニル環上に
 置換基としてフェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキ
 ル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基
 を1~5個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルC1~6アルキル基、フェニ
 ル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基
 及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1
 ~5個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルC1~6アルコキシカルボニル基
 、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア
 ルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ば
 れた基を1~5個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルカルバモイルC1~6ア
 ルキル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC
 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群よ
 り選ばれた基を1~5個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルカルバモイル基
 及びベンゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。)

【0323】

フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC1~6ア
 ルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシ基、C1~6アルコキシカルボニル
 基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の
 C1~6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基としてC1~6アルキル基を有すること
 のあるピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換して
 いてもよい)としては、例えば、フェニルカルバモイル基、2-フルオロフェニルカルバモ
 イル基、3-フルオロフェニルカルバモイル基、4-フルオロフェニルカルバモイル基、
 2-クロロフェニルカルバモイル基、3-クロロフェニルカルバモイル基、4-クロロフ
 エニルカルバモイル基、2-ブロモフェニルカルバモイル基、3-ブロモフェニルカルバ
 モイル基、4-ブロモフェニルカルバモイル基、2-ヨードフェニルカルバモイル基、3-
 ヨードフェニルカルバモイル基、4-ヨードフェニルカルバモイル基、2, 3-ジフル
 オロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジ
 フルオロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 6-
 ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3-ジクロロフェニルカルバモイル基、3,
 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジクロロフェニルカルバモイル基、2,
 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジクロロフェニルカルバモイル基、3,
 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイ

ル基、3, 4, 5-トリクロロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリフルオロフェ
 ニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルカルバモイル基、2-メチルフェ
 ニルカルバモイル基、3-メチルフェニルカルバモイル基、4-メチルフェニルカルバモ
 イル基、2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイル基、3-メチル-4-クロロフェ
 ニルカルバモイル基、2-クロロ-4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3
 -フルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、
 3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルフェニルカル
 バモイル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイル基、N-(2-フルオロフェニル)
 -N-メチルカルバモイル基、N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル
 基、N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-クロロフェ
 ニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-クロロフェニル)-N-メチルカルバモ
 イル基、N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-ブロモフ
 ェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-ヨードフェニル)-N-メチルカルバ
 モイル基、N-(3-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-ヨード
 フェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 3-ジフルオロフェニル)-N-メ
 チルカルバモイル基、N-(3, 4-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基
 、N-(3, 5-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4-ジ
 フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 6-ジフルオロフェニル)
 -N-メチルカルバモイル基、N-(2, 3-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモ
 イル基、N-(3, 4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 5
 -ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4-ジクロロフェニル)
 -N-メチルカルバモイル基、N-(2, 6-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモ
 イル基、N-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-
 (3, 4, 5-トリクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4, 6-
 トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4, 6-トリクロロフ
 ェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカルバ
 モイル基、N-(3-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-メチル
 フェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチル-3-クロロフェニル)-N-
 メチルカルバモイル基、N-(3-メチル-4-クロロフェニル)-N-メチルカルバ
 モイル基、N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-
 (2-メチル-3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-トリフ
 ルオロメチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-トリフルオロメチルフ
 ェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-ベンジル-N-フェニルカルバモイル基、N-
 ベンジル-N-(2-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-
 フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フルオロフェニル)カル
 バモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジ
 ル-N-(3-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-クロロフェ
 ニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ブロモフェニル)カルバモイル基、N-
 ベンジル-N-(3-ブロモフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ブロ
 モフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ヨードフェニル)カルバモイル
 基、N-ベンジル-N-(3-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(
 4-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 3-ジフルオロフェ
 ニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4-ジフルオロフェニル)カルバモ
 イル基、N-ベンジル-N-(3, 5-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベン
 ジル-N-(2, 4-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 6-
 ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 3-ジクロロフェ
 ニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4-ジクロロフェニル)カルバモ
 イル基、N-ベンジル-N-(3, 5-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベン
 ジル-N-(2, 4-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 6-
 ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4, 5-トリフルオロフェ
 ニル)

10

20

30

40

50

カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 3-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチル-4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイル基、3-イソプロピルフェニルカルバモイル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイル基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-ペンチルフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルフェニルカルバモイル基、2-メトキシフェニルカルバモイル基、3-メトキシフェニルカルバモイル基、4-メトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイル基、2, 6-ジメトキシフェニルカルバモイル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-ペンチルオキシフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルオキシフェニルカルバモイル基、2-ジメチルアミノフェニルカルバモイル基、2-アミノフェニルカルバモイル基、2, 4-ジアミノフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリアミノフェニルカルバモイル基、3-ジメチルアミノフェニルカルバモイル基、4-メチルアミノフェニルカルバモイル基、2-カルボキシルフェニルカルバモイル基、3-カルボキシルフェニルカルバモイル基、4-カルボキシルフェニルカルバモイル基、2, 3-ジカルボキシルフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリカルボキシルフェニルカルバモイル基、2-メトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、3-メトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、4-メトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2-エトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、3-エトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、4-エトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2-プロポキシカルボニルフェニルカルバモイル基、3-プロポキシカルボニルフェニルカルバモイル基、4-プロポキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2-(1-ピペラジニル)フェニルカルバモイル基、2-(2, 4-ジメチル-1-ピペラジニル)フェニルカルバモイル基、2-(2, 3, 4-トリメチル-1-ピペラジニル)

10

20

30

40

50

フェニルカルバモイル基、2-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニルカルバモイル基、3-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニルカルバモイル基、4-(4-メチル-1-ピペラジニル)フェニルカルバモイル基、2-モルホリノフェニルカルバモイル基、3-モルホリノフェニルカルバモイル基、4-モルホリノフェニルカルバモイル基等のフェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC1～6アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基、カルボキシ基、C1～6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基としてC1～6アルキル基を1～3個有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよく、またアミノ基部分に他にC1～6アルキル基またはフェニルC1～6アルキル基が置換していてもよい）を挙げることができる。

10

【0324】

フェニルC1～6アルキルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、1-フェニルエチルカルバモイル基、2-フェニルエチルカルバモイル基、3-フェニルプロピルカルバモイル基、4-フェニルブチルカルバモイル基、5-フェニルペンチルカルバモイル基、6-フェニルヘキシルカルバモイル基、2-メチル-3-フェニルプロピルカルバモイル基、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチルカルバモイル基、2-メチルベンジルカルバモイル基、3-メチルベンジルカルバモイル基、4-メチルベンジルカルバモイル基、2, 4-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメチル-3-メトキシベンジルカルバモイル基、2-エチルベンジルカルバモイル基、3-エチルベンジルカルバモイル基、4-エチルベンジルカルバモイル基、2-イソプロピルベンジルカルバモイル基、3-イソプロピルベンジルカルバモイル基、4-イソプロピルベンジルカルバモイル基、2, 4-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシ-3-メチルベンジルカルバモイル基、4-メトキシベンジルカルバモイル基、2-エトキシベンジルカルバモイル基、3-エトキシベンジルカルバモイル基、4-エトキシベンジルカルバモイル基、2-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、3-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、4-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルベンジルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシベンジルカルバモイル基等のフェニルC1～6アルキルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

20

30

【0325】

ピペラジニルカルボニル基（ピペラジン環上には、C1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕及びフェニルC1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、1-ピペラジニルカルボニル基、2-ピペラジニルカルボニル基、3-ピペラジニルカルボニル基、4-ピペラジニルカルボニル基、4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4-メチルベンジロキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(2, 4-ジメチルベンジロキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジロキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジロキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4-メチルベ

40

50

ンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル基、4 - (3, 4 - ジメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル基、4 - (3, 4, 5 - トリメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル基、4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル基、4 - メトキシカルボニル - 3 - ベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニル基、4 - ベンジルオキシカルボニル - 3, 5 - ジメトキシカルボニル - 1 - ピペラジニルカルボニル基等のピペラジニルカルボニル基(ピペラジン環上には、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基 1 ~ 3 個を有することのあるフェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基及びフェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基を 1 ~ 3 個有することのあるフェニル C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい。)を挙げることができる。

10

【0326】

本明細書において、(a) ~ (r) で示される各基は、具体的に次の通りである。

【0327】

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を示す。

【0328】

C 1 ~ 6 アルキル基とは、炭素原子が 1 ないし 6 から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、n - プロピル基、イソプロピル基、n - ブチル基、イソブチル基、tert - ブチル基、sec - ブチル基、n - ペンチル基、ネオペンチル基、n - ヘキシル基、イソヘキシル基、3 - メチルペンチル基等を挙げることができる。

20

【0329】

C 1 ~ 6 アルコキシ基とは、上記定義された C 1 ~ 6 アルキル基と酸素原子で構成される基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n - プロポキシ基、イソプロポキシ基、n - ブトキシ基、イソブトキシ基、tert - ブトキシ基、sec - ブトキシ基、n - ペントキシ基、ネオペントキシ基、n - ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、3 - メチルペントキシ基等を挙げることができる。

【0330】

ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基とは、上記定義された炭素原子が 1 ないし 6 から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基及びハロゲン原子が 1 ~ 7 個置換した前記アルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、n - プロピル基、イソプロピル基、n - ブチル基、イソブチル基、tert - ブチル基、sec - ブチル基、n - ペンチル基、ネオペンチル基、n - ヘキシル基、イソヘキシル基、3 - メチルペンチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2 - クロロエチル基、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、3 - クロロプロピル基、2 - クロロプロピル基、3 - ブロモプロピル基、4, 4, 4 - トリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3 - ペンタフルオロブチル基、4 - クロロブチル基、4 - ブロモブチル基、2 - クロロブチル基、5, 5, 5 - トリフルオロペンチル基、5 - クロロペンチル基、6, 6, 6 - トリフルオロヘキシル基、6 - クロロヘキシル基等を挙げることができる。

30

40

【0331】

ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基とは、上記で定義された C 1 ~ 6 のアルコキシ基及びハロゲン原子が 1 ~ 7 個置換した前記アルコキシ基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n - プロポキシ基、イソプロポキシ基、n - ブトキシ基、イソブトキシ基、tert - ブトキシ基、sec - ブトキシ基、n - ペントキシ基、ネオペントキシ基、n - ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、3 - メチルペントキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、ブロモメトキシ基、ジブロモメトキシ基、ジクロロフルオロメトキシ基、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオ

50

ロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロイソプロポキシ基、3-クロロプロポキシ基、2-クロロプロポキシ基、3-ブロモプロポキシ基、4, 4, 4-トリフルオロブトキシ基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブトキシ基、4-クロロブトキシ基、4-ブロモブトキシ基、2-クロロブトキシ基、5, 5, 5-トリフルオロペントキシ基、5-クロロペントキシ基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシルオキシ基、6-クロロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

【0332】

フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2, 3-ジクロロフェノキシ基、3, 4-ジクロロフェノキシ基、2, 4-ジクロロフェノキシ基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-エチルフェノキシ基、3-エチルフェノキシ基、4-エチルフェノキシ基、4-n-プロピルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2, 3-ジメチルフェノキシ基、3, 4, 5-トリメチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、2-エトキシフェノキシ基、3-エトキシフェノキシ基、4-エトキシフェノキシ基、4-n-プロポキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ基、4-n-ペンチルオキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基等のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0333】

ピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕としては、例えば、1-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-フェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリフェノキシ-1-ピペリジル基、2-（2-フルオロフェノキシ）-1-ピペリジル基、3-（3-フルオロフェノキシ）-2-ピペリジル基、4-（4-フルオロフェノキシ）-3-ピペリジル基、2-（2-クロロフェノキシ）-4-ピペリジル基、3-（3-クロロフェノキシ）-5-ピペリジル基、4-（4-クロロフェノキシ）-2-ピペリジル基、5-（2-ブロモフェノキシ）-2-ピペリジル基、6-（3-ブロモフェノキシ）-3-ピペリジル基、4-（4-ブロモフェノキシ）-1-ピペリジル基、3-（2, 3-ジクロロフェノキシ）-2-ピペリジル基、4-（3, 4-ジクロロフェノキシ）-3-ピペリジル基、3-（2, 4-ジクロロフェノキシ）-4-ピペリジル基、2-（3, 4, 5-トリクロロフェノキシ）-3-ピペリジル基、6-（2, 4, 6-トリクロロフェノキシ）-2-ピペリジル基

、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、5-(3-メチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(4-メチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、1-(2-エチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(3-エチルシフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-エチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-n-ブロピルフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、1-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(4-n-ペンチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(3-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(4-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(2-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-エトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-n-ブロポキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-tert-ブトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(4-n-ブトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(2, 3-ジメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ペンチルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基等のピペリジル基〔ピペリジン環上には、1~3個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0334】

フェニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕が置換していてもよい）とは、例えば、フェニル基、4-(1-ピペリジル)フェニル基、2, 4-ジ(1-ピペリジル)フェニル基、2, 4, 6-トリ(1-ピペリジル)フェニル基、3-(4-ピペリジル)フェニル基、2-(2-ピペリジル)フェニル基、4-(3-ピペリジル)フェニル基、3-(4-フェノキシ-1-ピペリジル)フェニル基、2-(2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル)フェニル基、4-(2, 4, 6-トリフェノキシ-1-ピペリジル)フェニル基、3-[2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]フェニル基、2-[3-(3-フルオロフェノキシ)-2-ピペリジル]フェニル基、4-[4-(4-フルオロフェノキシ)-3-ピペリジル]フェニル基、3-[2-(2-クロロフェノキシ)-4-ピペリジル]フェニル基、2-[3-(3-クロロフェノキシ)-5-ピペリジル]フェニル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-ピペリジル]フェニル基、3-[5-(2-ブロモフェノキシ)-2-ピペリジル]フェニル基、2-[6-(3-ブロモフェノキシ)-3-ピペリジル]フェニル基、4-[4-(4-ブロモフェノキシ)-1-ピペリジル]フェニル基、3-[3-(2, 3-ジクロロフェノキシ)-2-ピペリジル]フェニル基、2-[4-(3, 4-ジクロロフェノキシ)-3-ピペリジル]フェニル基、4-[3-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-

4-ピペリジル] フェニル基、3-[2-(3, 4, 5-トリクロロフェノキシ)-3-ピペリジル] フェニル基、2-[6-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)-2-ピペリジル] フェニル基、4-[3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、3-[4-(2-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、2-[5-(3-メチルフェノキシ)-2-ピペリジル] フェニル基、4-[6-(4-メチルフェノキシ)-3-ピペリジル] フェニル基、3-[1-(2-エチルフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、2-[2-(3-エチルフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、4-[3-(4-エチルフェノキシ)-2-ピペリジル] フェニル基、3-[4-(4-n-プロピルフェノキシ)-3-ピペリジル] フェニル基、2-[3-(4-tert-ブチルフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、4-[2-(4-n-ブチルフェノキシ)-3-ピペリジル] フェニル基、3-[1-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-ピペリジル] フェニル基、2-[2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、4-[3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、3-[1-(2-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、2-[1-(3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、4-[4-(2, 3-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、3-[1-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、2-[1-(4-n-ペンチルフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、4-[4-(4-n-ヘキシルフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、3-[4-(2-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、2-[1-(3-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、4-[1-(4-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、3-[2-(2-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル] フェニル基、2-[3-(3-エトキシフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、4-[4-(4-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル] フェニル基、3-[3-(4-n-プロポキシフェノキシ)-2-ピペリジル] フェニル基、2-[2-(4-tert-ブトキシフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、4-[1-(4-n-ブトキシフェノキシ)-2-ピペリジル] フェニル基、3-[2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル] フェニル基、2-[3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、3-[3-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-2-ピペリジル] フェニル基、2-[2-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、4-[1-(2, 3-ジメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル] フェニル基、3-[4-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、2-[4-(4-n-ペンチルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基、4-[4-(4-n-ヘキシルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル] フェニル基等のフェニル基（フェニル環上には、1～3個のピペリジル基〔ピペリジン環上には、1～3個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕が置換していてもよい）を挙げることができる。

【0335】

フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、無置換のフェニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選択された置換基を1～5個、好ましくは1～3個有するフェニル基であって、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基

10

20

30

40

50

、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることができる。

【0336】

フェニルC1~6アルキル基としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-メチル-3-フェニルプロピル基、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル基等を挙げる

ことができる。

【0337】

フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換のフェニルC 1～6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選択された基が1～5個、好ましくは1～3個置換している基であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-（2-トリフルオロメチルフェニル）エチル基、2-（3-トリフルオロメチルフェニル）エチル基、2-（4-トリフルオロメチルフェニル）エチル基、2-（2-トリフルオロメトキシフェニル）エチル基、2-（3-トリフルオロメトキシフェニル）エチル基、2-（4-トリフルオロメトキシフェニル）エチル基、2-（2-ペンタフルオロエトキシフェニル）エチル基、2-（3-ペンタフルオロエトキシフェニル）エチル基、2-（4-ペンタフルオロエトキシフェニル）エチル基、3-（2-トリフルオロメチルフェニル）プロピル基、3-（3-トリフルオロメチルフェニル）プロピル基、3-（4-トリフルオロメチルフェニル）プロピル基、3-（2-トリフルオロメトキシフェニル）プロピル基、3-（3-トリフルオロメトキシフェニル）プロピル基、3-（4-トリフルオロメトキシフェニル）プロピル基、3-（3-ペンタフルオロエトキシフェニル）プロピル基、3-（4-ペンタフルオロエトキシフェニル）プロピル基、4-（3-ペンタフルオロエトキシフェニル）ブチル基、5-（4-トリフルオロメチルフェニル）ペンチル基、4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ペンチル基、4-（4-トリフルオロメトキシ

10

20

30

40

50

フェニル) ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基等を挙げることができる。

【0338】

ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] としては、例えば、1-ピペラジニル基、2-ピペラジニル基、3, 4-ジベンジル-1-ピペラジニル基、2, 3, 4-トリベンジル-1-ピペラジニル基、4-ベンジル-1-ピペラジニル基、4-(2-フェネチル)-1-ピペラジニル基、4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル基、4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル基、4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル基、4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル基、4-(2-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-クロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-クロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-クロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 3-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 5-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-メトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 4-ジメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル]-1-ピペラジニル基、4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル]-1-ピペラジニル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ブチル]-1-ピペラジニル基、4-[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル]-1-ピペラジニル基、4-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル]-1-ピペラジニル基、4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル]-1-ピペラジニル基、4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル]-1-ピペラジニル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ブチル]-1-ピペラジニル基、4-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル]-1-ピペラジニル基、4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル]-1-ピペラジニル基等のピペラジニル基 [ピペラジン環上には、1~3個のフェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) が置換していてもよい] を挙げることができる。

【0339】

ピペリジル基 [ピペリジン環上には、アミノ基 (アミノ基上には、フェニル基 [フェニル

10

20

30

40

50

ル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) とは、例えば、1-ピペリジル基、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2, 4-ジアミノ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリアミノ-1-ピペリジル基、2-アミノ-1-ピペリジル基、3-アミノ-1-ピペリジル基、4-アミノ-1-ピペリジル基、4-メチルアミノ-1-ピペリジル基、4-エチルアミノ-1-ピペリジル基、4-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジメチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジ-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-フェニルアミノ-1-ピペリジル基、4-(N-フェニル-N-メチルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 3-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3, 4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3, 5-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ)]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジメチルフェニルアミノ)]-1-ピペリジル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-フェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリフェノキシ-1-ピペリジル基、2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(3-フルオロフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-フルオロフェノキシ)-3-ピペリジル基、2-(2-クロロフェノキシ)-4-ピペリジル基、3-(3-クロロフェノキシ)-5-ピペリジル基、4-(4-クロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、5-(2-ブromoフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(3-ブromoフェノキシ)-3-ピペリジル基、4-(4-ブromoフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(2, 3-ジクロロフェノキシ)-

10

20

30

40

50

2-ピペリジル基、4-(3, 4-ジクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(3, 4, 5-トリクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、6-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、5-(3-メチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(4-メチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、1-(2-エチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(3-エチルシフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-エチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-n-プロピルフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、1-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(4-n-ペンチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(3-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(4-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(2-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-エトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-n-プロポキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-tert-ブトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(4-n-ブトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(2, 3-ジメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ペンチルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-ベンジル-1-ピペリジル基、2, 4-ジベンジル-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリベンジル-1-ピペリジル基、2-(2-フルオロベンジル)-1-ピペリジル基、3-[2-(3-フルオロフェニル)エチル]-2-ピペリジル基、4-[1-(4-フルオロフェニル)エチル]-3-ピペリジル基、2-[3-(2-クロロフェニル)プロピル]-4-ピペリジル基、3-[4-(3-クロロフェニル)ブチル]-5-ピペリジル基、4-[5-(4-クロロフェニル)ペンチル]-2-ピペリジル基、5-(6-(2-ブロモフェニル)ヘキシル)-2-ピペリジル基、6-(3-ブロモベンジル)-3-ピペリジル基、4-(4-ブロモベンジル)-1-ピペリジル基、3-(2, 3-ジクロロベンジル)-2-ピペリジル基、4-(3, 4-ジクロロベンジル)-3-ピペリジル基、3-(2, 4-ジクロロベンジル)-4-ピペリジル基、2-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-3-ピペリジル基、6-(2, 4, 6-トリクロロベンジル)-2-ピペリジル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルベンジル)-1-ピペリジル基、5-[2-(3-メチルフェニル)エチル]-2-ピペリジル基、6-[3-(4-メチルフェニル)プロピル]-3-ピペリジル基、1-[4-(2-エチルフェニル)ブチル]-4-ピペリジル基、2-[5-(3-エチルフェニル)ペンチル]-1-ピペリジル基、3-[6-(4-エチルフェニル)ヘキシル]-2-ピペリジル基、4-(4-n-プロピルベンジル)-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルベンジル)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルベンジル)-3-ピペリジル基、1-(2-トリフルオロメチルベンジル)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペリジル基、3-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチ

10

20

30

40

50

ルベンジル) - 4 - ピペリジル基、1 - (3 - ペンタフルオロエチルベンジル) - 4 - ピペリジル基、4 - (2, 3 - ジメチルベンジル) - 1 - ピペリジル基、1 - (3, 4, 5 - トリメチルベンジル) - 4 - ピペリジル基、1 - (4 - n - ペンチルベンジル) - 4 - ピペリジル基、4 - (4 - n - ヘキシルベンジル) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - メトキシベンジル) - 1 - ピペリジル基、1 - [2 - (3 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - ピペリジル基、1 - [1 - (4 - メトキシフェニル) エチル] - 4 - ピペリジル基、2 - [3 - (2 - エトキシフェニル) プロピル] - 3 - ピペリジル基、3 - [4 - (3 - エトキシフェニル) ブチル] - 4 - ピペリジル基、4 - [5 - (4 - エトキシフェニル) ペンチル] - 3 - ピペリジル基、3 - [6 - (4 - n - プロポキシフェニル) ヘキシル - 2 - ピペリジル基、2 - (4 - tert - ブトキシベンジル) - 1 - ピペリジル基、1 - (4 - n - ブトキシベンジル) - 2 - ピペリジル基、2 - (2 - トリフルオロメトキシベンジル) - 3 - ピペリジル基、3 - (3 - トリフルオロメトキシベンジル) - 4 - ピペリジル基、4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジル) - 3 - ピペリジル基、3 - (2 - ペンタフルオロエトキシベンジル) - 2 - ピペリジル基、2 - (4 - ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1 - ピペリジル基、1 - (2, 3 - ジメトキシベンジル) - 4 - ピペリジル基、4 - (3, 4, 5 - トリメトキシベンジル) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - n - ペンチルオキシベンジル) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - n - ヘキシルオキシベンジル) - 1 - ピペリジル基、4 - ベンジル - 3 - フェノキシ - 1 - ピペリジル基、4 - フェノキシ - 2 - メチルアミノ - 1 - ピペリジル基等のピペリジル基 [ピペリジン環上には、アミノ基 (アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい] 及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 2 個置換していてもよい)、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい) 及びフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい] を挙げることができる。

【0340】

ベンゾチアゾリルオキシ基 (ベンゾチアゾール環上には、(b-1) フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、(b-2) ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも 1 個のフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) が置換していてもよい] 及び (b-3) ピペリジル基 [ピペリジン環上には、アミノ基 (アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) 及びフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] としては、例えば、2 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - ベンゾチアゾ

リルオキシ基、5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-ベン
 ゾチアゾリルオキシ基、2-(1-ピペラジニル)-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、
 2-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(3,
 4-ジベンジル-1-ピペラジニル)-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-(2, 3,
 4-トリベンジル-1-ピペラジニル)-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(
 2-フェネチル)-1-ピペラジニル]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(
 3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[
 4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-
 [4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ
 基、2-[4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリル
 オキシ基、4-[4-(2-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル]-2-ベンゾチア
 ザゾリルオキシ基、2-[4-(3-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル]-4-ベン
 ゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル]-5-
 ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-クロロベンジル)-1-ピペラジニル]
 -6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3-クロロベンジル)-1-ピペラジニ
 ル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-[4-(4-クロロベンジル)-1-ピペラ
 ジニル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(2, 3-ジクロロベンジル)-
 1-ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-(2, 4-ジクロロベ
 ンジル)-1-ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3, 4-
 ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-
 (3, 5-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、
 4-[4-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-1-ピペラジニル]-5-ベンゾチア
 ザゾリルオキシ基、4-[4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル)-1-ピ
 ペラジニル]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメチルベ
 ンジル)-1-ピペラジニル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(3-トリ
 フルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-
 [4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリ
 ルオキシ基、5-[4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル]-4-ベンゾチア
 ザゾリルオキシ基、6-[4-(3, 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-4-
 ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ピペ
 ラジニル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(2-ペンタフルオロエチルベ
 ンジル)-1-ピペラジニル]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(3-ペン
 タフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-
 [4-(4-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]-6-ベンゾチア
 ザゾリルオキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]
 -7-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-[4-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-
 1-ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(4-トリフルオロ
 メトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-
 (4-メトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-
 [4-(3, 4-ジメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリルオ
 キシ基、7-[4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-4-
 ベンゾチアゾリルオキシ基、5-[4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-
 ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエト
 キシベンジル)-1-ピペラジニル]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(4-
 ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-4-ベンゾチアゾリルオキ
 シ基、4-{4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル]-1-ピペラジ
 ニル}-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-{4-[3-(4-トリフルオロメトキシ
 フェニル)プロピル]-1-ピペラジニル}-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-{4-
 [4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル}-2-ベ
 ンゾチアゾリルオキシ基、4-{4-[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペン

10

20

30

40

50

チル] - 1 - ピペラジニル} - 2 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - {4 - [6 - (4 -
 トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル] - 1 - ピペラジニル} - 2 - ベンゾチアゾリ
 ルオキシ基、4 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エチル] - 1 - ピペ
 ラジニル} - 2 - ベンゾチアゾリルオキシ基、5 - {4 - [3 - (4 - トリフルオロメチ
 ルフェニル) プロピル] - 1 - ピペラジニル} - 2 - ベンゾチアゾリルオキシ基、6 - {
 4 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ブチル] - 1 - ピペラジニル} - 2 - ベ
 ンゾチアゾリルオキシ基、7 - {4 - [5 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ペンチ
 ル] - 1 - ピペラジニル} - 2 - ベンゾチアゾリルオキシ基、5 - {4 - [6 - (4 - ト
 リフルオロメチルフェニル) ヘキシル] - 1 - ピペラジニル} - 2 - ベンゾチアゾリルオ
 キシ基、2 - [4 - (トリフルオロメトキシフェノキシ - 1 - ピペリジル)] - 6 - ベン
 ゾチアゾリルオキシ基、2 - [4 - (トリフルオロメトキシベンジル - 1 - ピペリジル)
] - 6 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - {4 - [N - エチル - N - (4 - クロロフェニ
 ル) アミノ] - 1 - ピペリジル} - 6 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - フェニル - 5 -
 ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - ベンゾチアゾリルオキシ
 基、2 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 6 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 -
 (3 - トリフルオロメチルフェニル) - 5 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - (1 - ピペ
 リジル) - 4 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - (4 - ベンジル - 1 - ピペリジル) - 4 -
 ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - (3, 4 - ジベンジル - 1 - ピペリジル) - 4 - ベン
 ゾチアゾリルオキシ基、5 - (2, 3, 4 - トリベンジル - 1 - ピペリジル) - 2 - ベン
 ゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (2 - フェネチル) - 1 - ピペリジル] - 2 - ベンゾ
 チアゾリルオキシ基、4 - [4 - (3 - フェニルプロピル) - 1 - ピペリジル] - 5 - ベ
 ンゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (4 - フェニルブチル) - 1 - ピペリジル] - 6 -
 ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (5 - フェニルペンチル) - 1 - ピペリジル] -
 7 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - [4 - (6 - フェニルヘキシル) - 1 - ピペリジル]
 - 4 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (2 - フルオロベンジル) - 1 - ピペリ
 ジル] - 2 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - [4 - (3 - フルオロベンジル) - 1 - ピ
 ペリジル] - 4 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - [4 - (4 - フルオロベンジル) - 1
 - ピペラジニル] - 5 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - [4 - (2 - クロロベンジル)
 - 1 - ピペリジル] - 6 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - [4 - (3 - クロロベンジル)
 - 1 - ピペリジル] - 7 - ベンゾチアゾリルオキシ基、5 - [4 - (4 - クロロベンジ
 ル) - 1 - ピペリジル] - 4 - ベンゾチアゾリルオキシ基、6 - [4 - (2, 3 - ジクロ
 ロベンジル) - 1 - ピペリジル] - 4 - ベンゾチアゾリルオキシ基、7 - [4 - (2, 4
 - ジクロロベンジル) - 1 - ピペリジル] - 4 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - [4 -
 (3, 4 - ジクロロベンジル) - 1 - ピペリジル] - 4 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4
 - [4 - (3, 5 - ジクロロベンジル) - 1 - ピペリジル] - 2 - ベンゾチアゾリルオキ
 シ基、4 - [4 - (3, 4, 5 - トリクロロベンジル) - 1 - ピペリジル] - 5 - ベンゾ
 チアゾリルオキシ基、4 - [4 - (2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロベンジル) - 1
 - ピペリジル] - 2 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (2 - トリフルオロメチル
 ベンジル) - 1 - ピペリジル] - 6 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (3 - トリ
 フルオロメチルベンジル) - 1 - ピペリジル] - 7 - ベンゾチアゾリルオキシ基、2 - [
 4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペリジル] - 4 - ベンゾチアゾリルオ
 キシ基、5 - [4 - (4 - メチルベンジル) - 1 - ピペリジル] - 4 - ベンゾチアゾリル
 オキシ基、6 - [4 - (3, 4 - ジメチルベンジル) - 1 - ピペリジル] - 4 - ベンゾチ
 アゾリルオキシ基、7 - [4 - (2, 4, 6 - トリメチルベンジル) - 1 - ピペリジル]
 - 4 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (2 - ペンタフルオロエチルベンジル) -
 1 - ピペリジル] - 2 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (3 - ペンタフルオロエ
 チルベンジル) - 1 - ピペリジル] - 5 - ベンゾチアゾリルオキシ基、4 - [4 - (4 -
 ペンタフルオロエチルベンジル) - 1 - ピペリジル] - 6 - ベンゾチアゾリルオキシ基、
 4 - [4 - (2 - トリフルオロメトキシベンジル) - 1 - ピペリジル] - 7 - ベンゾチア
 ザリルオキシ基、5 - [4 - (3 - トリフルオロメトキシベンジル) - 1 - ピペリジル]

10

20

30

40

50

- 4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-
 1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-(4-メトキシベンジル)-
 1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(3,4-ジメトキシ
 ベンジル)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-(2,4,
 6-トリメトキシベンジル)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-
 [4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチア
 ズリルオキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペリジル
]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-
 1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-{4-[2-(4-トリフル
 オロメトキシフェニル)エチル]-1-ピペリジル}-2-ベンゾチアゾリルオキシ基
 、4-{4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル]-1-ピペリジル}
 }-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェ
 ニル)ブチル]-1-ピペリジル}-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-{4-[5-
 (4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル]-1-ピペリジル}-2-ベンゾチア
 ズリルオキシ基、4-{4-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル]-
 1-ピペリジル}-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-{4-[2-(4-トリフルオ
 ロメチルフェニル)エチル]-1-ピペリジル}-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-
 {4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-1-ピペリジル}-2-
 ベンゾチアゾリルオキシ基、6-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチ
 ル]-1-ピペリジル}-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-{4-[5-(4-トリ
 フルオロメチルフェニル)ペンチル]-1-ピペリジル}-2-ベンゾチアゾリルオキシ
 基、5-{4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-1-ピペリジル}
 }-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-フェノキシ-1-ピペリジル)-4-ベン
 ゾチアゾリルオキシ基、2-(3,4-ジフェノキシ-1-ピペリジル)-4-ベン
 ゾチアゾリルオキシ基、5-(2,3,4-トリフェノキシ-1-ピペリジル)-2-ベン
 ゾ

10

20

チアゾリルオキシ基、4-[4-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-
 ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]
 -4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-フルオロフェノキシ)-1-ピペラ
 ジニル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-クロロフェノキシ)-1-
 ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3-クロロフェノキシ)-
 1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-[4-(4-クロロフェノキシ)-
 1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(2,3-ジクロロ
 フェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-(2,4-
 ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-
 (3,4-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基
 、4-[4-(3,5-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ベンゾチアゾリ
 ルオキシ基、4-[4-(3,4,5-トリクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-
 ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノ
 キシ)-1-ピペリジル]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(2-トリフル
 オロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-
 (3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオ
 キシ基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベン
 ゾチアゾリルオキシ基、5-[4-(4-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-
 -

30

40

ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジ
 ル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)-
 1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(2-ペンタフルオ
 ロエチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-
 (3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオ

50

キシ基、4-[4-(4-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-[4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-(4-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(3,4-ジメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-[4-(2,4,6-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-[4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-[4-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2,5,6-トリフェニル-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-アミノ-1-ピペリジル)-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-(2,4-ジアミノ-1-ピペリジル)-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-(2,4,6-トリアミノ-1-ピペリジル)-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-(2-アミノ-1-ピペリジル)-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-(3-アミノ-1-ピペリジル)-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-メチルアミノ-1-ピペリジル)-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-エチルアミノ-1-ピペリジル)-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル)-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-ジメチルアミノ-1-ピペリジル)-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル)-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-ジ-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル)-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-(4-フェニルアミノ-1-ピペリジル)-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(N-フェニル-N-メチルアミノ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2,3-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2,4,6-トリフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2,4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3,4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-(3,5-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-メチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2,3-ジメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2,4,6-トリメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ

10

20

30

40

50

シ基、2-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-メトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2,3-ジメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2,4,6-トリメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-{4-[N-メチル-N-(2,4,6-トリメトキシフェニルアミノ)]-1-ピペリジル}-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-{4-[N-メチル-N-(3,4-ジメチルフェニルアミノ)]-1-ピペリジル}-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(2-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-(3-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-[4-(4-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-フェニル-5-(4-フェノキシ-1-ピペリジル)-7-ベンゾチアゾリルオキシ基等のベンゾチアゾリルオキシ基（ベンゾチアゾール環上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）、ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、1~3個のフェニルC1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、アミノ基（アミノ基上には、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい〕、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）及びフェニルC1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい〕等を挙げることができる。

【0341】

フェニルC1~6アルキリデン基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンジリデン基、1-フェニルエチリデン基、2-フェニルエチリデン基、3-フェニルプロピリデン基、2-フェニルプロピリデン基、4-フェニルブチリデン基、5-フェニルペンチリデン基、4-フェニルペンチリデン基、6-フェニルヘキシリデン基、2-フルオロベンジリデン基、3-フルオロベンジリデン基、4-フルオロベンジリデン基、2-クロロベンジリデン基、3-クロロベンジリデン基、4-クロロベンジリデン基、2-ブロモベンジリデン基、3-ブロモベンジリデン基、4-ブロモベンジリデン基、2-ヨードベンジリデン基、3-ヨードベンジリデン基、4-ヨードベンジリデン基、2,3-ジフルオロベンジリデン基、3,4-ジフルオロベンジリデン基、3,5-ジフルオ

10

20

30

40

50

ロベンジリデン基、2, 4-ジフルオロベンジリデン基、2, 6-ジフルオロベンジリデン基、2, 3-ジクロロベンジリデン基、3, 4-ジクロロベンジリデン基、3, 5-ジクロロベンジリデン基、2, 4-ジクロロベンジリデン基、2, 6-ジクロロベンジリデン基、2-フルオロ-4-ブロモベンジリデン基、4-クロロ-3-フルオロベンジリデン基、2, 3, 4-トリクロロベンジリデン基、3, 4, 5-トリフルオロベンジリデン基、2, 4, 6-トリクロロベンジリデン基、4-イソプロピルベンジリデン基、4-n-ブチルベンジリデン基、4-メチルベンジリデン基、2-メチルベンジリデン基、3-メチルベンジリデン基、2, 4-ジメチルベンジリデン基、2, 3-ジメチルベンジリデン基、2, 6-ジメチルベンジリデン基、3, 5-ジメチルベンジリデン基、2, 5-ジメチルベンジリデン基、2, 4, 6-トリメチルベンジリデン基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジリデン基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジリデン基、4-イソプロポキシベンジリデン基、4-n-ブトキシベンジリデン基、4-メトキシベンジリデン基、2-メトキシベンジリデン基、3-メトキシベンジリデン基、2, 4-ジメトキシベンジリデン基、2, 3-ジメトキシベンジリデン基、2, 6-ジメトキシベンジリデン基、3, 5-ジメトキシベンジリデン基、2, 5-ジメトキシベンジリデン基、2, 4, 6-トリメトキシベンジリデン基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジリデン基、2-イソプロポキシベンジリデン基、3-クロロ-4-メトキシベンジリデン基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジリデン基、3-メチル-4-フルオロベンジリデン基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジリデン基、2-トリフルオロメチルベンジリデン基、3-トリフルオロメチルベンジリデン基、4-トリフルオロメチルベンジリデン基、2-ペンタフルオロエチルベンジリデン基、3-ペンタフルオロエチルベンジリデン基、4-ペンタフルオロエチルベンジリデン基、2-トリフルオロメトキシベンジリデン基、3-トリフルオロメトキシベンジリデン基、4-トリフルオロメトキシベンジリデン基、2-ペンタフルオロエトキシベンジリデン基、3-ペンタフルオロエトキシベンジリデン基、4-ペンタフルオロエトキシベンジリデン基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチリデン基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチリデン基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチリデン基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチリデン基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチリデン基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチリデン基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチリデン基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチリデン基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチリデン基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピリデン基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピリデン基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピリデン基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピリデン基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピリデン基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピリデン基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピリデン基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピリデン基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチリデン基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチリデン基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチリデン基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチリデン基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシリデン基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシリデン基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシリデン基等のフェニルC 1~6アルキリデン基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0342】

ピペリジル基[ピペリジン環上には、アミノ基(アミノ基上には、フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種

10

20

30

40

50

が置換していてもよい) ; フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニルC 1~6アルキリデン基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、例えば、1-ピペリジル基、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2, 4-ジアミノ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリアミノ-1-ピペリジル基、2-アミノ-1-ピペリジル基、3-アミノ-1-ピペリジル基、4-アミノ-1-ピペリジル基、4-メチルアミノ-1-ピペリジル基、4-エチルアミノ-1-ピペリジル基、4-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジメチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジ-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-フェニルアミノ-1-ピペリジル基、4-(N-フェニル-N-メチルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 3-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3, 5-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ)]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジメチルフェニルアミノ)]-1-ピペリジル基、4-[N-エチル-N-(4-クロロフェニルアミノ)]-1-ピペリジル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(2-フルオロフェニル)アミノ]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(3-フルオロフェニル)アミノ]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(4-フルオロフェニル)アミノ]-1-ピペリジル基、4-フェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリフェノキシ-1-ピペリジル基、2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(3-フルオロフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-フルオロフェノキシ)-3-ピペリジル基、2-(2-クロロフェノキシ)-4-ピペリジル基、3-(3-クロロフェノキシ)-5-ピペリジル基、4-(

10

20

30

40

50

4-クロロフェノキシ)-1-ピペリジル基、5-(2-ブロモフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(3-ブロモフェノキシ)-3-ピペリジル基、4-(4-ブロモフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(2,3-ジクロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(3,4-ジクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2,4-ジクロロフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(3,4,5-トリクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、6-(2,4,6-トリクロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、3-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、5-(3-メチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(4-メチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、4-(2-エチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、2-(3-エチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-エチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-n-プロピルフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、1-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2,3-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(3,4,5-トリメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ペンチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(3-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、2-(2-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-エトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-n-プロポキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-tert-ブトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ブトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2,3-ジメトキシフェノキシ)-1-4-ピペリジル基、4-(3,4,5-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ペンチルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-ベンジル-1-ピペリジル基、2,4-ジベンジル-1-ピペリジル基、2,4,6-トリベンジル-1-ピペリジル基、2-(2-フルオロベンジル)-1-ピペリジル基、3-[2-(3-フルオロフェニル)エチル]-2-ピペリジル基、4-[1-(4-フルオロフェニル)エチル]-3-ピペリジル基、2-[3-(2-クロロフェニル)プロピル]-4-ピペリジル基、3-[4-(3-クロロフェニル)ブチル]-5-ピペリジル基、4-[5-(4-クロロフェニル)ペンチル]-2-ピペリジル基、5-[6-(2-ブロモフェニル)ヘキシル]-2-ピペリジル基、6-(3-ブロモベンジル)-3-ピペリジル基、4-(4-ブロモベンジル)-1-ピペリジル基、3-(2,3-ジクロロベンジル)-2-ピペリジル基、4-(3,4-ジクロロベンジル)-3-ピペリジル基、3-(2,4-ジクロロベンジル)-4-ピペリジル基、2-(3,4,5-トリクロロベンジル)-3-ピペリジル基、6-(2,4,6-トリクロロベンジル)-2-ピペリジル基、3-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジル)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルベンジル)-1-ピペリジル基、5-[2-(3-メチルフェニル)エチル]-2-ピペリジル基、6-[3-(4-メチルフェニル)プロピル]-3-ピペリジル基、1-[4-(2-エチルフェニル)ブチル]-4-ピペリジル基、2-[5-(3-エチルフェニル)ペンチル]-1-ピペリジル基、3-[6-(4-エチルフェニル)ヘキシル]-2-ピペリジル基、4-(4-n-プロピルベンジル)-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルベンジル)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルベンジル)-

10

20

30

40

50

3-ピペリジル基、1-(2-トリフルオロメチルベンジル)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-4-ピペリジル基、1-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-4-ピペリジル基、4-(2,3-ジメチルベンジル)-1-ピペリジル基、1-(3,4,5-トリメチルベンジル)-4-ピペリジル基、1-(4-n-ペンチルベンジル)-4-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルベンジル)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシベンジル)-1-ピペリジル基、1-[2-(3-メトキシフェニル)エチル]-4-ピペリジル基、1-[1-(4-メトキシフェニル)エチル]-4-ピペリジル基、2-[3-(2-エトキシフェニル)プロピル]-3-ピペリジル基、3-[4-(3-エトキシフェニル)ブチル]-4-ピペリジル基、4-[5-(4-エトキシフェニル)ペンチル]-3-ピペリジル基、3-[6-(4-n-プロポキシフェニル)ヘキシル]-2-ピペリジル基、2-(4-tert-ブトキシベンジル)-1-ピペリジル基、1-(4-n-ブトキシベンジル)-2-ピペリジル基、2-(2-トリフルオロメトキシベンジル)-3-ピペリジル基、3-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-4-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペリジル基、3-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-2-ピペリジル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペリジル基、1-(2,3-ジメトキシベンジル)-4-ピペリジル基、4-(3,4,5-トリメトキシベンジル)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ペンチルオキシベンジル)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルオキシベンジル)-1-ピペリジル基、4-ベンジル-3-フェノキシ-1-ピペリジル基、4-フェノキシ-2-メチルアミノ-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)-1-ピペリジル基、4-(4-クロロベンジリデン)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)-1-ピペリジル基等のピペリジル基〔ピペリジン環上には、アミノ基（アミノ基上には、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい）；フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）；フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）及びフェニルC1～6アルキリデン基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0343】

キノリルオキシ基（キノリン環上には、(c-1)ハロゲン原子、(c-2)フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、(c-3)ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕及び(c-4)ピペリジル基〔ピペリジン環上には、アミノ基（アミノ基上には、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少な

10

20

30

40

50

くとも1種が置換していてもよい) ; フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニルC 1 ~ 6 アルキリデン基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、2-キノリルオキシ基、3-キノリルオキシ基、4-キノリルオキシ基、5-キノリルオキシ基、6-キノリルオキシ基、7-キノリルオキシ基、8-キノリルオキシ基、4-(1-ピペラジニル)-2-キノリルオキシ基、3-(2-ピペラジニル)-4-キノリルオキシ基、4-(1-ピペラジニル)-3-キノリルオキシ基、5-(1-ピペラジニル)-4-キノリルオキシ基、6-(3, 4-ジベンジル-1-ピペラジニル)-5-キノリルオキシ基、7-(2, 3, 4-トリベンジル-1-ピペラジニル)-6-キノリルオキシ基、4-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)-2-キノリルオキシ基、3-[4-(2-フェネチル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-(2-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル]-7-キノリルオキシ基、2-[4-(3-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル]-8-キノリルオキシ基、3-[4-(4-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(2-クロロベンジル)-1-ピペラジニル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(3-クロロベンジル)-1-ピペラジニル]-4-キノリルオキシ基、2-[4-(4-クロロベンジル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、7-[4-(2, 3-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-(2, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]-7-キノリルオキシ基、2-[4-(3, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]-8-キノリルオキシ基、3-[4-(3, 5-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-1-ピペラジニル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル)-1-ピペラジニル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(2-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-8-キノリルオキシ基、3-[4-(3, 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(4-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、2-[4-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-8-キノリルオキシ基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(4-メトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(3, 4-ジメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジル)-

10

20

30

40

50

-1-ピペラジニル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、3-[4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-{4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル]-1-ピペラジニル}-3-キノリルオキシ基、5-{4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル]-1-ピペラジニル}-4-キノリルオキシ基、6-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル}-5-キノリルオキシ基、7-{4-[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル]-1-ピペラジニル}-6-キノリルオキシ基、8-{4-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル]-1-ピペラジニル}-7-キノリルオキシ基、2-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-1-ピペラジニル}-8-キノリルオキシ基、3-{4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-1-ピペラジニル}-2-キノリルオキシ基、4-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル}-2-キノリルオキシ基、5-{4-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル]-1-ピペラジニル}-2-キノリルオキシ基、6-{4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-1-ピペラジニル}-2-キノリルオキシ基、3-(2-ピペリジル)-2-キノリルオキシ基、4-(3-ピペリジル)-3-キノリルオキシ基、5-(4-ピペリジル)-4-キノリルオキシ基、6-(2,4-ジアミノ-1-ピペリジル)-5-キノリルオキシ基、7-(2,4,6-トリアミノ-1-ピペリジル)-6-キノリルオキシ基、8-(4-アミノ-1-ピペリジル)-7-キノリルオキシ基、2-(4-アミノ-1-ピペリジル)-8-キノリルオキシ基、3-(4-アミノ-1-ピペリジル)-2-キノリルオキシ基、4-(4-メチルアミノ-1-ピペリジル)-3-キノリルオキシ基、5-(4-エチルアミノ-1-ピペリジル)-4-キノリルオキシ基、6-(4-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル)-5-キノリルオキシ基、7-(4-ジメチルアミノ-1-ピペリジル)-6-キノリルオキシ基、8-(4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル)-7-キノリルオキシ基、2-(4-ジ-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル)-8-キノリルオキシ基、3-(4-フェニルアミノ-1-ピペリジル)-2-キノリルオキシ基、4-[4-(N-フェニル-N-メチルアミノ)-1-ピペリジル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(2-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(3-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(4-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-(2-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-キノリルオキシ基、2-[4-(3-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-8-キノリルオキシ基、3-[4-(4-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(2,3-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(2,4,6-トリフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(2,4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(3,4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-(3,5-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-キノリルオキシ基、2-[4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-8-キノリルオキシ基、3-[4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(2-メチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(2,3-ジメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(2,4,6-トリメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-7-キノリルオキシ基、2-[4-(2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-8

10

20

30

40

50

ーキノリルオキシ基、3-〔4-（3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ）-1-ピ
 ペリジル〕-2-キノリルオキシ基、4-〔4-（4-ペンタフルオロエチルフェニルア
 ミノ）-1-ピペリジル〕}-3-キノリルオキシ基、5-〔4-（2-トリフルオロメ
 トキシフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-4-キノリルオキシ基、6-〔4-（2-
 メトキシフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-5-キノリルオキシ基、7-〔4-（2-
 , 3-ジメトキシフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-6-キノリルオキシ基、8-〔
 4-（2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-7-キノリルオ
 キシ基、2-〔4-〔N-メチル-N-（2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ）〕
 -1-ピペリジル〕}-8-キノリルオキシ基、3-〔4-〔N-メチル-N-（3, 4-
 ジメチルフェニルアミノ）〕-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基、4-〔4-（
 3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基
 、5-〔4-（4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-2-キノ
 リルオキシ基、6-〔4-（2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ）-1-ピペ
 リジル〕-2-キノリルオキシ基、7-〔4-（3-ペンタフルオロエトキシフェニルア
 ミノ）-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基、8-〔4-（4-ペンタフルオロエ
 トキシフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基、2-〔4-（2-
 フルオロフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-3-キノリルオキシ基、3-〔4-（3-
 フルオロフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基、4-〔4-（4-
 フルオロフェニルアミノ）-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基、2-〔4-（
 〔N-エチル-N-（4-クロロフェニル）アミノ〕-1-ピペリジル〕}-6-キノリル
 オキシ基、2, 4-ジ（1-ピペラジニル）-6-キノリルオキシ基、3-（1-ピペリ
 ジ
 ル）-4-（1-ピペラジニル）-2-キノリルオキシ基、2, 4, 6-トリ（1-ピペ
 リジニル）-3-キノリルオキシ基、5-クロロ-8-キノリルオキシ基、2-（4-ト
 リフルオロメトキシフェノキシ）-6-キノリルオキシ基、2-〔4-（4-トリフルオ
 ロメトキシベンジリデン）-1-ピペリジル〕-6-キノリルオキシ基、2-〔4-（4-
 クロロベンジリデン）-1-ピペリジル〕-6-キノリルオキシ基、2-〔4-（4-
 トリフルオロメチルベンジリデン）-1-ピペリジル〕-6-キノリルオキシ基、2-（
 4-ベンジル-1-ピペリジル）-4-キノリルオキシ基、2-（3, 4-ジベンジル-
 1-ピペリジル）-4-キノリルオキシ基、5-（2, 3, 4-トリベンジル-1-ピペ
 リジル）-2-キノリルオキシ基、4-〔4-（2-フェネチル）-1-ピペリジル〕-
 2-キノリルオキシ基、4-〔4-（3-フェニルプロピル）-1-ピペリジル〕-5-
 キノリルオキシ基、4-〔4-（4-フェニルブチル）-1-ピペリジル〕-6-キノリ
 ルオキシ基、4-〔4-（5-フェニルペンチル）-1-ピペリジル〕-7-キノリルオ
 キシ基、2-〔4-（6-フェニルヘキシル）-1-ピペリジル〕-4-キノリルオキシ
 基、4-〔4-（2-フルオロベンジル）-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基、
 2-〔4-（3-フルオロベンジル）-1-ピペリジル〕-4-キノリルオキシ基、2-
 〔4-（4-フルオロベンジル）-1-ピペリジニル〕-5-キノリルオキシ基、2-〔
 4-（2-クロロベンジル）-1-ピペリジル〕-6-キノリルオキシ基、2-〔4-（
 3-クロロベンジル）-1-ピペリジル〕-7-キノリルオキシ基、5-〔4-（4-ク
 ロロベンジル）-1-ピペリジル〕-4-キノリルオキシ基、6-〔4-（2, 3-ジク
 ロロベンジル）-1-ピペリジル〕-4-キノリルオキシ基、7-〔4-（2, 4-ジク
 ロロベンジル）-1-ピペリジル〕-8-キノリルオキシ基、2-〔4-（3, 4-ジク
 ロロベンジル）-1-ピペリジル〕-8-キノリルオキシ基、4-〔4-（3, 5-ジク
 ロロベンジル）-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基、4-〔4-（3, 4, 5-
 トリクロロベンジル）-1-ピペリジル〕-5-キノリルオキシ基、4-〔4-（2, 3
 , 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル）-1-ピペリジル〕-2-キノリルオキシ基、
 4-〔4-（2-トリフルオロメチルベンジル）-1-ピペリジル〕-6-キノリルオキ
 シ基、4-〔4-（3-トリフルオロメチルベンジル）-1-ピペリジル〕-7-キノリ
 ルオキシ基、2-〔4-（4-トリフルオロメチルベンジル）-1-ピペリジル〕-8-

10

20

30

40

50

キノリルオキシ基、5-[4-(4-メチルベンジル)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(3,4-ジメチルベンジル)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、8-[4-(2,4,6-トリメチルベンジル)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、3-[4-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、8-[4-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、4-[4-(4-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペリジル]-6-キノリルオキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペリジル]-7-キノリルオキシ基、5-[4-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(4-メトキシベンジル)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、6-[4-(3,4-ジメトキシベンジル)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、7-[4-(2,4,6-トリメトキシベンジル)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、5-[4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、6-[4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、4-{4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル]-1-ピペリジル}-2-キノリルオキシ基、4-{4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル]-1-ピペリジル}-2-キノリルオキシ基、4-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチル]-1-ピペリジル}-2-キノリルオキシ基、4-{4-[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル]-1-ピペリジル}-3-キノリルオキシ基、4-{4-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル]-1-ピペリジル}-3-キノリルオキシ基、4-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-1-ピペリジル}-2-キノリルオキシ基、5-{4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-1-ピペリジル}-2-キノリルオキシ基、6-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチル]-1-ピペリジル}-2-キノリルオキシ基、7-{4-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル]-2-ピペリジル}-2-キノリルオキシ基、5-{4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-1-ピペリジル}-2-キノリルオキシ基、2-(4-フェノキシ-1-ピペリジル)-4-キノリルオキシ基、2-(3,4-ジフェノキシ-1-ピペリジル)-4-キノリルオキシ基、5-(2,3,4-トリフェノキシ-1-ピペリジル)-2-キノリルオキシ基、4-[4-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、2-[4-(3-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、2-[4-(4-フルオロフェノキシ)-1-ピペラジニル]-5-キノリルオキシ基、2-[4-(2-クロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-6-キノリルオキシ基、2-[4-(3-クロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-7-キノリルオキシ基、5-[4-(4-クロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(2,3-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、7-[4-(2,4-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、2-[4-(3,4-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-8-キノリルオキシ基、4-[4-(3,5-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(3,4,5-トリクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、4-[4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-6-キノリルオキシ基、4-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-7-キノリルオキシ基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、5-[4-(4-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、7-[4-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-

10

20

30

40

50

キノリルオキシ基、4-[4-(2-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、4-[4-(4-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-6-キノリルオキシ基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-7-キノリルオキシ基、5-[4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(4-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-キノリルオキシ基、6-[4-(3,4-ジメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、8-[4-(2,4,6-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、5-[4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、4-[4-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-キノリルオキシ基、6-[4-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、2,5,6-トリフェノキシ-7-キノリルオキシ基、4,5,6-トリクロロ-2-キノリルオキシ基、2-フェノキシ-6-ブromo-5-キノリルオキシ基、2-(2,3-ジメチルフェノキシ)-5-キノリルオキシ基、2-(3,4,5-トリメチルフェノキシ)-6-キノリルオキシ基、2-(2,3-ジメトキシフェノキシ)-7-キノリルオキシ基、2-(3,4,5-トリメトキシフェノキシ)-8-キノリルオキシ基、2-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ)-6-キノリルオキシ基、2-(2-メチルフェノキシ)-4-キノリルオキシ基、2-(3-メチルフェノキシ)-3-キノリルオキシ基、3-(4-メチルフェノキシ)-2-キノリルオキシ基、4-(2-メトキシフェノキシ)-3-キノリルオキシ基、5-(3-メトキシフェノキシ)-4-キノリルオキシ基、6-(4-メトキシフェノキシ)-5-キノリルオキシ基、7-(2-フルオロフェノキシ)-6-キノリルオキシ基、8-(3-フルオロフェノキシ)-7-キノリルオキシ基、2-(4-フルオロフェノキシ)-5-キノリルオキシ基、3-(2-クロロフェノキシ)-2-キノリルオキシ基、4-(3-クロロフェノキシ)-6-キノリルオキシ基、5-(4-クロロフェノキシ)-2-キノリルオキシ基、6-(2-ブromoフェノキシ)-3-キノリルオキシ基、7-(3-ブromoフェノキシ)-4-キノリルオキシ基、8-(4-ブromoフェノキシ)-2-キノリルオキシ基、2-(2,3-ジクロロフェノキシ)-6-キノリルオキシ基、3-(3,4-ジクロロフェノキシ)-7-キノリルオキシ基、4-(2,4-ジクロロフェノキシ)-5-キノリルオキシ基、2-(3,4,5-トリクロロフェノキシ)-6-キノリルオキシ基、2-(2,4,6-トリクロロフェノキシ)-5-キノリルオキシ基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-7-キノリルオキシ基等のキノリルオキシ基（キノリン環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）、ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、1～3個のフェニルC

10

20

30

1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、アミノ基（アミノ基上には、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい）、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）、フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし

40

50

くは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい)及びフェニルC 1～6アルキリデン基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい)からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0344】

フェニルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよいフェニルC 1～6アルコキシ基とC 1～6アルキル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシメチル基、2-フェニルエトキシメチル基、3-フェニルプロポキシメチル基、2-フェニルプロポキシメチル基、4-フェニルブトキシメチル基、5-フェニルペントキシメチル基、4-フェニルペントキシメチル基、6-フェニルヘキシルオキシメチル基、2-フルオロベンジルオキシメチル基、4-フルオロベンジルオキシメチル基、4-クロロベンジルオキシメチル基、3-クロロベンジルオキシメチル基、2-クロロベンジルオキシメチル基、3, 5-ジクロロベンジルオキシメチル基、3, 4-ジクロロベンジルオキシメチル基、2-(3-フルオロベンジルオキシ)エチル基、1-(4-フルオロベンジルオキシ)エチル基、3-[2-(2-フルオロフェニル)エトキシ]プロピル基、4-[2-(3-フルオロフェニル)エトキシ]ブチル基、5-[2-(4-フルオロフェニル)エトキシ]ペンチル基、6-(2-クロロベンジルオキシ)ヘキシル基、3-クロロベンジルオキシメチル基、2-(4-クロロベンジルオキシ)エチル基、1-(2-フルオロ-4-ブロモベンジルオキシ)エチル基、3-(4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシ)プロピル基、4-(2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシ)ブチル基、5-(3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシ)ペンチル基、6-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシ)ヘキシル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシメチル基、2-(4-イソプロピルベンジルオキシ)エチル基、1-(4-n-ブチルベンジルオキシ)エチル基、3-(4-メチルベンジルオキシ)プロピル基、4-(2-メチルベンジルオキシ)ブチル基、5-(3-メチルベンジルオキシ)ペンチル基、6-(2, 4-ジメチルベンジルオキシ)]ヘキシル基、2, 3-ジメチルベンジルオキシメチル基、4-メチルベンジルオキシメチル基、4-エチルベンジルオキシメチル基、3, 5-ジメチルベンジルオキシメチル基、4-イソプロピルベンジルオキシメチル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル基、2-(2, 6-ジメチルベンジルオキシ)エチル基、1-(3, 5-ジメチルベンジルオキシ)エチル基、3-(2, 5-ジメチルベンジルオキシ)プロピル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ)ブチル基、5-(3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシ)ペンチル基、6-(4-イソプロポキシベンジルオキシ)ヘキシル基、4-n-ブトキシベンジルオキシメチル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル基、2-(4-メトキシベンジルオキシ)エチル基、1-(2-メトキシベンジルオキシ)エチル基、3-(3-メトキシベンジルオキシ)プロピル基、4-(2, 4-ジメトキシベンジルオキシ)ブチル基、5-(2, 3-ジメトキシベンジルオキシ)ペンチル基、6-(2, 6-ジメトキシベンジルオキシ)ヘキシル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシメチル基、2-(2, 5-ジメトキシベンジルオキシ)エチル基、1-(2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ)エチル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオ

10

20

30

40

50

キシ) プロピル基、4-(2-イソプロポキシベンジルオキシ) ブチル基、5-(3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシ) ペンチル基、6-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) ヘキシル基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシメチル基、2-(4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジルオキシ) エチル基、1-[2-(2-クロロフェニル) エトキシ] メチル基、3-[2-(3-クロロフェニル) エトキシ] プロピル基、4-[2-(4-クロロフェニル) エトキシ] ブチル基、5-[2-トリフルオロメチルベンジルオキシ] ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ヘキシル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル基、2-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) プロピル基、4-[2-(2-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ブチル基、5-[2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ペンチル基、6-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ヘキシル基、[2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシ] メチル基、2-[2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシ] エチル基、1-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシ] エチル基、3-[3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ] プロピル基、4-[3-(3-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ] ブチル基、5-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ] ペンチル基、6-[3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ] ヘキシル基、[3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシ] メチル基、2-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシ] エチル基、1-[4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシ] エチル基、3-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシ] ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシ] ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペントキシ] ペンチル基、6-[6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシ] ヘキシル基、[6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシ] メチル基、2-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシ] エチル基等を挙げることができる。

【0345】

ピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC1~6アルコキシ置換C1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、例えば、1-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-フェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリフェノキシ-1-ピペリジル基、2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(3-フルオロフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-フルオロフェノキシ)-3-ピペリジル基、2-(2-クロロフェノキシ)-4-ピペリジル基、3-(3-クロロフェノキシ)-5-ピペリジル基、4-(4-クロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、5-(2-ブromoフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(3-ブromoフェノキシ)-3-ピペリジル基、4-(4-ブromoフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(2, 3-ジクロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(3, 4-ジクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(3, 4, 5-トリクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、6-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ)-1-ピペリジ

ル基、4-(2-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、5-(3-メチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(4-メチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2-エチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(3-エチルシフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-エチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-n-プロピルフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(4-n-ペンチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(3-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、3-(4-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(2-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-エトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-n-プロボキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-tert-ブトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ブトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(2, 3-ジメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ペンチルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-ベンジル-1-ピペリジル基、2, 4-ジベンジル-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリベンジル-1-ピペリジル基、2-(2-フルオロベンジル)-1-ピペリジル基、3-[2-(3-フルオロフェニル)エチル]-2-ピペリジル基、4-[1-(4-フルオロフェニル)エチル]-3-ピペリジル基、2-[3-(2-クロロフェニル)プロピル]-4-ピペリジル基、3-[4-(3-クロロフェニル)ブチル]-5-ピペリジル基、4-[5-(4-クロロフェニル)ペンチル]-2-ピペリジル基、5-(6-(2-ブロモフェニル)ヘキシル)-2-ピペリジル基、6-(3-ブロモベンジル)-3-ピペリジル基、4-(4-ブロモベンジル)-1-ピペリジル基、3-(2, 3-ジクロロベンジル)-2-ピペリジル基、4-(3, 4-ジクロロベンジル)-3-ピペリジル基、3-(2, 4-ジクロロベンジル)-4-ピペリジル基、2-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-3-ピペリジル基、6-(2, 4, 6-トリクロロベンジル)-2-ピペリジル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルベンジル)-1-ピペリジル基、5-[2-(3-メチルフェニル)エチル]-2-ピペリジル基、6-[3-(4-メチルフェニル)プロピル]-3-ピペリジル基、1-[4-(2-エチルフェニル)ブチル]-4-ピペリジル基、2-[5-(3-エチルフェニル)ペンチル]-1-ピペリジル基、3-[6-(4-エチルフェニル)ヘキシル]-2-ピペリジル基、4-(4-n-プロピルベンジル)-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルベンジル)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルベンジル)-3-ピペリジル基、1-(2-トリフルオロメチルベンジル)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-4-ピペリジル基、1-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-4-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメチルベンジル)-1-ピペリジル基、1-(3, 4, 5-トリメチルベンジル)-4-ピペリジル基、1-(4-n-ペンチルベンジル)-4-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルベンジル)-1-ピペリジル基、4-(

10

20

30

40

50

2-メトキシベンジル)-1-ピペリジル基、1-[2-(3-メトキシフェニル)エチル]-4-ピペリジル基、1-[1-(4-メトキシフェニル)エチル]-4-ピペリジル基、2-[3-(2-エトキシフェニル)プロピル]-3-ピペリジル基、3-[4-(3-エトキシフェニル)ブチル]-4-ピペリジル基、4-[5-(4-エトキシフェニル)ペンチル]-3-ピペリジル基、3-[6-(4-n-プロボキシフェニル)ヘキシル]-2-ピペリジル基、2-(4-tert-ブトキシベンジル)-1-ピペリジル基、1-(4-n-ブトキシベンジル)-2-ピペリジル基、2-(2-トリフルオロメトキシベンジル)-3-ピペリジル基、3-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-4-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペリジル基、3-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-2-ピペリジル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペリジル基、1-(2, 3-ジメトキシベンジル)-4-ピペリジル基、4-(3, 4, 5-トリメトキシベンジル)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ペンチルオキシベンジル)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルオキシベンジル)-1-ピペリジル基、4-ベンジル-3-フェノキシ-1-ピペリジル基、4-ベンジルオキシメチル-1-ピペリジル基、2, 4-ジベンジルオキシメチル-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリベンジルオキシメチル-1-ピペリジル基、2-[(2-フルオロベンジルオキシ)メチル]-1-ピペリジル基、3-{2-[2-(3-フルオロフェニル)エトキシ]エチル}-2-ピペリジル基、4-{1-[1-(4-フルオロフェニル)エチル]エトキシ}-3-ピペリジル基、2-{3-[3-(2-クロロフェニル)プロボキシ]プロピル}-4-ピペリジル基、3-{4-[4-(3-クロロフェニル)ブトキシ]ブチル}-5-ピペリジル基、4-{5-[5-(4-クロロフェニル)ペンチルオキシ]ペンチル}-2-ピペリジル基、5-{6-[6-(2-ブロモフェニル)ヘキシルオキシ]-2-ピペリジル基、6-(3-ブロモベンジルオキシメチル)-3-ピペリジル基、4-(4-ブロモベンジルオキシメチル)-1-ピペリジル基、3-(2, 3-ジクロロベンジルオキシメチル)-2-ピペリジル基、4-(3, 4-ジクロロベンジルオキシメチル)-3-ピペリジル基、3-(2, 4-ジクロロベンジルオキシメチル)-4-ピペリジル基、2-(3, 4, 5-トリクロロベンジルオキシメチル)-3-ピペリジル基、6-(2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシメチル)-2-ピペリジル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシメチル)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルベンジルオキシメチル)-1-ピペリジル基、5-{2-[2-(3-メチルフェニル)エトキシ]エチル}-2-ピペリジル基、6-{3-[3-(4-メチルフェニル)プロボキシ]プロピル}-3-ピペリジル基、1-{4-[4-(2-エチルフェニル)ブトキシ]ブチル}-4-ピペリジル基、2-{5-[5-(3-エチルフェニル)ペンチルオキシ]ペンチル}-1-ピペリジル基、3-{6-[6-(4-エチルフェニル)ヘキシルオキシ]ヘキシル}-2-ピペリジル基、4-(4-n-プロピルベンジルオキシメチル)-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルベンジルオキシメチル)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルベンジルオキシメチル)-3-ピペリジル基、1-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシメチル)-4-ピペリジル基、1-(3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシメチル)-4-ピペリジル基、4-(2, 3-ジメチルベンジルオキシメチル)-1-ピペリジル基、1-(3, 4, 5-トリメチルベンジルオキシメチル)-4-ピペリジル基、1-(4-n-ペンチルベンジルオキシメチル)-4-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルベンジルオキシメチル)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシベンジルオキシメチル)-1-ピペリジル基、1-{2-[2-(3-メトキシフェニル)エトキシ]エチル}-4-ピペリジル基、1-{1-[1-(4-メトキシフェニル)エトキシ]エチル}-4-ピペリジル基、2-{3-[3-(2-エトキシフェニル)プロボキシ]プロピル}-3-ピペリジル基、3-{4-[4-(3-エトキシフェニル)ブトキシ]ブチル}-4-ピペリジル基、4-{5-[5-(4-エトキシ

10

20

30

40

50

シフェニル) ペンチルオキシ] ペンチル} - 3-ピペリジル基、3- {6- [6- (4-n-プロポキシフェニル) ヘキシルオキシ] ヘキシル} - 2-ピペリジル基、2- (4-tert-ブトキシベンジルオキシメチル) - 1-ピペリジル基、1- (4-n-ブトキシベンジルオキシメチル) - 2-ピペリジル基、2- (2-トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル) - 3-ピペリジル基、3- (3-トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル) - 4-ピペリジル基、4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル) -

1-ピペリジル基、3- (2-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシメチル) - 2-ピペリジル基、2- (4-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシメチル) - 1-ピペリジル基、1- (2, 3-ジメトキシベンジルオキシメチル) - 4-ピペリジル基、4- (3, 4, 5-トリメトキシベンジルオキシメチル) - 1-ピペリジル基、4- (4-n-ペンチルオキシベンジルオキシメチル) - 1-ピペリジル基、4- (4-n-ヘキシルオキシベンジルオキシメチル) - 1-ピペリジル基、4-ベンジルオキシメチル-3-フェノキシ-1-ピペリジル基、4-ベンジル-3-フェノキシ-1-ピペリジル基等のピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)、フェニルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) 及びフェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい置換していてもよい] を挙げることができる。

【0346】

ピリジルオキシ基 (ピリジン環上には、ピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、2-ピリジルオキシ基、3-ピリジルオキシ基、4-ピリジルオキシ基、3- (1-ピペリジル) - 2-ピリジルオキシ基、2- (4-ピペリジル) - 3-ピリジルオキシ基、4- (2-ピペリジル) - 3-ピリジルオキシ基、5- (3-ピペリジル) - 2-ピリジルオキシ基、2, 4-ジ (1-ピペリジル) - 3-ピリジルオキシ基、2- (1-ピペリジル) - 4- [2- (2-フルオロフェノキシ) - 1-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、2, 4, 6-トリ (1-ピペリジル) - 3-ピリジルオキシ基、2- (4-フェノキシ-1-ピペリジル) - 3-ピリジルオキシ基、2- (2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル) - 3-ピリジルオキシ基、3- (2, 4, 6-トリフェノキシ-1-ピペリジル) - 4-ピリジルオキシ基、4- [2- (2-フルオロフェノキシ) - 1-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、5- [

10

20

30

40

50

3- (3-フルオロフェノキシ) - 2-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、6- [4-
 (4-フルオロフェノキシ) - 3-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、2- [2-
 (2-クロロフェノキシ) - 4-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、3- [3- (3-
 クロロフェノキシ) - 5-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、4- [4- (4-ク
 ロロフェノキシ) - 2-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、5- [5- (2-ブロモ
 フェノキシ) - 2-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、2- [6- (3-ブロモフェ
 ノキシ) - 3-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、2- [4- (4-ブロモフェノキ
 シ) - 1-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、3- [3- (2, 3-ジクロロフェノ
 キシ) - 2-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、3- [4- (3, 4-ジクロロフェ
 ノキシ) - 3-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、4- [3- (2, 4-ジクロロフ
 ェノキシ) - 4-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、5- [2- (3, 4, 5-トリ
 クロロフェノキシ) - 3-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、6- [6- (2, 4,
 6-トリクロロフェノキシ) - 2-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、2- [3- (2,
 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ) - 1-ピペリジル] - 3-ピリジルオ
 キシ基、4- [4- (2-メチルフェノキシ) - 1-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ
 基、3- [5- (3-メチルフェノキシ) - 2-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、
 5- [6- (4-メチルフェノキシ) - 3-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、2-
 [1- (2-エチルフェノキシ) - 4-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、2- [2-
 (3-エチルフェノキシ) - 1-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、3- [3- (4-
 エチルフェノキシ) - 2-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、4- [4- (4-
 n-プロピルフェノキシ) - 3-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、5- [5- (4-
 tert-ブチルフェノキシ) - 4-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、6- [2-
 (4-n-ブチルフェノキシ) - 3-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、2- [1-
 (2-トリフルオロメチルフェノキシ) - 2-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、
 3- [2- (3-トリフルオロメチルフェノキシ) - 1-ピペリジル] - 4-ピリジルオ
 キシ基、4- [3- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) - 1-ピペリジル] - 2-ピ
 リジルオキシ基、5- [1- (2-ペンタフルオロエチルフェノキシ) - 4-ピペリジル
] - 3-ピリジルオキシ基、6- [1- (3-ペンタフルオロエチルフェノキシ) - 4-
 ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、2- [4- (2, 3-ジメチルフェノキシ) - 1-
 ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、3- [1- (3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)
 - 4-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、4- [1- (4-n-ペンチルフェノ
 キシ) - 4-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、5- [4- (4-n-ヘキシルフェ
 ノキシ) - 1-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、6- [4- (2-メトキシフェノ
 キシ) - 1-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、2- [1- (3-メトキシフェノキ
 シ) - 4-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、3- [1- (4-メトキシフェノキシ)
 - 4-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、4- [2- (2-エトキシフェノキシ)
 - 3-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、5- [3- (3-エトキシフェノキシ) -
 4-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、2- [4- (4-エトキシフェノキシ) - 5-
 ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、2- [3- (4-n-プロポキシフェノキシ)
 - 2-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、3- [2- (4-tert-ブトキシフェ
 ノキシ) - 1-ピペリジル] - 4-ピリジルオキシ基、4- [1- (4-n-ブトキシフ
 ェノキシ) - 2-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、5- [2- (2-トリフルオロ
 メトキシフェノキシ) - 3-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、6- [3- (3-トリ
 フルオロメトキシフェノキシ) - 4-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基、6- [4-
 (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) - 3-ピペリジル] - 2-ピリジルオキシ基
 、2- [3- (2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) - 2-ピペリジル] - 3-ピリ
 ジルオキシ基、3- [4- (4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) - 1-ピペリジル
] - 2-ピリジルオキシ基、4- [1- (2, 3-ジメトキシフェノキシ) - 4-ピペリ
 ジル] - 2-ピリジルオキシ基、5- [4- (3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ) -
 1-ピペリジル] - 3-ピリジルオキシ基、6- [4- (4-n-ペンチルオキシフェノ

10

20

30

40

50

キシ) - 1 - ピペリジル] - 3 - ピリジルオキシ基、5 - [4 - (4 - n - ヘキシルオキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 3 - ピリジルオキシ基、2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシメチル) - 1 - ピペリジル] - 5 - ピリジルオキシ基、2 - (4 - トリフルオロメトキシベンジル - 1 - ピペリジル) - 5 - ピリジルオキシ基、2 - [4 - (4 - クロロベンジル) - 1 - ピペラジニル] - 5 - ピリジルオキシ基、2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1 - ピペラジニル] - 5 - ピリジルオキシ基、2 - [4 - (4 - クロロベンジルオキシメチル) - 1 - ピペリジル] - 5 - ピリジルオキシ基、4 - (4 - フルオロベンジル - 1 - ピペラジニル) - 6 - ピリジルオキシ基、4 - フェノキシ - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル) - 1 - ピペリジル] - 2 - ピリジルオキシ基等のピリジルオキシ基 (ピリジン環上には、前記例示のピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい)、フェニル C 1 ~ 6 アルコキシ置換 C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい) 及びフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい] 及び前記例示のピペラジニル基 [ピペラジン環上には、1 ~ 3 個のフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい) が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい) を挙げることができる。

【0347】

1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリルオキシ基 (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン環上には、オキシ基、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 及びフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) としては、例えば、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - (1 -, 2 -, 3 -, 4 -, 5 -, 6 -, 7 - 又は 8 -) キノリルオキシ基、1 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 2 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - トリフルオロメトキシベンジル) - 2 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - クロロベンジル) - 2 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - トリフルオロメトキシベンジル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - クロロベンジル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - クロロフェニル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (3, 4 - ジクロロベンジル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - [3, 4 - ジ (トリフルオロメトキシ) ベンジル] - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 6 - キノリルオキシ基、1 - (4 - クロロフェニル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 5 - キノリルオキシ基、1 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 5 - キノリルオキシ基、1 - (4 -

10

20

30

40

50

トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリルオキシ基、1-(4-クロロベンジル) - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリルオキシ基、1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリルオキシ基、1-(4-トリフルオロメチルベンジル) - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリルオキシ基、1-[3, 4, 5-トリ(トリフルオロメチル)ベンジル] - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルオキシ基、1-ベンジル-4-フェニル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルオキシ基、1-フェニル-4, 6-ジベンジル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリルオキシ基、4-フェニル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリルオキシ基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルオキシ基[1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、オキソ基、前記例示のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)及び前記例示のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい]を挙げることができる。

10

【0348】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基、4-オキソ-7-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基、1, 4-ジオキソ-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基、1, 2, 4-トリオキソ-5-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、1~3個のオキソ基が置換していてもよい)を挙げることができる。

20

【0349】

2H-クロメニオキシル基(2H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、2H-クロメニオキシル基、2-オキソ-2H-クロメニオキシル基等の2H-クロメニオキシル基(2H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)を挙げることができる。

30

【0350】

ナフチルオキシ基(ナフタレン環上には、少なくとも1個のピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、(1-又は2-)ナフチルオキシ基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ナフチルオキシ基、5-(1-ピペリジル)-2-ナフチルオキシ基、2-(4-ピペリジル)-3-ナフチルオキシ基、4-(2-ピペリジル)-1-ナフチルオキシ基、5-(3-ピペリジル)-2-ナフチルオキシ基、5, 6-ジ(1-ピペリジル)-1-ナフチルオキシ基、7-(1-ピペリジル)-6-[2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-1-ナフチルオキシ基、5, 6, 7-トリ(1-ピペリジル)-2-ナフチルオキシ基、6-(4-フェノキシ-1-ピペリジル)-3-ナフチルオキシ基、2-(2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル)-4-ナフチルオキシ基、3-(2, 4, 6-トリフェノキシ-1-ピペリジル)-5-ナフチルオキシ基、4-[2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-6-ナフチルオキシ基、4-[3-(3-フルオロフェノキシ)-2-ピペリジル]-2-ナフチルオキシ基、3-[4-(4-フルオロフェノキシ)-3-ピペリジル]-1-ナフチルオキシ基、5-[2-(2-クロロフェノキシ)-4-ピペリジル]-2-ナフチルオキシ基、6-[3-(3-クロロフェノキシ)-5-

40

50

ピペリジル] - 1 - ナフチルオキシ基、4 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、5 - [5 - (2 - ブロモフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 3 - ナフチルオキシ基、6 - [6 - (3 - ブロモフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、6 - [4 - (4 - ブロモフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、3 - [3 - (2, 3 - ジクロロフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、6 - [4 - (3, 4 - ジクロロフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 1 - ナフチルオキシ基、4 - [3 - (2, 4 - ジクロロフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、5 - [2 - (3, 4, 5 - トリクロロフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、6 - [6 - (2, 4, 6 - トリクロロフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 3 - ナフチルオキシ基、2 - [3 - (2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 3 - ナフチルオキシ基、4 - [4 - (2 - メチルフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、3 - [5 - (3 - メチルフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、5 - [6 - (4 - メチルフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 3 - ナフチルオキシ基、6 - [1 - (2 - エチルフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、2 - [2 - (3 - エチルシフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 3 - ナフチルオキシ基、3 - [3 - (4 - エチルフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、4 - [4 - (4 - n - プロピルフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、5 - [5 - (4 - tert - ブチルフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 1 - ナフチルオキシ基、6 - [2 - (4 - n - ブチルフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、2 - [1 - (2 - トリフルオロメチルフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、3 - [2 - (3 - トリフルオロメチルフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、4 - [3 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、5 - [1 - (2 - ペンタフルオロエチルフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 3 - ナフチルオキシ基、6 - [1 - (3 - ペンタフルオロエチルフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、2 - [4 - (2, 3 - ジメチルフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 1 - ナフチルオキシ基、3 - [1 - (3, 4, 5 - トリメチルフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、4 - [1 - (4 - n - ペンチルフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 1 - ナフチルオキシ基、5 - [4 - (4 - n - ヘキシルフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、6 - [4 - (2 - メトキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、2 - [1 - (3 - メトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、3 - [1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、4 - [2 - (2 - エトキシフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、5 - [3 - (3 - エトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 1 - ナフチルオキシ基、6 - [4 - (4 - エトキシフェノキシ) - 5 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、2 - [3 - (4 - n - プロポキシフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、3 - [2 - (4 - tert - ブトキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 4 - ナフチルオキシ基、4 - [1 - (4 - n - ブトキシフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、5 - [2 - (2 - トリフルオロメトキシフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、6 - [3 - (3 - トリフルオロメトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、6 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) - 3 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、2 - [3 - (2 - ペンタフルオロエトキシフェノキシ) - 2 - ピペリジル] - 3 - ナフチルオキシ基、3 - [4 - (4 - ペンタフルオロエトキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、4 - [1 - (2, 3 - ジメトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル] - 2 - ナフチルオキシ基、5 - [4 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 1 - ナフチルオキシ基、6 - [4 - (4 - n - ペンチルオキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 3 - ナフチルオキシ基、5 - [4 - (4 - n - ヘキシルオキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル] - 1 - ナフチルオキシ基等のナフチルオキシ基 (ナフトレン環上には、前記例示の1~3個のピペリジル基 [ピペリジン環上には、1~3個のフェノキシ基 (フェニル環

10

20

30

40

50

上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい) が置換していてもよい) を挙げることができる。

【0351】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリルオキシ基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、C 1～6アルコシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル(1-、2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-)キノリルオキシ基、2-tert-ブトキシカルボニル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-イソキノリルオキシ基、2-(4-クロロベンジル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-イソキノリルオキシ基、2-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-イソキノリルオキシ基、2-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-イソキノリルオキシ基、2-エトキシカルボニル-4-ベンジル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-7-イソキノリルオキシ基、1, 4, 6-トリベンジル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-8-イソキノリルオキシ基、1-[3, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)ベンジル]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-イソキノリルオキシ基、1-[3, 4, 5-トリ(トリフルオロメチル)ベンジル]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-イソキノリルオキシ基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリルオキシ基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、後記例示のC 1～6アルコシカルボニル基及び前記例示のフェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) を挙げることができる。

【0352】

フェニル基〔フェニル環上には、少なくとも1個のピペリジル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい) が置換しているものとする。〕としては、例えば、4-(1-ピペリジル)フェニル基、3-(2-ピペリジル)フェニル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]フェニル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]フェニル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)-1-ピペリジル]フェニル基、4-{4-[3, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]-1-ピペリジル]}フェニル基、4-{4-(3, 4, 5-トリ(トリフルオロメチル)フェノキシ)-1-ピペリジル]}フェニル基、4-[4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]フェニル基、4-[4-(2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]フェニル基、2-(2, 4, 5-トリフェノキシ)-1-ピペリジル]フェニル基、3-(1, 2-ジフェノキシ)-4-ピペリジル]フェニル基、2, 4-ジ(4-ピペリジル)フェニル基、2, 4, 6-トリ(3-ピペリジル)フェニル基等のフェニル基〔フェニル環上には、1～3個の前記例示のピペリジル基(ピペリジン環上には、1～3個のフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい) が置換していてもよい) が置換しているものとする。〕を挙げることができる。

【0353】

フェニル C 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、少なくとも 1 個のピペリジル基 (ピペリジン環上には、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] が置換しているものとする) 及び基 $-NR^{24}R^{25}$ (R^{24} は、水素原子又は C 1～6 アルキル基を示す。 R^{25} は、フェニル C 2～6 アルケニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] を示す。) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換しているものとする] としては、例えば、4- (1-ピペリジル) ベンジル基、2, 4-ジ (4-ピペリジル) ベンジル基、2, 4, 6-トリ (2-ピペリジル) ベンジル基、4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -1-ピペリジル] ベンジル基、4- [N-メチル-N- (4-トリフルオロメトキシシンナミル) アミノ] ベンジル基、4- [N- (4-トリフルオロメトキシシンナミル) アミノ] ベンジル基、4- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) -1-ピペリジル] ベンジル基、4- [4- (4-クロロフェノキシ) -1-ピペリジル] ベンジル基、4- {4- [3, 4-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ] -1-ピペリジル} ベンジル基、4- {4- [2, 4, 6-トリ (トリフルオロメチル) フェノキシ] -1-ピペリジル} ベンジル基、4- [4- (2, 4-ジクロロフェノキシ) -1-ピペリジル] ベンジル基、4- [4- (2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ) -1-ピペリジル] ベンジル基、3- [2, 4-ジフェノキシ-3-ピペリジル] ベンジル基、2- [1, 2, 3-トリフェノキシ-4-ピペリジル] ベンジル基、4- [N-メチル-N- (4-トリフルオロメトキシシンナミル) アミノ] -3- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -1-ピペリジル] ベンジル基等の前記例示のフェニル C 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、前記例示の 1～3 個のピペリジル基 (ピペリジン環上には、1～3 個のフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していてもよい] が置換してしているものとする) 及び基 $-NR^{24}R^{25}$ (R^{24} は、水素原子又は C 1～6 アルキル基を示す。 R^{25} は、後記例示のフェニル C 2～6 アルケニル基 [無置換又はハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基から選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換されたフェニル基 1 又は 2 個と炭素数 2 から 6 で二重結合を 1～3 個有するアルケニル基から構成される基] を示す。) からなる群より選ばれた基が 1～3 個置換しているものとする] を挙げることができる。

【0354】

ピペリジル C 1～6 アルキル基 (ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) が置換しているものとする。) としては、例えば、(4-フェニル-1-ピペリジル) メチル基、2- (3-フェニル-2-ピペリジル) エチル基、3- (2-フェニル-3-ピペリジル) プロピル基、4- (1-フェニル-4-ピペリジル) ブチル基、5- (4-フェニル-1-ピペリジル) ペンチル基、6- (1-フェニル-2-ピペリジル) ヘキシル基、1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -4-ピペリジルメチル基、1- (4-トリフルオロメチルフェニル) -4-ピペリジルメチル基、1- (3-メトキシフェニル) -4-ピペリジルメチル基、1- (2-メチルフェニル) -4-ピペリジルメチル基、1- (4-クロロフェニル) -4-ピペリジルメチル基、1- [3, 4-ジ (トリフルオロメトキシ) フェニル] -4-ピペリジルメチル基、1- [2, 4, 6-トリ (トリフルオロメチル) フェニル] -4-ピペリジルメチル基、1- (3, 4-ジメチルフェニル) -4-ピペリジルメチル基、1- (2, 4, 6-トリメトキシフェニル) -4-ピペリジルメチル基、1- (3, 4-ジクロロフェニル) -4-ピペリジルメチル基、1- (2, 4, 6-トリブromoフェニル) -4-ピペリジルメチル基、(

10

20

30

40

50

1, 2, 6-トリフェニル-4-ピペリジル)メチル基、(2, 4-ジフェニル-1-ピペリジル)メチル基等のピペリジルC 1~6アルキル基(ピペリジン環上には、1~3個の前記例示のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換しているものとする。)を挙げることができる。

【0355】

ピペラジニルC 1~6アルキル基(ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、1-ピペラジニルメチル基、1-(2-ピペラジニル)エチル基、2-(1-ピペラジニル)エチル基、3-(1-ピペラジニル)プロピル基、2-(1-ピペラジニル)プロピル基、4-(2-ピペラジニル)ブチル基、5-(2-ピペラジニル)ペンチル基、4-(1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(1-ピペラジニル)ヘキシル基、2-メチル-3-(1-ピペラジニル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(1-ピペラジニル)エチル基、(4-フェニル-1-ピペラジニル)メチル基、(2, 4-ジフェニル-1-ピペラジニル)メチル基、(2, 4, 5-トリフェニル-1-ピペラジニル)メチル基、[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、[4-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、[4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、[2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル-1-ピペラジニル]メチル基、[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル-1-ピペラジニル]メチル基等のピペラジニルC 1~6アルキル基(ピペラジン環上には、1~3個の前記例示のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0356】

ピペリジルC 1~6アルキル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、1-ピペリジルメチル基、2-(2-ピペリジル)エチル基、3-(3-ピペリジル)プロピル基、4-(4-ピペリジル)ブチル基、5-(1-ピペリジル)ペンチル基、6-(2-ピペリジル)ヘキシル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-4-ピペリジルメチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-4-ピペリジルメチル基、2-メチル-3-(ピペリジン-1-イル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(ピペリジン-1-イル)エチル基、1-(4-クロロフェノキシ)-4-ピペリジルメチル基、1-[3, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]-4-ピペリジルメチル基、1-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]-4-ピペリジルメチル基、1-(3, 4-ジクロロフェノキシ)-4-ピペリジルメチル基、1-(2, 4, 6-トリプロモフェノキシ)-4-ピペリジルメチル基、(1, 2, 6-トリフェノキシ-4-ピペリジル)メチル基、(2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル)メチル基等のピペリジルC 1~6アルキル基(ピペリジン環上には、1~3個の前記例示のフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]が置換しているものとする。)を挙げることができる。

【0357】

チアゾリル基[チアゾール環上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、

10

20

30

40

50

ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、ピペラジニルC 1～6 アルキル基(ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)及びピペリジルC 1～6 アルキル基(ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、(2-、4-又は5-)チアゾリル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-5-チアゾリル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]メチル-5-チアゾリル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]メチル-5-チアゾリル基、2-[2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル]-5-チアゾリル基、2-{4-[2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル]-1-ピペラジニル}メチル-5-チアゾリル基、2-{4-[2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]-1-ピペリジル}メチル-5-チアゾリル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-チアゾリル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]メチル-5-チアゾリル基、2-[4-(4-トリフルオロチルフェノキシ)-1-ピペリジル]メチル-5-チアゾリル基、2-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)フェニル]-5-チアゾリル基、2-{4-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)フェニル]-1-ピペラジニル}メチル-5-チアゾリル基、2-{4-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-ピペリジル}メチル-5-チアゾリル基、2-(4-クロロフェニル)-5-チアゾリル基、2-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]メチル-5-チアゾリル基、2-[4-(2-クロロフェノキシ)-1-ピペリジル]メチル-5-チアゾリル基、2-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-チアゾリル基、2-[4-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-ピペラジニル]メチル-5-チアゾリル基、2-[4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]メチル-5-チアゾリル基、2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-5-チアゾリル基、2-[4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1-ピペラジニル]メチル-5-チアゾリル基、2-[4-(2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]メチル-5-チアゾリル基、2-(2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル)メチル-5-チアゾリル基、5-(2, 4, 5-トリフェノキシ-1-ピペリジル)メチル-2-チアゾリル基、5-(2, 4-ジフェニル-1-ピペラジニル)メチル-2-チアゾリル基、2-(2, 4, 5-トリフェニル-1-ピペラジニル)メチル-4-チアゾリル基、4-(1-ピペリジル)-2-(1-ピペラジニル)-5-チアゾリル基等のチアゾリル基[チアゾール環上には、前記例示のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい)、前記例示のピペラジニルC 1～6 アルキル基(ピペラジン環上には、1～3個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]が置換していてもよい)及び前記例示のピペリジルC 1～6 アルキル基(ピペリジン環上には、1～3個のフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基1～2個が置換していてもよい]を挙げることができる。

【0358】

ベンゾオキサゾリルオキシ基（ベンゾオキサゾール環上には、ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする。）としては、例えば、2－〔4－（4－トリフルオロメトキシベンジル）－1－ピペラジニル〕－6－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－フェニル－5－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－（4－クロロフェニル）－5－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－〔4－（4－トリフルオロメチルベンジル）－1－ピペラジニル〕－6－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－〔4－（4－クロロベンジル）－1－ピペラジニル〕－6－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－〔4－〔2，4，6－トリ（トリフルオロメトキシ）ベンジル〕－1－ピペラジニル〕－6－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－〔4－〔2，4，6－トリ（トリフルオロメチル）ベンジル〕－1－ピペラジニル〕－6－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－〔4－（2，4－ジクロロベンジル）－1－ピペラジニル〕－6－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－〔4－（2，4，6－トリフルオロベンジル）－1－ピペラジニル〕－6－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－（4－ベンジル－1－ピペラジニル）－4－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－（2，4－ジベンジル－1－ピペラジニル）－7－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－（2，4，6－トリベンジル－1－ピペラジニル）－6－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－（4－トリフルオロメトキシフェニル）－5－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－（4－トリフルオロメチルフェニル）－5－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－（2，4－ジプロモフェニル）－5－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－（2，4，6－トリクロロフェニル）－5－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－〔2，4，6－トリ（トリフルオロメトキシ）フェニル〕－5－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2－〔2，4－ジ（トリフルオロメチル）フェニル〕－5－ベンゾオキサゾリルオキシ基、4－フェニル－5－（1－ピペラジニル）－2－ベンゾオキサゾリルオキシ基、2，4，5－トリフェニル－7－ベンゾオキサゾリルオキシ基等のベンゾオキサゾリルオキシ基（ベンゾオキサゾール環上には、前記例示のピペラジニル基〔ピペラジン環上には、1～3個のフェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕及び前記例示のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）からなる群より選ばれた基が1～3個置換しているものとする。）を挙げることができる。

【0359】

ベンゾイミダゾリルオキシ基（ベンゾイミダゾール環上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群から選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、（1－、2－、4－、5－、6－又は7－）ベンゾイミダゾリルオキシ基、2－フェニル－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、1－メチル－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、1－メチル－2－フェニル－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、2－（4－クロロフェニル）－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、1－メチル－2－（4－クロロフェニル）－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、1，2－ジフェニル－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、1，4－ジメチル－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、1－メチル－2，6－ジフェニル－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、2－（4－トリフルオロメチルフェニル）－5－ベンゾイミダゾリルオキシ基、1－メチル－2－（

10

20

30

40

50

4-トリフルオロメトキシフェニル) - 5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、1, 2, 7-トリフェニル-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、1, 2, 4-トリメチル-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、1-エチル-2, 6-ジフェニル-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、2-[2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル]-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、1-メチル-2-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル]-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、2-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、2-(3-ブロモフェニル)-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基、2-(2-ヨードフェニル)-5-ベンゾイミダゾリルオキシ基等のベンゾイミダゾリルオキシ基(ベンゾイミダゾール環上には、前記例示のC 1~6アルキル基及び前記例示のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]からなる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0360】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、(m-1)アミノ基[アミノ基上には、C 1~6アルキル基、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びフェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]及び(m-2)フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]としては、例えば、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメイルベンジル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-クロロフェニル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-(4-クロロフェニル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-クロロベンジル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-(4-クロロシフェノキシ)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-{N-メチル-N-[2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル]アミノ}-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-{N-メチル-N-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)ベンジル]アミノ}-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-[2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-{N-メチル-N-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ}-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-{N-メチル-N-[2, 4-ジ(トリフルオロメチル)ベンジル]アミノ}-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-[2, 4, 6-トリ(トリフルオ

10

20

30

40

50

ロメチル) フェノキシ] - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7- [N-メチル-N-(2, 4-ジブプロモフェニル) アミノ] - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7- [N-メチル-N-(2, 3-ジヨードベンジル) アミノ] - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-(2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ) - 1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-アミノ-6-フェノキシ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、4, 5, 6-トリフェノキシ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-7-イソキノリル基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、後記記載のアミノ基 [アミノ基上には、C 1~6アルキル基、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) 及びフェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい] 及び前記記載のフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基のが1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

10

【0361】

20

フェニル基が2個置換したC 1~6アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、例えば、1, 1-ジフェニルメトキシ基、1, 2-ジフェニルエトキシ基、3, 3-ジフェニルプロポキシ基、3, 4-ジフェニルブトキシ基、3, 5-ジフェニルペンチルオキシ基、4, 6-ジフェニルヘキシルオキシ基、1, 1-ジ(4-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシ基、1-(2-フルオロフェニル)-1-(3-フルオロフェニル)メトキシ基、1-(4-フルオロフェニル)-1-(2-クロロフェニル)メトキシ基、1-(3-クロロフェニル)-1-(4-クロロフェニル)メトキシ基、1-(2-ブプロモフェニル)-1-(3-ブプロモフェニル)メトキシ基、1-(4-ブプロモフェニル)-2-(2-ヨードフェニル)エトキシ基、3-(3-ヨードフェニル)-3-(4-ヨードフェニル)プロポキシ基、1-(2, 3-ジフルオロフェニル)-1-(3, 4-ジフルオロフェニル)メトキシ基、4-(3, 5-ジフルオロフェニル)-4-(2, 4-ジフルオロフェニル)ブトキシ基、5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-5-(2, 3-ジクロロフェニル)ペンチルオキシ基、6-(3, 4-ジクロロフェニル)-6-(3, 5-ジクロロフェニル)ヘキシルオキシ基、1-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-(2, 6-ジクロロフェニル)メトキシ基、1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)メトキシ基、1-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-1-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)メトキシ基、1-(4-n-ブチルフェニル)-1-(2, 4-ジメチルフェニル)メトキシ基、1-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-1-(4-n-ブトキシフェニル)メトキシ基、1-(2, 4-ジメトキシフェニル)-1-(2, 3-ジメトキシフェニル)メトキシ基、1-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)-1-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)メトキシ基、1-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-1-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシ基、1-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-1-(4-ブプロモ-3-トリフルオロメチルフェニル)メトキシ基、1-(2-メチルフェニル)-1-(3-メチルフェニル)メトキシ基、1-(2-ペンタフルオロエチルフェニル)-1-(3-ペンタフルオロエチルフェニル)メトキシ基、1-(2-イソプロピルフェニル)-1-(2-tert-ブチルフェニル)メトキシ基、1-(2-sec-ブチルフェニル)-1-(2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル

30

40

50

メトキシ基、1-(4-ペンチルフェニル)-1-(4-ヘキシルフェニル)メトキシ基、1-(2-メトキシフェニル)-1-(2,6-ジメトキシフェニル)メトキシ基、1-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)-1-(イソプロポキシフェニル)メトキシ基、1-(2-tert-ブトキシフェニル)-1-(2-sec-ブトキシフェニル)メトキシ基、1-(2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル)-1-(4-n-ペントキシフェニル)メトキシ基、1,1-ジ(4-n-ヘキシルオキシフェニル)メトキシ基等のフェニル基が2個置換したC1~6アルコキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

【0362】

ピペリジル基(ピペリジン環上には、(n-1)フェニル基[フェニル環上には、少なくとも1個の基-NR^{26'}R^{27'}(R^{26'}は、水素原子又はC1~6アルキル基を示す。R^{27'}は、フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい])を示す。)が置換しているものとする]、(n-2)基-W₁NR^{28'}R^{29'}[W₁はC1~6アルキレン基を示す。R^{28'}は、水素原子又はC1~6アルキル基を示す。R^{29'}は、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。]及び(n-3)フェニル基が2個置換したC1~6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、(1-, 2-, 3-又は4-)ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ]フェニル-1-ピペリジル基、4-[N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノメチル]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノメチル]-1-ピペリジル基、4-[N-エチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノメチル]-1-ピペリジル基、4-[1,1-ジ(4-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシ]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]フェニル-1-ピペリジル基、4-[N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノメチル]-1-ピペリジル基、4-{N-メチル-N-[2,4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル]アミノメチル}-1-ピペリジル基、4-{N-エチル-N-[2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル]アミノメチル}-1-ピペリジル基、4-[1,1-ジ(4-トリフルオロメチルフェニル)メトキシ]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(4-クロロフェニル)アミノ]フェニル-1-ピペリジル基、4-[N-(2,4-ジブromoフェニル)アミノメチル]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)アミノメチル]-1-ピペリジル基、4-[N-エチル-N-(4-クロロフェニル)アミノメチル]-1-ピペリジル基、4-[1,1-ジ(4-クロロフェニル)メトキシ]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(2,4-ジブromoフェニル)アミノ]フェニル-1-ピペリジル基、4-[1,1-ジ(2,4-ジブromoフェニル)メトキシ]-1-ピペリジル基、4-[N-メチル-N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)アミノ]フェニル-1-ピペリジル基、4-[1,1-ジ(2,4,6-トリフルオロフェニル)メトキシ]-1-ピペリジル基、4-{N-メチル-N-[2,4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ}フェニル-1-ピペリジル基、4-{N-メチル-N-[2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル]アミノ}フェニル-1-ピペリジル基、4-{1-[2,4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル]-1-[2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル]メトキシ}-1-ピペリジル基、4-[N-(4-トリフルオロメトキシフェニル

20

30

40

50

）アミノメチル〕－３－〔Ｎ－（４－トリフルオロメチルフェニル）アミノメチル〕－１－ピペリジル基、３，４，６－トリ（１，１－ジフェニルメトキシ）－１－ピペリジル基等のピペリジル基（ピペリジン環上には、フェニル基〔フェニル環上には、１～３個の基－ $\text{NRNR}^{26'}$ $\text{R}^{27'}$ （ $\text{R}^{26'}$ は、水素原子又はＣ１～６アルキル基を示す。 $\text{R}^{27'}$ は、前記例示のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基が１～５個、好ましくは１～３個置換していてもよい〕を示す。）が置換しているものとする。〕、基－ $\text{W}_1\text{NR}^{28'}$ $\text{R}^{29'}$ 〔 W_1 はＣ１～６アルキレン基を示す。 $\text{R}^{28'}$ は、水素原子又は前記例示のＣ１～６アルキル基を示す。 $\text{R}^{29'}$ は、前記例示のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基が１～５個、好ましくは１～３個置換していてもよい）を示す。〕及び前記例示のフェニル基が２個置換したＣ１～６アルコキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基が１～５個、好ましくは１～３個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が１～３個置換していてもよい）を挙げることができる。

【０３６３】

フェニル基が２個置換したＣ１～６アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕としては、例えば、１，１－ジフェニルメチル基、１，２－ジフェニルエチル基、３，３－ジフェニルプロピル基、３，４－ジフェニルチル基、３，５－ジフェニルペンチル基、４，６－ジフェニルヘキシル基、１，１－ジ（４－トリフルオロメトキシフェニル）メチル基、１，１－ジ（４－クロロフェニル）メチル基、１－（２－フルオロフェニル）－１－（３－フルオロフェニル）メチル基、１－（４－フルオロフェニル）－１－（２－クロロフェニル）メチル基、１－（３－クロロフェニル）－１－（４－クロロフェニル）メチル基、１－（２－ブromoフェニル）－１－（３－ブromoフェニル）メチル基、１－（４－ブromoフェニル）－２－（２－ヨードフェニル）エチル基、３－（３－ヨードフェニル）－３－（４－ヨードフェニル）プロピル基、１－（２，３－ジフルオロフェニル）－１－（３，４－ジフルオロフェニル）メチル基、４－（３，５－ジフルオロフェニル）－４－（２，４－ジフルオロフェニル）ブチル基、５－（２，６－ジフルオロフェニル）－５－（２，３－ジクロロフェニル）ペンチル基、６－（３，４－ジクロロフェニル）－６－（３，５－ジクロロフェニル）ヘキシル基、１－（２，４－ジクロロフェニル）－１－（２，６－ジクロロフェニル）メチル基、１－（３，４，５－トリフルオロフェニル）－１－（３，４，５－トリクロロフェニル）メチル基、１－（２，３，４，５，６－ペンタフルオロフェニル）－１－（２，４，６－トリメチルフェニル）メチル基、１－（４－*n*－ブチルフェニル）－１－（２，４－ジメチルフェニル）メチル基、１－（３，５－ジトリフルオロメチルフェニル）－１－（４－*n*－ブトキシフェニル）メチル基、１－（２，４－ジメトキシフェニル）－１－（２，３－ジメトキシフェニル）メチル基、１－（２，４，６－トリメトキシフェニル）－１－（３，５－ジトリフルオロメトキシフェニル）メチル基、１－（３－クロロ－４－メトキシフェニル）－１－（２－クロロ－４－トリフルオロメトキシフェニル）メチル基、１－（３－メチル－４－フルオロフェニル）－１－（４－ブromo－３－トリフルオロメチルフェニル）メチル基、１－（２－メチルフェニル）－１－（３－メチルフェニル）メチル基、１－（２－ペンタフルオロエチルフェニル）－１－（３－ペンタフルオロエチルフェニル）メチル基、１－（２－イソプロピルフェニル）－１－（２－*tert*－ブチルフェニル）メチル基、１－（２－*sec*－ブチルフェニル）－１－（２－*n*－ヘプタフルオロプロピルフェニル）メチル基、１－（４－*n*－ペンチルフェニル）－１－（４－*n*－ヘキシルフェニル）メチル基、１－（２－メトキシフェニル）－１－（２，６－ジメトキシフェニル）メチル基、１－（２－ペンタフルオロエトキシフェニル）－１－（イソプロポキシフェニル）メチル基、１－（２－*tert*－ブトキシフ

10

20

30

40

50

フェニル) - 1 - (2-sec-ブトキシフェニル) メチル基、1 - (2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル) - 1 - (4-n-ペントキシフェニル) メチル基、1, 1-ジ(4-n-ヘキシロキシフェニル) メチル基等のフェニル基が2個置換したC1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0364】

フェニルC2~6アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする〕とは、ハロゲン原子、ハロゲンC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基から選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されたフェニル基1又は2個と炭素数2から6で二重結合を1~3個有するアルケニル基から構成される基である。フェニルC2~6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC2~6アルケニル基としては、例えば、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3, 3-ジ(2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メト

10

20

30

40

50

キシフェニル) - 2-プロペニル基、3-(3-メトキシフェニル) - 2-プロペニル基、3-(4-メトキシフェニル) - 2-プロペニル基、3-(3, 4-ジメトキシフェニル) - 2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル) - 2-プロペニル基、4-(4-クロロフェニル) - 2-ブテニル基、4-(4-クロロフェニル) - 3-ブテニル基、5-(4-クロロフェニル) - 2-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル) - 4-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル) - 3-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル) - 5-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル) - 4-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル) - 3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

【0365】

イミダゾリル基 [イミダゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] としては、例えば、(1-, 2-, 4-又5-) イミダゾリル基、1-フェニル-2-イミダゾリル基、2-(2-フルオロフェニル) - 1-イミダゾリル基、4-(3-フルオロフェニル) - 2-イミダゾリル基、5-(4-フルオロフェニル) - 3-イミダゾリル基、1-(2-クロロフェニル) - 3-イミダゾリル基、2-(3-クロロフェニル) - 5-イミダゾリル基、1-(4-クロロフェニル) - 2-イミダゾリル基、4-(2-ブロモフェニル) - 5-イミダゾリル基、5-(3-ブロモフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(4-ブロモフェニル) - 3-イミダゾリル基、2-(2-ヨードフェニル) - 4-イミダゾリル基、4-(3-ヨードフェニル) - 5-イミダゾリル基、5-(4-ヨードフェニル) - 1-イミダゾリル基、1-(2, 3-ジフルオロフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(3, 4-ジフルオロフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(3, 5-ジフルオロフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2, 4-ジフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル基、1-(2, 6-ジフルオロフェニル) - 5-イミダゾリル基、1-(2, 3-ジクロロフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(3, 4-ジクロロフェニル) - 4-イミダゾリル基、1-(3, 5-ジクロロフェニル) - 5-イミダゾリル基、1-(2, 4-ジクロロフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2, 6-ジクロロフェニル) - 4-イミダゾリル基、1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) - 5-イミダゾリル基、1-(3, 4, 5-トリクロロフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) - 4-イミダゾリル基、1-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) - 5-イミダゾリル基、1-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(4-クロロ-3-フルオロフェニル) - 4-イミダゾリル基、1-(2, 3, 4-トリクロロフェニル) - 5-イミダゾリル基、1-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2, 4, 6-トリメチルフェニル) - 2-イミダゾリル基、2-(4-n-ブチルフェニル) - 4-イミダゾリル基、4-(2, 4-ジメチルフェニル) - 1-イミダゾリル基、5-(2, 3-ジメチルフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2, 6-ジメチルフェニル) - 4-イミダゾリル基、2-(3, 5-ジメチルフェニル) - 5-イミダゾリル基、4-(2, 5-ジメチルフェニル) - 1-イミダゾリル基、5-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(4-n-ブトキシフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2, 4-ジメトキシフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2, 3-ジメトキシフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2, 6-ジメトキシフェニル) - 2-イミダゾリル基、2-(3, 5-ジメトキシフェニル) - 4-イミダゾリル基、4-(2, 5-ジメトキシフェニル) - 1-イミダゾリル基、5-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(3-クロロ-4-メトキシフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(3-メチル-4-フルオロフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-イミダゾリル基、1-(2-メ

10

20

30

40

50

チルフェニル) - 2 - イミダゾリル基、2 - (3 - メチルフェニル) - 4 - イミダゾリル
 基、4 - (4 - メチルフェニル) - 5 - イミダゾリル基、5 - (2 - メチル - 3 - クロロ
 フェニル) - 1 - イミダゾリル基、1 - (3 - メチル - 4 - クロロフェニル) - 2 - イミ
 ダゾリル基、2 - (2 - クロロ - 4 - メチルフェニル) - 4 - イミダゾリル基、4 - (2
 - メチル - 3 - フルオロフェニル) - 5 - イミダゾリル基、5 - (2 - トリフルオロメチ
 ルフェニル) - 1 - イミダゾリル基、1 - (3 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - イ
 ミダゾリル基、2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 4 - イミダゾリル基、4 - (2
 - ペンタフルオロエチルフェニル) - 5 - イミダゾリル基、5 - (3 - ペンタフルオロ
 エチルフェニル) - 1 - イミダゾリル基、1 - (4 - ペンタフルオロエチルフェニル) -
 2 - イミダゾリル基、2 - (2 - イソプロピルフェニル) - 4 - イミダゾリル基、4 - (10
 3 - イソプロピルフェニル) - 5 - イミダゾリル基、5 - (4 - イソプロピルフェニル)
 - 1 - イミダゾリル基、1 - (2 - tert - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリル基、
 2 - (3 - tert - ブチルフェニル) - 4 - イミダゾリル基、4 - (4 - tert - ブ
 チルフェニル) - 5 - イミダゾリル基、5 - (2 - sec - ブチルフェニル) - 1 - イミ
 ダゾリル基、1 - (3 - sec - ブチルフェニル) - 2 - イミダゾリル基、2 - (4 - s
 ec - ブチルフェニル) - 4 - イミダゾリル基、4 - (2 - n - ヘプタフルオロプロピル
 フェニル) - 5 - イミダゾリル基、5 - (3 - n - ヘプタフルオロプロピルフェニル) -
 1 - イミダゾリル基、1 - (4 - n - ヘプタフルオロプロピルフェニル) - 2 - イミダゾ
 リル基、2 - (4 - ペンチルフェニル) - 4 - イミダゾリル基、4 - (4 - ヘキシルフェ
 ニル) - 5 - イミダゾリル基、1 - (2 - メトキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、5
 - (3 - メトキシフェニル) - 1 - イミダゾリル基、1 - (4 - メトキシフェニル) - 2
 - イミダゾリル基、2 - (3 - クロロ - 2 - メトキシフェニル) - 4 - イミダゾリル基、
 4 - (2 - フルオロ - 3 - メトキシフェニル) - 5 - イミダゾリル基、5 - (2 - フルオ
 ロ - 4 - メトキシフェニル) - 1 - イミダゾリル基、1 - (2, 6 - ジメトキシフェニル)
 - 2 - イミダゾリル基、1 - (2, 3, 4 - トリフルオロフェニル) - 2 - イミダゾリ
 ル基、1 - (2 - トリフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、2 - (3 - ト
 リフルオロメトキシフェニル) - 4 - イミダゾリル基、1 - (4 - トリフルオロメトキシ
 フェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (3 - フルオロ - 2 - トリフルオロメトキシフェ
 ニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (2 - フルオロ - 3 - トリフルオロメトキシフェニル)
 - 2 - イミダゾリル基、1 - (3 - フルオロ - 4 - トリフルオロメトキシフェニル) -
 2 - イミダゾリル基、1 - (3 - クロロ - 2 - トリフルオロメトキシフェニル) - 2 - イ
 ミダゾリル基、1 - (2 - クロロ - 3 - トリフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾ
 リル基、1 - (3 - クロロ - 4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 2 - イミダゾリル
 基、1 - (2 - ペンタフルオロエトキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (3 - ペン
 タフルオロエトキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (4 - ペンタフルオロエトキ
 シフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (3 - クロロ - 2 - ペンタフルオロエトキシフ
 ェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (2 - クロロ - 3 - ペンタフルオロエトキシフェ
 ニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (3 - クロロ - 4 - ペンタフルオロエトキシフェニル)
 - 2 - イミダゾリル基、1 - (2 - イソプロポキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1
 - (3 - イソプロポキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (4 - イソプロポキシフ
 ェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (2 - tert - ブトキシフェニル) - 2 - イミダ
 ザリル基、1 - (3 - tert - ブトキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (4 -
 tert - ブトキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (2 - sec - ブトキシフェ
 ニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (3 - sec - ブトキシフェニル) - 2 - イミダゾリ
 ル基、1 - (4 - sec - ブトキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (2 - n - ヘ
 プタフルオロプロポキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (3 - n - ヘプタフルオ
 ロプロポキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (4 - n - ヘプタフルオロプロポキ
 シフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1 - (4 - n - ペントキシフェニル) - 2 - イミダ
 ザリル基、1 - (4 - n - ヘキシルオキシフェニル) - 2 - イミダゾリル基、1, 4 - ジ
 フェニル - 2 - イミダゾリル基、1, 4, 5 - トリフェニル - 2 - イミダゾリル基等のイ

10

20

30

40

50

ミダゾリル基〔イミダゾール環上には、1～3個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0366】

ピペラジニル基（ピペラジン環上には、フェニル基が2個置換したC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、フェニルC 2～6アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする。〕及びイミダゾリル基〔イミダゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする。）としては、例えば、4-〔1, 1-ジ（4-クロロフェニル）メチル〕-1-ピペラジニル基、4-〔1, 1-ジ（4-トリフルオロメトキシフェニル）メチル〕-1-ピペラジニル基、4-（4-クロロシンナミル）-1-ピペラジニル基、4-（4-トリフルオロメトキシシンナミル）-1-ピペラジニル基、4-〔1-（4-クロロフェニル）-2-イミダゾリル〕-1-ピペラジニル基、4-〔1, 1-ジ（2, 4-ジブromoフェニル）メチル〕-1-ピペラジニル基、4-〔1, 1-ジ（4-トリフルオロメチルフェニル）メチル〕-1-ピペラジニル基、4-（2, 4-ジクロロシンナミル）-1-ピペラジニル基、4-（4-トリフルオロメチルシンナミル）-1-ピペラジニル基、4-〔1-〔2, 4-ジ（トリフルオロメトキシ）フェニル〕-2-イミダゾリル〕-1-ピペラジニル基、4-〔1, 1-ジ（2, 4, 6-トリフルオロフェニル）メチル〕-1-ピペラジニル基、4-〔1, 1-ジ〔2, 4-ジ（トリフルオロメトキシ）フェニル〕メチル〕-1-ピペラジニル基、4-〔2, 4, 6-トリ（トリフルオロメチル）シンナミル〕-1-ピペラジニル基、4-〔2, 4-ジ（トリフルオロメトキシ）シンナミル〕-1-ピペラジニル基、4-〔1-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-イミダゾリル〕-1-ピペラジニル基、4-（2, 4, 6-トリフルオロシンナミル）-1-ピペラジニル基、4-〔1-（2, 4-ジブromoフェニル）-2-イミダゾリル〕-1-ピペラジニル基、4-〔1, 1-ジ（4-クロロフェニル）メチル〕-3-（4-クロロシンナミル）-1-ピペラジニル基、4-（4-トリフルオロメトキシシンナミル）-2-〔1-（4-クロロフェニル）-2-イミダゾリル〕-1-ピペラジニル基、4-（4-トリフルオロメトキシシンナミル）-2-〔1-（4-クロロフェニル）-2-イミダゾリル〕-6-（1-イミダゾリル）-1-ピペラジニル基等のピペラジニル基（ピペラジン環上には、前記例示のフェニル基が2個置換したC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕、前記例示のフェニルC 2～6アルケニル基〔ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基から選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されたフェニル基1又は2個と炭素数2から6で二重結合を1～3個有するアルケニル基から構成される基〕及びイミダゾリル基〔イミダゾール環上には、1～3個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～3個置換しているものとする。）を挙げることができる。

【0367】

アニリノ C 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] としては、例えば、アニリノ基の N 位に C 1～6 アルキル基が置換していてもよく、無置換のアニリノ基又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基及びハロゲンからなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換したアニリノ基と C 1～6 アルキル基で構成される基であって、例えば、アニリノメチル基、N-メチル-N-アニリノメチル基、N-エチル-N-アニリノメチル基、N-n-プロピル-N-アニリノメチル基、N-n-ブチル-N-アニリノメチル基、N-n-ペンチル-N-アニリノメチル基、N-n-ヘキシル-N-アニリノメチル基、2-アニリノエチル基、3-アニリノプロピル基、4-アニリノブチル基、5-アニリノペンチル基、6-アニリノヘキシル基、4-フルオロアニリノメチル基、2-フルオロ-4-ブロモアニリノメチル基、4-クロロ-3-フルオロアニリノメチル基、2, 3, 4-トリクロロアニリノメチル基、3, 4, 5-トリクロロアニリノメチル基、2, 4, 6-トリクロロアニリノメチル基、N-メチル-N-2, 4, 6-トリクロロアニリノメチル基、4-イソプロピルアニリノメチル基、4-n-ブチルアニリノメチル基、4-メチルアニリノメチル基、2-メチルアニリノメチル基、3-メチルアニリノメチル基、2, 4-ジメチルアニリノメチル基、2, 3-ジメチルアニリノメチル基、2, 6-ジメチルアニリノメチル基、3, 5-ジメチルアニリノメチル基、2, 5-ジメチルアニリノメチル基、N-メチル-N-2, 5-ジメチルアニリノメチル基、2, 4, 6-トリメチルアニリノメチル基、3, 5-ジトリフルオロメチルアニリノメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロアニリノメチル基、4-イソプロポキシアニリノメチル基、4-n-ブトキシアニリノメチル基、4-メトキシアニリノメチル基、2-メトキシアニリノメチル基、3-メトキシアニリノメチル基、N-メチル-N-3-メトキシアニリノメチル基、2, 4-ジメトキシアニリノメチル基、2, 3-ジメトキシアニリノメチル基、2, 6-ジメトキシアニリノメチル基、3, 5-ジメトキシアニリノメチル基、2, 5-ジメトキシアニリノメチル基、2, 4, 6-トリメトキシアニリノメチル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシアニリノメチル基、2-イソプロポキシアニリノメチル基、3-クロロ-4-メトキシアニリノメチル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシアニリノメチル基、3-メチル-4-フルオロアニリノメチル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルアニリノメチル基、2-(4-フルオロアニリノ)エチル基、3-(4-フルオロアニリノ)プロピル基、4-(4-フルオロアニリノ)ブチル基、5-(4-フルオロアニリノ)ペンチル基、6-(4-フルオロアニリノ)ヘキシル基、4-クロロアニリノメチル基、2-(4-クロロアニリノ)エチル基、3-(4-クロロアニリノ)プロピル基、4-(4-クロロアニリノ)ブチル基、5-(4-クロロアニリノ)ペンチル基、6-(4-クロロアニリノ)ヘキシル基、4-メチルアニリノメチル基、2-(4-メチルアニリノ)エチル基、3-(4-メチルアニリノ)プロピル基、4-(4-メチルアニリノ)ブチル基、5-(4-メチルアニリノ)ペンチル基、6-(4-メチルアニリノ)ヘキシル基、4-トリフルオロメチルアニリノメチル基、2-(4-トリフルオロメチルアニリノ)エチル基、3-(4-トリフルオロメチルアニリノ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルアニリノ)ブチル基、N-メチル-N-[4-(4-トリフルオロメチルアニリノ)]ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルアニリノ)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルアニリノ)ヘキシル基、4-トリフルオロメトキシアニリノメチル基、N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシアニリノメチル基、2-(4-トリフルオロメトキシアニリノ)エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシアニリノ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメトキシアニリノ)ブチル基、5-(4-トリフルオロメトキシアニリノ)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメトキシアニリノ)ヘキシル基、4-メトキシアニリノメチル基、2-(4-メトキシアニリノ)エチル基、3-(4-メトキシアニリノ)プロピル基、4-(4-メトキシアニリノ)ブチル基、5-(4-メトキシアニリノ)ペンチル基、6-(4-メトキシアニリノ)ヘキシル基等を挙げることができる。

10

20

30

40

50

【0368】

チアゾリルC 1～6アルコキシ基（チアゾール環上には、(p-1)フェノキシC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、(p-2)アニリノC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、(p-3)フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、(p-4)ピペラジニルC 1～6アルキル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕及び(p-5)ピペリジルC 1～6アルキル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、（2-チアゾリル）メトキシ基、2-（4-チアゾリル）エトキシ基、3-（5-チアゾリル）プロポキシ基、4-（2-チアゾリル）ブトキシ基、5-（4-チアゾリル）ペンチルオキシ基、6-（5-チアゾリル）ヘキシルオキシ基、{4-[4-(4-クロロフェノキシ)-1-ピペリジルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、2-メチル-3-（2-チアゾリル）プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-（2-チアゾリル）エトキシ基、{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、[4-{4-[2, 4-ジ（トリフルオロメチル）フェノキシ]-1-ピペリジルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、[4-{4-[2, 4, 6-トリ（トリフルオロメチル）フェノキシ]-1-ピペリジルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[4-(2, 4-ジブromoフェノキシ)-1-ピペリジルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[4-(2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ)-1-ピペリジルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、[4-{4-[2, 4-ジ（トリフルオロメチル）フェニル]-1-ピペラジニルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、[4-{4-[2, 4, 6-トリ（トリフルオロメトキシ）フェニル]-1-ピペラジニルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[4-(2, 4-ジブromoフェニル)-1-ピペラジニルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1-ピペラジニルメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、4-（4-トリフルオロメチルフェノキシメチル）-2-チアゾリル基、[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2-チアゾリル]メトキシ基、[4-(4-クロロフェノキシメチル)-2-チアゾリル]メトキシ基、{4-[2, 4-ジ（トリフルオロメトキシ）フェノキシメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[2, 4, 6-トリ（トリフルオロメチル）フェノキシメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、[4-(2, 4-ジブromoフェノキシメチル)-2-チアゾリル]メトキシ基、[4-(2, 4, 6-トリフルオロフェノキシメチル)-2-チアゾリル]メトキシ基、[4-(4-トリフルオロメチルアニリノメチル)-2-チアゾリル]メトキシ基、[4-(4-トリフルオロメトキシアニリノメトキシ)-2-チアゾリル]メトキシ基、[4-(4-クロロアニリノメチル)-2-チアゾリル]メトキシ

10

20

30

40

50

基、{4-[2, 4-ジ(トリフルオロメチル)アニリノメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)アニリノメチル]-2-チアゾリル}メトキシ基、[4-(2, 4-ジブromoアニリノメチル)-2-チアゾリル]メトキシ基、[4-(2, 4, 6-トリフルオロアニリノメチル)-2-チアゾリル]メトキシ基、{4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[3-(4-クロロフェニル)プロピル]-2-チアゾリル}メトキシ基、[4-(2, 4-ジヨードベンジル)-2-チアゾリル]メトキシ基、[4-(2, 4, 6-トリブromoベンジル)-2-チアゾリル]メトキシ基、{4-[2, 4-ジ(トリフルオロメチル)ベンジル]-2-チアゾリル}メトキシ基、{4-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)ベンジル]-2-チアゾリル}メトキシ基、(4, 5-ジベンジル-2-チアゾリル)メトキシ基、(2-フェノキシメチル-4-ベンジル-5-チアゾリル)メトキシ基、(2, 5-ジアニリノメチル-4-チアゾリル)メトキシ基等のチアゾリルC1~6アルコキシ基(チアゾール環上には、後記例示のフェノキシC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]、前記例示のアニリノC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]、前記例示のフェニルC1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]、前記例示のピペラジニルC1~6アルキル基[ピペラジン環上には、1~3個のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい]及び前記例示のピペリジルC1~6アルキル基[ピペリジン環上には、1~3個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0369】

8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基(8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクタン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-(4-クロロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-(2-ブromoフェノキシ)-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-(3-フルオロフェノキシ)-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-[2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)フェノキシ]-8-アザビシクロ[3. 2. 1]オクチル基、3, 6-ジフェノキシ-8-アザ

ビスクロ [3. 2. 1] オクチル基、3, 7, 6-トリフェノキシ-8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクチル基、3-(4-メトキシフェノキシ)-8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクチル基、3-(4-メチルフェノキシ)-8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクチル基、3-(2, 4-ジメトキシフェノキシ)-8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクチル基、3-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ)-8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクチル基、3-(2, 4-ジメチルフェノキシ)-8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクチル基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)-8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクチル基等の8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクチル基(8-アザビスクロ [3. 2. 1] オクタン環上には、1~3個の前記例示のフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい)を挙げることができる。

10

【0370】

置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ置換C1~6アルキル基としては、例えば、アミノメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチル-3-アミノプロピル基、1, 1-ジメチル-2-アミノエチル基、エチルアミノメチル基、1-(プロピルアミノ)エチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、3-(イソプロピルアミノ)プロピル基、4-(n-ブチルアミノ)ブチル基、5-(n-ペンチルアミノ)ペンチル基、6-(n-ヘキシルアミノ)ヘキシル基、ジメチルアミノメチル基、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチル基、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル基等の置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ-C1~6アルキル基を挙げることができる。

20

【0371】

C1~6アルキレン基としては、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等を挙げることができる。

【0372】

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニルC1~6アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-フルオロ-4-プロモベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロピルベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、

30

40

50

ルボニル基、2, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメチルベンジル
オキシカルボニル基、2, 6-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメチル
ベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4,
6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオ
キシカルボニル基、4-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブトキシ
ベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシ
ベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメ
トキシベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、
2, 6-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシカル
ボニル基、2, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシ
ベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボ
ニル基、2-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシベ
ンジルオキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル
ボニル基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-ブromo-3-トリ
フルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-クロロフェニル)エトキシカル
ボニル基、2-(3-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-クロロフェ
ニル)エトキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-
トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキ
シカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオ
ロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル
ボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-
トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェ
ニル)エトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカル
ボニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-
トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチ
ルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポ
キシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、
3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフル
オロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェ
ニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカル
ボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-
トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメト
キシフェニル)ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキ
シルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカル
ボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基等を
挙げることができる。

【0373】

フェニルC 2~6アルケニルカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ
ン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキ
シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例え
ば、無置換又はハロゲン原子、ハロゲンC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未
置換のC 1~6アルコキシ基から選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換された
フェニル基と炭素数2から6で二重結合を1~3個有するアルケニルカルボニル基から構
成される基である。フェニルC 2~6アルケニルカルボニル基は、トランス体及びシス体
の両者を包含する。このようなフェニルC 2~6アルケニルカルボニル基としては、例え
ば、2-フェニルビニルカルボニル基、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル基（慣
用名：シンナモイル基）、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル基、4-フェニル-3-
ブテニルカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルカルボニル基、5-フェ
ニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルカルボニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-
プロペニルカルボニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル

10

20

30

40

50

基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,3-ジクロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,5-ジクロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,3,4-トリクロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,4,6-トリクロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,4-ジメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,3-ジメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,6-ジメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(2-メトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-メトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニルカルボニル基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニルカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ペンテニルカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニルカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニルカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニルカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニルカルボニル基等を挙げることができる。

10

20

30

40

50

【0374】

C1～4アルキレンジオキシ基としては、例えば、メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基、トリメチレンジオキシ基、テトラメチレンジオキシ基等を例示できる。

【0375】

置換基としてC1～6アルキル基を有することのあるアミノ置換スルホニル基としては例えば、アミノスルホニル基、メチルアミノスルホニル基、エチルアミノスルホニル基、プロピルアミノスルホニル基、イソプロピルアミノスルホニル基、ブチルアミノスルホニル基、tert-ブチルアミノスルホニル基、ペンチルアミノスルホニル基、ヘキシルアミノスルホニル基、ジメチルアミノスルホニル基、ジエチルアミノスルホニル基、ジプロピルアミノスルホニル基、ジブチルアミノスルホニル基、ジペンチルアミノスルホニル基、ジヘキシルアミノスルホニル基、N-メチル-N-エチルアミノスルホニル基、N-エチル-N-プロピルアミノスルホニル基、N-メチル-N-ブチルアミノスルホニル基、N-メチル-N-ヘキシルアミノスルホニル基等の置換基としてC1～6アルキル基を1～2個有することのあるアミノスルホニル基を挙げることができる。

10

【0376】

フェニルC1～6アルコキシ基としては、例えば、ベンジルオキシ基、2-フェニルエトキシ基、1-フェニルエトキシ基、3-フェニルプロポキシ基、2-フェニルプロポキシ基、4-フェニルブトキシ基、5-フェニルペントキシ基、4-フェニルペントキシ基、6-フェニルヘキシルオキシ基、2-メチル-3-フェニルプロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ基等を挙げることができる。

20

【0377】

ピロリジニル基〔ピロリジン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい〕としては、例えば、ピロリジニル基、2-オキソピロリジニル基、2, 5-ジオキソピロリジニル基等のピロリジニル基（ピロリジン環上には、1～2個のオキシ基が置換していてもよい）を挙げることができる。

【0378】

ピロリジニルC1～6アルコキシ基としては、例えば、（1-ピロリジニル）メトキシ基、2-（1-ピロリジニル）エトキシ基、1-（2-ピロリジニル）エトキシ基、3-（1-ピロリジニル）プロポキシ基、2-（3-ピロリジニル）プロポキシ基、4-（1-ピロリジニル）ブトキシ基、5-（2-ピロリジニル）ペントキシ基、4-（3-ピロリジニル）ペントキシ基、6-（1-ピロリジニル）ヘキシルオキシ基、2-メチル-3-（1-ピロリジニル）プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-（1-ピロリジニル）エトキシ基等を挙げることができる。

30

【0379】

ベンゾフリルC1～6アルキル基（ベンゾフラン環上には、置換基として少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）としては、例えば、2-ベンゾフリルメチル基、1-（2-ベンゾフリル）エチル基、2-（4-ベンゾフリル）エチル基、3-（5-ベンゾフリル）プロピル基、4-（6-ベンゾフリル）ブチル基、5-（7-ベンゾフリル）ペンチル基、6-（2-ベンゾフリル）ヘキシル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、6-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-3-ベ

40

50

ンゾフリルメチル基、4-ブromo-3-ベンゾフリルメチル基、5-ブromo-3-ベンゾフリルメチル基、6-ブromo-3-ベンゾフリルメチル基、7-ブromo-3-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、2-(4-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-フルオロ-3-ベンゾフリル)メチル基、2-(5-フルオロ-3-ベンゾフリル)メチル基、2-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-フルオロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、6-(5-フルオロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(6-フルオロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(4-クロロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(5-クロロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(6-クロロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(7-クロロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(4-フルオロ-3-ベンゾフリル)メチル基、6-(5-フルオロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(7-フルオロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(4-クロロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(5-クロロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(6-クロロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(7-クロロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、(2, 4-ジブromo-3-ベンゾフリル)メチル基、(4, 5, 6-トリクロロ-3-ベンゾフリル)メチル基等のベンゾフラン環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいベンゾフリル置換C1~6アルキル基を挙げることができる。

【0380】

フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェノキシ基又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びハロゲンからなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換したフェノキシ基とC1~6アルキル基で構成される基であって、例えば、フェノキシメチル基、2-フェノキシエチル基、3-フェノキシプロピル基、4-フェノキシブチル基、5-フェノキシペンチル基、6-フェノキシヘキシル基、4-フルオロ-6-メチルフェノキシメチル基、2-フルオロ-4-ブromoフェノキシメチル基、2-フルオロ-4-ブromoフェノキシメチル基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシメチル基、2-クロロフェノキシメチル基、3-クロロフェノキシメチル基、4-クロロフェノキシメチル基、3, 4-ジクロロフェノキシメチル基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシメチル基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシメチル基、2-(2-クロロフェノキシ)エチル基、2-(3-クロロフェノキシ)エチル基、2-(4-クロロフェノキシ)エチル基、2-(3, 4-ジクロロフェノキシ)エチル基、2-(4-フルオロフェノキシ)エチル基、4-イソプロピルフェノキシメチル基、4-n-ブチルフェノキシメチル基、4-メチルフェノキシメチル基、2-メチルフェノキシメチル基、3-メチルフェノキシメチル基、4-n-プロピルフェノキシメチル基、4-イソプロピルフェノキシメチル基、2, 4-ジメチルフェノキシメチル基、2, 3-ジメチルフェノキシメチル基、2, 6-ジメチルフェノキシメチル基、3, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシメチル基、4-ヘキシルフェノキシメチル基、2-(3-メチルフェノキシ)エチル基、2-(3, 4-ジメチルフェノキシ)エチル基、

10

20

30

40

50

3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシメチル基、4-イソプロポキシフェノキシメチル基、4-n-ブトキシフェノキシメチル基、4-メトキシフェノキシメチル基、2-メトキシフェノキシメチル基、3-メトキシフェノキシメチル基、2-(3-メトキシフェノキシ)エチル基、2-(4-メトキシフェノキシ)エチル基、2-(3, 4-ジメトキシフェノキシ)エチル基、2, 4-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 3-ジメトキシフェノキシメチル基、3, 4-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 6-ジメトキシフェノキシメチル基、3, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシメチル基、3, 4, 5-トリメトキシフェノキシメチル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシメチル基、2-イソプロポキシフェノキシメチル基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシメチル基、2-クロロ-4-メトキシフェノキシメチル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル基、3-メチル-4-フルオロフェノキシメチル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-(4-フルオロフェノキシ)エチル基、3-(4-フルオロフェノキシ)プロピル基、4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル基、5-(4-フルオロフェノキシ)ペンチル基、6-(4-フルオロフェノキシ)ヘキシル基、4-クロロフェノキシメチル基、3-(4-クロロフェノキシ)プロピル基、4-(4-クロロフェノキシ)ブチル基、5-(4-クロロフェノキシ)ペンチル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキシル基、4-メチルフェノキシメチル基、2-(4-メチルフェノキシ)エチル基、2-(2-イソプロピルフェノキシ)エチル基、2-(4-イソプロピルフェノキシ)エチル基、2-(4-ヘキシルフェノキシ)エチル基、2-(2-フルオロ-5-メチルフェノキシ)エチル基、2-(2-クロロ-4-メトキシフェノキシ)エチル基、2-(3-フルオロ-4-クロロフェノキシ)エチル基、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)エチル基、3-(4-メチルフェノキシ)プロピル基、4-(4-メチルフェノキシ)ブチル基、5-(4-メチルフェノキシ)ペンチル基、6-(4-メチルフェノキシ)ヘキシル基、4-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、3-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ヘキシル基、4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ブチル基、5-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ヘキシル基、4-メトキシフェノキシメチル基、2-イソプロポキシフェノキシメチル基、2-(4-メトキシフェノキシ)エチル基、3-(4-メトキシフェノキシ)プロピル基、4-(4-メトキシフェノキシ)ブチル基、5-(4-メトキシフェノキシ)ペンチル基、6-(4-メトキシフェノキシ)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0381】

チアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、5-フェニル-4-チアゾリルメチル基、4-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2, 5-ジフェニル-4-チアゾリルメチル基、2, 4-ジフェニル-5-チアゾリルメチル基、5-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリル

メチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(3-ヨードフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2,3-ジフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(2,4,6-トリクロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(3-メチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(3-エチルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-プロピルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-n-ブチルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-n-ペンチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-n-ヘキシルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(3,4-ジメチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2,4,6-トリメチルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-メトキシフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-エトキシフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-プロポキシフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-n-ブトキシフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-チアゾリル)エチル基、2-(4-チアゾリル)エチル基、2-(5-チアゾリル)エチル基、2-[5-(2-n-ペンチルオキシフェニル)-4-チアゾリル]エチル基、2-[2-(2-n-ヘキシルオキシフェニル)-5-チアゾリル]エチル基、2-[2-(2,5-ジメトキシフェニル)-4-チアゾリル]エチル基、2-[2-(2,4,6-トリメトキシフェニル)-5-チアゾリル]エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2,4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-トリフルオロメトキシフェニル-4-チアゾリルメチル基、2,3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-(2-メチル-5-トリフルオロメトキシフェニル-4-チアゾリル)エチル基、3-(2-チアゾリル)プロピル基、2-(4-チアゾリル)プロピル基、3-(5-チアゾリル)プロピル基、3-[(2-メトキシ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリル]プロピル基、4-(2-チアゾリル)ブチル基、4-(4-チアゾリル)ブチル基、3-(5-チアゾリル)ブチル基、4-[4-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-2-チアゾリル]ブチル基、5-(2-チアゾリル)ペンチル基、5-[5-(2-フルオロ-3-メトキシフェニル)-2-チアゾリル]ペンチル基、5-(4-チアゾリル)ペンチル基、5-(5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-チアゾリル)ヘキシル基、5-(4-チアゾリル)ヘキシル基、5-(5-チアゾリル)ヘキシル基等のチアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、1~2個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0382】

C1~6アルコキシカルボニル基とは、上記で定義されたC1~6アルコキシ基とカルボニル基で構成された基であって、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、n-ペントキシカルボニル基、ネオペントキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、イソヘキシルオキシカルボニル基、3-メチルペントキシカルボニル

10

20

30

40

50

基等を挙げることができる。

【0383】

ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンゾイル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-フルオロベンゾイル基、2, 3-ジフルオロベンゾイル基、3, 4-ジフルオロベンゾイル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイル基、2, 3-ジクロロベンゾイル基、3, 4-ジクロロベンゾイル基、2, 4, 6-トリクロロベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンゾイル基、2-ブロモベンゾイル基、3-ブロモベンゾイル基、4-ブロモベンゾイル基、2, 3-ジブロモベンゾイル基、3, 4-ジブロモベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、2, 3-ジメチルベンゾイル基、3, 4-ジメチルベンゾイル基、3, 4, 5-トリメチルベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル基、2, 3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3, 4-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、2-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、3, 4-ジメトキシベンゾイル基、2, 4, 6-トリメトキシベンゾイル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイル基、4-トリフルオロメトキシベンゾイル基、2-メトキシ-3-フルオロベンゾイル基、3-メチル-4-クロロベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシ-4-メチルベンゾイル基、2-メトキシ-4-トリフルオロメチルベンゾイル基等のベンゾイル基（フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びからなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0384】

フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよいアニリン、N-C 1～6アルキルアニリン又はN-フェニルC 1～6アルキルアニリンとカルボニル基から構成される基であって、例えば、フェニルカルバモイル基、2-フルオロフェニルカルバモイル基、3-フルオロフェニルカルバモイル基、4-フルオロフェニルカルバモイル基、2-クロロフェニルカルバモイル基、3-クロロフェニルカルバモイル基、4-クロロフェニルカルバモイル基、2-ブロモフェニルカルバモイル基、3-ブロモフェニルカルバモイル基、4-ブロモフェニルカルバモイル基、2-ヨードフェニルカルバモイル基、3-ヨードフェニルカルバモイル基、4-ヨードフェニルカルバモイル基、2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリクロロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルカルバモイル基、2-メチルフェニルカルバモイル基、3-メチルフェニルカルバモイル基、4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイル基、3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイル基、2-クロロ-4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイル基

50

3-メチル-4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイル基、3-イソプロピルフェニルカルバモイル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイル基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-ペンチルフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルフェニルカルバモイル基、2,4-ジメチルフェニルカルバモイル基、2,4,6-トリメチルフェニルカルバモイル基、3,4-ジメトキシフェニルカルバモイル基、3,4,5-トリメトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシフェニルカルバモイル基、3-メトキシフェニルカルバモイル基、4-メトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイル基、2,6-ジメトキシフェニルカルバモイル基、2,3,4-トリフルオロフェニルカルバモイル基、3,4,5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ペンチルオキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルカルバモイル基等を挙げることができる。

【0385】

ベンゾチアゾリル基(ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい)としては、例えば、(2-, 4-, 5-, 6-, 又は7-)ベンゾチアゾリル基、2-メチル-5-ベンゾチアゾリル基、4-エチル-6-ベンゾチアゾリル基、5-プロピル-7-ベンゾチアゾリル基、6-tert-ブチル-2-ベンゾチアゾリル基、7-ペンチル-4-ベンゾチアゾリル基、2-ヘキシル-5-ベンゾチアゾリル基、2,4-ジメチル-5-ベンゾチアゾリル基、2,4,6-トリメチル-7-ベンゾチアゾリル基等のベンゾチアゾリル基(ベンゾチアゾール環上には1~3個のC1~6アルキル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0386】

2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基(2,3-ジヒドロ-1H-インダン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基、1-オキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基、1,3-ジオキシ-2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基等の2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基(2,3-ジヒドロ-1H-インダン環上には、1~2個のオキシ基が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0387】

フェニルC 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換又はハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基から選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されたフェニル基1又は2個と炭素数2から6で二重結合を1～3個有するアルケニル基から構成される基である。フェニルC 2～6 アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC 2～6 アルケニル基としては、例えば、2-フェニルビニル基、3-フェニル-2-プロペニル基（慣用名：シンナミル基）、3, 3-ジフェニル-2-プロペニル基、3-フェニル-2-メチル-2-プロペニル基、4-フェニル-2-ブテニル基、4, 4-ジフェニル-2-ブテニル基、4-フェニル-3-ブテニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニル基、5-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニル基、5, 5-ジフェニル-3-ペンテニル基、6, 6-ジフェニル-2-ヘキセニル基、6-フェニル-1, 3-ヘキサジエニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 6-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 6-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 5-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-エチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ヘキシルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-トリフルオロメチル-4-フルオロフェニル)-2-

10

20

30

40

50

ープロペニル基、3-（3-トリフルオロメチル-2-フルオロフェニル）-2-プロペニル基、3-（4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニル基、3-（4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニル基、3-（3-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニル基、3-（2-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニル基、3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニル基、3-（2-トリフルオロメトキシフェニル）-2-プロペニル基、3-（3-トリフルオロメトキシフェニル）-2-プロペニル基、3-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-2-プロペニル基、3-（2-メトキシフェニル）-2-プロペニル基、3-（3-メトキシフェニル）-2-プロペニル基、3-（4-メトキシフェニル）-2-プロペニル基、3-（4-n-ヘキシルオキシフェニル）-2-プロペニル基、3-（3, 4-ジメトキシフェニル）-2-プロペニル基、3-（3, 5-ジメトキシフェニル）-2-プロペニル基、4-（4-クロロフェニル）-2-ブテニル基、4-（4-クロロフェニル）-3-ブテニル基、5-（4-クロロフェニル）-2-ペンテニル基、5-（4-クロロフェニル）-4-ペンテニル基、5-（4-クロロフェニル）-3-ペンテニル基、6-（4-クロロフェニル）-5-ヘキセニル基、6-（4-クロロフェニル）-4-ヘキセニル基、6-（4-クロロフェニル）-3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

【0388】

フェニル基（フェニル環上には、C1~4アルキレンジオキシ基、シアノ基、ニトロ基、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ置換スルホニル基、C1~6アルコキシカルボニル基、C1~6アルキルチオ基、フェノキシ基、フェニルC1~6アルコキシ基、ピロリジニル基（ピロリジン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）、イミダゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサゾリル基、フェニルC1~6アルキル基、フェニル基、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノC1~6アルキル基、ピロリジニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、前記例示のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）に加えて、4-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、2-シアノフェニル基、3, 4-ジシアノフェニル基、2, 4, 6-トリシアノフェニル基、4-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、2-ニトロフェニル基、3, 4-ジニトロフェニル基、2, 4, 6-トリニトロフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、2-N-エチル-N-メチルアミノフェニル基、2, 4-ジ（メチルアミノ）フェニル基、2, 4, 6-トリ（メチルアミノ）フェニル基、4-ジメチルアミノスルホニルフェニル基、3-メチルアミノスルホニルフェニル基、2-N-エチル-N-メチルアミノスルホニルフェニル基、2, 4-ジ（メチルアミノスルホニル）フェニル基、2, 4, 6-トリ（メチルアミノスルホニル）フェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、2-プロポキシカルボニルフェニル基、2, 4-ジエトキシカルボニルフェニル基、2, 4, 6-トリエトキシカルボニルフェニル基、4-メチルチオフェニル基、3-エチルチオフェニル基、2-メチルチオフェニル基、3, 4-ジメチルチオフェニル基、2, 4, 6-トリメチルチオフェニル基、3, 4-エチレンジオキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、4-ジイソプロピルアミノメチルフェニル基、3-メチルアミノメチルフェニル基、2-エチルアミノメチルフェニル基、2, 4-ジメチルアミノメチルフェニル基、2, 4, 6-トリエチルアミノメチルフェニル基、4-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、2-フェノキシフェニル基、2, 4-ジフェノキシフェニル基、3, 4, 5-トリフェノキシフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、

10

20

30

40

50

2, 4-ジベンジルオキシフェニル基、2, 4, 6-トリベンジルオキシフェニル基、4-(2-オキソ-1-ピロリジニル)フェニル基、4-(5-オキサゾリル)フェニル基、4-(5-イソオキサゾリル)フェニル基、4-(1-イミダゾリル)フェニル基、4-ベンジルフェニル基、3-ベンジルフェニル基、2-ベンジルフェニル基、3, 4-ジベンジルフェニル基、2, 4, 6-トリベンジルフェニル基、4-ビフェニル基、3-ビフェニル基、2-ビフェニル基、2, 4-ジフェニルフェニル基、2, 4, 6-トリフェニルフェニル基、2-(2-イミダゾリル)-4-フェノキシフェニル基、3-(2-オキサゾリル)-4-ベンジルオキシフェニル基、4-(3-イソオキサゾリル)-2-ベンジルフェニル基等のフェニル基（フェニル環上には、前記例示のC 1～4アルキレンジオキシ基、シアノ基、ニトロ基、後記例示の置換基としてC 1～6アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基、前記例示の置換基としてC 1～6アルキル基を1～2個有することのあるアミノ置換スルホニル基、後記例示のC 1～6アルコキシカルボニル基、後記例示のC 1～6アルキルチオ基、フェノキシ基、前記例示のフェニルC 1～6アルコキシ基、前記例示のピロリジニル基（ピロリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）、イミダゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサゾリル基、前記例示のフェニルC 1～6アルキル基、フェニル基、後記例示の置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノC 1～6アルキル基、前記例示のピロリジニルC 1～6アルコキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

10

20

【0389】

フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲンが置換していてもよい〕としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリブロモフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1～5個置換していてもよいフェニル基を挙げることができる。

30

【0390】

フェニルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、フェノキシ基、C 1～6アルキルチオ基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、前記例示のフェニルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）に加えて、4-シアノフェニルメトキシメチル基、3-シアノフェニルメトキシメチル基、2-シアノフェニルメトキシメチル基、2, 4-ジシアノフェニルメトキシメチル基、2, 4, 6-トリシアノフェニルメトキシメチル基、4-ビフェニルメトキシメチル基、3-ビフェニルメトキシメチル基、2-ビフェニルメトキシメチル基、2, 4-ジフェニルフェニルメトキシメチル基、2, 4, 6-トリフェニルフェニルメトキシメチル基、4-フェノキシフェニルメトキシメチル基、3-フェノキシフェニルメトキシメチル基、2-フェノキシフェニルメトキシメチル基、3, 4-ジフェノキシフェニルメトキシ

40

50

メチル基、3, 4, 5-トリフェノキシフェニルメトキシメチル基、4-メチルチオフェニルメトキシメチル基、3-エチルチオフェニルメトキシメチル基、2-メチルチオフェニルメトキシメチル基、2, 4-ジメチルチオフェニルメトキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルチオフェニルメトキシメチル基、4-シアノー-2-フェニルフェニルメトキシメチル基、3-フェノキシ-4-メチルチオフェニルメトキシメチル基、3-トリフルオロメチル-4-メチルチオフェニルメトキシメチル基、3-トリフルオロメトキシ-2-フェノキシフェニルメトキシメチル基等のフェニルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、フェノキシ基、前記例示のC 1~6アルキルチオ基、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基およびハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個が置換していてもよい）を挙げることができる。

10

【0391】

フェニルC 1~6アルコキシ基（フェニル環上には、シアノ基、フェニル基、C 1~6アルコキシカルボニル基、フェノキシ基、C 1~6アルキルチオ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、前記例示のフェニルC 1~6アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）に加えて、4-シアノフェニルメトキシ基、3-シアノベンジルオキシ基、2-シアノベン
20
ジルオキシ基、2, 4-ジシアノベンジルオキシ基、2, 3, 4-トリシアノベンジルオキシ基、4-ビフェニルメトキシ基、3-ビフェニルメトキシ基、2-ビフェニルメトキシ基、2, 4-ジフェニルベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリフェニルベンジルオキシ基、4-メトキシカルボニルベンジルオキシ基、3-エトキシカルボニルベンジルオキシ基、2-メトキシカルボニルベンジルオキシ基、3, 4-ジエトキシカルボニルベンジルオキシ基、3, 4, 5-トリメトキシカルボニルベンジルオキシ基、3-フェノキシベン
30
ジルオキシ基、2-フェノキシベンジルオキシ基、4-フェノキシベンジルオキシ基、2, 4-ジフェノキシベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリフェノキシベンジルオキシ基、4-メチルチオベンジルオキシ基、3-メチルチオベンジルオキシ基、2-メチルチオベン
ジルオキシ基、3, 4-ジメチルチオベンジルオキシ基、2, 5, 6-トリメチルチオ
40
ベンジルオキシ基、3-シアノー-4-ビベンジルオキシ基、4-エトキシカルボニル-3-フェノキシベンジルオキシ基、3-メチルチオ-4-エチルベンジルオキシ基、ジ（4-トリフルオロメトキシフェニル）メトキシ基、ジ（4-トリフルオロメチルフェニル）メトキシ基、ジ（4-クロロフェニル）メトキシ基、ジ（3-メトキシフェニル）メトキシ基、ジ（2-メチルフェニル）メトキシ基、ジ（2, 4-ジメトキシフェニル）メトキシ基、ジ（3, 4-ジメチルフェニル）メトキシ基、ジ（2, 4, 6-トリメトキシフェニル）メトキシ基、ジ（3, 4, 5-トリメチルフェニル）メトキシ基、ジ（2, 4, 6-トリフルオロフェニル）メトキシ基、1-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-
1-（2, 4-ジクロロフェニル）メトキシ基等のフェニル基が1~2個置換したC 1~6アルコキシ基（フェニル環上には、シアノ基、フェニル基、前記例示のC 1~6アルコ
キシカルボニル基、フェノキシ基、前記例示のC 1~6アルキルチオ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アル
コキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

20

30

40

【0392】

フェニルC 2~6アルケニルオキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換又はハ
50
ロゲン原子、ハロゲンC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基から選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されたフェニル基と炭素

50

数2から6で少なくとも二重結合を1～3個有するアルケニル基から構成される基である。フェニルC2～6アルケニルオキシ基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC2～6アルケニルオキシ基としては、例えば、2-フェニルビニルオキシ基、3-フェニル-2-プロペニルオキシ基（慣用名：シンナミルオキシ基）、4-フェニル-2-ブテニルオキシ基、4-フェニル-3-ブテニルオキシ基、4-フェニル-1,3-ブタジエニルオキシ基、5-フェニル-1,3,5-ヘキサトリエニルオキシ基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,3-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,5-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,3,4-トリクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,4,6-トリクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,4-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,3-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,6-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニルオキシ基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニルオキシ基、5-(4-クロロフェニル)-2-ペンテニルオキシ基、5

10

20

30

40

50

ー（４－クロロフェニル）－４－ペンテニルオキシ基、５－（４－クロロフェニル）－３－ペンテニルオキシ基、６－（４－クロロフェニル）－５－ヘキセニルオキシ基、６－（４－クロロフェニル）－４－ヘキセニルオキシ基、６－（４－クロロフェニル）－３－ヘキセニルオキシ基、６－（４－クロロフェニル）－３－ヘキセニルオキシ基等を挙げることができる。

【０３９３】

置換基として水酸基を有することのあるＣ１～６アルキル基としては、前記Ｃ１～６アルキル基に加えて、ヒドロキシメチル基、２－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシエチル基、３－ヒドロキシプロピル基、２，３－ジヒドロキシプロピル基、４－ヒドロキシブチル基、３，４－ジヒドロキシブチル基、１，１－ジメチル－２－ヒドロキシエチル基、５－ヒドロキシペンチル基、６－ヒドロキシヘキシル基、２－メチル－３－ヒドロキシプロピル基、２，３，４－トリヒドロキシブチル基等の水酸基を１～３個有することのあるＣ１～６の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

【０３９４】

Ｃ１～６アルカノイル基としては、炭素原子数１～６で構成される脂肪族カルボン酸から誘導される基であって、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、ペンタノイル基、ヘキサノイル基等が挙げられる。

【０３９５】

フェニルＣ１～６アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基が１～５個、好ましくは１～３個置換していてもよいフェニルＣ１～６アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、２－フェニルエトキシカルボニル基、３－フェニルプロポキシカルボニル基、２－フェニルプロポキシカルボニル基、４－フェニルブトキシカルボニル基、５－フェニルペントキシカルボニル基、４－フェニルペントキシカルボニル基、６－フェニルヘキシルオキシカルボニル基、２－フルオロベンジルオキシカルボニル基、３－フルオロベンジルオキシカルボニル基、４－フルオロベンジルオキシカルボニル基、２－（２－フルオロフェニル）エトキシカルボニル基、２－（３－フルオロフェニル）エトキシカルボニル基、２－（４－フルオロフェニル）エトキシカルボニル基、２－クロロベンジルオキシカルボニル基、３－クロロベンジルオキシカルボニル基、４－クロロベンジルオキシカルボニル基、２－フルオロ－４－プロモベンジルオキシカルボニル基、４－クロロ－３－フルオロベンジルオキシカルボニル基、２，３，４－トリクロロベンジルオキシカルボニル基、３，４，５－トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、２，３，４，５，６－ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、２，４，６－トリクロロベンジルオキシカルボニル基、４－イソプロピルベンジルオキシカルボニル基、４－ｎ－ブチルベンジルオキシカルボニル基、４－メチルベンジルオキシカルボニル基、２－メチルベンジルオキシカルボニル基、３－メチルベンジルオキシカルボニル基、２，４－ジメチルベンジルオキシカルボニル基、２，３－ジメチルベンジルオキシカルボニル基、２，６－ジメチルベンジルオキシカルボニル基、３，５－ジメチルベンジルオキシカルボニル基、２，５－ジメチルベンジルオキシカルボニル基、２，４，６－トリメチルベンジルオキシカルボニル基、３，５－ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、４－イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、４－ｎ－ブトキシベンジルオキシカルボニル基、４－メトキシベンジルオキシカルボニル基、２－メトキシベンジルオキシカルボニル基、３－メトキシベンジルオキシカルボニル基、２，４－ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、２，３－ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、２，６－ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、３，５－ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、２，５－ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、２，４，６－トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、３，５－ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボ

10

20

30

40

50

ニル基、2-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0396】

置換基としてC1~6アルカノイル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、n-ペンチルアミノ基、n-ヘキシルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジ-n-プロピルアミノ基、ジ-n-ブチルアミノ基、ジ-n-ペンチルアミノ基、ジ-n-ヘキシルアミノ基、N-メチル-N-エチルアミノ基、N-エチル-N-n-プロピルアミノ基、N-メチル-N-n-ブチルアミノ基、N-メチル-N-n-ヘキシルアミノ基、N-メチル-N-アセチルアミノ基、アセチルアミノ基、ホルミルアミノ基、n-プロピオニルアミノ基、n-ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、n-ペンタノイルアミノ基、n-ヘキサノイルアミノ基、N-エチル-N-アセチルアミノ基等の置換基としてC1~6アルカノイル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ基を挙げることができる。

【0397】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-3-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-4-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-7-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-8-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-4-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-7-キノリル

基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-8-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-3-キノリル基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0398】

C1~6アルキルスルホニル基とは、炭素数1ないしは6個で構成されるアルキル基とスルホニル基で構成される基であって、例えば、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、n-プロパンスルホニル基、n-ブタンスルホニル基、n-ペンタンスルホニル基、n-ヘキサンスルホニル基等を挙げることができる。

10

【0399】

C3~8シクロアルキル基とは、構成する炭素原子数が3個ないしは8個の3員環、4員環、5員環、6員環、7員環及び8員環の環状アルキル基であって、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、3, 4-ジメチルシクロペンチル基、3, 3-ジメチルシクロヘキシル基等を挙げることができる。

【0400】

C1~6アルキルチオ基とは、炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキルチオ基であって、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、n-ブチルチオ基、イソブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基、3-メチルペンチルチオ基等を挙げることができる。

20

【0401】

フェニルスルホニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基及びからなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、無置換のフェニルスルホニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びからなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェニルスルホニル基であって、例えば、フェニルスルホニル基、2-フルオロフェニルスルホニル基、3-フルオロフェニルスルホニル基、4-フルオロフェニルスルホニル基、2-クロロフェニルスルホニル基、3-クロロフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルスルホニル基、2-ブロモフェニルスルホニル基、3-ブロモフェニルスルホニル基、4-ブロモフェニルスルホニル基、2-ヨードフェニルスルホニル基、3-ヨードフェニルスルホニル基、4-ヨードフェニルスルホニル基、2, 3-ジフルオロフェニルスルホニル基、3, 4-ジフルオロフェニルスルホニル基、3, 5-ジフルオロフェニルスルホニル基、2, 4-ジフルオロフェニルスルホニル基、2, 6-ジフルオロフェニルスルホニル基、2, 3-ジクロロフェニルスルホニル基、3, 4-ジクロロフェニルスルホニル基、3, 5-ジクロロフェニルスルホニル基、2, 4-ジクロロフェニルスルホニル基、2, 6-ジクロロフェニルスルホニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルスルホニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルスルホニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニルスルホニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニルスルホニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニルスルホニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルスルホニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニル基、4-n-ブチルフェニルスルホニル基、2, 4-ジメチルフェニルスルホニル基、2, 3-ジメチルフェニルスルホニル基、2, 6-ジメチルフェニルスルホニル基、3, 5-ジメチルフェニルスルホニル基、2, 5-ジメチルフェニルスルホニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニルスルホニル基、4-n-ブトキシフェニルスルホニル基、2, 4-ジメトキシフェニルスルホニル基、2, 3-ジメトキシフェニルスルホニル基、2, 6-ジメトキシ

30

40

50

シフェニルスルホニル基、3, 5-ジメトキシシフェニルスルホニル基、2, 5-ジメトキシシフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリメトキシシフェニルスルホニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-メトキシシフェニルスルホニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、3-メチル-4-フルオロフェニルスルホニル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-メチルフェニルスルホニル基、3-メチルフェニルスルホニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、2-メチル-3-クロロフェニルスルホニル基、3-メチル-4-クロロフェニルスルホニル基、2-クロロ-4-メチルフェニルスルホニル基、2-メチル-3-フルオロフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、4-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、2-イソプロピルフェニルスルホニル基、3-イソプロピルフェニルスルホニル基、4-イソプロピルフェニルスルホニル基、2-tert-ブチルフェニルスルホニル基、3-tert-ブチルフェニルスルホニル基、4-tert-ブチルフェニルスルホニル基、2-sec-ブチルフェニルスルホニル基、3-sec-ブチルフェニルスルホニル基、4-sec-ブチルフェニルスルホニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、4-n-ペンチルフェニルスルホニル基、4-n-ヘキシルフェニルスルホニル基、2-メトキシシフェニルスルホニル基、3-メトキシシフェニルスルホニル基、4-メトキシシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-メトキシシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-3-メトキシシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-4-メトキシシフェニルスルホニル基、2, 6-ジメトキシシフェニルスルホニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、3-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、4-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシシフェニルスルホニル基、2-ペンタフルオロエトキシシフェニルスルホニル基、3-ペンタフルオロエトキシシフェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエトキシシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシシフェニルスルホニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシシフェニルスルホニル基、2-イソプロポキシシフェニルスルホニル基、3-イソプロポキシシフェニルスルホニル基、4-イソプロポキシシフェニルスルホニル基、2-tert-ブトキシシフェニルスルホニル基、3-tert-ブトキシシフェニルスルホニル基、4-tert-ブトキシシフェニルスルホニル基、2-sec-ブトキシシフェニルスルホニル基、3-sec-ブトキシシフェニルスルホニル基、4-sec-ブトキシシフェニルスルホニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシシフェニルスルホニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシシフェニルスルホニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシシフェニルスルホニル基、4-n-ペントキシシフェニルスルホニル基、4-n-ヘキシロキシシフェニルスルホニル基等を挙げることができる。

【0402】

置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基置換C1~6アルコキシ基としては、例えば、アミノメトキシ基、2-アミノエトキシ基、1-アミノエトキシ基、3-アミノプロポキシ基、4-アミノブトキシ基、5-アミノペンチルオキシ基、6-アミノヘキシロキシ基、2-メチル-3-アミノプロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-アミノエトキシ基、エチルアミノメトキシ基、1-(プロピルアミノ)エトキシ基、2-(メチルアミノ)エトキシ基、3-(イソプロピルアミノ)プロポキシ基、4-(n-

10

20

30

40

50

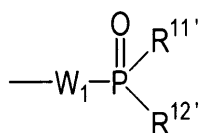
ブチルアミノ) ブトキシ基、5-(n-ペンチルアミノ) ペンチルオキシ基、6-(n-ヘキシルアミノ) ヘキシルオキシ基、ジメチルアミノメトキシ基、3-ジメチルアミノプロポキシ基、(N-エチル-N-プロピルアミノ) メトキシ基、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ) エトキシ基等の置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ-C1~6アルコキシ基を挙げることができる。

【0403】

フェニル基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基、置換基としてC1~6アルカノイル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が少なくとも1個置換していてもよい)、C1~6アルキルスルホニル基、C3~8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C1~6アルキルチオ基、フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、水酸基置換C1~6アルキル基及び基

【0404】

【化32】

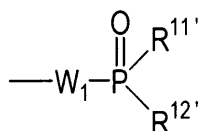


【0405】

(W₁はC1~6アルキレン基を示す。R^{11'}及びR^{12'}は、同一又は異なって、C1~6アルコキシ基を示す。) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、前記のハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基、置換基としてC1~6アルカノイル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が1~2個置換していてもよい)、C1~6アルキルスルホニル基、C3~8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C1~6アルキルチオ基、フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)、水酸基置換C1~6アルキル基及び基

【0406】

【化33】



【0407】

(式中、 W_1 はC 1～6アルキレン基を示す。 $R^{11'}$ 及び $R^{12'}$ は、同一又は異なって、C 1～6アルコキシ基を示す。)からなる群より選ばれた基がフェニル環の2～6位に、1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよいフェニル基を例示できる。

【0408】

水酸基置換C 1～6アルキル基としては、例えば、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、2, 3-ジヒドロキシプロピル基、4-ヒドロキシブチル基、3, 4-ジヒドロキシブチル基、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル基、5-ヒドロキシペンチル基、6-ヒドロキシヘキシル基、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基、2, 3, 4-トリヒドロキシブチル基等の水酸基を1～3個有するC 1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

10

【0409】

ハロゲン置換又は未置換のC 1～10アルコキシ基としては、例えば、前記例示のハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基に加えて、ヘプチルオキシ基、オクチルオキシ基、ノニルオキシ基、デシルオキシ基、7-フルオロヘプチルオキシ基、7, 7, 6-トリフルオロヘプチルオキシ基、7, 7, 7, 6, 6, 5, 5-ヘプタフルオロヘプチルオキシ基、8-クロロオクチルオキシ基、8, 8-ジブロモオクチルオキシ基、6, 7, 8-トリフルオロオクチルオキシ基、8, 8, 8, 7, 7, 6, 6-ヘプタフルオロオクチルオキシ基、8, 8, 8, 7, 7-ペンタクロロオクチルオキシ基、9-ヨードノニルオキシ基、9, 9-ジブロモノニルオキシ基、9, 9, 9, 8, 8-ペンタクロロノニルオキシ基、9, 9, 9, 8, 8, 7, 7-ヘプタフルオロノニルオキシ基、10-クロロデシルオキシ基、10, 10-ジブロモデシルオキシ基、10, 10, 10, 9-テトラクロロデシルオキシ基、10, 10, 10, 9, 9, 9, 8, 8-ヘプタフルオロデシルオキシ基等のC 1～10のアルコキシ基及びハロゲン原子が1～7個置換したC 1～10アルコキシ基を挙げることができる。

20

【0410】

フェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、置換基としてC 1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェニルC 1～6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にC 1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選択された基が1～5個、好ましくは1～3個置換している基(置換基がC 1～4アルキレンジオキシ基の場合は、1～2個置換しているのがよい)であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2, 3-メチレンジオキシベンジル基、3, 4-メチレンジオキシベンジル基、3-フェニルベンジル基、2-フェニルベンジル基、4-フェニルベンジル基、3, 4-ジフェニルベンジル基、2, 4, 6-トリフェニルベンジル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-エチルベンジル基、4-sec-ブチルベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル

30

40

50

基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベン
 ジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジ
 トリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-
 イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-tert-ブトキシベン
 ジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、
 2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベン
 ジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-
 トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロ
 ポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオ
 ロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブromo-3-トリフル
 オロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチル
 ベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基
 、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-ト
 リフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオ
 ロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエ
 トキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメ
 チルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-
 トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)
 エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオ
 ロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基
 、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエ
 トキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-
 (3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニ
 ル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリ
 フルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)
 プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペン
 タフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)
 ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフル
 オロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル
 基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチ
 ルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、4-
 (4-クロロフェニル)ブチル基等を挙げることができる。

【0411】

フェニルC 1~6アルキル基〔フェニル環上には、置換基としてC 1~4アルキレンジ
 オキシ基、フェニル基、基-N(R^{11A'})R^{12A'}(R^{11A'}及びR^{12A'}は、同一又は異
 なって水素原子、C 1~6アルキル基又はフェニル基を示す。R^{11A'}及びR^{12A'}は、隣
 接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく
 互いに結合して5~7員の飽和複素環を形成してもよい)、フェノキシ基、フェニルC 1
 ~6アルコキシ基、置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基置換C
 1~6アルコキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及び
 ハロゲン置換又は未置換のC 1~10アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくと
 も1種が置換していてもよい〕としては、例えば、前記例示のフェニルC 1~6アルキル
 基(フェニル環上には、置換基としてC 1~4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロ
 ゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の
 C 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい
)に加えて、4-フェノキシベンジル基、3-フェノキシベンジル基、2-フェノキシベン
 ジル基、2, 4-ジフェノキシベンジル基、2, 4, 6-トリフェノキシベンジル基、
 4-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、2-ベンジルオキシベン
 ジル基、3, 4-ジベンジルオキシベンジル基、3, 4, 5-トリベンジルオキシベン
 ジル基、4-オクチルオキシベンジル基、3-ノニルオキシベンジル基、2-デシルオキ

10

20

30

40

50

シベンジル基、4-ヘプチルオキシベンジル基、2, 4-ジオクチルオキシベンジル基、3, 4, 6-トリオクチルオキシベンジル基、4-(8, 8, 8-トリフルオロオクチルオキシ)ベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、4-ジフェニルアミノベンジル基、4-(3-ジメチルアミノプロポキシ)ベンジル基、4-ジ-n-ブチルアミノベンジル基、3-(N-メチル-N-エチルアミノ)ベンジル基、2-(N-メチル-N-フェニルアミノ)ベンジル基、2, 4, 6-メチルアミノベンジル基、3-(3-ジメチルアミノプロポキシ)ベンジル基、2, 4-ジ-n-ブチルアミノベンジル基、4-(2-メチルアミノエトキシ)ベンジル基、2-(4-メチルアミノブトキシ)ベンジル基、4-(2-ジメチルアミノエトキシ)ベンジル基、2, 3-ジエチルアミノメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリ(2-ジメチルアミノエトキシ)ベンジル基、2-フェノキシ-3-フェニルベンジル基、4-オクチルオキシ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-ベンジルオキシ-2-ジメチルアミノベンジル、4-(1-ピロリジニル)ベンジル基、4-(1-ピペリジル)ベンジル基等のフェニルC 1~6アルキル基〔フェニル環上には、置換基としてC 1~4アルキレンジオキシ基、フェニル基、基-N(R^{11A'})R^{12A'}(R^{11A'}及びR^{12A'}は、同一又は異なって水素原子、前記例示のC 1~6アルキル基又はフェニル基を示す。後記例示のR^{11A'}及びR^{12A'}は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~7員の飽和複素環を形成してもよい)、フェノキシ基、前記例示のフェニルC 1~6アルコキシ基、前記例示の置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基置換C 1~6アルコキシ基、前記例示のハロゲン原子、前記例示のハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及び前記例示のハロゲン置換又は未置換のC 1~10アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。置換基がC 1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~2個置換しているのがよい)を挙げることができる。

【0412】

ベンゾフリルC 1~6アルキル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)ベンゾフリルメチル基、1-(2-ベンゾフリル)エチル基、2-(3-ベンゾフリル)エチル基、3-(4-ベンゾフリル)プロピル基、2-(5-ベンゾフリル)プロピル基、2-(6-ベンゾフリル)プロピル基、4-(7-ベンゾフリル)ブチル基、5-(2-ベンゾフリル)ペンチル基、4-(3-ベンゾフリル)ペンチル基、6-(4-ベンゾフリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(5-ベンゾフリル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(6-ベンゾフリル)エチル基、(5-クロロ-2-ベンゾフリル)メチル基、2-(5-トリフルオロメトキシベンゾフリル)メチル基、2-(5-トリフルオロメチルベンゾフリル)メチル基、(6-トリフルオロメチルベンゾフリル)メチル基、2-(5-メチルベンゾフリル)メチル基、2-(5-メトキシベンゾフリル)メチル基、(5, 6-ジブromo-2-ベンゾフリル)メチル基、(3, 5, 6-トリフルオロ-2-ベンゾフリル)メチル基、2-(5, 6-ジメチルベンゾフリル)メチル基、2-(5, 7-ジメトキシベンゾフリル)メチル基、2-(5, 6, 7-トリメチルベンゾフリル)メチル基、2-(3, 5, 6-トリメトキシベンゾフリル)メチル基、2-(5-トリフルオロメチル-6-クロロベンゾフリル)メチル基、2-(5-トリフルオロメトキシ-6-メトキシベンゾフリル)メチル基等のベンゾフリルC 1~6アルキル基〔ベンゾフラン環上には、前記例示のハロゲン原子、前記例示のハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及び前記例示のハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0413】

フェニルスルホニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基及びC 1~4アル

10

20

30

40

50

キレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]とは、無置換のフェニルスルホニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びC1～4アルキレンジオキシ基からなる群より選択された置換基を1～5個、好ましくは1～3個有するフェニルスルホニル基（置換基がC1～4アルキレンジオキシ基の場合は、1～2個置換しているのがよい）であって、例えば、フェニルスルホニル基、2-フルオロフェニルスルホニル基、3-フルオロフェニルスルホニル基、4-フルオロフェニルスルホニル基、2-クロロフェニルスルホニル基、3-クロロフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルスルホニル基、2-ブロモフェニルスルホニル基、3-ブロモフェニルスルホニル基、4-ブロモフェニルスルホニル基、2-ヨードフェニルスルホニル基、3-ヨードフェニルスルホニル基、4-ヨードフェニルスルホニル基、2,3-ジフルオロフェニルスルホニル基、3,4-ジフルオロフェニルスルホニル基、3,5-ジフルオロフェニルスルホニル基、2,4-ジフルオロフェニルスルホニル基、2,6-ジフルオロフェニルスルホニル基、2,3-ジクロロフェニルスルホニル基、3,4-ジクロロフェニルスルホニル基、3,5-ジクロロフェニルスルホニル基、2,4-ジクロロフェニルスルホニル基、2,6-ジクロロフェニルスルホニル基、3,4,5-トリフルオロフェニルスルホニル基、3,4,5-トリクロロフェニルスルホニル基、2,4,6-トリフルオロフェニルスルホニル基、2,4,6-トリクロロフェニルスルホニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニルスルホニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニルスルホニル基、2,3,4-トリクロロフェニルスルホニル基、3,4,5-トリフルオロフェニルスルホニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルスルホニル基、2,4,6-トリメチルフェニルスルホニル基、4-n-ブチルフェニルスルホニル基、2,4-ジメチルフェニルスルホニル基、2,3-ジメチルフェニルスルホニル基、2,6-ジメチルフェニルスルホニル基、3,5-ジメチルフェニルスルホニル基、2,5-ジメチルフェニルスルホニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニルスルホニル基、4-n-ブトキシフェニルスルホニル基、2,4-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,3-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,6-ジメトキシフェニルスルホニル基、3,5-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,5-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,4,6-トリメトキシフェニルスルホニル基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-メチル-4-フルオロフェニルスルホニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-メチルフェニルスルホニル基、3-メチルフェニルスルホニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、2-メチル-3-クロロフェニルスルホニル基、3-メチル-4-クロロフェニルスルホニル基、2-クロロ-4-メチルフェニルスルホニル基、2-メチル-3-フルオロフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、4-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、2-イソプロピルフェニルスルホニル基、3-イソプロピルフェニルスルホニル基、4-イソプロピルフェニルスルホニル基、2-tert-ブチルフェニルスルホニル基、3-tert-ブチルフェニルスルホニル基、4-tert-ブチルフェニルスルホニル基、2-sec-ブチルフェニルスルホニル基、3-sec-ブチルフェニルスルホニル基、4-sec-ブチルフェニルスルホニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、4-n-ペンチルフェニルスルホニル基、4-n-ヘキシルフェニルスルホニル基、2-メトキシフェニルスルホニル基、3-メトキシフェニルスルホニル基、4-メトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルスルホニル基、2,3,4-トリフルオロフェニルスルホニル

10

20

30

40

50

基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、2-イソプロポキシフェニルスルホニル基、3-イソプロポキシフェニルスルホニル基、4-イソプロポキシフェニルスルホニル基、2-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、3-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、4-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、2-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、3-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、4-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、4-n-ペントキシフェニルスルホニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルスルホニル基、2, 3-メチレンジオキシフェニルスルホニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニルスルホニル基等を挙げることができる。

【0414】

フェノキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してもよい〕としては、例えば、フェノキシカルボニル基、2-フルオロフェノキシカルボニル基、3-フルオロフェノキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシカルボニル基、4-フルオロフェノキシカルボニル基、2-クロロフェノキシカルボニル基、3-クロロフェノキシカルボニル基、4-クロロフェノキシカルボニル基、2, 3-ジクロロフェノキシカルボニル基、3, 4-ジクロロフェノキシカルボニル基、3, 5-ジクロロフェノキシカルボニル基、2-ブロモフェノキシカルボニル基、3-ブロモフェノキシカルボニル基、4-ブロモフェノキシカルボニル基、2-メチルフェノキシカルボニル基、3-メチルフェノキシカルボニル基、4-メチルフェノキシカルボニル基、2-エチルフェノキシカルボニル基、3-エチルフェノキシカルボニル基、4-エチルフェノキシカルボニル基、4-n-プロピルフェノキシカルボニル基、4-tert-ブチルフェノキシカルボニル基、4-n-ブチルフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメチルフェノキシカルボニル基、3, 4, 5-トリメチルフェノキシカルボニル基、4-n-ペンチルフェノキシカルボニル基、4-n-ヘキシルフェノキシカルボニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシカルボニル基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシカルボニル基、4-イソプロピルフェノキシカルボニル基、4-n-ブチルフェノキシカルボニル基、2, 4-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 6-ジメチルフェノキシカルボニル基、3, 5-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 5-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 6-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 5-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-メチル-4-フルオ

ロフェノキシカルボニル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエチルシフェノキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、2-メトキシフェノキシカルボニル基、3-メトキシフェノキシカルボニル基、4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-エトキシフェノキシカルボニル基、3-エトキシフェノキシカルボニル基、4-エトキシフェノキシカルボニル基、4-n-プロポキシフェノキシカルボニル基、4-tert-ブトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ペントキシフェノキシカルボニル基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基等のフェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換してもよい）を挙げることができる。

10

【0415】

C1~6アルコキシ置換C1~6アルキル基とは、上記C1~6アルキル基とC1~6アルコキシ基で構成される基であって、例えば、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、4-メトキシブチル基、5-メトキシペンチル基、6-メトキシヘキシル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、3-エトキシプロピル基、2-イソプロポキシエチル基、tert-ブトキシメチル基、ペンチルオキシメチル基、ヘキシルオキシメチル基、2-(tert-ブトキシ)エチル基、3-(tert-ブトキシ)プロピル基、6-(tert-ブトキシ)ヘキシル基、4-(tert-ブトキシ)ブチル基等を挙げることができる。

20

【0416】

C2~6アルケニル基としては、例えば、ビニル基、2-プロペニル基、3-ブテニル基、2-ブテニル基、4-ペンテニル基、3-ペンテニル基、5-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

30

【0417】

C1~6アルコキシ置換C2~6アルカノイル基とは、上記C1~6アルキル基とC2~6アルカノイル基で構成される基であって、例えば、2-メトキシアセチル基、2-メトキシプロピオニル基、3-メトキシプロピオニル基、4-メトキシブチリル基、5-メトキシペンタノイル基、6-メトキシヘキサノイル基、2-エトキシアセチル基、2-エトキシプロピオニル基、3-エトキシプロピオニル基、2-イソプロポキシプロピオニル基、2-(tert-ブトキシ)アセチル基、2-ペンチルオキシアセチル基、2-ヘキシルオキシアセチル基、2-(tert-ブトキシ)プロピオニル基、3-(tert-ブトキシ)プロピオニル基、6-(tert-ブトキシ)ヘキサノイル基、4-(tert-ブトキシ)ブチリル基等を挙げることができる。

40

【0418】

C3~8シクロアルキル置換C1~6アルキル基とは、炭素数3乃至8個の環状アルキル基と炭素数1乃至6個のアルキル基で構成される基であって、例えば、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、3-シクロプロピルプロピル基、4-シクロプロピルブチル基、5-シクロプロピルペンチル基、6-シクロプロピルヘキシル基、シクロブチルメチル基、2-シクロブチルエチル基、3-シクロブチルプロピル基、4-シクロブチルブチル基、5-シクロブチルペンチル基、6-シクロブチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、3-シクロペンチルプロピル基、4-シクロペンチルブチル基、5-シクロペンチルペンチル基、6-シクロペンチルヘキシル

50

基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、3-シクロヘキシルプロピル基、4-シクロヘキシルブチル基、5-シクロヘキシルペンチル基、6-シクロヘキシルヘキシル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロヘプチルエチル基、3-シクロヘプチルプロピル基、4-シクロヘプチルブチル基、5-シクロヘプチルペンチル基、6-シクロヘプチルヘキシル基、シクロオクチルメチル基、2-シクロオクチルエチル基、3-シクロオクチルプロピル基、4-シクロオクチルブチル基、5-シクロオクチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基等を挙げることができる。

【0419】

ピリジルC1~6アルキル基としては、例えば、2-ピリジルメチル基、2-(3-ピリジル)エチル基、1-(4-ピリジル)エチル基、3-(2-ピリジル)プロピル基、4-(3-ピリジル)ブチル基、5-(4-ピリジル)ペンチル基、6-(2-ピリジル)ヘキシル基、2-メチル-3-(3-ピリジル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-ピリジル)エチル等を挙げることができる。

【0420】

イミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、4-イミダゾリルメチル基、2-(4-イミダゾリル)エチル基、3-(2-イミダゾリル)プロピル基、4-(1-イミダゾリル)ブチル基、5-(5-イミダゾリル)ペンチル基、6-(4-イミダゾリル)ヘキシル基、2,5-ジフェニル-1-イミダゾリルメチル基、2-フェニル-4-イミダゾリルメチル基、2-(2-フェニル-4-イミダゾリル)エチル基、3-(2-フェニル-4-イミダゾリル)プロピル基、4-(2-フェニル-5-イミダゾリル)ブチル基、5-(2-フェニル-4-イミダゾリル)ペンチル基、6-(2-フェニル-4-イミダゾリル)ヘキシル基等のイミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0421】

1,2,3,4-テトラヒドロキノリル基(1,2,3,4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-2-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-3-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-4-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-5-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-4-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-3-キノリル基、2-メチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4-エチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1,5,6-トリメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1,4,5,6-テトラメチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1-プロピル-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル基、5-n-ペンチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-4-キノリル基、6-n-ヘキシル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリル基、7-tert-ブチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、8-n-ペンチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、1-n-ヘキシル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、1-メチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-5-キノリル基、3-エチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-3-キノリル基等の1,2,3,4-テ

10

20

30

40

50

トラヒドロキノリル基（1，2，3，4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～5個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0422】

置換基としてC1～6アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、n-ペンチルアミノ基、n-ヘキシルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジ-n-プロピルアミノ基、ジ-n-ブチルアミノ基、ジ-n-ペンチルアミノ基、ジ-n-ヘキシルアミノ基、N-メチル-N-エチルアミノ基、N-エチル-N-n-プロピルアミノ基、N-メチル-N-n-ブチルアミノ基、N-メチル-N-n-ヘキシルアミノ基等の置換基としてC1～6アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基を挙げることができる。

10

【0423】

シアノ置換C1～6アルキル基としては、例えば、シアノメチル基、2-シアノエチル基、1-シアノエチル基、3-シアノプロピル基、4-シアノブチル基、5-シアノペンチル基、6-シアノヘキシル基、2-メチル-3-シアノプロピル基、1，1-ジメチル-2-シアノエチル基等を挙げることができる。

【0424】

フリル置換C1～6アルキル基としては、例えば、2-フリルメチル基、3-フリルメチル基、2-（2-フリル）エチル基、1-（3-フリル）エチル基、3-（2-フリル）プロピル基、3-（3-フリル）プロピル基、4-（2-フリル）ブチル基、4-（3-フリル）ブチル基、5-（2-フリル）ペンチル基、5-（3-フリル）ペンチル基、6-（2-フリル）ヘキシル基、6-（3-フリル）ヘキシル基等を挙げることができる。

20

【0425】

ピペラジニル置換C1～6アルキル基〔ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕としては、例えば、1-ピペラジニルメチル基、2-（2-ピペラジニル）エチル基、1-（1-ピペラジニル）エチル基、3-（1-ピペラジニル）プロピル基、4-（1-ピペラジニル）ブチル基、5-（2-ピペラジニル）ペンチル基、6-（1-ピペラジニル）ヘキシル基、2-（4-フェニル-1-ピペラジニル）エチル基、3-（4-フェニル-1-ピペラジニル）プロピル基、4-（4-フェニル-1-ピペラジニル）ブチル基、5-（4-フェニル-1-ピペラジニル）ペンチル基、6-（4-フェニル-1-ピペラジニル）ヘキシル基、2-〔4-（2-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕エチル基、3-〔4-（2-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕プロピル基、4-〔4-（2，3-ジフルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕ブチル基、5-〔4-（2-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕ペンチル基、6-〔4-（4-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕ヘキシル基、3-〔4-（3-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕プロピル基、4-〔4-（3-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕ブチル基、5-〔4-（3-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕ペンチル基、3-〔4-（4-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕プロピル基、4-〔4-（4-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕ブチル基、5-〔4-（4-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕ペンチル基、6-〔4-（4-フルオロフェニル）-1-ピペラジニル〕ヘキシル基、2-〔4-（2，3-ジクロロフェニル）-1-ピペラジニル〕エチル基、3-〔4-（2-クロロフェニル）-1-ピペラジニル〕プロピル基、4-〔4-（2-クロロフェニル）-1-ピペラジニル〕ブチル基、5-〔4-（2，4，6-トリクロロフェニル）-1-ピペラジニル〕ペンチル基、6-〔4-（2-クロロフェニル）-1-ピペラジニル〕ヘキシル基、2-〔4-（3-クロロフェニル）-1-ピペラジニル〕エチル基、3-〔4-

30

40

50

(3-クロロフェニル)-1-ピペラジニル] プロピル基、4-[4-(3-クロロフェニル)-1-ピペラジニル] ブチル基、5-[4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-1-ピペラジニル] ペンチル基、6-[4-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-1-ピペラジニル] ヘキシル基、2-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル] エチル基、3-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル] プロピル基、4-[4-(4-クロロ-3-メトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ブチル基、5-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル] ペンチル基、6-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル] ヘキシル基、2-[4-(2-メチルフェニル)-1-ピペラジニル] メチル基、2-[4-(2, 4-ジメチルフェニル)-1-ピペラジニル] メチル基、2-[4-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-ピペラジニル] メチル基、2-[4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] エチル基、3-[4-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] プロピル基、4-[4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] ブチル基、5-[4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] ペンチル基、6-[4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] ヘキシル基、3-[4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] プロピル基、4-[4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] ブチル基、5-[4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] ペンチル基、3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] プロピル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] ペンチル基、6-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル] ヘキシル基、2-[4-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] エチル基、2-[4-(2-メトキシフェニル)-1-ピペラジニル] メチル基、2-[4-(2, 4-ジメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] メチル基、2-[4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] メチル基、3-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] プロピル基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ブチル基、5-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ペンチル基、6-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ヘキシル基、3-[4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] プロピル基、4-[4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ブチル基、5-[4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ペンチル基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] プロピル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ペンチル基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル] ヘキシル基、2, 4-ジフェニル-1-ピペラジニルメチル基、(2, 4, 5-トリフェニル-1-ピペラジニル)メチル基等のピペラジニル置換C 1~6アルキル基〔ピペラジン環上には、置換基として1~3個のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい〕が挙げられる。

【0426】

R^9 ' 及び R^{10} '、 R^{11A} ' 及び R^{12A} ' もしくは R^{11B} ' 及び R^{12B} ' が、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する5~7員の飽和複素環基としては、例えば、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、モルホリノ基、チオモルホリノ基、ホモピペラジニル基等を挙げることができる。

【0427】

R^9 ' 及び R^{10} ' が、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子

10

20

30

40

50

を介し又は介することなく互いに結合して形成する 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基、イソインドリル基又は前記例示の 5~7 員環の飽和の複素環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基、フェニル基[フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、ベンゾイル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、ピリジル C 1~6 アルキル基、C 3~8 シクロアルキル基、フェニル C 1~6 アルキル基[フェニル環上には、C 1~4 アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、ピペリジル C 1~6 アルキル基、ピペリジル基、フェニル C 1~6 アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、置換基としてフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、C 1~6 アルキル基及びフェニル C 1~6 アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよいアミノ基、ベンゾオキサゾリル基及びベンゾイミダゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよく、このような置換基としては、前記及び後記で例示したハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基、フェニル基[フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい]、ベンゾイル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい]、ピリジル C 1~6 アルキル基、C 3~8 シクロアルキル基、フェニル C 1~6 アルキル基[フェニル環上には、C 1~4 アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい]、ピペリジル C 1~6 アルキル基、ピペリジル基、フェニル C 1~6 アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい]、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい]、置換基としてフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい]、C 1~6 アルキル基及びフェニル C 1~6 アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が 1~2 個置換していても

10

20

30

40

50

よいアミノ基、ベンゾオキサゾリル基及びベンゾイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

【0428】

$R^{11B'}$ 及び $R^{12B'}$ が、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する前記例示の5～7員環の飽和の複素環上には、C1～6アルコキシカルボニル基及びアミノ基〔アミノ基上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよく、このような置換基としては、前記及び後記で例示したC1～6アルコキシカルボニル基及びアミノ基〔アミノ基上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が挙げられ、これら置換基は複素環上に1～3個置換していてもよい。

【0429】

フェニル基〔フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、無置換のフェニル基並びに上記定義されたフェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシからなる群より選択された置換基を1～5個、好ましくは1～3個有するフェニル基であって、例えば、フェニル基、2-フェニルフェニル基、3-フェニルフェニル基、4-フェニルフェニル基、2,3-ジフェニルフェニル、2,4,6-トリフェニルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,4,6-トリフルオロフェニル基、2,4,6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2,3,4-トリクロロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2,4,6-トリメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2,4-ジメチルフェニル基、2,3-ジメチルフェニル基、2,6-ジメチルフェニル基、3,5-ジメチルフェニル基、2,5-ジメチルフェニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2,4-ジメトキシフェニル基、2,3-ジメトキシフェニル基、2,6-ジメトキシフェニル基、3,5-ジメトキシフェニル基、2,5-ジメトキシフェニル基、2,4,6-トリメトキシフェニル基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペ

10

20

30

40

50

ンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ペンチルフェニル基、4-n-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることができる。

【0430】

フェニルC1~6アルコキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニルC1~6アルコキシ基であって、例えば、ベンジルオキシ基、2-フェニルエトキシ基、3-フェニルプロポキシ基、2-フェニルプロポキシ基、4-フェニルブトキシ基、5-フェニルペントキシ基、4-フェニルペントキシ基、6-フェニルヘキシルオキシ基、2-フルオロベンジルオキシ基、3-フルオロベンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシ基、2-(3-フルオロフェニル)エトキシ基、2-(4-フルオロフェニル)エトキシ基、2-クロロベンジルオキシ基、3-クロロベンジルオキシ基、4-クロロベンジルオキシ基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルオキシ基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシ基、2-クロロ-4-フルオロベンジルオキシ基、3, 4-ジクロロベンジルオキシ基、3, 5-ジクロロベンジルオキシ基、2, 3-ジクロロベンジルオキシ基、2, 5-ジクロロベンジルオキシ基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシ基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシ基、4-イソプロピルベンジルオキシ基、4-n-ブチルベンジルオキシ基、4-メチルベンジルオキシ基、2-メチルベンジルオキシ基、3-メチルベンジルオキシ基、2, 4-ジメチルベンジルオキシ基、2, 3-ジメチルベンジルオキシ基、2, 6-ジメチルベンジルオキシ基、3, 5-ジメチルベンジルオキシ基、2, 5-ジメチルベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ基、4-エチルベンジルオキシ基、4-イソプロピルベンジルオキシ基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシ基、4-イソプロポキシベンジルオキシ基、4-n-ブトキ

シベンジルオキシ基、4-メトキシベンジルオキシ基、2-メトキシベンジルオキシ基、3-メトキシベンジルオキシ基、2,4-ジメトキシベンジルオキシ基、2,3-ジメトキシベンジルオキシ基、2,6-ジメトキシベンジルオキシ基、3,5-ジメトキシベンジルオキシ基、2,5-ジメトキシベンジルオキシ基、2,4,6-トリメトキシベンジルオキシ基、3,5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-イソプロポキシベンジルオキシ基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシ基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2-(2-クロロフェニル)エトキシ基、2-(3-クロロフェニル)エトキシ基、2-(4-クロロフェニル)エトキシ基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシ基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシ基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシ基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシ基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシ基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペントキシ基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

【0431】

フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、無置換のフェノキシ基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェノキシ基であって、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、2-ブromoフェノキシ基、3-ブromoフェノキシ基、4-ブromoフェノキシ基、2-ヨードフェノキシ基、3-ヨードフェノキシ基、4-ヨードフェノキシ基、2,3-ジフルオロフェノキシ基、3,4-ジフルオロフェノキシ基、3,5-ジフルオロフェノキシ基、2,4-ジフルオロフェノキシ基、2,6-ジフルオロフェノキシ基、2,3-ジクロロフェノキシ基、3,4-ジクロロフェノキシ基、3,5-ジクロロフェノキシ基、2,4-ジクロロフェノキシ基、2,6-ジクロロフェノキシ基、3,4,5-トリフルオロフェノキシ基、3,4,5-トリクロロフェノキシ基、2,4,6-トリフルオロフェノキシ基、2,4,6-トリクロロフェノキシ基、2-フルオロ-4-ブromoフェノキシ基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシ基、2,3,4-トリクロロフェノキシ基、3,4,5-トリフルオロフェノキシ基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ基、2,4,6-トリメチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、2,4-ジメチルフェノキシ基、2,3-ジメチルフェノキシ基、2,6-ジメチルフェノキシ基、3,5-ジメチルフェノキシ基、2,5-ジメチルフェノキシ基、3,5-ジトリフルオロメチルフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2,4-ジメトキシフェノキシ基、2,3-ジメトキシフェノキシ基、2,6-ジメトキシフェノキシ基、3,5-ジメトキシフェノキシ基、2,5-ジメトキシフェノキシ基、2,4,6-トリメトキシフェノキシ基、3,5-ジ

トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-メチル-4-フルオロフェノキシ基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-メチル-3-クロロフェノキシ基、3-メチル-4-クロロフェノキシ基、2-クロロ-4-メチルフェノキシ基、2-メチル-3-フルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、4-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2-イソプロピルフェノキシ基、3-イソプロピルフェノキシ基、4-イソプロピルフェノキシ基、2-tert-ブチルフェノキシ基、3-tert-ブチルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、2-sec-ブチルフェノキシ基、3-sec-ブチルフェノキシ基、4-sec-ブチルフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、3-クロロ-2-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-3-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、2, 3, 4-トリフルオロフェノキシ基、2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ペンチンキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基等を挙げることができる。

【0432】

フェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上には、C1~4アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、無置換のフェニルC1~6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にC1~4アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された基が1~5個、好ましくは1~3個置換している基（置換基がC1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~2個置換しているのがよい）であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2, 3-メチレンジオキシベンジル基、3, 4-メチレンジオキシベンジル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブromoベンジル基、3-ブromoベンジル基、4-ブromoベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4

ージフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブromoベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基等を挙げることができる。

【0433】

ピペリジルC1~6アルキル基としては、例えば、ピペリジン-1-イルメチル基、ピペリジン-2-イルエチル基、ピペリジン-3-イルプロピル基、ピペリジン-4-イルブチル基、ピペリジン-1-イルペンチル基、ピペリジン-2-イルヘキシル基等を挙げることができる。

【0434】

置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくと

10

20

30

40

50

も1種が置換していてもよいアミノ基としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ基、*n*-プロピルアミノ基、*n*-ブチルアミノ基、*n*-ペンチルアミノ基、*n*-ヘキシルアミノ基、フェニルアミノ基、(4-クロロフェニル)アミノ基、(4-ブロモフェニル)アミノ基、(2, 4-ジクロロフェニル)アミノ基、(2, 4, 6-トリクロロフェニル)アミノ基、(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)アミノ基、(4-フルオロフェニル)アミノ基、(4-ヨードフェニル)アミノ基、(4-クロロフェニル)アミノ基、(3-メチルフェニル)アミノ基、(2-トリフルオロメチルフェニル)アミノ基、(3-トリフルオロメチルフェニル)アミノ基、(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ基、(3, 4-ジメチルフェニル)アミノ基、(3, 4, 5-トリメチルフェニル)アミノ基、(2-メトキシフェニル)アミノ基、(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ基、(3-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ基、(3, 5-ジメトキシフェニル)アミノ基、(2, 5-ジメトキシフェニル)アミノ基、(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)アミノ基、*N*-メチル-*N*-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ基、*N*-エチル-*N*-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ基、1-フェネチルアミノ基、2-フェネチルアミノ基、3-フェニルプロピルアミノ基、2-フェニルプロピルアミノ基、4-フェニルブチルアミノ基、5-フェニルペンチルアミノ基、4-フェニルペンチルアミノ基、6-フェニルヘキシルアミノ基、2-フルオロベンジルアミノ基、3-フルオロベンジルアミノ基、*N*-フェニル-*N*-(4-フルオロベンジル)アミノ基、2-クロロベンジルアミノ基、3-クロロベンジルアミノ基、4-クロロベンジルアミノ基、2-ブロモベンジルアミノ基、*N*-メチル-*N*-(3-ブロモベンジル)アミノ基、4-ブロモベンジルアミノ基、2-ヨードベンジルアミノ基、3-ヨードベンジルアミノ基、4-ヨードベンジルアミノ基、2, 3-ジフルオロベンジルアミノ基、3, 4-ジフルオロベンジルアミノ基、3, 5-ジフルオロベンジルアミノ基、2, 4-ジフルオロベンジルアミノ基、2, 6-ジフルオロベンジルアミノ基、2, 3-ジクロロベンジルアミノ基、3, 4-ジクロロベンジルアミノ基、3, 5-ジクロロベンジルアミノ基、2, 4-ジクロロベンジルアミノ基、2, 6-ジクロロベンジルアミノ基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルアミノ基、4-クロロ-3-フルオロベンジルアミノ基、2, 3, 4-トリクロロベンジルアミノ基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルアミノ基、2, 4, 6-トリクロロベンジルアミノ基、4-イソプロピルベンジルアミノ基、4-*n*-ブチルベンジルアミノ基、4-メチルベンジルアミノ基、2-メチルベンジルアミノ基、3-メチルベンジルアミノ基、2, 4-ジメチルベンジルアミノ基、2, 3-ジメチルベンジルアミノ基、2, 6-ジメチルベンジルアミノ基、3, 5-ジメチルベンジルアミノ基、2, 5-ジメチルベンジルアミノ基、2, 4, 6-トリメチルベンジルアミノ基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルアミノ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルアミノ基、4-イソプロポキシベンジルアミノ基、4-*n*-ブトキシベンジルアミノ基、4-メトキシベンジルアミノ基、2-メトキシベンジルアミノ基、3-メトキシベンジルアミノ基、2, 4-ジメトキシベンジルアミノ基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジルアミノ基、3, 5-ジメトキシベンジルアミノ基、2, 5-ジメトキシベンジルアミノ基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルアミノ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルアミノ基、2-イソプロポキシベンジルアミノ基、3-クロロ-4-メトキシベンジルアミノ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルアミノ基、3-メチル-4-フルオロベンジルアミノ基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、2-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、3-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、4-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、2-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ基、3-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ基、4-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ基、2-トリフルオロメトキシベンジルアミノ基、3-トリフルオロメトキシベンジルアミノ基、4-トリフルオロメトキシベンジルアミノ基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミノ基、2-(3-トリ

10

20

30

40

50

フルオロメチルフェニル) エチルアミノ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチルアミノ基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチルアミノ基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチルアミノ基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチルアミノ基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチルアミノ基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチルアミノ基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチルアミノ基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピルアミノ基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) プロピルアミノ基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピルアミノ基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル) プロピルアミノ基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロピルアミノ基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピルアミノ基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピルアミノ基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピルアミノ基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) ブチルアミノ基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチルアミノ基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチルアミノ基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルアミノ基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルアミノ基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルアミノ基、N-メチル-N-フェニルアミノ基、N-メチル-N-ベンジルアミノ基、N-フェニル-N-ベンジルアミノ基等の置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよいアミノ基を挙げることができる。

【0435】

カルバモイルオキシ基(アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、カルバモイルオキシ基、フェニルカルバモイルオキシ基、2-フルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3-フルオロフェニルカルバモイルオキシ基、4-フルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、3-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、4-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、2-ブロモフェニルカルバモイルオキシ基、3-ブロモフェニルカルバモイルオキシ基、4-ブロモフェニルカルバモイルオキシ基、2-ヨードフェニルカルバモイルオキシ基、3-ヨードフェニルカルバモイルオキシ基、4-ヨードフェニルカルバモイルオキシ基、2,3-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3,4-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3,5-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2,4-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2,6-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2,3-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、3,4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、3,5-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、2,4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、2,6-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、3,4,5-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3,4,5-トリクロロフェニルカルバモイルオキシ基、2,4,6-トリクロロフェニルカルバモイルオキシ基、2-メチルフェニルカルバモイルオキシ基、3-メチルフェニルカルバモイルオキシ基、4-メチルフェニルカルバモイルオキシ基、2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、2-クロロ-4-メチルフェニルカルバモイルオキシ基、2-メチル-3-フルオ

ロフェニルカルバモイルオキシ基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ
 基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ基、メチルカルバモイルオキシ
 基、エチルカルバモイルオキシ基、n-プロピルカルバモイルオキシ基、n-ブチルカル
 バモイルオキシ基、n-ヘキシルカルバモイルオキシ基、n-ペンチルカルバモイルオキ
 シ基、N-メチル-N-フェニルカルバモイルオキシ基、N、N-ジメチルカルバモイル
 オキシ基、N-メチル-N-エチルカルバモイルオキシ基、N-(2-フルオロフェニル)
 -N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカル
 バモイルオキシ基、N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、
 N-(2-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3-クロロフェ
 ニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカル
 バモイルオキシ基、N-(4-ブロモフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、
 N-(2-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3-ヨードフェ
 ニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(4-ヨードフェニル)-N-メチルカル
 バモイルオキシ基、N-(2,3-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオ
 キシ基、N-(3,4-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-
 (3,5-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(2,4-ジ
 フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(2,6-ジフルオロフェ
 ニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(2,3-ジクロロフェニル)-N-メ
 チルカルバモイルオキシ基、N-(3,4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイ
 ルオキシ基、N-(3,5-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-
 (2,4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(2,6-ジ
 クロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3,4,5-トリフルオロ
 フェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3,4,5-トリクロロフェニル)
 -N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-N-
 メチルカルバモイルオキシ基、N-(2,4,6-トリクロロフェニル)-N-メチル
 カルバモイルオキシ基、N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基
 、N-(3-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(4-メチルフェ
 ニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(2-メチル-3-クロロフェニル)
 -N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3-メチル-4-クロロフェニル)-N-メ
 チルカルバモイルオキシ基、N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-N-メチルカル
 バモイルオキシ基、N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイ
 ルオキシ基、N-(2-トリフルオロメチルフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ
 基、N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ基、N-
 フェニル-N-フェニルカルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-フルオロフェ
 ニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-フルオロフェニル)カルバモイ
 ルオキシ基、N-フェニル-N-(4-フルオロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-
 フェニル-N-(2-クロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-
 クロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(4-クロロフェニル)
 カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-ブロモフェニル)カルバモイルオキシ
 基、N-フェニル-N-(3-ブロモフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-
 N-(4-ブロモフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-ヨードフェ
 ニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-ヨードフェニル)カルバモイ
 ルオキシ基、N-フェニル-N-(4-ヨードフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェ
 ニル-N-(2,3-ジフルオロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-
 (3,4-ジフルオロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3,5-
 ジフルオロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2,4-ジフルオ
 ロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2,6-ジフルオロフェニル)
 カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2,3-ジクロロフェニル)カルバモイ
 ルオキシ基、N-フェニル-N-(3,4-ジクロロフェニル)カルバモイルオキシ基、
 N-フェニル-N-(3,5-ジクロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル

10

20

30

40

50

-N-(2, 4-ジクロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 6-ジクロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-メチルフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-メチルフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(4-メチルフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-メチル-3-クロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-メチル-4-クロロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイルオキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ基、2-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、3-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、4-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシ基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシ基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシ基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシ基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシ基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ペンチルフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ヘキシルフェニルカルバモイルオキシ基、2, 4-ジメチルフェニルカルバモイルオキシ基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4-ジメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4, 5-トリメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2, 6-ジメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2, 3, 4-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェニルカルバモイルオキシ基等のカルバモイルオキシ基（アミノ基上には、C1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕からなる群より選

10

20

30

40

50

ばれた基が1～2個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0436】

ハロゲン置換又は未置換のC1～10アルキル基としては、例えば、前記例示のハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基に加えて、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、7-フルオロヘプチル基、7, 7, 6-トリフルオロヘプチル基、7, 7, 7, 6, 6, 5, 5-ヘプタフルオロヘプチル基、8-クロロオクチル基、8, 8-ジブromoオクチル基、6, 7, 8-トリフルオロオクチル基、8, 8, 8, 7, 7, 6, 6-ヘプタフルオロオクチル基、8, 8, 8, 7, 7-ペンタクロロオクチル基、9-ヨードノニル基、9, 9-ジブromoノニル基、9, 9, 9, 8, 8-ペンタクロロノニル基、9, 9, 9, 8, 8, 7, 7-ヘプタフルオロノニル基、10-クロロデシル基、10, 10-ジブromoデシル基、10, 10, 10, 9-テトラクロロデシル基、10, 10, 10, 9, 9, 9, 8, 8-ヘプタフルオロデシル基等のC1～10のアルキル基及びハロゲン原子が1～7個置換したC1～10アルキル基を挙げることができる。

【0437】

フェニル基〔フェニル環上には、C1～4アルキレンジオキシ基、シアノ基、フェノキシ基、C1～6アルキルチオ基、C1～6アルカノイル基、フェニル基、フェニルC1～6アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～10アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～10アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、前記例示のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）に加えて、4-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、2-シアノフェニル基、3, 4-ジシアノフェニル基、3, 4, 5-トリシアノフェニル基、4-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、2-フェノキシフェニル基、3, 4-ジフェノキシフェニル基、2, 4, 6-トリフェノキシフェニル基、4-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、2-メチルチオフェニル基、3, 4-ジメチルチオフェニル基、2, 4, 6-トリメチルチオフェニル基、4-アセチルフェニル基、3-アセチルフェニル基、2-アセチルフェニル基、3, 4-ジアセチルフェニル基、2, 4, 6-トリアセチルフェニル基、4-ビフェニル基、3-ビフェニル基、2-ビフェニル基、3, 4-ジフェニルフェニル基、2, 4, 6-トリフェニルフェニル基、4-ヘプチルオキシフェニル基、3-オクチルオキシフェニル基、2-ノニルオキシフェニル基、4-デシルオキシフェニル基、2, 4-ジヘプチルオキシフェニル基、2, 4, 6-トリヘプチルオキシフェニル基、4-(7, 7-ジクロロヘプチルオキシ)フェニル基、4-ベンジルフェニル基、3-ベンジルフェニル基、2-ベンジルフェニル基、2, 4-ジベンジルフェニル基、2, 4, 6-トリベンジルフェニル基、4-オクチルフェニル基、4-ヘプチルフェニル基、3-オクチルフェニル基、3-(8, 8, 8-トリフルオロオクチル)フェニル基、2-ノニルフェニル基、4-デシルフェニル基、2, 4-ジオクチルフェニル基、2, 4, 6-トリオクチルシフェニル基、4-フェニル-3-クロロフェニル基、4-フェノキシ-3-メチルチオフェニル基、4-ヘプチルオキシ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-オクチル-2-トリフルオロメチルフェニル基、4-ベンジル-2-メチルフェニル基、3, 4-エチレンジオキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基等のフェニル基〔フェニル環上には、前記例示のC1～4アルキレンジオキシ基、シアノ基、フェノキシ基、前記例示のC1～6アルキルチオ基、前記例示のC1～6アルカノイル基、フェニル基、前記例示のフェニルC1～6アルキル基、前記例示のハロゲン原子、前記例示のハロゲン置換又は未置換のC1～10アルキル基及び前記例示のハロゲン置換又は未置換のC1～10アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい（置換基がC1～4アルキレンジオキシ基の場合は、1～2個置換しているのがよい）〕を挙げることができる。

【0438】

カルバモイルオキシ置換C1～6アルキル基（アミノ基上には、C1～6アルキル基、

フェニル C 1～6 アルキル基、C 3～8 シクロアルキル基、ナフチル基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基、2, 3-ジヒドロベンゾフリル基及びフェニル基 [フェニル環上には、C 1～4 アルキレンジオキシ基、シアノ基、フェノキシ基、C 1～6 アルキルチオ基、C 1～6 アルカノイル基、フェニル基、フェニル C 1～6 アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～10 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～10 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、カルバモイルオキシメチル基、2-カルバモイルオキシエチル基、1-カルバモイルオキシエチル基、3-カルバモイルオキシプロピル基、4-カルバモイルオキシブチル基、5-カルバモイルオキシペンチル基、6-カルバモイルオキシヘキシル基、フェニルカルバモイルオキシメチル基、2-メチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-メチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-メチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 3-ジメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4-ジメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 6-ジメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-(n-プロピルフェニル)カルバモイルオキシメチル基、3-(n-プロピルフェニル)カルバモイルオキシメチル基、4-(n-プロピルフェニル)カルバモイルオキシメチル基、2-(フェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-(2, 3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-(2, 4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-(2, 6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、3-(フェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、3-(2, 3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、3-(2, 4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、3-(2, 6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、3-(2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ)ヘキシル基、(2-フルオロフェニルカルバモイルオキシ)メチル基、2-(3-フルオロフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、1-(4-フルオロフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、3-(2-クロロフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、4-(3-クロロフェニルカルバモイルオキシ)ブチル基、5-(4-クロロフェニルカルバモイルオキシ)ペンチル基、6-(2-ブロモフェニルカルバモイルオキシ)ヘキシル基、(3-ブロモフェニルカルバモイルオキシ)メチル基、2-(4-ブロモフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、1-(2-ヨードフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、3-(3-ヨードフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、4-(4-ヨードフェニルカルバモイルオキシ)ブチル基、5-(2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイルオ

10

20

30

40

50

キシ)ペンチル基、6-(3,4-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ)ヘキシル基、(3,5-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ)メチル基、2-(2,4-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、1-(2,6-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、3-(2,3-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、4-(3,4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ)ブチル基、5-(3,5-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ)ペンチル基、6-(2,4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ)ヘキシル基、(2,6-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ)メチル基、2-(3,4,5-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、1-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、3-(3,4,5-トリクロロフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、4-(2,4,6-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ)ブチル基、5-(2,4,6-トリクロロフェニルカルバモイルオキシ)ペンチル基、(2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイルオキシ)メチル基、(3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイルオキシ)メチル基、(2-クロロ-4-メチルフェニルカルバモイルオキシ)メチル基、(2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイルオキシ)メチル基、エチルカルバモイルオキシメチル基、n-ブチルカルバモイルオキシメチル基、n-ヘキシルカルバモイルオキシメチル基、n-ペンチルカルバモイルオキシメチル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイルオキシメチル基、N、N-ジメチルカルバモイルオキシメチル基、N-メチル-N-エチルカルバモイルオキシメチル基、2-[N-(2-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、1-[N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、3-[N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]プロピル基、4-[N-(2-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ブチル基、5-[N-(3-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ペンチル基、6-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ヘキシル基、[N-(4-ブロモフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]メチル基、2-[N-(2-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、1-[N-(3-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、3-[N-(4-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]プロピル基、4-[N-(2,3-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ブチル基、5-[N-(3,4-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ペンチル基、6-[N-(3,5-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ヘキシル基、[N-(2,4-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]メチル基、2-[N-(2,6-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、1-[N-(2,3-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、3-[N-(3,4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]プロピル基、[N-(3,5-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]メチル基、4-[N-(2,4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ブチル基、5-[N-(2,6-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ペンチル基、6-[N-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ヘキシル基、[N-(3,4,5-トリクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]メチル基、2-[N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、1-[N-(2,4,6-トリクロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、3-[N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]プロピル基、4-[N-(3-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ブチル基、5-[N-(4-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ヘキシル基、6-[N-(2-メチル-3-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]ヘキシル基、[N-(3-メチル-4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]メチル基、2-[N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、1-[N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイルオキシ]エチル基、3-[N-(2-トリフルオロメチルフェニル)-N-メチルカル

10

20

30

40

50

バモイルオキシ] プロピル基、4- [N- (4-トリフルオロメチルフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ブチル基、2- [N- (4-トリフルオロメチルフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、5- [N-フェニル-N-フェニルカルバモイルオキシ] ペンチル基、6- [N-フェニル-N- (2-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (3-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、2- [N-フェニル-N- (4-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1- [N-フェニル-N- (2-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1- [N-フェニル-N- (3-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3- [N-フェニル-N- (4-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、4- [N-フェニル-N- (2-ブロモフェニル) カルバモイルオキシ] ブチル基、5- [N-フェニル-N- (3-ブロモフェニル) カルバモイルオキシ] ペンチル基、6- [N-フェニル-N- (4-ブロモフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (2-ヨードフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、1- [N-フェニル-N- (3-ヨードフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、2- [N-フェニル-N- (4-ヨードフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1- [N-フェニル-N- (2, 3-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3- [N-フェニル-N- (3, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、4- [N-フェニル-N- (3, 5-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ブチル基、5- [N-フェニル-N- (2, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ペンチル基、6- [N-フェニル-N- (2, 6-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (2, 3-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、2- [N-フェニル-N- (3, 4-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1- [N-フェニル-N- (3, 5-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3- [N-フェニル-N- (2, 4-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、4- [N-フェニル-N- (2, 6-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] ブチル基、5- [N-フェニル-N- (3, 4, 5-トリフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ペンチル基、6- [N-フェニル-N- (3, 4, 5-トリクロロフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、2- [N-フェニル-N- (2, 4, 6-トリクロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1- [N-フェニル-N- (2-メチルフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3- [N-フェニル-N- (3-メチルフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、4- [N-フェニル-N- (4-メチルフェニル) カルバモイルオキシ] ブチル基、5- [N-フェニル-N- (2-メチル-3-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] ペンチル基、6- [N-フェニル-N- (3-メチル-4-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (2-クロロ-4-メチルフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、[N-フェニル-N- (2-メチル-3-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、2- [N-フェニル-N- (2-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1- [N-フェニル-N- (3-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3- [N-フェニル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-メチル-4-クロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ペンチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ヘキシルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-ジメト

10

20

30

40

50

キシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-メトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-メトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-メトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-(2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、1-(2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、3-(2, 6-ジメトキシフェニルカルバモイルオキシ)プロピル基、4-(2, 3, 4-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ)ブチル基、5-(3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ)ペンチル基、6-(2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシ)ヘキシル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシ)エチル基、2-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバモイルオキシ]エチル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-トリフルオロメチル-4-クロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-クロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-クロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-クロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 5-ジクロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-フルオロフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-フルオロフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-フルオロフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-メトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-メトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-エトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ペンチルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-シアノフェニルカルバモイルオキシメチル基、[N-メチル-N-(3-シアノフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、2-シアノフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-ジシアノフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4, 5-トリシアノフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-フェノキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、[N-メチル-N-(3-フェノキシフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、2-フェノキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-ジフェノキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4, 6-トリフェノキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-メチルチオフェニルカルバモイルオキシメチル基、[N-メチル-N-(4-メチルチオフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、3-メチルチオフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-メチルチオフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-ジメチルチオフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルチオフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-アセチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-アセチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-アセチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-ジアセチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、[N-メ

10

20

30

40

50

チル-N-(3, 4-ジアセチルフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、2, 4, 6-トリアセチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ビフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-ビフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-ビフェニルカルバモイルオキシメチル基、[N-メチル-N-(2-ビフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、3, 4-ジフェニルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4, 6-トリフェニルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ヘプチルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、[N-メチル-N-4-(n-ヘプチルオキシフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、3-n-オクチルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-n-ノニルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-デシルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4-ジn-ヘプチルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4, 6-トリn-ヘプチルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-(7, 7-ジクロロヘプチルオキシ)フェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ベンジルフェニルカルバモイルオキシメチル基、[N-メチル-N-(4-ベンジルフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、3-ベンジルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-ベンジルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4-ジベンジルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4, 6-トリベンジルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-オクチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、[N-メチル-N-(4-n-オクチルフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、3-n-ヘプチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-n-オクチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-(8, 8, 8-トリフルオロオクチル)フェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ノニルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-n-デシルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4-ジn-オクチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4, 6-トリn-オクチルシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-フェニル-3-クロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-フェノキシ-3-メチルチオフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ヘプチルオキシ-3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-オクチル-2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ベンジル-2-メチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-エチレンジオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-メチレンジオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、ベンジルカルバモイルオキシメチル基、2-フェニルエチルカルバモイルオキシメチル基、シクロヘキシルカルバモイルオキシメチル基、1-ナフチルカルバモイルオキシメチル基、2-ナフチルカルバモイルオキシメチル基、5-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル)カルバモイルオキシメチル基、5-(2, 3-ジヒドロベンゾフリル)カルバモイルオキシメチル基、[N-メチル-N-(3, 4-メチレンジオキシフェニル)カルバモイルオキシ]メチル基、(N-メチル-N-ベンジルカルバモイルオキシ)メチル基、[N-メチル-N-(2-フェニルエチル)カルバモイルオキシ]メチル基、(N-メチル-N-シクロヘキシルカルバモイルオキシ)メチル基、[N-メチル-N-(1-ナフチル)カルバモイルオキシ]メチル基、[N-メチル-N-(2-ナフチル)カルバモイルオキシ]メチル基、{N-メチル-N-[5-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル)]カルバモイルオキシ}メチル基、[N-メチル-N-(2, 3-ジヒドロ-5-ベンゾフリル)カルバモイルオキシ]メチル基等のカルバモイルオキシ置換C1~6アルキル基(アミノ基上には、C1~6アルキル基、前記記載のフェニルC1~6アルキル基、前記記載のC3~8シクロアルキル基、ナフチル基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基、2, 3-ジヒドロベンゾフリル基及び前記記載のフェニル基[フェニル環上には、C1~4アルキレンジオキシ基、シアノ基、フェノキシ基、C1~6アルキルチオ基、C1~6アルカノイル基、フェニル基、フェニルC1~6アルキル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~10アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~10アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい(置換基がC1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~2個置換しているのがよい)]からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

10

20

30

40

50

【0439】

C 1～6 アルカノイル置換 C 1～6 アルキル基としては、例えば、アセチルメチル基、2-プロピオニルエチル基、1-ブチリルエチル基、2-アセチルエチル基、3-アセチルプロピル基、4-アセチルブチル基、4-イソブチリルブチル基、5-ペンタノイルペンチル基、6-アセチルヘキシル基、6-tert-ブチルカルボニルヘキシル基、1,1-ジメチル-2-ヘキサノイルエチル基、2-メチル-3-アセチルプロピル基等を挙げることができる。

【0440】

フェノキシ C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；C 1～4 アルキレンジオキシ基；C 1～6 アルコキシカルボニル基；フェニル基；フェノキシ基；ピロリル基；ベンゾチアゾリル基；1, 2, 4-トリアゾリル基；イミダゾリル基；イソオキサゾリル基；ベンゾオキサゾリル基；ベンゾトリアゾリル基；シアノ基；ニトロ基；C 2～6 アルケニル基；C 1～6 アルカノイル基；C 1～6 アルコキシカルボニル置換 C 1～6 アルキル基；C 1～6 アルカノイル置換 C 1～6 アルキル基；基-N(R^{11B})R^{12B}(R^{11B}及びR^{12B}は、同一又は異なって水素原子、C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルカノイル基又はフェニル基を示す。R^{11B}及びR^{12B}は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びアミノ基〔アミノ基上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニル C 1～6 アルコキシ基；フェニル C 1～6 アルキル基；C 1～6 アルキルチオ基；C 3～8 シクロアルキル基；ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～10 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。〕としては、例えば、前記例示のフェノキシ C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）に加えて、3, 4-メチレンジオキシフェノキシメチル基、3, 4-エチレンジオキシフェノキシメチル基、4-エトキシカルボニルフェノキシメチル基、3-メトキシカルボニルフェノキシメチル基、2-エトキシカルボニルフェノキシメチル基、2, 4-ジエトキシカルボニルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリエトキシカルボニルフェノキシメチル基、2-エトキシカルボニル-4-メチルフェノキシメチル基、2-メトキシカルボニル-4-メトキシフェノキシメチル基、2-メトキシカルボニル-3-メトキシフェノキシメチル基、2-(4-エトキシカルボニルフェノキシ)エチル基、4-シアノフェノキシメチル基、3-シアノフェノキシメチル基、2-シアノフェノキシメチル基、2, 4-ジシアノフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリシアノフェノキシメチル基、2-(4-シアノフェノキシ)エチル基、4-ニトロフェノキシメチル基、3-ニトロフェノキシメチル基、2-ニトロフェノキシメチル基、2, 4-ジニトロフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリニトロフェノキシメチル基、2-(4-ニトロフェノキシ)エチル基、4-アリルフェノキシメチル基、3-アリルフェノキシメチル基、2-アリルフェノキシメチル基、3, 4-ジアリルフェノキシメチル基、3, 4, 5-トリアリルフェノキシメチル基、2-(4-アリルフェノキシ)エチル基、2-(3-アリルフェノキシ)エチル基、3-ジエチルアミノフェノキシメチル基、3-アニリノフェノキシメチル基、4-アセチルアミノフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリ(ジエチルアミノ)フェノキシメチル基、2-アニリノフェノキシメチル基、2, 4-ジアセチルアミノフェノキシメチル基、2-(3-ジエチルアミノフェノキシ)エチル基、2-(3-アニリノフェノキシ)エチル基、2-[4-(2-アセチルエチル)フェノキシ]エチル基、4-(2-アセチルエチル)フェノキシメチル基、3-アセチルメチルフェノキシメチル基、2-(3-アセチルプロピル)フ

10

20

30

40

50

フェノキシメチル基、2, 4-ジ(2-アセチルエチル)フェノキシメチル基、2, 4, 6-トリ(2-アセチルエチル)フェノキシメチル基、4-メトキシカルボニルメチルフェノキシメチル基、3-エトキシカルボニルメチルフェノキシメチル基、2-メトキシカルボニルメチルフェノキシメチル基、2, 4-ジメトキシカルボニルメチルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメトキシカルボニルメチルフェノキシメチル基、2-(4-メトキシカルボニルメチルフェノキシ)エチル基、4-プロピオニルフェノキシメチル基、4-アセチルフェノキシメチル基、3-プロピオニルフェノキシメチル基、2-アセチルフェノキシメチル基、2, 4-ジプロピオニルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリアセチルフェノキシメチル基、2-(4-プロピオニルフェノキシ)エチル基、2-ベンジルフェノキシメチル基、3-ベンジルフェノキシメチル基、4-ベンジルフェノキシメチル基、2, 3-ジベンジルフェノキシメチル基、3, 4, 5-トリベンジルフェノキシメチル基、4-メチルチオフェノキシメチル基、3-メチルチオフェノキシメチル基、2-メチルチオフェノキシメチル基、2, 4-ジメチルチオフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルチオフェノキシメチル基、2-(4-メチルチオフェノキシ)エチル基、4-シクロペンチルフェノキシメチル基、3-シクロヘキシルフェノキシメチル基、4-シクロヘキシルフェノキシメチル基、2-シクロヘプチルフェノキシメチル基、2, 4-ジシクロペンチルフェノキシメチル基、2, 4-シクロペンチル-6-シクロオクチルフェノキシメチル基、2-(4-シクロヘキシルフェノキシ)エチル基、2-(4-シクロペンチルフェノキシ)エチル基、4-n-オクチルオキシフェノキシメチル基、2-(4-n-オクチルオキシフェノキシ)エチル基、4-フェニルフェノキシメチル基、3-フェニルフェノキシメチル基、2-フェニルフェノキシメチル基、2, 4-ジフェニルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリフェニルフェノキシメチル基、2-(4-フェニルフェノキシ)エチル基、4-フェノキシフェノキシメチル基、3-フェノキシフェノキシメチル基、2-フェノキシフェノキシメチル基、2, 4-ジフェノキシフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリフェノキシフェノキシメチル基、2-(3-フェノキシフェノキシ)エチル基、4-ベンジルオキシフェノキシメチル基、3-ベンジルオキシフェノキシメチル基、2-ベンジルオキシフェノキシメチル基、2, 4-ジベンジルオキシフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリベンジルオキシフェノキシメチル基、2-(4-ベンジルオキシフェノキシ)エチル基、2, 4-ジベンジルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリベンジルフェノキシメチル基、2-(4-ベンジルフェノキシ)エチル基、4-(1-ピロリル)フェノキシメチル基、3-(1-ピロリル)フェノキシメチル基、2-(1-ピロリル)フェノキシメチル基、2, 4-ジ(1-ピロリル)フェノキシメチル基、2, 4, 6-トリ(1-ピロリル)フェノキシメチル基、2-(2-ベンゾチアゾリル)フェノキシメチル基、2-(2-ベンゾチアゾリル)フェノキシメチル基、3-(2-ベンゾチアゾリル)フェノキシメチル基、2, 4, 6-トリ(5-ベンゾチアゾリル)フェノキシメチル基、2, 4-ジ(6-ベンゾチアゾリル)フェノキシメチル基、4-(1-1, 2, 4-トリアゾリル)フェノキシメチル基、3-(1-1, 2, 4-トリアゾリル)フェノキシメチル基、2-(1-1, 2, 4-トリアゾリル)フェノキシメチル基、4-(3-1, 2, 4-トリアゾリル)フェノキシメチル基、2, 4-ジ(5-1, 2, 4-トリアゾリル)フェノキシメチル基、2, 4, 6-トリ(1-1, 2, 4-トリアゾリル)フェノキシメチル基、4-(5-イソオキサゾリル)フェノキシメチル基、3-(3-イソオキサゾリル)フェノキシメチル基、2-(4-イソオキサゾリル)フェノキシメチル基、2-(5-イソオキサゾリル)フェノキシメチル基、2, 4-ジ(5-イソオキサゾリル)フェノキシメチル基、2, 4, 6-トリ(5-イソオキサゾリル)フェノキシメチル基、4-(1-イミダゾリル)フェノキシメチル基、3-(2-イミダゾリル)フェノキシメチル基、2-(4-イミダゾリル)フェノキシメチル基、2, 4-ジ(1-イミダゾリル)フェノキシメチル基、2, 4, 6-トリ(1-イミダゾリル)フェノキシメチル基、4-(1-ベンゾトリアゾリル)フェノキシメチル基、3-(1-ベンゾトリアゾリル)フェノキシメチル基、2-(1-ベンゾトリアゾリル)フェノキシメチル基、2, 4-ジ(1-ベンゾトリアゾリル)フェノキシ

10

20

30

40

50

シメチル基、2, 4, 6-トリ(1-ベンゾトリアゾリル)フェノキシメチル基、4-(6-ベンゾイミダゾリル)フェノキシメチル基、3-(5-ベンゾイミダゾリル)フェノキシメチル基、2-(2-ベンゾイミダゾリル)フェノキシメチル基、2-(1-ベンゾトリアゾリル)フェノキシメチル基、2, 4-ジ(2-ベンゾイミダゾリル)フェノキシメチル基、2, 4, 6-トリ(2-ベンゾイミダゾリル)フェノキシメチル基、4-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル)フェノキシメチル基、2-[4-{4-[4-(N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ)]-1-ピペリジル}フェノキシ]エチル基、2-[4-(1-1, 2, 4-トリアゾリル)フェノキシ]エチル基、2-[2-(5-イソオキサゾリル)フェノキシ]エチル基、2-(2-メトキシ-4-アリルフェノキシ)エチル基、2-(2-フルオロ-4-ニトロフェノキシ)エチル基、2-(2-エトキシ-5-アリルフェノキシ)エチル基、2-フルオロ-4-ニトロフェノキシメチル基、2-メトキシ-4-アリルフェノキシメチル基、2-エトキシ-5-アリルフェノキシメチル基、2-メチル-4-アセチルフェノキシメチル基等のフェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子; 前記例示のC1~4アルキレンジオキシ基; 前記例示のC1~6アルコキシカルボニル基; フェニル基; フェノキシ基; ピロリル基; ベンゾチアゾリル基; 1, 2, 4-トリアゾリル基; イミダゾリル基; イソオキサゾリル基; ベンゾオキサゾリル基; ベンゾトリアゾリル基; シアノ基; ニトロ基; 前記例示のC2~6アルケニル基; 前記例示のC1~6アルカノイル基; 前記例示のC1~6アルコキシカルボニル置換C1~6アルキル基; 前記例示のC1~6アルカノイル置換C1~6アルキル基; 基-N(R^{11B'})R^{12B'}(R^{11B'}及びR^{12B'}は、同一又は異なって水素原子、前記例示のC1~6アルキル基、前記例示のC1~6アルカノイル基又はフェニル基を示す。前記例示のR^{11B'}及びR^{12B'}は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、C1~6アルコキシカルボニル基及びアミノ基[アミノ基上には、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい); 前記例示のフェニルC1~6アルコキシ基; 前記例示のフェニルC1~6アルキル基; 前記例示のC1~6アルキルチオ基; 前記例示のC3~8シクロアルキル基; 前記例示のハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及び前記例示のハロゲン置換又は未置換のC1~10アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい(置換基がC1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~2個置換しているのがよい))を示す。]を挙げることができる。

【0441】

テトラヒドロピラニルオキシC1~6アルキル基としては、例えば、(2-テトラヒドロピラニルオキシ)メチル基、2-(3-テトラヒドロピラニルオキシ)エチル基、1-(4-テトラヒドロピラニルオキシ)エチル基、2-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)エチル基、3-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)プロピル基、4-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ブチル基、4-(3-テトラヒドロピラニルオキシ)ブチル基、5-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ペンチル基、6-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ヘキシル基、6-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-(4-テトラヒドロピラニルオキシ)エチル基、2-メチル-3-(3-テトラヒドロピラニルオキシ)プロピル基等を挙げることができる。

【0442】

フリルC1~6アルコキシ置換C1~6アルキル基(フラン環上には、少なくとも1個のC1~6アルコキシカルボニル基が置換していてもよい)としては、例えば、[(2-フリル)メトキシ]メチル基、[2-(3-フリル)エトキシ]メチル基、[3-(2-フリル)プロポキシ]メチル基、[2-(3-フリル)プロポキシ]メチル基、[4-(

10

20

30

40

50

2-フリル) ブトキシ] メチル基、[5-(3-フリル) ペントキシ] メチル基、[4-(2-フリル) ペントキシ] メチル基、[6-(3-フリル) ヘキシルオキシ] メチル基、2-[(2-フリル) メトキシ] エチル基、1-[2-(3-フリル) エトキシ] エチル基、3-[3-(2-フリル) プロポキシ] プロピル基、4-[2-(3-フリル) プロポキシ] ブチル基、5-[4-(2-フリル) ブトキシ] ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[5-(3-フリル) ペントキシ] エチル基、2-メチル-3-[4-(2-フリル) ペントキシ] プロピル基、2-[6-(3-フリル) ヘキシルオキシ] エチル基、[(5-エトキシカルボニル-2-フリル) メトキシ] メチル基、[(4-メトキシカルボニル-2-フリル) メトキシ] メチル基、[(3-プロポキシカルボニル-2-フリル) メトキシ] メチル基、[(5-ブトキシカルボニル-2-フリル) メトキシ] メチル基、[(4-ペンチルオキシカルボニル-2-フリル) メトキシ] メチル基、[(3-ヘキシルオキシカルボニル-2-フリル) メトキシ] メチル基、[(3, 5-ジエトキシカルボニル-2-フリル) メトキシ] メチル基、[(3, 4, 5-トリエトキシカルボニル-2-フリル) メトキシ] メチル基等のフリルC 1~6 アルコキシ置換C 1~6 アルキル基 (フラン環上には、1~3 個のC 1~6 アルコキシカルボニル基が置換していてもよい) を挙げることができる。

【0443】

C 3~8 シクロアルキルC 1~6 アルキル基としては、例えば、シクロヘキシルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、1-シクロペンチルエチル基、3-シクロブチルプロピル基、4-シクロヘキシルブチル基、5-シクロヘプチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-シクロヘキシルエチル基、2-メチル-3-シクロヘキシルプロピル基等を挙げることができる。

【0444】

テトラゾリルC 1~6 アルコキシ置換C 1~6 アルキル基 (テトラゾール環上には、フェニルC 1~6 アルキル基及びC 3~8 シクロアルキルC 1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基が置換していてもよい) としては、例えば、[(5-テトラゾリル) メトキシ] メチル基、[2-(5-テトラゾリル) エトキシ] メチル基、[3-(5-テトラゾリル) プロポキシ] メチル基、[2-(5-テトラゾリル) プロポキシ] メチル基、[4-(5-テトラゾリル) ブトキシ] メチル基、[5-(5-テトラゾリル) ペントキシ] メチル基、[4-(1-テトラゾリル) ペントキシ] メチル基、[6-(5-テトラゾリル) ヘキシルオキシ] メチル基、2-[(1-テトラゾリル) メトキシ] エチル基、1-[2-(5-テトラゾリル) エトキシ] エチル基、3-[3-(1-テトラゾリル) プロポキシ] プロピル基、4-[2-(5-テトラゾリル) プロポキシ] ブチル基、5-[4-(1-テトラゾリル) ブトキシ] ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[5-(5-テトラゾリル) ペントキシ] エチル基、2-メチル-3-[4-(1-テトラゾリル) ペントキシ] プロピル基、2-[6-(5-テトラゾリル) ヘキシルオキシ] エチル基、{ [1-(2-フェニルエチル)-5-テトラゾリル] メトキシ} メチル基、[(1-シクロヘキシルメチル-5-テトラゾリル) メトキシ] メチル基、[(5-ベンジル-1-テトラゾリル) メトキシ] メチル基、[(1-シクロペンチルメチル-5-テトラゾリル) メトキシ] メチル基、{ [5-(2-シクロヘキシルエチル)-1-テトラゾリル] メトキシ} メチル基、[(1-ベンジル-5-テトラゾリル) メトキシ] メチル基、[(1-シクロヘプチルメチル-5-テトラゾリル) メトキシ] メチル基、{ [1-(3-フェニルプロピル)-5-テトラゾリル] メトキシ} メチル基等のテトラゾリルC 1~6 アルコキシ置換C 1~6 アルキル基 (テトラゾール環上には、前記例示のフェニルC 1~6 アルキル基及び前記例示のC 3~8 シクロアルキルC 1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基が置換していてもよい) を挙げることができる。

【0445】

イソオキサゾリルC 1~6 アルコキシ置換C 1~6 アルキル基 (イソオキサゾール環上には、少なくとも1 個のC 1~6 アルキル基が置換していてもよい) としては、例えば、[(3-イソオキサゾリル) メトキシ] メチル基、[2-(4-イソオキサゾリル) エト

10

20

30

40

50

キシ] メチル基、[3-(5-イソオキサゾリル) プロポキシ] メチル基、[2-(3-イソオキサゾリル) プロポキシ] メチル基、[4-(4-イソオキサゾリル) ブトキシ] メチル基、[5-(5-イソオキサゾリル) ペントキシ] メチル基、[4-(3-イソオキサゾリル) ペントキシ] メチル基、[6-(4-イソオキサゾリル) ヘキシルオキシ] メチル基、2-[(5-イソオキサゾリル) メトキシ] エチル基、1-[2-(3-イソオキサゾリル) エトキシ] エチル基、3-[3-(4-イソオキサゾリル) プロポキシ] プロピル基、4-[2-(5-イソオキサゾリル) プロポキシ] ブチル基、5-[4-(3-イソオキサゾリル) ブトキシ] ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[5-(4-イソオキサゾリル) ペントキシ] エチル基、2-メチル-3-[4-(5-イソオキサゾリル) ペントキシ] プロピル基、2-[6-(3-イソオキサゾリル) ヘキシルオキシ] エチル基、[(5-メチル-3-イソオキサゾリル) メトキシ] メチル基、[(4-エチル-3-イソオキサゾリル) メトキシ] メチル基、[(3-n-プロピル-4-イソオキサゾリル) メトキシ] メチル基、[(5-n-ブチル-3-イソオキサゾリル) メトキシ] メチル基、[(4-n-ペンチル-3-イソオキサゾリル) メトキシ] メチル基、[(3-n-ヘキシル-5-イソオキサゾリル) メトキシ] メチル基、[(4, 5-ジメチル-3-イソオキサゾリル) メトキシ] メチル基等のイソオキサゾリルC 1~6 アルコキシ置換C 1~6 アルキル基 (イソオキサゾール環上には、1~2個の前記例示のC 1~6 アルキル基が置換していてもよい) を挙げることができる。

10

【0446】

ベンゾチエニルC 1~6 アルコキシ置換C 1~6 アルキル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、[(3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[2-(2-ベンゾチエニル) エトキシ] メチル基、[3-(4-ベンゾチエニル) プロポキシ] メチル基、[2-(5-ベンゾチエニル) プロポキシ] メチル基、[4-(6-ベンゾチエニル) ブトキシ] メチル基、[5-(7-ベンゾチエニル) ペントキシ] メチル基、[4-(3-ベンゾチエニル) ペントキシ] メチル基、[6-(2-ベンゾチエニル) ヘキシルオキシ] メチル基、2-[(4-ベンゾチエニル) メトキシ] エチル基、1-[2-(5-ベンゾチエニル) エトキシ] エチル基、3-[3-(6-ベンゾチエニル) プロポキシ] プロピル基、4-[2-(7-ベンゾチエニル) プロポキシ] ブチル基、5-[4-(3-ベンゾチエニル) ブトキシ] ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[5-(3-ベンゾチエニル) ペントキシ] エチル基、2-メチル-3-[4-(5-ベンゾチエニル) ペントキシ] プロピル基、2-[6-(3-ベンゾチエニル) ヘキシルオキシ] エチル基、[(5-メチル-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(4-エチル-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(5-クロロ-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(6-メチル-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(4-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(3-メトキシ-5-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(4, 5-ジクロロ-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(2, 4, 5-トリフルオロ-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(4, 5-ジクロロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基、[(4, 5-ジクロロ-2-メトキシ-3-ベンゾチエニル) メトキシ] メチル基等のベンゾチエニルC 1~6 アルコキシ置換C 1~6 アルキル基 (ベンゾチオフェン環上には、前記例示のハロゲン原子、前記例示のハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及び前記例示のハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

20

30

40

【0447】

1, 3, 4-オキサジアゾリルC 1~6 アルコキシ置換C 1~6 アルキル基 (1, 3, 4-オキサジアゾール環上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6

50

アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、[(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)メトキシ]メチル基、[2-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)エトキシ]メチル基、[3-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)プロポキシ]メチル基、[2-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)プロポキシ]メチル基、[4-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)ブトキシ]メチル基、[5-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)ペントキシ]メチル基、[4-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)ペントキシ]メチル基、[6-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)ヘキシルオキシ]メチル基、2-[(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)メトキシ]エチル基、1-[2-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)エトキシ]エチル基、3-[3-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)プロポキシ]プロピル基、4-[2-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)プロポキシ]ブチル基、5-[(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)メトキシ]ペンチル基、6-[4-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)ブトキシ]ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[5-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)ペントキシ]エチル基、2-メチル-3-[4-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)ペントキシ]プロピル基、2-[6-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル)ヘキシルオキシ]エチル基、[5-(4-メチルフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル]メトキシメチル基、[5-(4-クロロフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル]メトキシメチル基、[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル]メトキシメチル基、[5-(4-メトキシフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル]メトキシメチル基、[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル]メトキシメチル基、[5-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル]メトキシメチル基、[5-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル]メトキシメチル基、[5-(2, 4-ジメトキシフェニル)-2-1, 3, 4-オキサジアゾリル]メトキシメチル基等の1, 3, 4-オキサジアゾリルC1~6アルコキシ置換C1~6アルキル基(1, 3, 4-オキサジアゾール環上には、前記例示のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0448】

C2~6アルキニルオキシ置換C1~6アルキル基としては、例えば、エチニルオキシメチル基、2-エチニルオキシメチル基、2-(2-エチニルオキシ)エチル基、1-(2-ブチニルオキシ)エチル基、2-(3-ブチニルオキシ)エチル基、3-(1-メチル-2-プロピニルオキシ)プロピル基、4-(2-ペンチニルオキシ)ブチル基、4-(2-ヘキシニルオキシ)ブチル基、5-(2-プロピニルオキシ)ペンチル基、6-(2-プロピニルオキシ)ヘキシル基、6-(2-ブチニルオキシ)ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-(2-プロピニルオキシ)エチル基、2-メチル-3-(2-プロピニルオキシ)プロピル基等を挙げることができる。

【0449】

ナフチルC1~6アルコキシ置換C1~6アルキル基としては、例えば、(1-ナフチル)メトキシメチル基、[2-(2-ナフチル)エトキシ]メチル基、[3-(1-ナフチル)プロポキシ]メチル基、[2-(2-ナフチル)プロポキシ]メチル基、[4-(1-ナフチル)ブトキシ]メチル基、[5-(2-ナフチル)ペントキシ]メチル基、[4-(1-ナフチル)ペントキシ]メチル基、[6-(1-ナフチル)ヘキシルオキシ]メチル基、2-[(1-ナフチル)メトキシ]エチル基、1-[2-(2-ナフチル)エトキシ]エチル基、3-[3-(1-ナフチル)プロポキシ]プロピル基、4-[2-(2-ナフチル)プロポキシ]ブチル基、5-[4-(1-ナフチル)ブトキシ]ペンチル基、6-[5-(2-ナフチル)ペントキシ]ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[4-(1-ナフチル)ペントキシ]エチル基、2-メチル-3-[6-(1-ナフチル)ヘ

キシロキシ] プロピル基等を挙げることができる。

【0450】

1, 2, 4-オキサジアゾリルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基 [1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい] としては、例えば、
 [(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) メトキシ] メチル基、[2-(5-1, 2, 4-オキサジアゾリル) エトキシ] メチル基、[3-(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) プロポキシ] メチル基、[2-(5-1, 2, 4-オキサジアゾリル) プロポキシ] メチル基、[4-(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) ブトキシ] メチル基、[5-(5-1, 2, 4-オキサジアゾリル) ペントキシ] メチル基、[4-(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) ペントキシ] メチル基、[6-(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) ヘキシロキシ] メチル基、2-[(5-1, 2, 4-オキサジアゾリル) メトキシ] エチル基、1-[2-(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) エトキシ] エチル基、3-[3-(5-1, 2, 4-オキサジアゾリル) プロポキシ] プロピル基、4-[2-(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) プロポキシ] ブチル基、5-[(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) メトキシ] ペンチル基、6-[4-(5-1, 2, 4-オキサジアゾリル) ブトキシ] ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[5-(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) ペントキシ] エチル基、2-メチル-3-[4-(5-1, 2, 4-オキサジアゾリル) ペントキシ] プロピル基、2-[6-(3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) ヘキシロキシ] エチル基、(5-フェニル-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル) メトキシメチル基、(3-フェニル-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル) メトキシメチル基等の1, 2, 4-オキサジアゾリルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基 [1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい] を挙げることができる。

【0451】

ピリジルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基 [ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、例えば、(2-ピリジル) メトキシメチル基、[2-(3-ピリジル) エトキシ] メチル基、[3-(4-ピリジル) プロポキシ] メチル基、[2-(2-ピリジル) プロポキシ] メチル基、[4-(3-ピリジル) ブトキシ] メチル基、[5-(4-ピリジル) ペントキシ] メチル基、[4-(2-ピリジル) ペントキシ] メチル基、[6-(3-ピリジル) ヘキシロキシ] メチル基、2-[(4-ピリジル) メトキシ] エチル基、1-[2-(2-ピリジル) エトキシ] エチル基、3-[3-(3-ピリジル) プロポキシ] プロピル基、4-[2-(4-ピリジル) プロポキシ] ブチル基、5-[(2-ピリジル) メトキシ] ペンチル基、6-[4-(2-ピリジル) ブトキシ] ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[5-(3-ピリジル) ペントキシ] エチル基、2-メチル-3-[4-(4-ピリジル) ペントキシ] プロピル基、2-[6-(2-ピリジル) ヘキシロキシ] エチル基、(2-トリフルオロメチル-5-ピリジル) メトキシメチル基、(4-クロロ-2-ピリジル) メトキシメチル基、(3-トリフルオロメチル-2-ピリジル) メトキシメチル基、(2-メトキシ-4-ピリジル) メトキシメチル基、(2-トリフルオロメトキシ-5-ピリジル) メトキシメチル基、(2, 4-ジブromo-3-ピリジル) メトキシメチル基、(2, 4, 6-トリメチル-5-ピリジル) メトキシメチル基、(2, 4-ジメトキシ-5-ピリジル) メトキシメチル基、(2, 4, 6-トリフルオロ-3-ピリジル) メトキシメチル基等のピリジルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基 [ピリジン環上には、前記例示のハロゲン原子、前記例示のハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及び前記例示のハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい] を挙げることができる。

【0452】

チアゾリルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基 [チアゾール環上には、少なく

10

20

30

40

50

とも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい]としては、例えば、（4-チアゾリル）メトキシメチル基、[2-（2-チアゾリル）エトキシ]メチル基、[3-（5-チアゾリル）プロポキシ]メチル基、[2-（4-チアゾリル）プロポキシ]メチル基、[4-（2-チアゾリル）ブトキシ]メチル基、[5-（4-チアゾリル）ペントキシ]メチル基、[4-（5-チアゾリル）ペントキシ]メチル基、[6-（4-チアゾリル）ヘキシルオキシ]メチル基、2-[（2-チアゾリル）メトキシ]エチル基、1-[2-（5-チアゾリル）エトキシ]エチル基、3-[3-（4-チアゾリル）プロポキシ]プロピル基、4-[2-（2-チアゾリル）プロポキシ]ブチル基、5-[（4-チアゾリル）メトキシ]ペンチル基、6-[4-（5-チアゾリル）ブトキシ]ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[5-（4-チアゾリル）ペントキシ]エチル基、2-メチル-3-[4-（2-チアゾリル）ペントキシ]プロピル基、2-[6-（5-チアゾリル）ヘキシルオキシ]エチル基、[2-（4-メチルフェニル）-4-チアゾリル]メトキシメチル基、[2-（4-クロロフェニル）-4-チアゾリル]メトキシメチル基、[2-（4-トリフルオロメチルフェニル）-4-チアゾリル]メトキシメチル基、[5-（4-メトキシフェニル）-4-チアゾリル]メトキシメチル基、[2-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-4-チアゾリル]メトキシメチル基、[5-（2, 4-ジクロロフェニル）-2-チアゾリル]メトキシメチル基、[4-（2, 4, 6-トリメチルフェニル）-2-チアゾリル]メトキシメチル基、[4-（2, 4-ジメトキシフェニル）-2-チアゾリル]メトキシメチル基等のチアゾリルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基[チアゾール環上には、1～2個の前記例示のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）が置換していてもよい]を挙げることができる。

【0453】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基[1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい]としては、例えば、（6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）メトキシメチル基、[2-（2-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）エトキシ]メチル基、[3-（3-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）プロポキシ]メチル基、[2-（4-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）プロポキシ]メチル基、[4-（5-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）ブトキシ]メチル基、[5-（6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）ペントキシ]メチル基、[4-（6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）ペントキシ]メチル基、[6-（5-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）ヘキシルオキシ]メチル基、2-[（6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）メトキシ]エチル基、1-[2-（6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）エトキシ]エチル基、3-[3-（5-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）プロポキシ]プロピル基、4-[2-（5-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）プロポキシ]ブチル基、5-[4-（6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）ブトキシ]ペンチル基、6-[5-（5-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）ペントキシ]ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[4-（6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）ペントキシ]エチル基、2-メチル-3-[6-（6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）ヘキシルオキシ]プロピル基、（1, 1, 4, 4-テトラメチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）メトキシメチル基、（1, 1, 4-トリメチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）メトキシメチル基、（1, 1-ジメチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）メトキシメチル基、（1, 1-ジメチル-7-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）メトキシメチル基、（1-メチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル）メトキシメチル基、（1, 4-ジメチル-

6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシメチル基、(1, 1, 4, 4-テトラエチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシメチル基、(1, 1-ジメチル-4-エチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシメチル基、(1, 1-ジ-n-プロピル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシメチル基、(4, 4-ジ-n-ブチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシメチル基、(1-n-ペンチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシメチル基、(1, 4-ジ-n-ヘキシル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシメチル基、(1-メチル-5-n-プロピル-4-エチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシメチル基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基〔1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、1~4個の前記C 1~6アルキル基が置換していてもよい〕を挙げることができる。

10

【0454】

カルバモイルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基〔アミノ基上には、C 3~8シクロアルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、カルバモイルメトキシメチル基、2-（カルバモイルエトキシ）メチル基、（3-カルバモイルプロポキシ）メチル基、（2-カルバモイルプロポキシ）メチル基、（4-カルバモイルブトキシ）メチル基、（5-カルバモイルペントキシ）メチル基、（4-カルバモイルペントキシ）メチル基、（6-カルバモイルヘキシルオキシ）メチル基、2-（カルバモイルメトキシ）エチル基、1-（2-カルバモイルエトキシ）エチル基、3-（3-カルバモイルプロポキシ）プロピル基、4-（2-カルバモイルプロポキシ）ブチル基、5-（カルバモイルメトキシ）ペンチル基、4-（2-カルバモイルプロポキシ）ブチル基、6-（4-カルバモイルブトキシ）ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-（5-カルバモイルペントキシ）エチル基、2-メチル-3-（4-カルバモイルペントキシ）プロピル基、2-（6-カルバモイルヘキシルオキシ）エチル基、〔N-（4-メチルフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、〔N-（4-クロロフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、〔N-（4-トリフルオロメチルフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、〔N-（4-メトキシフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、〔N-（4-トリフルオロメトキシフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、〔N-（2, 4-ジクロロフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、〔N-（2, 4, 6-トリメチルフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、〔N-（2, 4-ジメトキシフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、（N-シクロヘキシルカルバモイル）メトキシメチル基、（N-シクロペンチルカルバモイル）メトキシメチル基、（N-シクロヘプチルカルバモイル）メトキシメチル基、（N-シクロオクチルカルバモイル）メトキシメチル基、（N-シクロブチルカルバモイル）メトキシメチル基、（N-シクロプロピルカルバモイル）メトキシメチル基、（N-シクロプロピル-N-シクロヘキシルカルバモイル）メトキシメチル基、（N、N-ジシクロヘキシルカルバモイル）メトキシメチル基、〔N-シクロプロピル-N-（4-フルオロメチルフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基、〔N-シクロヘキシル-N-（4-フルオロメチルフェニル）カルバモイル〕メトキシメチル基等のカルバモイルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基（アミノ基上には、前記例示のC 3~8シクロアルキル基及び前記例示のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい）を挙げることができる。

20

30

40

【0455】

ベンゾフリルC 1~6アルコキシ置換C 1~6アルキル基〔ベンゾフラン環上には、少

50

なくとも1個のシアノ基が置換していてもよい]としては、例えば、(2-ベンゾフリル)メトキシメチル基、[2-(3-ベンゾフリル)エトキシ]メチル基、[3-(4-ベンゾフリル)プロポキシ]メチル基、[2-(5-ベンゾフリル)プロポキシ]メチル基、[4-(6-ベンゾフリル)ブトキシ]メチル基、[5-(7-ベンゾフリル)ペントキシ]メチル基、[4-(2-ベンゾフリル)ペントキシ]メチル基、[6-(3-ベンゾフリル)ヘキシルオキシ]メチル基、2-[(2-ベンゾフリル)メトキシ]エチル基、1-[2-(3-ベンゾフリル)エトキシ]エチル基、3-[3-(4-ベンゾフリル)プロポキシ]プロピル基、4-[2-(5-ベンゾフリル)プロポキシ]ブチル基、5-[4-(6-ベンゾフリル)ブトキシ]ペンチル基、6-[5-(7-ベンゾフリル)ペントキシ]ヘキシル基、1, 1-ジメチル-2-[4-(2-ベンゾフリル)ペントキシ]エチル基、2-メチル-3-[6-(3-ベンゾフリル)ヘキシルオキシ]プロピル基、(7-シアノ-2-ベンゾフリル)メトキシメチル基、(6-シアノ-2-ベンゾフリル)メトキシメチル基、(5-シアノ-2-ベンゾフリル)メトキシメチル基、(4-シアノ-2-ベンゾフリル)メトキシメチル基、(3-シアノ-2-ベンゾフリル)メトキシメチル基、(2-シアノ-5-ベンゾフリル)メトキシメチル基、(6, 7-ジシアノ-2-ベンゾフリル)メトキシメチル基、(3, 4, 5-トリシアノ-2-ベンゾフリル)メトキシメチル基等のベンゾフリルC1~6アルコキシ置換C1~6アルキル基[ベンゾフラン環上には、1~3個のシアノ基が置換していてもよい]を挙げることができる。

10

【0456】

20

C7~10アルコキシ基としては、例えば、n-ヘプチルオキシ基、n-オクチルオキシ基、n-ノニルオキシ基、n-デシルオキシ基、5-メチルヘキシルオキシ基、4, 4-ジメチルペンチルオキシ基、6-メチルヘプチルオキシ基、5, 5, 5-トリメチルペンチルオキシ基等を挙げることができる。

【0457】

フェノキシ基[フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、C3~8シクロアルキル基、C7~10アルコキシ基及びフェノキシ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種を置換しているものとする]としては、例えば、4-ベンジルオキシフェノキシ基、4-シクロヘキシルフェノキシ基、4-n-オクチルオキシフェノキシ基、4-シクロペンチルフェノキシ基、3-フェノキシフェノキシ基、3-ベンジルオキシフェノキシ基、3-シクロヘキシルフェノキシ基、3-n-オクチルオキシフェノキシ基、3-シクロペンチルフェノキシ基、4-フェノキシフェノキシ基、2-ベンジルオキシフェノキシ基、2-シクロヘキシルフェノキシ基、2-n-ヘプチルオキシフェノキシ基、2-シクロペンチルフェノキシ基、2-フェノキシフェノキシ基、4-(2-フェニルエトキシ)フェノキシ基、4-シクロオクチルフェノキシ基、4-n-ノニルオキシフェノキシ基、4-シクロプロピルフェノキシ基、2, 3-ジフェノキシフェノキシ基、4-(3-フェニルプロポキシ)フェノキシ基、4-シクロヘプチルフェノキシ基、4-n-デシルオキシフェノキシ基、4-シクロブチルフェノキシ基、2, 4, 6-トリフェノキシフェノキシ基、4-(4-フェニルブトキシ)フェノキシ基、2, 4-ジシクロヘキシルフェノキシ基、2, 4-ジ-n-オクチルオキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリシクロペンチルフェノキシ基、3-フェノキシ-4-ベンジルオキシフェノキシ基、4-(5-フェニルペンチルオキシ)フェノキシ基、4-シクロヘキシル-3-フェノキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリ-n-オクチルオキシフェノキシ基、4-シクロペンチル-2-ベンジルオキシフェノキシ基、3-フェノキシ-2-シクロヘキシルフェノキシ基、4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェノキシ基、3, 4, 5-トリベンジルオキシフェノキシ基、2, 4-ジベンジルオキシフェノキシ基等のフェノキシ基[フェニル環上には、前記例示のフェニルC1~6アルコキシ基、前記例示のC3~8シクロアルキル基、前記例示のC7~10アルコキシ基及びフェノキシ基なる群より選ばれた基が1~3個置換しているものとする]を挙げることができる。

30

40

【0458】

50

2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基 [2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい] としては、例えば、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) 2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基、3-オキソ-6-2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基、2-オキソ-5-2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基等の2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基 [2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、1~2個のオキシ基が置換していてもよい] を挙げることができる。

【0459】

ベンゾチアゾリルオキシ基 [ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい] としては、例えば、(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ基、2-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-エチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-n-プロピル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-tert-ブチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-n-ペンチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-n-ヘキシル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2, 5-ジメチル-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4, 5, 6-トリメチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基等のベンゾチアゾリルオキシ基 [ベンゾチアゾール環上には1~3個の前記例示のC1~6アルキル基が置換していてもよい] を挙げることができる。

【0460】

フリルC1~6アルコキシ基 [フラン環上には、少なくとも1個のC1~6アルコシカルボニル基が置換していてもよい] としては、例えば、(2-又は3-) フリルメトキシ基、2- [(2-又は3-) フリル] エトキシ基、1- [(2-又は3-2-) フリル] エトキシ基、3- [(2-又は3-) フリル] プロポキシ基、2- [(2-又は3-) フリル] プロポキシ基、4- [(2-又は3-) フリル] ブトキシ基、5- [(2-又は3-) フリル] ペントキシ基、4- [(2-又は3-) フリル] ペントキシ基、6- [(2-又は3-) フリル] ヘキシルオキシ基、2-メチル-3- [(2-又は3-) フリル] プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2- [(2-又は3-) フリル] エトキシ基、2-エトキシカルボニル-5-フリルメトキシ基、2-エトキシカルボニル-5-フリルメトキシ基、2-メトキシカルボニル-4-フリルメトキシ基、2-プロポキシカルボニル-3-フリルメトキシ基、2-ブトキシカルボニル-5-フリルメトキシ基、2-ペンチルオキシカルボニル-5-フリルメトキシ基、2-ヘキシルオキシカルボニル-5-フリルメトキシ基、2, 3-ジエトキシカルボニル-5-フリルメトキシ基、2, 3, 4-トリメトキシカルボニル-5-フリルメトキシ基等のフリルC1~6アルコキシ基 [フラン環上には、1~3個の前記例示のC1~6アルコシカルボニル基が置換していてもよい] を挙げることができる。

【0461】

テトラゾリルC1~6アルコキシ基 [テトラゾール環上には、フェニルC1~6アルキル基及びC3~8シクロアルキルC1~6アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種を置換していてもよい] としては、例えば、(1-, 2-又は5-) テトラゾリルメトキシ基、2- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] エトキシ基、1- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] エトキシ基、3- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] プロポキシ基、2- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] プロポキシ基、4- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] ブトキシ基、5- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] ペントキシ基、4- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] ペントキシ基、6- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] ヘキシルオキシ基、2-メチル-3- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2- [(1-, 2-又は5-) テトラゾリル] エトキシ基、1- (2-フェニルエチル) -5-テトラゾリルメトキシ基、1-シクロヘキシルメチル-5-テトラゾリルメトキシ基、5-ベンジル-1-テトラゾリルメトキシ基、5- (2-シクロペンチルエチル) -1-テトラゾリルメトキシ基、1-ベンジル-5-テトラゾリルメトキシ基、1- (3-フェニルプロピル) -5-テトラゾリルメトキシ基、1- (4-フェニルブチル) -5-テトラゾリルメトキシ基、1- (5-フェニルペンチル) -5-テトラゾリルメトキシ基、1- (6-フェ

10

20

30

40

50

ニルヘキシル) - 5 - テトラゾリルメトキシ基、1 - シクロブチルメチル - 5 - テトラゾリルメトキシ基、1 - (3 - シクロプロピルプロピル) - 5 - テトラゾリルメトキシ基、1 - (4 - シクロヘプチルブチル) - 5 - テトラゾリルメトキシ基、1 - (5 - シクロオクチルルペンチル) - 5 - テトラゾリルメトキシ基、1 - (6 - シクロヘキシルヘキシル) - 5 - テトラゾリルメトキシ基等のテトラゾリル C 1 ~ 6 アルコキシ基 [テトラゾール環上には、前記例示のフェニル C 1 ~ 6 アルキル基及び前記例示の C 3 ~ 8 シクロアルキル C 1 ~ 6 アルキル基なる群より選ばれた基が 1 個置換していてもよい] を挙げることができる。

【0462】

1, 2, 4 - オキサジアゾリル C 1 ~ 6 アルコキシ基 [1, 2, 4 - オキサジアゾール環上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) が置換していてもよい] としては、例えば、(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、2 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] エトキシ基、1 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] エトキシ基、3 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] プロポキシ基、2 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] プロポキシ基、4 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] ブトキシ基、5 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] ペントキシ基、4 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] ペントキシ基、6 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] ヘキシルオキシ基、2 - メチル - 3 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] プロポキシ基、1, 1 - ジメチル - 2 - [(3 - 又は 5 -) 1, 2, 4 - オキサジアゾリル] エトキシ基、3 - (4 - tert - ブチルフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - フェニル - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、5 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 3 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、5 - (4 - メトキシフェニル) - 3 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、5 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 3 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (2, 4 - ジメチルフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、5 - (2, 4, 6 - トリメトキシフェニル) - 3 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (2 - メチル - 5 - クロロフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (3 - メトキシ - 5 - クロロフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基、3 - (2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロフェニル) - 5 - 1, 2, 4 - オキサジアゾリルメトキシ基等の 1, 2, 4 - オキサジアゾリル C 1 ~ 6 アルコキシ基 [1, 2, 4 - オキサジアゾール環上には、前記例示のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個が置換していてもよい) が置換していてもよい] を挙げることができる。

【0463】

ベンゾチエニル C 1 ~ 6 アルコキシ基 [ベンゾチオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい] としては、例えば、(2 -、3 -、4 -、5 -、6 - 又は 7 -) ベンゾチエニルメトキシ基、2 - [(2 -、3 -、4 -、5 -、6 - 又は 7 -) ベンゾチエニル] エトキシ基、1 - [(2 -、3 -、4 -、5 -、6 - 又は 7 -) ベンゾチエニル] エトキシ基、3 - [(2 -、3 -、4 -、5 -、6 - 又は 7 -) ベンゾチ

10

20

30

40

50

エニル] プロポキシ基、2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] プロポキシ基、4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] ブトキシ基、5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] ペントキシ基、4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] ペントキシ基、6-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] ヘキシルオキシ基、2-メチル-3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチエニル] エトキシ基、5-クロロ-3-ベンゾチエニルメトキシ基、4-ブロモ-2-ベンゾチエニルメトキシ基、6-フルオロ-5-ベンゾチエニルメトキシ基、7-ヨード-4-1, 2, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、4, 5-ジクロロ-3-ベンゾチエニルメトキシ基、3, 4, 5-トリフルオロ-2-ベンゾチエニルメトキシ基等のベンゾチエニルC 1~6 アルコキシ基 [ベンゾチオフェン環上には、1~3個のハロゲン原子が置換していてもよい] を挙げることができる。

【0464】

イソオキサゾリルC 1~6 アルコキシ基 [イソオキサゾール環上には、少なくとも1個のC 1~6 アルキル基が置換していてもよい] としては、例えば、(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリルメトキシ基、2-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] エトキシ基、1-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] エトキシ基、3-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] プロポキシ基、2-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] プロポキシ基、4-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] ブトキシ基、5-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] ペントキシ基、4-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] ペントキシ基、6-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] ヘキシルオキシ基、2-メチル-3-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-[(3-, 4-又は5-) イソオキサゾリル] エトキシ基、(3, 5-ジメチル-4-イソオキサゾリル) メトキシ基、(3-メチル-5-イソオキサゾリル) メトキシ基、(4-エチル-5-イソオキサゾリル) メトキシ基、(5-n-プロピル-4-イソオキサゾリル) メトキシ基、(3-tert-ブチル-4-イソオキサゾリル) メトキシ基、(4-n-ペンチル-5-イソオキサゾリル) メトキシ基、(5-n-ヘキシル-5-イソオキサゾリル) メトキシ基等のイソオキサゾリルC 1~6 アルコキシ基 [イソオキサゾール環上には、1~2個の前記例示のC 1~6 アルキル基が置換していてもよい] を挙げることができる。

【0465】

1, 3, 4-オキサジアゾリルC 1~6 アルコキシ基 [1, 3, 4-オキサジアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のC 1~6 アルキル基が置換していてもよい) が置換していてもよい] としては、例えば、2-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、2-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) エトキシ基、1-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) エトキシ基、3-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) プロポキシ基、2-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) プロポキシ基、4-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) ブトキシ基、5-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) ペントキシ基、4-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) ペントキシ基、6-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) ヘキシルオキシ基、2-メチル-3-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-(2-1, 3, 4-オキサジアゾリル) エトキシ基、2-(4-メチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、3-フェニル-5-1, 2, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、2-(4-エチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、3-(4-n-プロピルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、3-(4-sec-ブチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、3-(4-n-ペンチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、3-(2, 4-ジメチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基

、3-(3-n-ヘキシルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、3-(2-メチルフェニル)-5-1, 3, 4-オキサジアゾリルメトキシ基、3-(3-メチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリルメトキシ基等の1, 3, 4-オキサジアゾリルC 1~6アルコキシ基〔1, 3, 4-オキサジアゾール環上には、1個のフェニル基（フェニル環上には、1~3個の前記例示のC 1~6アルキル基が置換していてもよい）が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0466】

ナフチルC 1~6アルコキシ基としては、例えば、(2-又は3-)ナフチルメトキシ基、2-〔(2-又は3-)ナフチル〕エトキシ基、1-〔(2-又は3-)ナフチル〕エトキシ基、3-〔(2-又は3-)ナフチル〕プロポキシ基、2-〔(2-又は3-)ナフチル〕プロポキシ基、4-(2-又は3-)ナフチル〕ブトキシ基、5-〔(2-又は3-)ナフチル〕ペントキシ基、4-(1-または2-)ナフチル〕ペントキシ基、6-(2-又は3-)ナフチル〕ヘキシルオキシ基、2-メチル-3-〔(2-又は3-)ナフチル〕プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-〔(2-又は3-)ナフチル〕エトキシ基等を挙げることができる。

【0467】

ピリジルC 1~6アルコキシ基（ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が置換していてもよい）としては、例えば、(1-、2-、3-又は4-)ピリジルメトキシ基、2-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕エトキシ基、1-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕エトキシ基、3-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕プロポキシ基、2-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕プロポキシ基、4-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕ブトキシ基、5-〔1-、2-、3-又は4-〕ピリジル〕ペントキシ基、4-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕ペントキシ基、6-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕ヘキシルオキシ基、2-メチル-3-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-〔(1-、2-、3-又は4-)ピリジル〕エトキシ基、2-トリフルオロメチル-5-ピリジルメトキシ基、2-メチル-5-ピリジルメトキシ基、2-エチル-6-ピリジルメトキシ基、3-n-プロピル-2-ピリジルメトキシ基、4-n-ブチル-5-ピリジルメトキシ基、3-n-ペンチル-4-ピリジルメトキシ基、2-n-ヘキシル-6-ピリジルメトキシ基、2, 3-ジトリフルオロメチル-5-ピリジルメトキシ基、3, 4, 5-トリフルオロメチル-2-ピリジルメトキシ基、2, 4-ジメチル-5-ピリジルメトキシ基、3, 4, 5-トリメチル-2-ピリジルメトキシ基等のピリジルC 1~6アルコキシ基（ピリジン環上には、1~3個のハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が置換していてもよい）を挙げることができる。

【0468】

チアゾリルC 1~6アルコキシ基〔チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕としては、例えば、(2-、4-又は5-)チアゾリルメトキシ基、2-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕エトキシ基、1-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕エトキシ基、3-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕プロポキシ基、2-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕プロポキシ基、4-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕ブトキシ基、5-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕ペントキシ基、4-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕ペントキシ基、6-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕ヘキシルオキシ基、2-メチル-3-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-〔(2-、4-又は5-)チアゾリル〕エトキシ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメトキシ基、2-フェニル-4-チアゾリルメトキシ基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメトキシ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシ基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-4-チア

10

20

30

40

50

ゾリルメトキシ基、5-(4-メトキシフェニル)-3-チアゾリルメトキシ基、5-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-チアゾリルメトキシ基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-チアゾリルメトキシ基、2-(2, 4-ジメチルフェニル)-5-チアゾリルメトキシ基、2-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)-4-チアゾリルメトキシ基、2-(2, 4-ジブプロモフェニル)-4-チアゾリルメトキシ基、2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-5-チアゾリルメトキシ基、2-(3, 5-ジクロロフェニル)-4-チアゾリルメトキシ基、2-(2-メチル-5-クロロフェニル)-4-チアゾリルメトキシ基、2-(3-メトキシ-5-クロロフェニル)-4-チアゾリルメトキシ基、2-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-4-チアゾリルメトキシ基、2, 5-ジフェニル-4-チアゾリルメトキシ基等のチアゾリルC 1~6アルコキシ基〔チアゾール環上には、1~2個の前記例示のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕を挙げることができる。

10

【0469】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルC 1~6アルコキシ基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のC 1~6アルキル基が置換していてもよい。）としては、例えば、(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルメトキシ基、2-[(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]エトキシ基、1-[(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]エトキシ基、3-[(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]プロポキシ基、2-[(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]プロポキシ基、4-[(1-又2-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]ブトキシ基、5-[(1-又は2-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]ペントキシ基、4-[(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]ペントキシ基、6-[(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]ヘキシルオキシ基、2-メチル-3-[(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]プロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-[(1-, 2-, 5-又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル]エトキシ基、(1, 1, 4, 4-テトラメチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1, 1, 4-トリメチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1, 1-ジメチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(4, 4-ジメチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1-メチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1, 4-ジメチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1, 1, 4, 4-テトラエチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1, 1-ジメチル-4-エチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1, 1-ジn-プロピル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(4, 4-ジn-ブチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1-n-ペンチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1, 4-ジn-ヘキシル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基、(1-メチル-5-n-プロピル-4-エチル-6-1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル)メトキシ基等1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルC 1~6アルコキシ基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、1~4個の前記例示のC 1~6アルキル基が置換していてもよい）を挙げることができる。

20

30

40

【0470】

フェノキシC 1~6アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、フェノキシメトキシ基、2-フェノキシエトキシ基、1-フェノキシエトキシ基、3

50

ーフェノキシプロポキシ基、2-フェノキシプロポキシ基、4-フェノキシブトキシ基、
 5-フェノキシペントキシ基、4-フェノキシペントキシ基、6-フェノキシヘキシルオ
 キシ基、2-メチル-3-フェノキシプロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-フェノキシ
 エトキシ基、2-フルオロフェノキシメトキシ基、3-フルオロフェノキシメトキシ基、
 4-フルオロフェノキシメトキシ基、2-(2-フルオロフェノキシ)エトキシ基、2-
 (3-フルオロフェノキシ)エトキシ基、2-(4-フルオロフェノキシ)エトキシ基、
 2-クロロフェノキシメトキシ基、3-クロロフェノキシメトキシ基、4-クロロフェノ
 キシメトキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシメトキシ基、4-クロロ-3-フル
 オロフェノキシメトキシ基、2-クロロ-4-フルオロフェノキシメトキシ基、3, 4
 -ジクロロフェノキシメトキシ基、3, 5-ジクロロフェノキシメトキシ基、2, 3-ジ
 クロロフェノキシメトキシ基、2, 5-ジクロロフェノキシメトキシ基、2, 3, 4-トリ
 クロロフェノキシメトキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシメトキシ基、2,
 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシメトキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェノ
 キシメトキシ基、4-イソプロピルフェノキシメトキシ基、4-n-ブチルフェノキシメ
 トキシ基、4-メチルフェノキシメトキシ基、2-メチルフェノキシメトキシ基、3-メ
 チルフェノキシメトキシ基、2, 4-ジメチルフェノキシメトキシ基、2, 3-ジメチル
 フェノキシメトキシ基、2, 6-ジメチルフェノキシメトキシ基、3, 5-ジメチルフェ
 ノキシメトキシ基、2, 5-ジメチルフェノキシメトキシ基、2, 4, 6-トリメチルフェ
 ノキシメトキシ基、4-エチルフェノキシメトキシ基、4-イソプロピルフェノキシメ
 トキシ基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシメトキシ基、4-イソプロポキシフ
 ェノキシメトキシ基、4-n-ブトキシフェノキシメトキシ基、4-メトキシフェノキシ
 メトキシ基、2-メトキシフェノキシメトキシ基、3-メトキシフェノキシメトキシ基、
 2, 4-ジメトキシフェノキシメトキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシメトキシ基、
 2, 6-ジメトキシフェノキシメトキシ基、3, 5-ジメトキシフェノキシメトキシ基、
 2, 5-ジメトキシフェノキシメトキシ基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシメトキシ
 基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシメトキシ基、2-イソプロポキシフェ
 ノキシメトキシ基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシメトキシ基、2-クロロ-4-ト
 リフルオロメトキシフェノキシメトキシ基、3-メチル-4-フルオロフェノキシメト
 キシ基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシメトキシ基、2-(2-クロロ
 フェノキシ)エトキシ基、2-(3-クロロフェノキシ)エトキシ基、2-(4-クロロ
 フェノキシ)エトキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシメトキシ基、3-トリフル
 オロメチルフェノキシメトキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシメトキシ基、2-ト
 リフルオロメトキシフェノキシメトキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシメト
 キシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシメトキシ基、2-(2-トリフルオロメチ
 ルフェノキシ)エトキシ基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)エトキシ基、2-
 (4-トリフルオロメチルフェノキシ)エトキシ基、2-(2-トリフルオロメトキシ
 フェノキシ)エトキシ基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)エトキシ基、2-
 (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エトキシ基、3-(2-トリフルオロメチル
 フェノキシ)プロポキシ基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)プロポキシ基、
 3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロポキシ基、3-(2-トリフルオロメチ
 ルフェノキシ)プロポキシ基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロポキシ
 基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロポキシ基、4-(3-トリフルオ
 ロメチルフェノキシ)ブトキシ基、5-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ペントキ
 シ基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ペントキシ基、4-(4-トリフルオ
 ロメトキシフェノキシ)ペントキシ基、6-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ヘキ
 シルオキシ基、6-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ヘキシルオキシ基、6-(4-ト
 リフルオロメトキシフェノキシ)ヘキシルオキシ基等のフェノキシC1~6アルコキ
 シ基(フェニル環上には、前記例示のハロゲン原子、前記例示のハロゲン置換もしくは未
 置換のC1~6アルキル基及び前記例示のハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコ
 キシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)

10

20

30

40

50

を挙げることができる。

【0471】

カルバモイルC 1～6アルコキシ基〔アミノ基上には、C 3～8シクロアルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、カルバモイルメトキシ基、2-カルバモイルエトキシ基、3-カルバモイルプロポキシ基、2-カルバモイルプロポキシ基、4-カルバモイルブトキシ基、5-カルバモイルペントキシ基、4-カルバモイルペントキシ基、6-カルバモイルヘキシルオキシ基、2-メチル-3-カルバモイルプロポキシ基、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエトキシ基、〔N-（4-メチルフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、〔N-（4-クロロフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、〔N-（4-トリフルオロメチルフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、〔N-（4-メトキシフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、〔N-（4-トリフルオロメトキシフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、〔N-（2, 4-ジクロロフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、〔N-（2, 4, 6-トリメチルフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、〔N-（2, 4-ジメトキシフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、（N-シクロヘキシルカルバモイル）メトキシ基、（N-シクロペンチルカルバモイル）メトキシ基、（N-シクロヘプチルカルバモイル）メトキシ基、（N-シクロオクチルカルバモイル）メトキシ基、（N-シクロブチルカルバモイル）メトキシ基、（N-シクロプロピルカルバモイル）メトキシ基、（N-シクロプロピル-N-シクロヘキシルカルバモイル）メトキシ基、（N, N-ジシクロヘキシルカルバモイル）メトキシ基、〔N-シクロプロピル-N-（4-フルオロメチルフェニル）カルバモイル〕メトキシ基、〔N-シクロヘキシル-N-（4-フルオロメチルフェニル）カルバモイル〕メトキシ基等のカルバモイルC 1～6アルコキシ基〔アミノ基上には、前記例示のC 3～8シクロアルキル基及び前記例示のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0472】

ベンゾフリルC 1～6アルコキシ基（ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のシアノ基が置換していてもよい）としては、例えば、（2-ベンゾフリル）メトキシ基、2-（3-ベンゾフリル）エトキシ基、3-（4-ベンゾフリル）プロポキシ基、2-（5-ベンゾフリル）プロポキシ基、4-（6-ベンゾフリル）ブトキシ基、5-（7-ベンゾフリル）ペントキシ基、4-（2-ベンゾフリル）ペントキシ基、6-（3-ベンゾフリル）ヘキシルオキシ基、2-（2-ベンゾフリル）メトキシ基、1, 1-ジメチル-2-（2-ベンゾフリル）エトキシ基、2-メチル-3-（3-ベンゾフリル）プロポキシ基、（7-シアノ-2-ベンゾフリル）メトキシ基、（6-シアノ-2-ベンゾフリル）メトキシ基、（5-シアノ-2-ベンゾフリル）メトキシ基、（4-シアノ-2-ベンゾフリル）メトキシ基、（3-シアノ-2-ベンゾフリル）メトキシ基、（2-シアノ-5-ベンゾフリル）メトキシ基、（6, 7-ジシアノ-2-ベンゾフリル）メトキシ基、（3, 4, 5-トリシアノ-2-ベンゾフリル）メトキシ基等のベンゾフリルC 1～6アルキル基（ベンゾフラン環上には、1～3個のシアノ基が置換していてもよい）を挙げることができる。

【0473】

ナフチルオキシC 1～6アルキル基（ナフタレン環上には、少なくとも1個のC 1～6アルコキシ基が置換していてもよい。）としては、例えば、（1-又は2-）ナフチルオキシメチル基、2-〔（1-又は2-）ナフチルオキシ〕エチル基、1-〔（1-又は2-）ナフチルオキシ〕エチル基、3-〔（1-又は2-）ナフチルオキシ〕プロピル基、2-〔（1-又は2-）ナフチルオキシ〕ブチル基、5-〔（1-又は2-）ナフチルオキシ〕

シ] ペンチル基、4- [(1-又は2-) ナフチルオキシ] ペンチル基、6- [(1-又は2-) ナフチルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3- [(1-又は2-) ナフチルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2- [(1-又は2-) ナフチルオキシ] エチル基、2- (4-メトキシ-1-ナフチルオキシ) エチル基、(4-メトキシ-1-ナフチルオキシ) メチル基、2- (3-エトキシ-1-ナフチルオキシ) エチル基、2-n-プロポキシ-1-ナフチルオキシメチル基、5-tert-ブトキシ-2-ナフチルオキシメチル基、6-n-ペンチルオキシ-3-ナフチルオキシメチル基、7-n-ヘキシルオキシ-4-ナフチルオキシメチル基、2- (2, 4-ジメトキシ-1-ナフチルオキシ) エチル基、2- (1, 1, 4, 4-テトラメトキシ-5-ナフチルオキシ) エチル基等のナフチルオキシC1~6アルキル基(ナフタレン環上には、1~4個の前記例示のC1~6アルコキシ基が置換していてもよい)を挙げることができる。

10

【0474】

ベンゾチアゾリルオキシC1~6アルキル基(ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい)としては、例えば、(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシメチル基、2- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] エチル基、1- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] エチル基、3- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] プロピル基、2- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] プロピル基、4- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] ブチル基、5- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] ペンチル基、4- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] ペンチル基、6- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2- [(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾチアゾリルオキシ] エチル基、2- (2-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ) エチル基、(2-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ) メチル基、2- (4-エチル-6-ベンゾチアゾリルオキシ) エチル基、(2-n-プロピル-4-ベンゾチアゾリルオキシ) メチル等、(5-tert-ブチル-6-ベンゾチアゾリルオキシ) メチル基、(6-n-ペンチル-7-ベンゾチアゾリルオキシ) メチル基、(7-n-ヘキシル-5-ベンゾチアゾリルオキシ) メチル基、2- (2, 4-ジメチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ) エチル基、2- (2, 4, 5-トリメチル-7-ベンゾチアゾリルオキシ) エチル基等のベンゾチアゾリルオキシC1~6アルキル基(ベンゾチアゾール環上には、1~3個の前記例示のC1~6アルキル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

20

30

【0475】

キノリルオキシC1~6アルキル基(キノリン環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい)としては、例えば、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシメチル基、2- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] エチル基、1- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] エチル基、3- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] プロピル基、2- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] プロピル基、4- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] ブチル基、5- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] ペンチル基、4- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] ペンチル基、6- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) キノリルオキシ] エチル基、2-メチル-8-キノリルオキシメチル基、(3-エチル-7-キノリルオキシ) メチル基、(4-n-プロピル-6-キノリルオキシ) メチル基、(5-n-ブチル-4-キノリルオキシ) メチル基、(6-n-ヘキシル-5-キノリルオキシ) メチル基、(2-メチル-7-キノリルオ

40

50

キシ)メチル基、(7-n-ペンチル-6-キノリルオキシ)メチル基、(8-メチル-2-キノリルオキシメチル)基、(2,4-ジメチル-8-キノリルオキシ)メチル基、(5,6,7-トリメチル-2-キノリルオキシ)メチル基等のキノリルオキシC1~6アルキル基(キノリン環上には、1~3個の前記例示のC1~6アルキル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0476】

2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシC1~6アルキル基(2,3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシメチル基、2-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]エチル基、1-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]エチル基、3-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]プロピル基、2-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]プロピル基、4-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]ブチル基、5-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]ペンチル基、4-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]ペンチル基、6-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]ヘキシル基、2-メチル-3-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]プロピル基、1,1-ジメチル-2-[(2-,3-,4-,5-,6-又は7-)2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ]エチル基、2-(2,2-ジメチル-7-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)エチル基、(2,2-ジメチル-7-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)メチル基、2-(3-エチル-6-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)エチル基、(4-n-プロピル-5-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)メチル基、(5-tert-ブチル-6-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)メチル基、(6-n-ペンチル-7-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)メチル基、(7-n-ヘキシル-5-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)メチル基、2-(2,4-ジメチル-5-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)エチル基、2-(2,2,3-トリメチル-7-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)エチル基、(2-オキソ-5-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)メチル基、(3-オキソ-6-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)メチル基、(2-オキソ-3-メチル-5-2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシ)メチル基等の2,3-ジヒドロベンゾフリルオキシC1~6アルキル基(2,3-ジヒドロベンゾフラン環上には、前記例示のC1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0477】

1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシC1~6アルキル基(1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい)としては、例えば、(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシメチル基、2-[(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]エチル基、1-[(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]エチル基、3-[(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]プロピル基、2-[(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]プロピル基、4-[(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]ブチル基、5-[(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]ペンチル基、4-[(1-又は2-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]ペンチル基、6-[(1-又は2-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]ヘキシル基、2-メチル-3-[(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ]プロピル基、1,1-ジメチル-2-[(1-,2-,5-又は6-)1,2,3,4-テ

10

20

30

40

50

トラヒドロナフチルオキシ] エチル基、[1-オキソ- (2-, 5-, 又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ] メチル基、[1, 4-ジオキソ- (2-, 5- 又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ] メチル基、1, 2, 4-トリオキソ- (3-, 5-, 6-, 7-又は8-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ] メチル基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシC 1~6アルキル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、1~3個のオキソ基が置換していてもよい) を挙げることができる。

【0478】

2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシC 1~6アルキル基 (2, 3-ジヒドロ-1H-インデン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) としては、例えば、(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシメチル基、2-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] エチル基、1-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] エチル基、3-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] プロピル基、2-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] プロピル基、4-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] ブチル基、5-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] ペンチル基、4-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] ペンチル基、6-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2-[(1-, 2-, 4-又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] エチル基、[1-オキソ- (2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] メチル基、[1, 3-ジオキソ- (2-, 4-, 又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ] メチル基等の2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシC 1~6アルキル基 (2, 3-ジヒドロ-1H-インデン環上には、1~2個のオキソ基が置換していてもよい) を挙げることができる。

【0479】

ベンゾオキサチオラニルオキシC 1~6アルキル基 (ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) としては、例えば、(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシメチル基、2-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] エチル基、1-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] エチル基、3-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] プロピル基、2-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] プロピル基、4-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] ブチル基、5-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] ペンチル基、4-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] ペンチル基、6-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2-[(2-, 4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] エチル基、[2-オキソ- (4-, 5-, 6-又は7-) ベンゾオキサチオラニルオキシ] メチル基等のベンゾオキサチオラニルオキシC 1~6アルキル基 (ベンゾオキサチオラン環上には、1個のオキソ基が置換していてもよい) を挙げることができる。

【0480】

イソキノリルオキシC 1~6アルキル基としては、例えば (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) イソキノリルオキシメチル基、2-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) イソキノリルオキシ] エチル基、1-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) イソキノリルオキシ] エチル基、3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-) イソキノリルオキシ] プロピル基、2-[(1-, 3-, 4-

10

20

30

40

50

、5-、6-、7-又は8-) イソキノリルオキシ] プロピル基、4- [(1-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) イソキノリルオキシ] ブチル基、5- [(1-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) イソキノリルオキシ] ペンチル基、4- [(1-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) イソキノリルオキシ] ペンチル基、6- [(1-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) イソキノリルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3- [(1-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) イソキノリルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2- [(1-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) イソキノリルオキシ] エチル基等を挙げることができる。

【0481】

ピリジルオキシC 1~6アルキル基としては、例えば、(2-、3-又は4-) ピリジルオキシメチル基、2- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] エチル基、1- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] エチル基、3- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] プロピル基、2- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] プロピル基、4- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] ブチル基、5- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] ペンチル基、4- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] ペンチル基、6- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2- [(2-、3-又は4-) ピリジルオキシ] エチル基等を挙げることができる。

【0482】

ジベンゾフリルオキシC 1~6アルキル基としては、例えば、(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシメチル基、2- [(1-、2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) ジベンゾフリルオキシ] エチル基、1- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] エチル基、3- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] プロピル基、2- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] プロピル基、4- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] ブチル基、5- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] ペンチル基、4- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] ペンチル基、6- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2- [(1-、2-、3-又は4-) ジベンゾフリルオキシ] エチル基等を挙げることができる。

【0483】

2H-1-ベンゾピラニルオキシC 1~6アルキル基(2H-1-ベンゾピラン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシメチル基、2- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] エチル基、1- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] エチル基、3- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] プロピル基、2- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] プロピル基、4- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] ブチル基、5- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] ペンチル基、4- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] ペンチル基、6- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] ヘキシル基、2-メチル-3- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] プロピル基、1, 1-ジメチル-2- [(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] エチル基、[2-オキシ-(3-、4-、5-、6-、7-又は8-) 2H-1-ベンゾピラニルオキシ] メチル基等の2H-1-ベンゾピラニルオキシC 1~6アルキル基(2H-1-ベンゾピラン環上には、1個のオキシ基が置換していてもよい)を挙げることができる。

10

20

30

40

50

【0484】

ベンゾイソキサゾリルオキシ C 1～6 アルキル基としては、例えば、（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシメチル基、2－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕エチル基、1－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕エチル基、3－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕プロピル基、2－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕プロピル基、4－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕ブチル基、5－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕ペンチル基、4－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕ペンチル基、6－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕ヘキシル基、2－メチル－3－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕プロピル基、1，1－ジメチル－2－〔（3－、4－、5－、6－、又は7－）ベンゾイソキサゾリルオキシ〕エチル基等を挙げることができる。

10

【0485】

ベンゾフラザニルオキシ C 1～6 アルキル基としては、例えば、（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシメチル基、2－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕エチル基、1－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕エチル基、3－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕プロピル基、2－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕プロピル基、4－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕ブチル基、5－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕ペンチル基、4－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕ペンチル基、6－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕ヘキシル基、2－メチル－3－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕プロピル基、1，1－ジメチル－2－〔（4－又は5－）ベンゾフラザニルオキシ〕エチル基等を挙げることができる。

20

【0486】

キノキサリルオキシ C 1～6 アルキル基としては、例えば、（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシメチル基、2－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕エチル基、1－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕エチル基、3－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕プロピル基、2－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕プロピル基、4－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕ブチル基、5－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕ペンチル基、4－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕ペンチル基、6－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕ヘキシル基、2－メチル－3－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕プロピル基、1，1－ジメチル－2－〔（2－、5－又は6－）キノキサリルオキシ〕エチル基等を挙げることができる。

30

【0487】

フェニル C 2～10 アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、C 1～4 アルキレンジオキシ基、C 1～6 アルキルチオ基、ベンゾイル基、シアノ基、ニトロ基、C 2～6 アルカノイルオキシ基、置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基、水酸基、フェニル C 1～6 アルコキシ基、フェノキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、前記例示のフェニル C 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）に加えて、2－n－ペンチル－3－フェニル－2－プロペニル基、9－フェニル－2－ノネニル基、10－フェニル－2－デセニル基、8－フェニル－1，3－オクタジエニル基、9－フェニル－1，3，5－ノナトリエニル基、10－2，4，6－デカトリエニル基、3－（4－メチルチオフェニル）－2－プロペニル基、3－（3－メチルチオフェニル）－2－プロペニル基、3

40

50

- (2-メチルチオフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3, 4-ジメチルチオフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3, 4, 5-トリメチルチオフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-ベンゾイル) - 2-プロペニル基、3- (3-ベンゾイル) - 2-プロペニル基、3- (2-ベンゾイル) - 2-プロペニル基、3- (3, 4-ジベンゾイル) - 2-プロペニル基、3- (2, 4, 6-トリベンゾイル) - 2-プロペニル基、3- (4-シアノフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3-シアノフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2-シアノフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3, 4-ジシアノフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2, 4, 6-トリシアノフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-アセチルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-アセチルオキシ-3-メトキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3-アセチルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2-アセチルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3, 4-ジアセチルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2, 4, 6-トリアセチルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-ジメチルアミノフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-ジメチルアミノフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3-メチルアミノフェニル) - 2-プロペニル基、3- [2- (N-メチル-N-エチルアミノ)フェニル] - 2-プロペニル基、3- (2, 4-ジメチルアミノフェニル) - 2-プロペニル基、3- [2, 4, 6-トリ (ジメチルアミノ)フェニル] - 2-プロペニル基、3- (2-ヒドロキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3-ヒドロキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-ヒドロキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3, 5-ジメチル-4-ヒドロキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3-メトキシ-4-ヒドロキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2-ヒドロキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-ベンジルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-ベンジルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2-ベンジルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2, 4, 6-トリベンジルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3, 4-ジベンジルオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (4-フェノキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3-フェノキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2-フェノキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2, 4-ジフェノキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2, 4, 6-トリフェノキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3, 4-メチレンジオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (2, 3-エチレンジオキシフェニル) - 2-プロペニル基、3- (3, 4-エチレンジオキシフェニル) - 2-プロペニル基等の、C 2~10アルケニル基上にフェニル基が1~2個置換した炭素数2から10で二重結合を1~3個有するアルケニル基が挙げられる。該フェニルC 2~10アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。該フェニル環上には、ハロゲン原子、前記例示のC 1~4アルキレンジオキシ基、前記例示のC 1~6アルキルチオ基、ベンゾイル基、シアノ基、ニトロ基、前記例示のC 2~6アルカノイルオキシ基、前記例示の置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、水酸基、前記例示のフェニルC 1~6アルコキシ基、フェノキシ基、前記例示のハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及び前記例示のハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。置換基がC 1~4アルキレンジオキシ基の場合は、該基はフェニル環上に1~2個置換しているのがよい。

【0488】

ナフチルC 2~6アルケニル基としては、例えば、2- (1-又は2-) ナフチルビニル基、3- (1-又は2-) ナフチル-2-プロペニル基、3- (1-又は2-) ナフチル-2-メチル-2-プロペニル基、4- (1-又は2-) ナフチル-2-ブテニル基、4- (1-又は2-) ナフチル-3-ブテニル基、4- (1-又は2-) ナフチル-1, 3-ブタジエニル基、5- (1-又は2-) ナフチル-1, 3-ペンタジエニル基、6- (1-又は2-) ナフチル-1, 3-ヘキサジエニル基、6- (1-又は2-) ナフチル-2-ペンテニル基、6- (1-又は2-) ナフチル-1, 3, 5-ヘキサジエニル基等のナフチル基が置換した炭素数2か

10

20

30

40

50

ら6で二重結合を1～3個有するアルケニル基が挙げられる。該ナフチルC 2～6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。

【0489】

ベンゾチエニルC 2～6アルケニル基としては、例えば、2-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニルビニル基、3-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-2-プロペニル基、3-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-2-メチル-2-プロペニル基、4-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-2-ブテニル基、4-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-3-ブテニル基、4-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-1, 3-ブタジエニル基、5-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-1, 3-ペンタジエニル基、6-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-1, 3-ヘキサジエニル基、6-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-2-ヘキセニル基、5-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-2-ペンテニル基、6-（2-、3-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチエニル-1, 3, 5-ヘキサジエニル基等のベンゾチエニル基が置換した炭素数2から6で二重結合を1～3個有するアルケニル基を挙げることができる。該ベンゾチエニルC 2～6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。

【0490】

ベンゾチアゾリルC 2～6アルケニル基〔ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい〕としては、例えば、2-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリルビニル基、3-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-2-プロペニル基、3-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-2-メチル-2-プロペニル基、4-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-2-ブテニル基、4-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-3-ブテニル基、4-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-1, 3-ブタジエニル基、5-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-1, 3-ペンタジエニル基、6-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-1, 3-ヘキサジエニル基、6-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-2-ヘキセニル基、5-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-2-ペンテニル基、6-（2-、4-、5-、6-又は7-）ベンゾチアゾリル-1, 3, 5-ヘキサジエニル基、3-（2-メチル-5-ベンゾチアゾリル）-2-プロペニル基、3-（2-エチル-4-ベンゾチアゾリル）-2-プロペニル基、3-（2-n-プロピル-6-ベンゾチアゾリル）-2-プロペニル基、3-（2-n-ブチル-7-ベンゾチアゾリル）-2-プロペニル基、3-（4-n-ペンチル-5-ベンゾチアゾリル）-2-プロペニル基、3-（5-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリル）-2-プロペニル基、3-（2, 4-ジメチル-5-ベンゾチアゾリル）-2-プロペニル基、3-（2, 4, 5-トリメチル-7-ベンゾチアゾリル）-2-プロペニル基等のベンゾチアゾリル基が置換した炭素数2から6で二重結合を1～3個有するアルケニル基を挙げることができる。該ベンゾチアゾリルC 2～6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。

【0491】

フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ピペリジニル基（ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい）及びフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする〕としては、例えば、4-（1-ピペリジル）ベン

10

20

30

40

50

ジル基、2, 4-ジ(4-ピペリジル)ベンジル基、2, 4, 6-トリ(2-ピペリジル)ベンジル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]ベンジル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)-1-ピペリジル]ベンジル基、4-{4-[3, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]-1-ピペリジル}ベンジル基、4-{4-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)フェノキシ]-1-ピペリジル}ベンジル基、4-[4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)-1-ピペリジル]ベンジル基、4-[4-(2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]ベンジル基、3-[2, 4-ジフェノキシ-3-ピペリジル]ベンジル基、2-[1, 2, 3-トリフェノキシ-4-ピペリジル]ベンジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(4-クロロフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)ベンジル基、4-(3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(3-メチルフェノキシ)ベンジル基、4-(2-メトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 4-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(3, 4-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)ベンジル基、2, 4-ジフェノキシベンジル基、2, 4, 6-トリフェノキシベンジル基、2-フェノキシ-4-(1-ピペリジル)ベンジル基等の前記例示のフェニルC 1~6アルキル基〔フェニル環上には、前記例示ののピペリジル基(ピペリジン環上には、フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕が1~3個置換していてもよい)及び前記例示のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)からなる群より選ばれた基が1~3個置換しているものとする〕を挙げることができる。

【0492】

ジフェニルC 1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、ジフェニルメチル基、2, 2-ジフェニルエチル基、1, 1-ジフェニルエチル基、3, 3-ジフェニルプロピル基、2, 3-ジフェニルプロピル基、4, 4-ジフェニルブチル基、5, 5-ジフェニルペンチル基、4, 5-ジフェニルペンチル基、6, 6-ジフェニルヘキシル基、2-メチル-3, 3-ジフェニルプロピル基、1, 1-ジメチル-2, 2-ジフェニルエチル基、ジ(4-クロロフェニル)メチル基、ジ(4-トリフルオロメトキシフェニル)メチル基、ジ(4-トリフルオロメチルフェニル)メチル基、ジ(3-メトキシフェニル)メチル基、ジ(2, 4-ジクロロフェニル)メチル基、ジ(2-メチルフェニル)メチル基、ジ(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)メチル基、ジ(3, 4-ジメトキシフェニル)メチル基、ジ(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)メチル基、ジ(3, 4-ジメチルフェニル)メチル基、ジ(2, 4, 6-トリメチルフェニル)メチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-(4-クロロフェニル)メチル基等の前記例示のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕が2個置換したC 1~6アルキル基を挙げることができる。

【0493】

フェニル基〔フェニル環上には、C 1~4アルキレンジオキシ基、フェニル基、C 1~6アルコキシカルボニル基、水酸基及びフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)からな

る群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているものとする]としては、例えば、4-ビフェニル基、4-tert-ブトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-ビフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、2,3-エチレンジオキシフェニル基、3-ビフェニル基、3-tert-ブトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、2,4-ジフェニルフェニル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2,3-メチレンジオキシフェニル基、2,4,6-トリフェニル基、2-tert-ブトキシカルボニルフェニル基、2-プロポキシカルボニルフェニル基、2-n-ペンチルオキシフェニル基、2-ヒドロキシフェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3,4-エチレンジオキシフェニル基、2,4,6-トリヒドロキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、2,4-ジエトキシカルボニルフェニル基、2-ビフェニル基、3,4-ジヒドロキシフェニル基、4-(2,4-ジクロロフェノキシ)フェニル基、3-(2,4,6-トリフルオロフェノキシ)フェニル基、2,4,6-トリエトキシカルボニルフェニル基、3-(2-メチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-メチルフェノキシ)フェニル基、2-(4-メチルフェノキシ)フェニル基、3-(2,3-ジメチルフェノキシ)フェニル基、4-(2,4,5-トリメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-メトキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3,4-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2,4,6-トリメトキシフェノキシ)フェニル基、2-フェノキシ-4-エトキシカルボニルフェニル基、2-フェニル-3-フェノキシフェニル基等のフェニル基〔フェニル環上には、前記例示のC1~4アルキレンジオキシ基、フェニル基、前記例示のC1~6アルコキシカルボニル基、水酸基及び前記例示のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）からなる群より選ばれた基が1~3個置換しているものとする〕を挙げることができる。

【0494】

ベンゾフリル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子及びC1~6アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種を置換していてもよい〕としては、例えば、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)ベンゾフリル基、5-クロロ-7-ベンゾフリル基、5-メチル-7-ベンゾフリル基、4-ヨード-6-ベンゾフリル基、6-エチル-7-ベンゾフリル基、6-ブromo-5-ベンゾフリル基、7-n-プロピル-4-ベンゾフリル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリル基、4-n-ブチル-2-ベンゾフリル基、2,5-ジクロロ-7-ベンゾフリル基、5,6-ジメチル-7-ベンゾフリル基、3,5,6-トリフルオロ-2-ベンゾフリル基、3,4,5-トリメチル-3-ベンゾフリル基、5-クロロ-4-メチル-7-ベンゾフリル基、5-メチル-3-フルオロ-8-ベンゾフリル基等のベンゾフリル基〔ベンゾフラン環上には、前記例示のハロゲン原子及び前記例示のC1~6アルキル基なる群より選ばれた基が1~3個を置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0495】

ベンゾチアゾリニル基〔ベンゾチアゾリン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい〕としては、例えば、(2-, 4-, 5-, 6-又は7-)ベンゾチアゾリニル基、2-オキソ-6-ベンゾチアゾリニル基等のベンゾチアゾリニル基〔ベンゾチアゾリン環上には、1個のオキソ基が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0496】

ベンゾチエニル基〔ベンゾチオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい〕としては、例えば、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-又は7-)ベンゾチエニル基、5-フルオロ-4-ベンゾチエニル基、2-クロロ-3-ベンゾチエニル基、3-ブromo-6-ベンゾチエニル基、4-ヨード-5-ベンゾチエニル基、2,4,6

ートリクロロー７－ベンゾチエニル基、４，５－ジフルオロー２－ベンゾチエニル基等のベンゾチエニル基〔ベンゾチオフェン環上には、１～３個のハロゲン原子が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【０４９７】

１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基（１，２，３，４－テトラヒドロキノリン環上には、オキシ基及びＣ１～６アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい）としては、例えば、（１－、２－、３－、４－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、２－オキソー（１－、３－、４－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、２，４－ジオキソー（１－、３－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、３－オキソー（１－、２－、４－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、１－メチルー２－オキソー５－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、２－メチルー１－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、３－エチルー２－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、４－ｎ－プロピルー３－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、５－ｎ－ブチルー４－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、６－ｎ－ペンチルー５－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、７－ｎ－ヘキシルー６－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、８－メチルー７－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、４，６－ジメチルー５－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基、５，６，７－トリメチルー４－１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基等の１，２，３，４－テトラヒドロキノリル基（１，２，３，４－テトラヒドロキノリン環上には、オキシ基及び前記例示のＣ１～６アルキル基なる群より選ばれた基が１～３個置換していてもよい）を挙げることができる。

【０４９８】

１，２－ジヒドロヒドロキノリル基（１，２－ジヒドロヒドロキノリン環上には、少なくとも１個のオキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、（１－、２－、３－、４－、５－、６－、７－又は８－）１，２－ジヒドロヒドロキノリル基、２－オキソー１－、３－、４－、５－、６－、７－又は８－）１，２－ジヒドロヒドロキノリル基等の１，２－ジヒドロヒドロキノリル基（１，２－ジヒドロヒドロキノリン環上には、１個のオキシ基が置換していてもよい）を挙げることができる。

【０４９９】

１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基〔１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリン環上には、オキシ基及びＣ１～６アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕としては、例えば、（１－、２－、３－、４－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、２－オキソー（１－、３－、４－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、４－オキソー（１－、２－、３－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、２，４－ジオキソー（１－、３－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、１－メチルー２，４－ジオキソー（３－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、３－エチルー２，４－ジオキソー（１－、５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、１，３－ジメチルー２，４－ジオキソ（５－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、１－ｎ－プロピルー５－メチルー２－オキソー（３－、４－、６－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、１－ｎ－ブチルー６－メチルー４－オキソ（２－、３－、５－、７－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、１－ｎ－ペンチルー７－メチルー２－オキソ（３－、４－、５－、６－又は８－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基、１－ｎ－ヘキシルー８－メチルー２，４－ジオキソー（３－、５－、６－又は７－）１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基等の１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリニル基〔１，２，３，４－テトラヒドロキナゾリン環上には、オキシ基及び前記例示のＣ１～６アルキル基なる群より選ばれた基が１～４個置換していてもよい〕を挙げることがで

10

20

30

40

50

きる。

【0500】

ベンゾチエニル置換C 1～6アルキル基 [ベンゾチオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] としては、例えば、2-ベンゾチエニルメチル基、3-ベンゾチエニルメチル基、4-ベンゾチエニルメチル基、5-ベンゾチエニルメチル基、6-ベンゾチエニルメチル基、7-ベンゾチエニルメチル基、2-(2-ベンゾチエニル)エチル基、3-(2-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(2-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(2-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(2-ベンゾチエニル)ヘキシル基、5-クロロ-3-ベンゾチエニルメチル基、3, 4-ジブromo-2-ベンゾチエニルメチル基、4, 5, 6-トリクロロ-2-ベンゾチエニルメチル基等のベンゾチエニル置換C 1～6アルキル基 [ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子が1～3個置換していてもよい] を挙げることができる。

10

【0501】

ナフチル置換C 1～6アルキル基としては、例えば、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、2-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、3-(1-ナフチル)プロピル基、3-(2-ナフチル)プロピル基、4-(1-ナフチル)ブチル基、4-(2-ナフチル)ブチル基、5-(1-ナフチル)ペンチル基、5-(2-ナフチル)ペンチル基、6-(1-ナフチル)ヘキシル基、6-(2-ナフチル)ヘキシル基等を挙げることができる。

20

【0502】

ピリジル置換C 1～6アルキル基 [ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] としては、例えば、2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、2-(2-ピリジル)エチル基、2-(3-ピリジル)エチル基、2-(4-ピリジル)エチル基、3-(2-ピリジル)プロピル基、3-(3-ピリジル)プロピル基、3-(4-ピリジル)プロピル基、4-(2-ピリジル)ブチル基、4-(3-ピリジル)ブチル基、4-(4-ピリジル)ブチル基、5-(2-ピリジル)ペンチル基、5-(3-ピリジル)ペンチル基、5-(4-ピリジル)ペンチル基、6-(2-ピリジル)ヘキシル基、6-(3-ピリジル)ヘキシル基、6-(4-ピリジル)ヘキシル基、2-クロロ-3-ピリジルメチル基、3-bromo-2-ピリジルメチル基、4-フルオロ-2-ピリジルメチル基、2-(2-クロロ-4-ピリジル)エチル基、2-(3-クロロ-5-ピリジル)エチル基、2-(4-ヨード-3-ピリジル)エチル基、3-(2-bromo-5-ピリジル)プロピル基、3-(3-フルオロ-4-ピリジル)プロピル基、3-(4-クロロ-2-ピリジル)プロピル基、4-(2-ヨード-5-ピリジル)ブチル基、4-(3-bromo-5-ピリジル)ブチル基、4-(4-クロロ-3-ピリジル)ブチル基、5-(2-クロロ-5-ピリジル)ペンチル基、5-(3-フルオロ-2-ピリジル)ペンチル基、5-(4-bromo-2-ピリジル)ペンチル基、6-(2-クロロ-5-ピリジル)ヘキシル基、6-(3-フルオロ-4-ピリジル)ヘキシル基、6-(4-bromo-2-ピリジル)ヘキシル基、(2, 6-ジクロロ-4-ピリジル)メチル基、(2, 3, 4-トリクロロ-6-ピリジル)メチル基等のピリジル置換C 1～6アルキル基 [ピリジン環上には、置換基としてハロゲン原子が1～3個置換していてもよい] を挙げることができる。

30

40

【0503】

フリル置換C 1～6アルキル基 [フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい] としては、例えば、2-フリルメチル基、3-フリルメチル基、2-(2-フリル)エチル基、3-(2-フリル)プロピル基、3-(3-フリル)プロピル基、4-(2-フリル)ブチル基、4-(3-フリル)ブチル基、5-(2-フリル)ペンチル基、5-(3-フリル)ペンチル基、6-(2-フリル)ヘキシル基、6-(3-フリル)ヘキシル基、5-ニトロ-2-フリルメチル基、5-ニトロ-3-フリルメチル基、2-(5-ニトロ-2-フリル)エチル基、3-(5-ニトロ-2-フリル)プロピル基、4-(5-ニトロ-2-フリル)ブチル基、4-(5-ニトロ-3-フリル)ブチル

50

基、5-(5-ニトロ-2-フリル)ペンチル基、5-(5-ニトロ-3-フリル)ペンチル基、6-(5-ニトロ-2-フリル)ヘキシル基、6-(5-ニトロ-3-フリル)ヘキシル基、(4, 5-ジニトロ-2-フリル)メチル基、(2, 4, 5-トリニトロ-3-フリル)メチル基等のフリル置換C1~6アルキル基〔フラン環上には、置換基としてニトロ基が1~3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0504】

チエニル置換C1~6アルキル基〔チオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい〕としては、例えば、2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-(2-チエニル)エチル基、3-(2-チエニル)プロピル基、3-(3-チエニル)プロピル基、4-(2-チエニル)ブチル基、4-(3-チエニル)ブチル基、5-(2-チエニル)ペンチル基、5-(3-チエニル)ペンチル基、6-(2-チエニル)ヘキシル基、6-(3-チエニル)ヘキシル基、5-クロロ-2-チエニルメチル基、5-クロロ-3-チエニルメチル基、2-(4-ブロモ-2-チエニル)エチル基、3-(3-フルオロ-2-チエニル)プロピル基、4-(5-ヨード-2-チエニル)ブチル基、4-(4-クロロ-3-チエニル)ブチル基、5-(3-クロロ-2-チエニル)ペンチル基、5-(2-クロロ-3-チエニル)ペンチル基、6-(3-クロロ-2-チエニル)ヘキシル基、6-(5-クロロ-3-チエニル)ヘキシル基、(4, 5-ジクロロ-2-チエニル)メチル基、(2, 4, 5-トリクロロ-3-チエニル)メチル基等のチエニル置換C1~6アルキル基〔チオフェン環上には、置換基としてハロゲン原子が1~3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0505】

フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ペンチルフェニル基、4-n-ヘキシルフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオ

ロフェニル基等を挙げることができる。

【0506】

チアゾリル置換 C 1 ～ 6 アルキル基 [チアゾール環上には、C 1 ～ 6 アルキル基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] としては、例えば、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-チアゾリルメチル基、2, 5-ジメチル-4-チアゾリルメチル基、2, 4-ジメチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-ヨードフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(4-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-(2-チアゾリル)エチル基、2-(4-チアゾリル)エチル基、2-(5-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)エチル基、3-(2-チアゾリル)プロピル基、2-(4-チアゾリル)プロピル基、3-(5-チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、2-(2-メチル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(2, 4-ジメチル

10

20

30

40

50

-5-チアゾリル) プロピル基、3-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) プロピル基、3-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) プロピル基、2-(2-フェニル-4-チアゾリル) プロピル基、3-(3-フェニル-5-チアゾリル) プロピル基、3-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) プロピル基、4-(2-チアゾリル) ブチル基、4-(4-チアゾリル) ブチル基、3-(5-チアゾリル) ブチル基、4-(2-メチル-4-チアゾリル) ブチル基、4-(2-メチル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル) ブチル基、4-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) ブチル基、4-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2-フェニル-4-チアゾリル) ブチル基、4-(4-フェニル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) ブチル基、5-(2-チアゾリル) ペンチル基、5-(4-チアゾリル) ペンチル基、5-(5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-フェニル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(4-フェニル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) ペンチル基、6-(2-チアゾリル) ヘキシル基、6-(4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-メチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-メチル-5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-フェニル-4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(4-フェニル-5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、2-(2, 3-ジメチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-メチルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(3-エチルフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-(2-トリフルオロエチルフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基等のチアゾリル置換C1~6アルキル基〔チアゾール環上には、C1~6アルキル基及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0507】

テトラゾリル置換C1~6アルキル基〔テトラゾール環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい〕としては、例えば、5-(1H)-テトラゾリルメチル基、2-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、1-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、3-(5-(1H)-テトラゾリル)プロピル基、4-(5-(1H)-テトラゾリル)ブチル基、5-(5-(1H)-テトラゾリル)ペンチル基、6-(5-(1H)-テトラゾリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(5-(1H)-テトラゾリル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、1-メチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-エチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-n-プロピル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-n-ブチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-n-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-n-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、2-(1-メチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-エチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-n-プロピル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-n-ブチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-n-ペ

10

20

30

40

50

ンチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-n-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基等のテトラゾリル置換C1~6アルキル基〔テトラゾール環上には、1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0508】

イソオキサゾリル置換C1~6アルキル基〔イソオキサゾール環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい〕としては、例えば、(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)メチル基、2-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)エチル基、1-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)エチル基、3-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)プロピル基、4-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)ブチル基、5-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)ペンチル基、6-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)ヘキシル基、3-メチル-2-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)エチル基、(3-メチル-4-イソオキサゾリル)メチル基、(4-エチル-3-イソオキサゾリル)メチル基、(5-n-プロピル-3-イソオキサゾリル)メチル基、(4-n-ブチル-5-イソオキサゾリル)メチル基、(5-n-ペンチル-3-イソオキサゾリル)メチル基、(3-n-ヘキシル-4-イソオキサゾリル)メチル基、(3, 4-ジメチル-5-イソオキサゾリル)メチル基、2-(3-メチル-4-イソオキサゾリル)エチル基、1-(4-エチル-3-イソオキサゾリル)エチル基、3-(5-n-プロピル-3-イソオキサゾリル)プロピル基、4-(4-n-ブチル-5-イソオキサゾリル)ブチル基、5-(5-n-ペンチル-3-イソオキサゾリル)メペンチル基、6-(3-n-ヘキシル-4-イソオキサゾリル)ヘキシル基、2-(3, 4-ジメチル-5-イソオキサゾリル)エチル基等のイソオキサゾリル置換C1~6アルキル基〔イソオキサゾール環上には、C1~6アルキル基が1~2個置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0509】

1, 2, 4-オキサジアゾリル置換C1~6アルキル基〔1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基(フェニル環上には、C1~6のアルキル基が置換していてもよい)が置換していてもよい〕としては、例えば、(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリルメチル基、2-[(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、1-[(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、3-[(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリル]プロピル基、4-[(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリル]ブチル基、5-[(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリル]ペンチル基、6-[(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリル]ヘキシル基、3-メチル-2-[(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリル]プロピル基、1, 1-ジメチル-2-[(3-又は5-)1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、(3-フェニル-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル)メチル基、(5-フェニル-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル)メチル基、[3-(3-メチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]メチル基、[5-(3, 4-ジメチルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]メチル基、[3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]メチル基、[5-(2-エチルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]メチル基、2-[(3-n-プロピルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、1-[5-(4-n-ブチルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、3-[3-(3-n-ペンチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]プロピル基、4-[5-(5-n-ヘキシルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]ブチル基、5-[3-(3-エチル-4-メチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]ペンチル基、6-[5-(2-メチルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]ヘキシル基等の1, 2, 4-オキサジアゾリル置換C1~6アルキル基〔1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、1個のフェニル基(フェニル環上には、C1~6のアルキル基が1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0510】

10

20

30

40

50

ベンゾフラザニル置換 C 1～6 アルキル基としては、例えば、4-ベンゾフラザニルメチル、5-ベンゾフラザニルメチル、6-ベンゾフラザニルメチル、7-ベンゾフラザニルメチル、1-(4-ベンゾフラザニル)エチル、2-(5-ベンゾフラザニル)エチル、3-(6-ベンゾフラザニル)プロピル、4-(7-ベンゾフラザニル)ブチル、5-(4-ベンゾフラザニル)ペンチル、6-(5-ベンゾフラザニル)ヘキシル、2-メチル-3-(6-ベンゾフラザニル)プロピル、1, 1-ジメチル-2-(7-ベンゾフラザニル)エチル基等を挙げることができる。

【0511】

フェニルアミノ基〔フェニルアミノ基の N 位には C 1～6 アルキル基が置換していてもよく、フェニルアミノ基のフェニル環上には、少なくとも 1 個のハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい〕としては、無置換のフェニルアミノ基（別名：アニリノ基）又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が 1 ないし 3 個置換したフェニルアミノ基であって、例えば、フェニルアミノ基、2-メトキシフェニルアミノ基、3-メトキシフェニルアミノ基、4-メトキシフェニルアミノ基、2-エトキシフェニルアミノ基、3-エトキシフェニルアミノ基、4-エトキシフェニルアミノ基、4-n-プロポキシフェニルアミノ基、4-tert-ブトキシフェニルアミノ基、4-n-ブトキシフェニルアミノ基、2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ基、3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ基、4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ基、2, 3-ジメトキシフェニルアミノ基、3, 4, 5-トリメトキシフェニルアミノ基、4-n-ペンチルオキシフェニルアミノ基、4-n-ヘキシルオキシフェニルアミノ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルアミノ基、N-フェニル-N-メチルアミノ基、N-(2-メトキシフェニル)-N-エチルアミノ基、N-(3-メトキシフェニル)-N-n-プロピルアミノ基、N-(4-メトキシフェニル)-N-n-ブチルアミノ基、N-(2-エトキシフェニル)-N-n-ペンチルアミノ基、N-(3-エトキシフェニル)-N-n-ヘキシルアミノ基、N-(4-エトキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(4-n-プロポキシフェニル)-N-エチルアミノ基、N-(4-tert-ブトキシフェニル)-N-n-プロピルアミノ基、N-(4-n-ブトキシフェニル)-N-n-ブチルアミノ基、N-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-N-n-ペンチルアミノ基、N-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-N-n-ヘキシルアミノ基、N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)-N-エチルアミノ基、N-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)-N-n-プロピルアミノ基、N-(2, 3-ジメトキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(4-n-ペンチルオキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(4-n-ヘキシルオキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-N-メチルアミノ基等を挙げることができる。

【0512】

フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、フェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタメトキシフェノキシ基、3, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ基、3, 5-ジ（トリフルオロメトキシ）フェノキシ基、4-メトキシ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 3-ジ（トリフルオロメトキシ）フェノキシ基、2, 4-ジ（トリフルオロメトキシ）フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-イソ

10

20

30

40

50

プロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基等のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0513】

アミノ基（該アミノ基上には、置換基としてC1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、n-ペンチルアミノ基、3-n-ヘキシルアミノ基、フェニルアミノ基、（4-クロロフェニル）アミノ基、（4-ブロモフェニル）アミノ基、（2, 4-ジクロロフェニル）アミノ基、（2, 4, 6-トリクロロフェニル）アミノ基、（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル）アミノ基、（4-フルオロフェニル）アミノ基、（4-ヨードフェニル）アミノ基、（4-クロロフェニル）アミノ基、（3-メチルフェニル）アミノ基、（4-トリフルオロメチルフェニル）アミノ基、（4-トリフルオロメチルフェニル）アミノ基、3-（4-トリフルオロメチルフェニル）アミノ基、（3, 4-ジメチルフェニル）アミノ基、（3, 4, 5-トリメチルフェニル）アミノ基、（2-メトキシフェニル）アミノ基、（4-トリフルオロメトキシフェニル）アミノ基、3-（4-トリフルオロメトキシフェニル）アミノ基、（3, 5-ジメトキシフェニル）アミノ基、（2, 5-ジメトキシフェニル）アミノ基、（2, 4, 6-トリメトキシフェニル）アミノ基、N-メチル-N-（4-トリフルオロメチルフェニル）アミノ基、N-エチル-N-（4-トリフルオロメトキシフェニル）アミノ基等のアミノ基（該アミノ基上には、置換基としてC1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい）を挙げることができる。

【0514】

ピペリジル基〔ピペリジン環上には、フェノキシ基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が置換していてもよい）及びアミノ基（該アミノ基上には、置換基としてC1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2, 4-ジアミノ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリアミノ-1-ピペリジル基、4-アミノ-3-フェノキシ-1-ピペリジル基、4-フェノキシ-2-アミノ-1-ピペリジル基、2-アミノ-1-ピペリジル基、3-アミノ-1-ピペリジル基、4-アミノ-1-ピペリジル基、4-メチルアミノ-1-ピペリジル基、4-エチルアミノ-1-ピペリジル基、4-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジメチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジ-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-フェニルアミノ-1-ピペリジル基、4-（N-フェニル-N-メチルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（2-フルオロフェニルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（3-フルオロ

10

20

30

40

50

フェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - フルオロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - クロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (3 - クロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - クロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2, 3 - ジクロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2, 4 - ジクロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (3, 4 - ジクロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (3, 5 - ジクロロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - メチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2, 3 - ジメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2, 4, 6 - トリメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (3 - ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - トリフルオロメトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - メトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2, 3 - ジメトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2, 4, 6 - トリメトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - [N - メチル - N - (2, 4, 6 - トリメトキシフェニルアミノ)] - 1 - ピペリジル基、4 - [N - メチル - N - (3, 4 - ジメチルフェニルアミノ)] - 1 - ピペリジル基、4 - (3 - トリフルオロメトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (3 - ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - フルオロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (3 - フルオロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - フルオロフェニルアミノ) - 1 - ピペリジル基、4 - フェノキシ - 1 - ピペリジル基、2, 4 - ジフェノキシ - 1 - ピペリジル基、2, 4, 6 - トリフェノキシ - 1 - ピペリジル基、4 - (2 - メトキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル基、1 - (3 - メトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル基、1 - (4 - メトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル基、2 - (2 - エトキシフェノキシ) - 3 - ピペリジル基、3 - (3 - エトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル基、4 - (4 - エトキシフェノキシ) - 5 - ピペリジル基、3 - (4 - n - プロポキシフェノキシ) - 2 - ピペリジル基、2 - (4 - tert - ブトキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル基、1 - (4 - n - ブトキシフェノキシ) - 2 - ピペリジル基、2 - (2 - トリフルオロメトキシフェノキシ) - 3 - ピペリジル基、3 - (3 - トリフルオロメトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル基、4 - (4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) - 3 - ピペリジル基、3 - (2 - ペンタフルオロエトキシフェノキシ) - 2 - ピペリジル基、6 - (3 - ペンタフルオロエトキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル基、1 - (2, 3 - ジメトキシフェノキシ) - 4 - ピペリジル基、4 - (3, 4, 5 - トリメトキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル基、4 - (4 - n - ペンチルオキシフェノキシ基、4 - (4 - n - ヘキシルオキシフェノキシ) - 1 - ピペリジル基等のピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい) 及びアミノ基 (該アミノ基上には、置換基として C 1 ~ 6 アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が 1 ~ 2 個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい] を挙げることができる。

【0515】

ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、フェニル C

10

20

30

40

50

1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、フェニルC 2～6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれたの少なくとも1種が置換していてもよい）及びベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、例えば、

（1－、2－又は3－）ピペラジニル基、4－tert－ブトキシカルボニル－1－ピペラジニル基、4－エトキシカルボニル－1－ピペラジニル基、4－メトキシカルボニル－1－ピペラジニル基、2，4－ジメトキシカルボニル－1－ピペラジニル基、2，4，6－トリエトキシカルボニル－1－ピペラジニル基、4－（4－トリフルオロメトキシベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（4－クロロベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（4－メトキシベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（4－ブロモベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（4－メチルベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（2，4－ジクロロベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（3，4－ジメトキシベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（2，4，6－トリフルオロベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（3，4－ジメチルベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（2，4，6－トリメトキシベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（2，4，6－トリメチルベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（4－ヨードベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（4－トリフルオロメチルベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（3，4－ジクロロベンジル）－1－ピペラジニル基、4－[3－（4－トリフルオロメチルフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（4－トリフルオロメチルフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－（4－トリフルオロメチルベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－[3－（4－クロロフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（4－メチルフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（4－メトキシフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（3，4－ジメチルフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（3，4－ジメトキシフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（3，4，5－トリメチルフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（3，4，5－トリメトキシフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（3，4，5－トリメチルフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（2，4，6－トリフルオロフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（4－ヨードフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－[3－（3－ブロモフェニル）－2－プロペニル]－1－ピペラジニル基、4－（4－フルオロベンジル）－1－ピペラジニル基、4－（4－メチルベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（4－メトキシベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（3，4－ジメチルベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（2，4－ジメトキシベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（3，4，5－トリメチルベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（2，4，6－トリメトキシベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（4－クロロベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（2，4，6－トリフルオロベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（4－ブロモベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（4－ヨードベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（3，4－ジクロロベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－（4－フルオロベンゾイル）－1－ピペラジニル基、4－ベンジル－3－（3－フェニル－2－プロペニル）－1－ピペラジニル基、4－ベンゾイル－3，5－ジベンジル－1－ピペラジニル基等のピペラジニル基 [ピペラジン環上には、前記例示のC 1～6アルコキシカルボニル基、前記例示のフェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個

10

20

30

40

50

置換していてもよい)、前記例示のフェニルC 2～6 アルケニル基(無置換又はハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基から選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されたフェニル基1又は2個と炭素数2から6で二重結合を1～3個有するアルケニル基から構成される基である。)及び前記例示のベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい)からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい]を挙げることができる。

【0516】

ホモピペラジニル基[ホモピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6 アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]としては、例えば、(1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-)ホモピペラジニル基、3, 4-ジベンジル-1-ホモピペラジニル基、2, 7-ジベンジル-1-ホモピペラジニル基、2, 3, 4-トリベンジル-1-ホモピペラジニル基、2, 4, 6-トリベンジル-1-ホモピペラジニル基、4-ベンジル-1-ホモピペラジニル基、4-(2-フェネチル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3-フェニルプロピル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-フェニルブチル)-1-ホモピペラジニル基、4-(5-フェニルペンチル)-1-ホモピペラジニル基、4-(6-フェニルヘキシル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2-フルオロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3-フルオロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-フルオロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2-クロロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3-クロロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-クロロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 3-ジクロロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4-ジクロロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジクロロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 5-ジクロロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2-トリフルオロメチルベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジメチルベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-メトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジメトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ホモピペラジニル基、4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル]-1-ホモピペラジニル基、4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル]-1-ホモピペラジニル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチル]-1-ホモピペラジニル基、4-[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル]-1-ホモピペラジニル基、4-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル]-1-ホモピペラジニル基、4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-1-ホモピペラジニル基、4-

10

20

30

40

50

[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-1-ホモピペラジニル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチル]-1-ホモピペラジニル基、4-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル]-1-ホモピペラジニル基、4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-1-ホモピペラジニル基等のホモピペラジニル基〔ホモピペラジン環上には、1～3個の前記例示のフェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0517】

フェノキシ置換フェニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、2-フェノキシフェニル基、2,3-ジフェノキシフェニル基、2,4,6-トリフェノキシフェニル基、3-(2-メトキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-メトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-イソプロポキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-n-ブトキシフェノキシ)フェニル基、2-(2,4-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2,3-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3,5-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2,5-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2,4,6-トリメトキシフェノキシ)フェニル基、2-[3,5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]フェニル基、3-(4-メトキシ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2,6-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-[2,3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]フェニル基、3-[2,4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-イソプロポキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-イソプロポキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-イソプロポキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-tert-ブトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3-tert-ブトキシフェノキシ)フェニル基、3-(4-tert-ブトキシフェノキシ)フェニル基、4-(2-sec-ブトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3-sec-ブトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-sec-ブトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-n-ヘキシルオキシフェノキシ)フェニル基、3-(2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ)フェニル基等のフェノキシ置換フェニル基（フェニル環上には、1～5個、好ましくは1～3個のハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が置換していてもよい）を挙げることができる。

【0518】

フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びフェノキシ置換フェニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、フェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2,4-ジメトキシフェノキシ基、2,3-ジメトキシフェノキシ基、2,3,4,5,6-ペンタメトキシフェノキシ基、3,5-ジメトキシフェノキシ基、2,5-ジメトキシフェノキシ基、2,4,6-トリメトキシフェノキシ基、3,5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、4-メトキシ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2,6-ジメトキシフェノキシ基、2-

トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、2-(2-フェノキシフェニル)フェノキシ基、2, 3-ジ(2-フェノキシフェニル)フェノキシ基、2, 3-ジ(2-フェノキシフェニル)-4-メトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシ-3-(3-フェノキシフェニル)フェノキシ基、3-(2, 3-ジフェノキシフェニル)フェノキシ基、4-(2, 4, 6-トリフェノキシフェニル)フェノキシ基、2-[3-(2-メトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(3-メトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(4-メトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(4-イソプロポキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(4-n-ブトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(2, 4-ジメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(2, 3-ジメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(3, 5-ジメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(2, 5-ジメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-{2-[3, 5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]フェニル}フェノキシ基、2-[3-(4-メトキシ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(2, 6-ジメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-{2-[2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]フェニル}フェノキシ基、2-{3-[2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]フェニル}フェノキシ基、3-[4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(2-イソプロポキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(3-イソプロポキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(4-イソプロポキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[2-(2-tert-ブトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(3-tert-ブトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(4-tert-ブトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(2-sec-ブトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[2-(3-sec-ブトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(4-sec-ブトキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(4-n-ヘキシルオキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、2-[3-(2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、3-[4-(3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基、4-[2-(4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ)フェニル]フェノキシ基等のフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ置換フェニル基(フェニル環上には、1~5個、好ましくは1~3個のハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

10

20

30

40

50

ホモピペラジニル基（ホモピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニル C 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕、フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕、フェニルカルバモイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕、フェニル C 2～6 アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕及びベンゾイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい）としては、例えば、（１－、２－、３－、４－、５－、６－又は７－）ホモピペラジニル基、４－tert－ブトキシカルボニル－１－ホモピペラジニル基、４－エトキシカルボニル－１－ホモピペラジニル基、４－メトキシカルボニル－１－ホモピペラジニル基、２，４－ジメトキシカルボニル－１－ホモピペラジニル基、２，４，６－トリエトキシカルボニル－１－ホモピペラジニル基、４－（４－トリフルオロメトキシベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（４－クロロベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（４－メトキシベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（４－プロモベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（４－メチルベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（２，４－ジクロロベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（３，４－ジメトキシベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（２，４，６－トリフオロベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（３，４－ジメチルベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（２，４，６－トリメトキシベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（２，４，６－トリメチルベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（４－ヨードベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（４－トリフルオロメチルベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（３，４－ジクロロベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（４－トリフルオロメチルフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（４－トリフルオロメチルフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－（４－トリフルオロメチルベンゾイル）－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（４－クロロフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（４－メチルフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（４－メトキシフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（３，４－ジメチルフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（３，４－ジメトキシフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（３，４，５－トリメチルフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（３，４，５－トリメトキシフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（３，４，５－トリフルオロフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（２，４，６－トリフルオロフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（４－ヨードフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－〔３－（３－プロモフェニル）－２－プロペニル〕－１－ホモピペラジニル基、４－（４－フルオロベンジル）－１－ホモピペラジニル基、４－（４－メチルベンゾイル）－１－ホモピペラジニル基、４－（４－メトキシベンゾイル）－１－ホモピペラジニル基、

20

30

40

50

ニル基、4-(3, 4-ジメチルベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4-ジメトキシベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4, 5-トリメチルベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-クロロベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ブロモベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ヨードベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジクロロベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-フルオロベンゾイル)-1-ホモピペラジニル基、4-ベンジル-3-(3-フェニル-2-プロペニル)-1-ホモピペラジニル基、4-ベンゾイル-3, 5-ジベンジル-1-ホモピペラジニル基、2, 7-ジベンジル-4-フェニル-1-ホモピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-クロロフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-メトキシフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-メチルフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4-ジメトキシフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4-ジメチルフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ブロモフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ヨードフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-フルオロフェニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-メトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ブロモベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-メチルベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ヨードベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-クロロフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-メトキシフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ブロモフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-メチルフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4-ジクロロフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジメトキシフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3, 4-ジメチルフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ヨードフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、3, 4-ジ(フェニルカルバモイル)-1-ホモピペラジニル基、4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-1-ホモピペラジニル基、4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-1-ホモピペラジニル基等のホモピペラジニル基(ホモピペラジン環上には、前記例示のC 1~6 アルコキシカルボニル基、前記例示のフェニルC 1~6 アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6

10

20

30

40

50

アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい」、前記例示のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕、前記例示のフェニルC 1～6アルコシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕、前記例示のフェニルカルバモイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕、前記例示のフェニルC 2～6アルケニル基〔無置換又はハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基から選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されたフェニル基1又は2個と炭素数2から6で二重結合を1～3個有するアルケニル基から構成される基である。〕及び前記例示のベンゾイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい)を挙げることができる。

【0520】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のアミノ基〔アミノ基上には、フェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい)としては、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-又は8-)イソキノリル基、4, 6-ジアミノ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、4, 6, 7-トリアミノ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(4-クロロベンジル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-(4-クロロベンジル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-{N-メチル-N-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)ベンジル]アミノ}-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-{N-メチル-N-[2, 4-ジ(トリフルオロメチル)ベンジル]アミノ}-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-[N-メチル-N-(2, 3-ジヨードベンジル)アミノ]-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル環上には、1～3個のアミノ基〔アミノ基上には、前記例示のフェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい)及び前記例示のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい〕が置換していてもよい)を挙げることができる。

【0521】

オキサゾリル基(オキサゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又

10

20

30

40

50

は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい) としては、例えば、(2-、4-又は5-) オキサゾリル基、4-(4-クロロフェニル)-2-オキサゾリル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-オキサゾリル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-オキサゾリル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-オキサゾリル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-4-オキサゾリル基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-オキサゾリル基、5-(4-ブロモフェニル)-2-オキサゾリル基、4-(4-フルオロフェニル)-2-オキサゾリル基、5-(4-ヨードフェニル)-2-オキサゾリル基、2-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-4-オキサゾリル基、4-(4-メチルフェニル)-2-オキサゾリル基、4-(3-メトキシフェニル)-2-オキサゾリル基、2-(3, 4-ジメチルフェニル)-5-オキサゾリル基、4-(2, 4-ジメトキシフェニル)-2-オキサゾリル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-オキサゾリル基、4-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-2-オキサゾリル基、4, 5-ジフェニル-2-オキサゾリル基、2, 4-ジフェニル-5-オキサゾリル基等のオキサゾリル基(オキサゾール環上には、1～2個の前記例示のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい] が置換していてもよい) を挙げることができる。

10

【0522】

20

イソインドリニル基(イソインドリン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、(1-、2-、4-又は5-) イソインドリニル基、4-クロロ-(1-、2-、3-、5-、6-又は7-) -イソインドリニル基、4-トリフルオロメチル-(1-、2-、3-、5-、6-又は7-) -イソインドリニル基、4-トリフルオロメトキシ-(1-、2-、3-、5-、6-又は7-) -イソインドリニル基、5-メチル-(1-、2-、3-、4-、6-又は7-) -イソインドリニル基、4-メトキシ-(1-、2-、3-、5-、6-、又は7-) イソインドリニル基、3, 4-ジフルオロ-(1-、2-、5-、6-又は7-) イソインドリニル基、4, 5, 6-トリクロロ-(1-、2-、3-又は7-) イソインドリニル基、4, 5-ジメチル-(1-、2-、3-、6-又は7-) イソインドリニル基、4, 5, 6-トリメチル-(1-、2-、3-又は7-) イソインドリニル基、4, 5-ジメトキシ-(1-、2-、3-、6-又は7-) イソインドリニル基、4, 5, 6-トリメトキシ-(1-、2-、3-又は7-) イソインドリニル基、1, 1-ジメチル-5-プロモ-(2-、3-、4-、6-又は7-) イソインドリニル基等のイソインドリニル基(イソインドリン環上には、前記例示のハロゲン原子、前記提示のハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及び前記例示のハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) を挙げることができる。

30

【0523】

40

ピペラジニル基[ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] としては、例えば、(1-、2-又は3-) ピペラジニル基、4-フェニル-1-ピペラジニル基、2, 4-ジフェニル-1-ピペラジニル基、2, 4, 5-トリフェニル-1-ピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル基、(4-クロロフェニル-1-ピペラジニル) メチル基、4-(2, 4-ジクロロフェニル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-1-ピペラジニル基、2, 4-ジ(トリフルオロメチル) フェニル-1-ピペラジニル

50

基、2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル-1-ピペラジニル基等のピペラジニル基〔ピペラジン環上には、1~3個の前記例示のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい〕を挙げることができる。

【0524】

チアゾリル基(チアゾール環上には、フェノキシC 1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニルC 1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；基-(W₁) o NR³¹ ' R³² ' [W₁及びoは、前記に同じ。R³¹ ' 及びR³² ' は、同一又は異なって、水素原子、C 1~6アルキル基、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。〕；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい〕；ピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい〕及びフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、(2-, 4-又は5-)チアゾリル基、2-[(4-フルオロメトキシフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、4-[(4-フルオロメトキシフェノキシ)メチル]-2-チアゾリル基、2-[(4-フルオロメチルフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、2-[(3-メトキシフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、2-[(2-メチルフェノキシ)メチル]-5-チアゾリル基、2-[(2, 4-ジメトキシフェノキシ)メチル]-5-チアゾリル基、2-[(3, 4-ジメチルフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、5-[(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ)メチル]-2-チアゾリル基、2-[(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、2-[(2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、4-[(3, 4-ジクロロフェノキシ)メチル]-2-チアゾリル基、2-[(4-ブロモフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、2-[(4-ヨードフェノキシ)メチル]-4-チアゾリル基、4-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-2-チアゾリル基、2, 5-ジフェノキシメチル-4-チアゾリル基、4, 5-ジフェノキシメチル-2-チアゾリル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリル基、4-(4-フルオロフェニル)-2-チアゾリル基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリル基、4-(4-クロロフェニル)-2-チアゾリル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-4-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-チ

10

20

30

40

50

アゾリル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-チアゾリル基、2-(3, 4-ジクロロフェニル)-4-チアゾリル基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-チアゾリル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-2-チアゾリル基、5-(4-プロモフェニル)-2-チアゾリル基、5-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-ヨードフェニル)-5-チアゾリル基、2-(4-メチルフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-メトキシフェニル)-4-チアゾリル基、2-(2, 4-ジメチルフェニル)-5-チアゾリル基、4-(3, 4-ジメトキシフェニル)-2-チアゾリル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-5-チアゾリル基、5-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-4-チアゾリル基、2, 4-ジフェニル-5-チアゾリル基、4, 5-ジフェニル-2-チアゾリル基、2-フェニル-5-フェノキシメチル-4-チアゾリル基、2-(4-フルオロベンジル)-4-チアゾリル基、2-(4-クロロベンジル)-4-チアゾリル基、2-(4-トリフルオロメチルベンジル)-4-チアゾリル基、2-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-4-チアゾリル基、2-(3, 4-ジクロロベンジル)-4-チアゾリル基、4-(2, 4, 6-トリフルオロベンジル)-2-チアゾリル基、5-(4-プロモベンジル)-2-チアゾリル基、5-(4-フルオロベンジル)-4-チアゾリル基、2-(4-ヨードベンジル)-5-チアゾリル基、2-(4-メチルベンジル)-4-チアゾリル基、2-(4-メトキシベンジル)-4-チアゾリル基、2-(2, 4-ジメチルベンジル)-5-チアゾリル基、4-(3, 4-ジメトキシベンジル)-2-チアゾリル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-5-チアゾリル基、5-(3, 4, 5-トリメトキシベンジル)-4-チアゾリル基、2, 4-ジベンジル-5-チアゾリル基、4, 5-ジベンジル-2-チアゾリル基、2-ベンジル-5-フェノキシメチル-4-チアゾリル基、4-(4-クロロベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-クロロベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-(4-クロロフェニル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-クロロフェニル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-(4-クロロベンジル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-クロロベンジル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-(4-クロロフェニル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-クロロフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-(4-プロモベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(4-メトキシベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(4-メチルベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジクロロベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(2, 4-ジメトキシベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジメチルベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-(4-プロモフェニル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(4-メトキシフェニル)アミノ-2-チアゾリル

10

20

30

40

50

基、4-(4-メチルフェニル)アミノ-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジクロロフェニル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジメトキシフェニル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(2, 4-ジメチルフェニル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-(4-プロモベンジル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-(4-メトキシベンジル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-(4-メチルベンジル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジクロロベンジル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-メトキシベンジル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジメチルベンジル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-(4-プロモフェニル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-(4-メトキシフェニル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-(4-メチルフェニル)アミノメチル-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジクロロフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(2, 4-ジメトキシフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(3, 4-ジメチルフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-(4-フルオロベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(3, 4, 5-トリメチルベンジル)アミノ-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-ヨードベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(2, 4, 6-トリフルオロベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-ヨードベンジル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-(4-フルオロフェニル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)アミノ-2-チアゾリル基、4-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)アミノ-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-ヨードフェニル)アミノ]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-ヨードフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノメチル]-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-2-チアゾリル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-チアゾリル基、4-(4-クロロフェノキシ)-2-チアゾリル基、4-(3, 4-ジクロロフェノキシ)-2-チアゾリル基、4-(4-メトキシフェノキシ)-2-チアゾリル基、4-(3, 4-ジメトキシフェノキシ)-2-チアゾリル基、5-(2, 4-ジメチルフェノキシ)-4-チアゾリル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ)-5-チアゾリル基、4-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)-2-チアゾリル基、4-(4-フルオロフェノキシ)-2-チアゾリル基、2-(4-プロモフェノキシ)-5-チアゾリル基、2-(4-ヨードフェノキシ)-4-チアゾリル基、5-(2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ)-2-チアゾリル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]-2-チアゾリル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]-2-チアゾリル基、4-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]-2-チアゾリル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-チアゾリル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-チアゾリル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-チア

10

20

30

40

50

ゾリル基、5-[3, 4-ジフェニル-1-ピペラジニル]-2-チアゾリル基、2-[3, 4, 5-トリフェニル-1-ピペラジニル]-4-チアゾリル基、5-[3, 4, 5-トリフェノキシ-1-ピペリジル]-4-チアゾリル基、4-[3, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル]-5-チアゾリル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]-5-フェノキシ-2-チアゾリル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-5-フェノキシ-2-チアゾリル基、4-フェニル-2-チアゾリル基、2-フェニル-4-チアゾリル基等のチアゾリル基（チアゾール環上には、前記例示のフェノキシC1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕；前記例示のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕；前記例示のフェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕；基-(W₁) o NR^{31'} R^{32'}〔W₁及びoは、前記に同じ。R^{31'}及びR^{32'}は、同一又は異なって、水素原子、前記例示のC1~6アルキル基、前記例示のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）又は前記例示のフェニルC1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）を示す。〕；前記例示のピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1~3個のフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕；前記例示のピペリジル基〔ピペリジン環上には、1~3個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）が置換していてもよい〕及び前記例示のフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい）を挙げることができる。

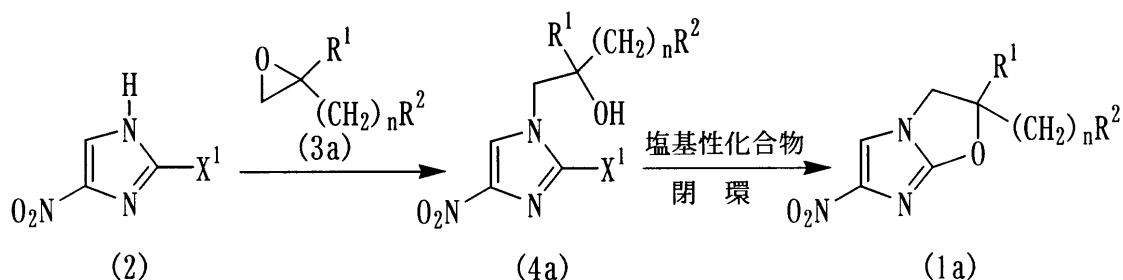
【0525】

本発明の化合物の製造方法を以下に示す。

【0526】

【化34】

反応工程式-1



【0527】

[式中、 R^1 、 R^2 及び n は前記に同じ。 X^1 はハロゲン原子又はニトロ基を示す。]

反応工程式－１によれば、一般式（１）で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下又は非存在下に、一般式（２）で表される４－ニトロイミダゾール化合物と一般式（３a）で表されるエポキシ化合物とを反応させて一般式（４a）で表される化合物を得、次いで得られた一般式（４a）で表される化合物を閉環させることにより製造される。

【０５２８】

一般式（２）の化合物と一般式（３a）の化合物との使用割合は、通常前者に対して後者を０．５～５倍モル、好ましくは０．５～３倍モルとするのがよい。

【０５２９】

塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば金属水素化物、金属アルコール、水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩等の無機塩基性化合物、酢酸塩等の有機塩基性化合物等が挙げられる。

【０５３０】

金属水素化物としては、具体的には、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を例示できる。金属アルコールとしては、具体的には、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t er t -ブトキシド等を例示できる。水酸化物としては、具体的には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等を例示できる。炭酸塩としては、具体的には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等を例示できる。炭酸水素塩としては、具体的には、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を例示できる。無機塩基性化合物には、上記以外に、ナトリウムアミド等も包含される。

【０５３１】

酢酸塩としては、具体的には、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等を例示できる。上記以外の有機塩基性化合物としては、具体的には、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、１－メチルピロリジン、 N －メチルモルホリン、１，５－ジアザビシクロ〔４．３．０〕ノネン－５（DBN）、１，８－ジアザビシクロ〔５．４．０〕ウンデセン－７（DBU）、１，４－ジアザビシクロ〔２．２．２〕オクタン（DABCO）等を例示できる。

【０５３２】

斯かる塩基性化合物は、一般式（２）の化合物に対して、通常０．１～２倍モル、好ましくは０．１倍～等モル、より好ましくは０．１～０．５倍モル用いるのがよい。

【０５３３】

一般式（２）の化合物と一般式（３a）の化合物との反応は、通常、適当な溶媒中で行われる。

【０５３４】

溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であれば公知のものを広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、ジメチルホルムアミド（DMF）、ジメチルスルホキシド（DMSO）、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール、 n －ブタノール、 t er t -ブタノール等のアルコール系溶媒、テトラヒドロフラン（THF）、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル系溶媒、これらの混合溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、水が含まれていてもよい。

【０５３５】

一般式（２）の化合物と一般式（３a）の化合物との反応は、例えば、一般式（２）の化合物を反応溶媒に溶解し、攪拌しながら氷冷下乃至は室温（３０℃）で塩基性化合物を加え、室温～８０℃で３０分～１時間攪拌した後、一般式（３a）の化合物を加え、通常室温～１００℃、好ましくは５０～８０℃で３０分～６０時間、好ましくは１～５０時間攪拌を続けることにより行われる。

【０５３６】

原料として用いられる化合物(2)は公知化合物である。化合物(3a)は、新規化合物を包含し、該化合物の製造方法については後述する。

【0537】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(4a)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0538】

一般式(1)で表される本発明化合物は、一般式(4a)で表される化合物を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式(4a)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加えて攪拌することにより行われる。

10

【0539】

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用できる。

【0540】

塩基性化合物の使用量は、一般式(4a)の化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

【0541】

閉環反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは50～100℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～12時間である。

20

【0542】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(1)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0543】

本発明では、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応により生成する一般式(4a)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができる。例えば、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物とを室温～80℃で反応させた後、反応混合物に塩基性化合物を添加し、50～100℃で更に攪拌を行うか、又は一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物とを室温～80℃で反

30

【0544】

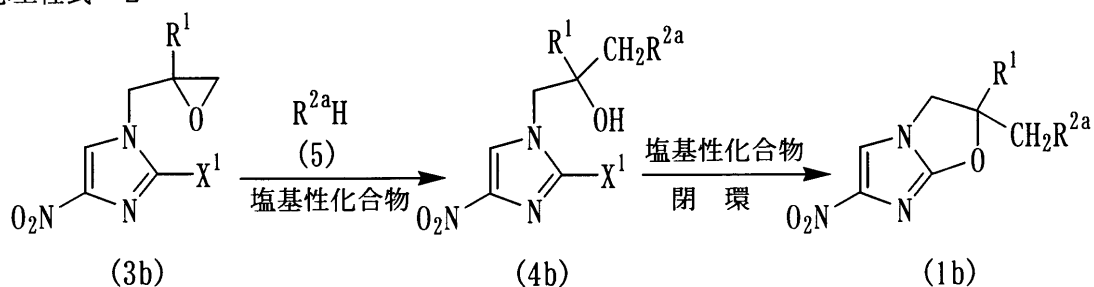
また、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応において、塩基性化合物を化合物(2)に対して0.9～2倍モル用い、50～100℃で攪拌することにより、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応を一挙に行い、一般式(1a)で表される目的化合物を製造することもできる。

【0545】

【化35】

40

反応工程式-2



【0546】

50

[式中、 R^1 及び X^1 は前記に同じ。 R^{2a} は、一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す。]

反応工程式-2によれば、一般式(1b)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下に、一般式(3b)で表される化合物と一般式(5)で表される化合物又はその塩とを反応させて一般式(4b)で表される化合物を得、次いで得られた一般式(4b)で表される化合物を閉環させることにより製造される。

【0547】

化合物(3b)は新規化合物であり、該化合物の製造方法については後述する(反応工程式-13)。また、 R^{2a} が一般式(E)で表される基を示す化合物(5)は新規化合物を包含しており、該化合物の製造方法の一例を後記参考例182、参考例186～参考例188及び参考例192に示す。

10

【0548】

一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との使用割合は、通常前者に対して後者を0.5～5倍モル、好ましくは0.5～2倍モルとするのがよい。

【0549】

一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応は、塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行われる。

【0550】

塩基性化合物及び反応溶媒としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物及び反応溶媒と同じものを使用できる。塩基性化合物の使用量は、一般式(3b)の化合物に対して、通常触媒量、好ましくは0.1～3倍モル、より好ましくは0.1～2倍モルである。

20

【0551】

R^{2a} が一般式(B)又は(E)で表される基を示す化合物(5)の場合、化合物(5)と塩基性化合物とを用いる代わりに、該化合物(5)の塩を使用することができる。斯かる塩としては、化合物(5)のナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩が挙げられる。

【0552】

一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応は、通常室温～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは室温～80℃で行われる。反応時間は、通常10分～48時間、好ましくは10分～24時間、より好ましくは10分～2時間である。

30

【0553】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(4b)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0554】

一般式(1b)で表される本発明化合物は、一般式(4b)で表される化合物を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式(4b)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加え、所定の温度にて攪拌することにより行われる。

40

【0555】

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用できる。

【0556】

塩基性化合物の使用量は、一般式(4b)の化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～5倍モル、より好ましくは等モル～2倍モルである。

【0557】

閉環反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは50～100℃である。反応時間は、通常10分～48時間、好ましくは10分～24時間、より好ましくは20分～4時間である。

50

【0558】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(1b)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0559】

本発明では、一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応により生成する一般式(4b)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができ、斯くして目的とする一般式(1b)で表される本発明化合物を製造することもできる。

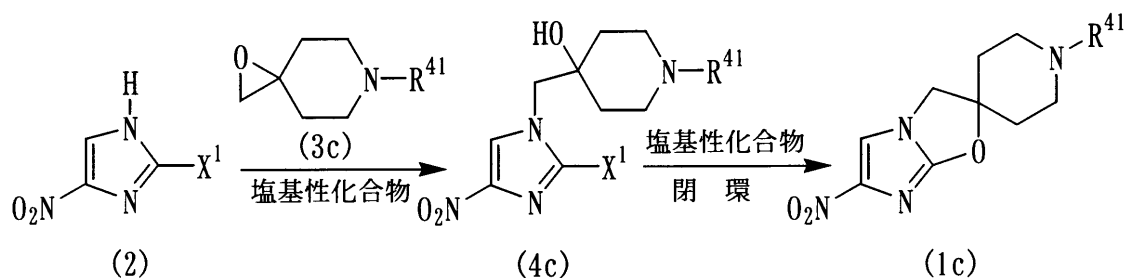
【0560】

特に、 R^{2a} が一般式(B)又は(E)で表される基を示す化合物(5)の場合、塩基性化合物を化合物(5)に対して等モル～過剰モル使用し、50～100℃で反応を行えば、中間体(4)が単離されずに、一般式(1b)の本発明化合物が一挙に製造される。 R^{2a} が一般式(B)又は(E)で表される基を示す化合物(5)のアルカリ金属塩(例えば、ナトリウム塩、カリウム塩)を用いた場合も同様である。

【0561】

【化36】

反応工程式-3



【0562】

[式中、 R^{41} 及び X^1 は前記に同じ。]

反応工程式-3によれば、一般式(1c)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下に、一般式(2)で表される化合物と一般式(3c)で表される化合物とを反応させて一般式(4c)で表される化合物を得、次いで得られた一般式(4c)で表される化合物を閉環させることにより製造される。

【0563】

化合物(3c)は新規化合物を包含しており、該化合物の製造方法については後述する(反応工程式-14)。

【0564】

一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との使用割合は、通常後者に対して前者を0.1～2倍モル、好ましくは0.1倍～等モル、より好ましくは0.1～0.5倍モルとするのがよい。

【0565】

一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との反応は、塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行われる。

【0566】

塩基性化合物及び反応溶媒としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物及び反応溶媒と同じものを使用できる。塩基性化合物の使用量は、一般式(2)の化合物に対して、通常0.1倍モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

【0567】

一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との反応は、例えば、一般式(2)の化合物を反応溶媒に溶解し、攪拌しながら氷冷下乃至は室温(30℃)で塩基性化合物を

10

20

30

40

50

加え、室温～80℃で30分～1時間攪拌した後、一般式(3c)の化合物を加え、通常室温～100℃、好ましくは50～80℃で30分～24時間、好ましくは1～12時間、より好ましくは1～8時間攪拌を続けることにより行われる。

【0568】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(4c)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0569】

一般式(1c)で表される本発明化合物は、一般式(4c)で表される化合物を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式(4c)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加え、所定の温度にて攪拌することにより行われる。

【0570】

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用できる。

【0571】

塩基性化合物の使用量は、一般式(4c)の化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

【0572】

閉環反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは50～100℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～12時間である。

【0573】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(1c)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

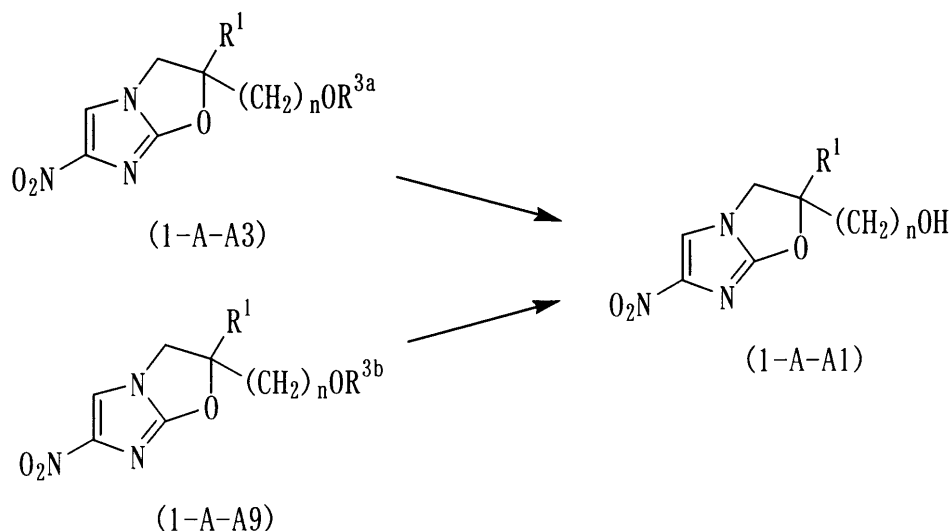
【0574】

本発明では、一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との反応により生成する一般式(4c)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができ、斯くして目的とする一般式(1c)で表される本発明化合物を製造することもできる。

【0575】

【化37】

反応工程式-4



【0576】

[式中、 R^1 及び n は前記に同じ。 R^{3a} はC 1～6アルコキシ-C 1～6アルキル基を示す。 R^{3b} はC 1～6アルカノイル基を示す。]

一般式(1)において、 R^2 が一般式(A)で表される基を示し、 R^3 がA1)の水素原子を示す化合物(以下「化合物(1-A-A1)」という)は、対応する R^3 がA3)のC 1～6アルコキシ-C 1～6アルキル基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A3)」という)又は R^3 がA9)のC 1～6アルカノイル基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A9)」という)を加水分解することにより製造される。

【0577】

化合物(1-A-A3)の加水分解は、酸性条件下で行われる。例えば、化合物(1-A-A3)を適当な溶媒に懸濁又は溶解した液に、酸を加え、0～120℃で攪拌することにより行われる。使用される溶媒は、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒、アセトニトリル、アセトン、トルエン、DMF、DMSO、酢酸、トリフルオロ酢酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。使用される酸は、例えばトリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸、塩酸、臭素酸、臭化水素酸、硫酸等の無機酸等を挙げることができる。トリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸は、それ自身反応溶媒としても使用できる。反応温度は、通常0～120℃、好ましくは室温～100℃、より好ましくは室温～80℃である。反応時間は、通常30分～24時間、好ましくは30分～12時間、より好ましくは1～8時間である。

【0578】

化合物(1-A-A9)の加水分解は、塩基性条件下で行われる。例えば、化合物(1-A-A9)を適当な溶媒に懸濁又は溶解した液に、塩基を加え、0～120℃で攪拌することにより行われる。使用される溶媒は、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒、又はこれらの混合溶媒である。使用される塩基は、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸化物、酢酸ナトリウム等の酢酸塩等を挙げることができる。反応温度は、0～120℃、好ましくは室温～100℃、より好ましくは室温～80℃である。反応時間は、30分～24時間、好ましくは30分～12時間、より好ましくは1～8時間である。

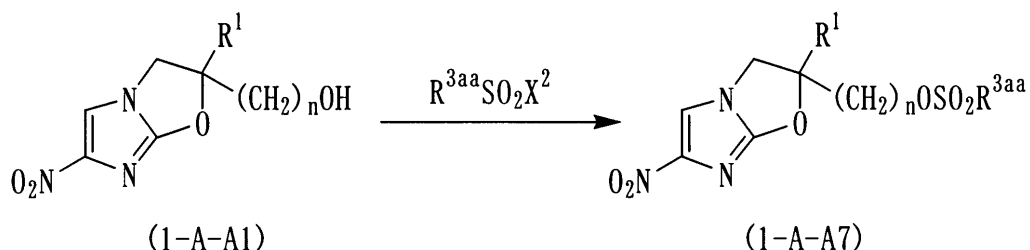
【0579】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(1-A-A1)を反応混合物から単離精製することができる。

【0580】

【化38】

反応工程式-5



【0581】

[式中、 R^1 及び n は前記に同じ。 X^2 はハロゲン原子を示す。 R^{3aa} はC 1～6アルキル基又はC 1～6アルキル基が置換していてもよいフェニル基を示す。]

一般式(1)において、 R^2 が一般式(A)で表される基を示し、 R^3 がA7)のC 1～6アルキルスルホニル基及びA8)のC 1～6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A7)」という)は、対応する R^3 がA1)の水素原子を示す化合物(化合物(1-A-A1))をスルホニル化することにより製造さ

れる。

【0582】

ここで、C1～6アルキルスルホニル基とは、炭素数1ないしは6個で構成されるアルキル基とスルホニル基で構成される基であって、例えば、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、プロパンスルホニル基、ブタンスルホニル基、ペンタンスルホニル基、ヘキサンスルホニル基等を挙げることができる。

【0583】

C1～6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基としては、例えば、ベンゼンスルホニル基、*o*-トルエンズルホニル基、*m*-トルエンズルホニル基、*p*-トルエンズルホニル基、2-エチルベンゼンスルホニル基、3-エチルベンゼンスルホニル基、4-エチルベンゼンスルホニル基、2-プロピルベンゼンスルホニル基、3-プロピルベンゼンスルホニル基、4-プロピルベンゼンスルホニル基、2,3-ジメチルベンゼンスルホニル基、2,4-ジメチルベンゼンスルホニル基、2,4,6-トリメチルベンゼンスルホニル基等のC1～6アルキル基が1～3個置換していてもよいベンゼンスルホニル基を挙げることができる。

10

【0584】

化合物(1-A-A1)のスルホニル化には、一般に行われているアルコールのスルホニル化反応の反応条件を広く適用できる。例えば、化合物(1-A-A1)を適当な溶媒に溶解し、この溶液に塩基性化合物の存在下、一般式 $R^{3aa}SO_2X^2$ で表される化合物を加え、0～150℃で攪拌することによって化合物(1-A-A7)を得ることができる。

20

【0585】

使用される溶媒としては、スルホニル化反応を阻害しない溶媒であれば全て使用できる。このような溶媒としては、例えば、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、アセトン等、又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

【0586】

一般式 $R^{3aa}SO_2X^2$ で表される化合物は、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～2倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用すればよい。

30

【0587】

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

【0588】

塩基性化合物の使用量は、一般式 $R^{3aa}SO_2X^2$ で表される化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

【0589】

本スルホニル化反応では、4-ジメチルアミノピリジン、4-(1-ピロリジニル)ピリジン等を触媒として使用することもできる。

40

【0590】

反応温度は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃、より好ましくは0～60℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～4時間である。

【0591】

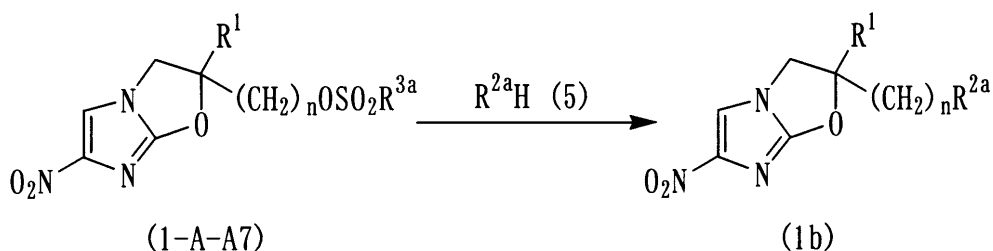
斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(1-A-A7)を反応混合物から単離精製することができる。

【0592】

50

【化 3 9】

反応工程式－6



10

【0593】

[式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{3a} 及び n は前記に同じ。]

一般式(1)において、 R^2 が一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す化合物(以下「化合物(1b)」という)は、 R^2 が一般式(A)で表される基を示し、対応する R^3 がA7)のC1～6アルキルスルホニル基及びA8)のC1～6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基を示す化合物(化合物(1-A-A7))と一般式(5)で表される化合物とを反応させることによっても製造される。

【0594】

化合物(1-A-A7)と一般式(5)で表される化合物との反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下で行われる。

20

【0595】

使用される溶媒としては、本反応を阻害しない溶媒であれば全て使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、エタノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、*tert*-ブタノール等のアルコール系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、アセトン等、又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

【0596】

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

30

【0597】

塩基性化合物の使用量は、化合物(1-A-A7)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

【0598】

一般式(5)で表される化合物は、化合物(1-A-A7)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは0.9～2倍モル、より好ましくは0.9～1.5倍モル使用すればよい。

【0599】

反応温度は、通常室温～150℃、好ましくは室温～100℃、より好ましくは60～100℃である。反応時間は、通常10分～24時間、好ましくは10分～12時間、より好ましくは20分～7時間である。

40

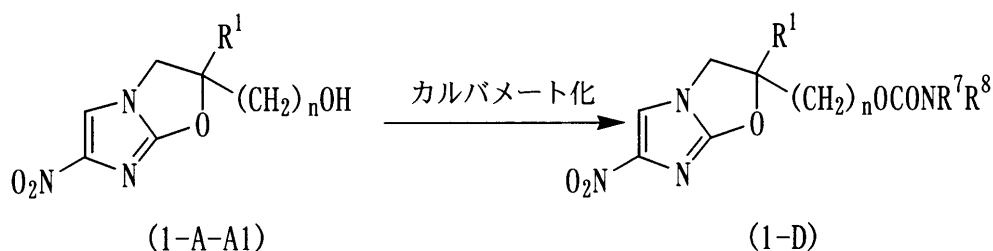
【0600】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0601】

【化 4 0】

反応工程式－7



10

【0602】

[式中、R¹、n、R⁷及びR⁸は前記に同じ。]

一般式(1)において、R²が一般式(D)で表される基を示す化合物(以下「化合物(1-D)」という)は、R²が一般式(A)で表される基を示し、R³がA1)の水素原子を示す化合物(化合物(1-A-A1))をカルバメート化することにより製造される。

【0603】

化合物(1-A-A1)のカルバメート化には、一般に行われているアルコールのカルバメート化反応の反応条件を広く適用できる。このような方法としては、例えば、(i)一般式 R⁷R⁸NH (式中、R⁷及びR⁸は前記に同じ)で表されるアミン及びトリホスゲンを用いる方法、(ii)一般式 R⁷R⁸NH (式中、R⁷及びR⁸は前記に同じ)で表されるアミン及びカルボジイミダゾールを用いる反応、(iii)イソシアナート化合物を用いる方法等が挙げられる。

20

【0604】

(i) アミン及びトリホスゲンを用いる方法：

一般式 R⁷R⁸NH (式中、R⁷及びR⁸は前記に同じ)で表されるアミンにトリホスゲンを作用させると、一般式 ClCONR⁷R⁸ (式中、R⁷及びR⁸は前記に同じ)で表されるカルバミン酸クロライドが生成する。カルバミン酸クロライドは、単離してもよいが、一般的に不安定であるため、単離することなくそのまま次の工程で使用する。

【0605】

トリホスゲンの塩化メチレン溶液に冷却攪拌下、塩基性化合物及び上記アミンを加え、0～30℃で30分～4時間攪拌してカルバミン酸クロライドを発生させる。トリホスゲンの使用量は、アミンに対して、通常0.3～1.5倍モル、好ましくは0.3～0.6倍モル、より好ましくは0.3～0.4倍モルである。

30

【0606】

アミンとトリホスゲンとの反応において使用される塩基性化合物としては、例えば、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン、N-メチルモルホリン等が挙げられる。これらの塩基性化合物は、トリホスゲンに対して、通常3倍モル～過剰モル、好ましくは3～4.5倍モル、より好ましくは3～3.3倍モル用いる。

【0607】

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは0℃～室温(30℃)であり、反応時間は、通常30分～8時間、好ましくは1～4時間、より好ましくは1～2時間である。

40

【0608】

斯くして得られるカルバミン酸クロライドの反応溶液は、そのまま使用できるが、不溶物を濾過して除き、濾液を濃縮した方がより有利である。

【0609】

次に、化合物(1-A-A1)を適当な反応溶媒に溶解し、上記で製造したカルバミン酸クロライドを氷冷攪拌下に加え、次いで塩化第一銅を加えた後、更に所定温度で所定時間攪拌することによって、化合物(1-D)を製造することができる。

【0610】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶

50

媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【0611】

カルバミン酸クロライドは、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル～5倍モル、好ましくは等モル～3倍モル、より好ましくは等モル～2倍モル使用するのがよい。

【0612】

また、塩化第一銅は、化合物(1-A-A1)に対して、通常0.1～5倍モル、好ましくは0.5～2倍モル、より好ましくは0.5倍モル～等モル使用すればよい。

10

【0613】

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは10～50℃、より好ましくは20～35℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～30時間、より好ましくは2～24時間である。

【0614】

(ii)アミン及びカルボジイミダゾールを用いる反応：

一般式 R^7R^8NH (式中、 R^7 及び R^8 は前記に同じ) で表されるアミンを適当な反応溶媒に溶解し、これに氷冷攪拌下、1, 1'-カルボニルジイミダゾールを加え、所定温度で所定時間攪拌することにより、アミノカルボニルイミダゾール誘導体を得られる。

20

【0615】

1, 1'-カルボニルジイミダゾールの使用量は、アミンに対して、通常0.9～2倍モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.2倍モルである。

【0616】

使用される溶媒は、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【0617】

30

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは0℃～室温(30℃)であり、反応時間は、通常30分～8時間、好ましくは1～4時間、より好ましくは1～2時間である。

【0618】

次に、予め化合物(1-A-A1)を適当な溶媒に溶解し、これに上記で得られるアミノカルボニルイミダゾール誘導体を氷冷攪拌下に加え、更に塩化第一銅を加えて所定温度で所定時間攪拌することにより、化合物(1-D)を製造することができる。

【0619】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

40

【0620】

アミノカルボニルイミダゾール誘導体は、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル～5倍モル、好ましくは等モル～3倍モル、より好ましくは等モル～2倍モル使用するのがよい。

【0621】

また、塩化第一銅は、化合物(1-A-A1)に対して、通常0.9～5倍モル、好ましくは等モル～2倍モル、より好ましくは等モル～1.2倍モル使用すればよい。

50

【0622】

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは10～50℃、より好ましくは20～35℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～30時間、より好ましくは1～3時間である。

【0623】

(iii)イソシアナートを用いる方法：

化合物(1-A-A1)を適当な反応溶媒に溶解し、これに氷冷攪拌下、イソシアネート類を加え、更に塩化第一銅を加えて、所定温度で所定時間攪拌することにより、R⁷又はR⁸が水素原子を示す化合物(1-D)を製造することができる。

【0624】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【0625】

イソシアナート類は、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル～5倍モル、好ましくは等モル～3倍モル、より好ましくは等モル～2倍モル使用するのがよい。

【0626】

また、塩化第一銅は、化合物(1-A-A1)に対して、通常0.9～5倍モル、好ましくは等モル～2倍モル、より好ましくは等モル～1.2倍モル使用すればよい。

【0627】

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは10～50℃、より好ましくは20～35℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～30時間、より好ましくは1～3時間である。

【0628】

上記(i)、(ii)又は(iii)の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(1-D)を反応混合物から単離精製することができる。

【0629】

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子にC1～6アルコキシカルボニル基が置換した化合物は、これを脱保護することにより、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物に誘導することができる。

【0630】

この方法では、例えば、脱保護すべき原料化合物を適当な反応溶媒に溶解し、酸を用いて加水分解することにより、目的化合物を得ることができる。

【0631】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【0632】

酸としては、例えば、塩酸、臭素酸、臭化水素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

10

20

30

40

50

【0633】

これらの酸の使用量は、原料化合物に対して、通常等モル以上、好ましくは2～10倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。反応温度は、通常室温～100℃であるが、用いる酸の種類によって適宜調節すればよい。トリフルオロ酢酸を用いる場合には、室温で充分である。反応時間は、通常1～24時間、好ましくは1～12時間である。

【0634】

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の目的化合物を単離することができる。

【0635】

脱保護された目的化合物は、上記のようにして単離することも可能であるが、単離することなく、トリエチルアミン等の塩基性化合物を加えて遊離形態の目的化合物に導き、これを次の反応に使用することができる。

【0636】

例えば、遊離形態の上記目的化合物に酸ハライド、酸無水物又は混合酸無水物を作用させることによって対応するアミド又はカルバメートを製造できる。遊離形態の上記目的化合物とスルホン酸クロライドとを反応させることにより、対応するスルホン酸アミドを製造できる。遊離形態の上記目的化合物をアミンを用いて尿素化することにより、対応する尿素を製造することができる。更に、アルデヒド類を用いる還元的アミノ化反応、又はアルキルハライドによるアルキル化反応を用いて、上記目的化合物のN-アルキル化体を製造することができる。

【0637】

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物は、これをカルバメート化することにより、対応する複素環上の窒素原子に-COOR²⁷基(R²⁷は前記に同じ)が置換した化合物に誘導することができる。

【0638】

カルバメート化方法としては、例えば、(i)各種のハロゲン化ギ酸エステルを用いる方法、(ii)アルコールにカルボニルジイミダゾールを作用させて得られる活性中間体を用いる方法等が挙げられる。

【0639】

(i)ハロゲン化ギ酸エステルを用いる方法：

原料化合物を、反応溶媒中、塩基性化合物の存在下に、ハロゲン化ギ酸エステルを反応させることにより、目的化合物を製造できる。

【0640】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【0641】

塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば、水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩等の無機塩基性化合物、酢酸塩等の有機塩基性化合物等が挙げられる。

【0642】

水酸化物としては、具体的には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化セシウム、水酸化リチウム等を例示できる。炭酸塩としては、具体的には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸リチウム等を例示できる。炭酸水素塩としては、具体的には、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素セシウム、炭酸水素リチウム等を例示できる。

【0643】

酢酸塩としては、具体的には、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等を例示できる。上記以外の有機塩基性化合物としては、具体的には、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1-メチルピロリジン、N-メチルモルホリン、DBN、DBU、DABCO等を例示できる。

【0644】

斯かる塩基性化合物は、原料化合物に対して、通常等モル～4倍モル、好ましくは1～1.5倍モル、より好ましくは1～1.1倍モル用いるのがよい。

【0645】

ハロゲン化ギ酸エステルは、原料化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用するのがよい。

10

【0646】

反応温度は、通常0～100℃、好ましくは0～60℃、より好ましくは10～30℃である。反応時間は、通常30分～12時間、好ましくは1～6時間、より好ましくは1～2時間である。

【0647】

(ii) 活性中間体を用いる方法：

適当な溶媒中、一般式 $R^{27}OH$ (R^{27} は前記に同じ) で表されるアルコールと1, 1'-カルボニルジイミダゾールとを反応させて活性中間体を得(第一工程)、次いで得られる活性中間体に原料化合物を反応させる(第二工程) ことにより、目的化合物を製造できる。

20

【0648】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【0649】

1, 1'-カルボニルジイミダゾールは、上記一般式で表されるアルコールに対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用するのがよい。

30

【0650】

第一工程の反応温度は、通常0～100℃、好ましくは0～60℃、より好ましくは10～30℃である。また、反応時間は、通常30分～12時間、好ましくは1～6時間、より好ましくは1～2時間である。

【0651】

活性中間体は、原料化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用するのがよい。

【0652】

第二工程の反応温度は、通常0～100℃、好ましくは0～60℃、より好ましくは10～30℃である。また、反応時間は、通常30分～12時間、好ましくは1～6時間、より好ましくは1～2時間である。

40

【0653】

上記(i)又は(ii)の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、カルバメート化された目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0654】

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素

50

環上の窒素原子に $R^{32}R^{33}NCO-$ (R^{32} 及び R^{33} は前記に同じ) 基が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物を尿素化することにより製造される。

【0655】

この尿素化反応には、例えば、(i)一般式 $R^{32}R^{33}NH$ (式中、 R^{32} 及び R^{33} は前記に同じ) で表されるアミン及びトリホスゲンを用いる方法、(ii)一般式 $R^{32}R^{33}NH$ (式中、 R^{32} 及び R^{33} は前記に同じ) で表されるアミン及びカルボニルジイミダゾールを用いる反応、(iii)イソシアナート化合物を用いる方法等を適用できる。

【0656】

これら(i)、(ii)及び(iii)の反応は、例えば、上記化合物 (1-A-A1) のカルバメート化で述べた(i)、(ii)及び(iii)の反応と同様の反応条件下で行われる。

10

【0657】

上記(i)、(ii)又は(iii)の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0658】

一般式 (1) の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に基 $R^{38a}-$ (R^{38a} は、C 1～6 アルカノイル基、フェニル C 2～6 アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシ C 2～6 アルカノイル基、フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオ C 2～6 アルカノイル基、ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基及び C 1～6 アルキルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、4-ビフェニルカルボニル基、ピリジルカルボニル基又はフェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニル C 2～6 アルケニルカルボニル基を示す) が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物に、一般式 $R^{38a}OH$ (R^{38a} は前記に同じ) で表されるカルボン酸を反応させることにより製造される。

20

30

【0659】

この反応は、後記反応工程式-19における化合物 (Ea-2) と化合物 (18) との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0660】

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0661】

一般式 (1) の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に基 $R^{39a}SO_2-$ (R^{39a} はハロゲン原子及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基を示す) が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物に、一般式 $R^{39a}SO_2X^2$ (R^{39a} 及び X^2 は前記に同じ) で表されるスルホン酸ハライドを反応させることにより製造される。

40

【0662】

この反応は、後記反応工程式-18における化合物 (Fd-1) と化合物 (15) との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0663】

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離

50

操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0664】

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に基 $R^{40a}R^{52}CH-$ (R^{40a} は、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、シクロヘキシル基、置換基としてC1～6アルキル基を有していてもよいアミノ基、C1～6アルコキシカルボニル基、フェノキシ基、フェニルC1～6アルキル基、フェニルC2～6アルケニル基、ピリジル基、イミダゾリル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びピペリジニル基からなる群より選ばれた少なくとも1種が置換していてもよい〕、4-ビフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及び置換基としてC1～6アルキル基を有していてもよいアミノ基からなる群より選ばれた少なくとも1種が置換していてもよい〕、ナフチル基、フリル基又はチエニル基を示す。 R^{52} は、水素原子又はC1～6アルキル基を示す。)が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物を、還元的アルキル化反応に付すことにより製造される。

10

【0665】

この還元的アルキル化反応は、例えば、適当な溶媒中、還元剤の存在下、原料化合物に、一般式 $R^{40}R^{52}CO$ (R^{40} 及び R^{52} は前記に同じ)で表されるアルデヒド又はケトン

20

【0666】

この反応は、後記反応工程式-16における化合物(E-2)と化合物(13)との反応と同様の反応条件下に行われる。

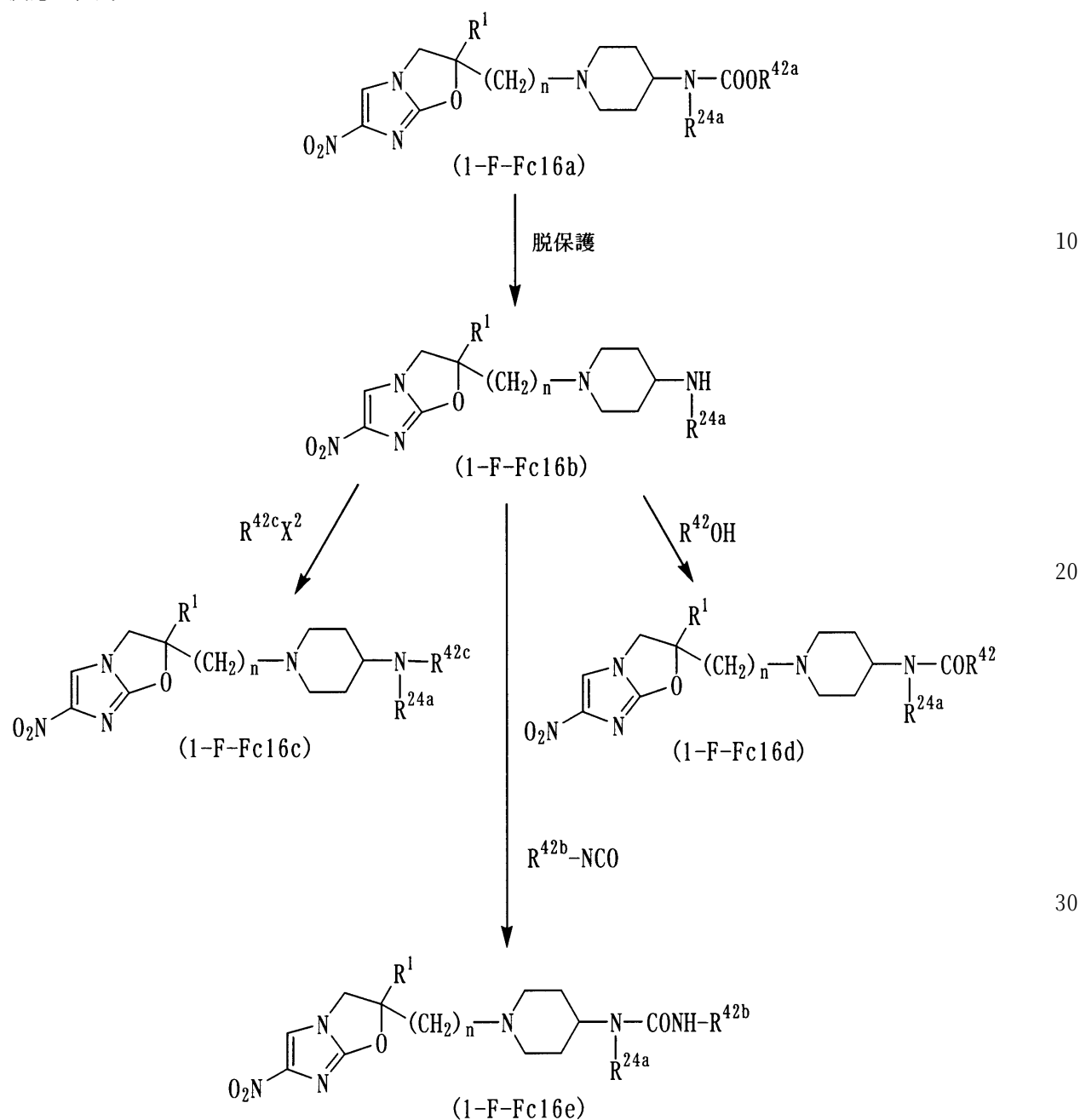
【0667】

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0668】

【化 4 1】

反応工程式－8



【0669】

[式中、 R^1 、 X^2 及び n は前記に同じ。 R^{24a} は、(Fca1)～(Fca11)で示される基を示す。 R^{42a} は、C1～6アルキル基を示す。 R^{42} は、(Fca5)、(Fca6)又は(Fca7)で示される基を示す。 R^{42c} は、(Fca2)、(Fca3)、(Fca4)、(Fca8)又は(Fca9)で示される基を示す。 R^{42b} は、フェニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が置換していてもよい）を示す。]

化合物(1-F-Fc16a)を化合物(1-F-Fc16b)に導く反応は、後記反応工程式－16における化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0670】

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の目的化合物を単離することができる。

【0671】

化合物(1-F-Fc16c)は、化合物(1-F-Fc16b)と一般式 $R^{42c}X^2$ で表されるハロゲン化物とを反応させることにより製造される。

【0672】

この反応は、後記反応工程式-18における化合物(E d-1)と化合物(15)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0673】

化合物(1-F-Fc16d)は、化合物(1-F-Fc16b)と一般式 $R^{42}OH$ で表されるカルボン酸とを反応させることにより製造される。

【0674】

この反応は、後記反応工程式-19における化合物(E a-2)と化合物(18)との反応と同様の反応条件下に行われる。

10

【0675】

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

【0676】

化合物(1-F-Fc16e)は、化合物(1-F-Fc16b)と一般式 $R^{42b}NCO$ で表されるイソシアネート化合物とを反応させることにより製造される。

【0677】

化合物(1-F-Fc16b)とイソシアネート化合物との反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に適当な不活性溶媒又は無溶媒下で行われる。

20

【0678】

塩基性化合物としては、例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン-5(DBN)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン-7(DBU)、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン(DABCO)等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。また、溶媒としては、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、N, N-ジメチルアセタミド、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水等又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

30

【0679】

イソシアネート化合物の使用量としては、化合物(1-F-Fc16b)に対して、通常等モル~5倍モル量程度、好ましくは等モル~3倍モル量程度とするのがよい。該反応は通常0~200℃程度、好ましくは室温~150℃程度付近の温度で、通常5分~30時間程度を要して行われる。

40

【0680】

該反応の反応系内には、三弗化硼素ジエチルエーテル錯体等の硼素化合物、塩化第一銅等のハロゲン化銅化合物等を添加してもよい。

【0681】

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作

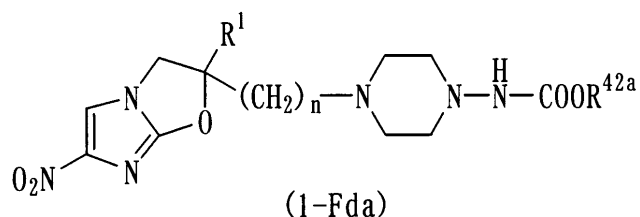
50

によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

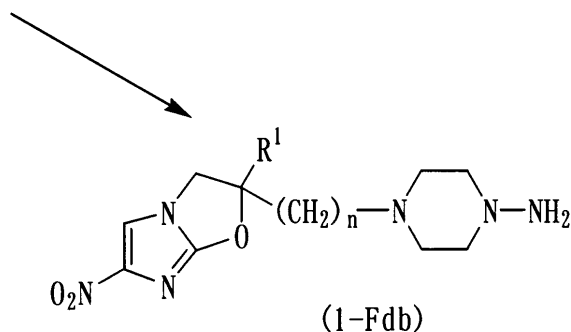
【0682】

【化42】

反応工程式-9



10



20

【0683】

[式中、 R^1 、 R^{42a} 及び n は前記に同じ。]

化合物(1-Fdb)は、化合物(1-Fda)を脱保護することにより製造される。具体的には、例えば、化合物(1-Fda)を適当な反応溶媒に溶解し、酸を用いて加水分解することにより、化合物(1-Fdb)を得ることができる。

【0684】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

30

【0685】

酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、臭素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

【0686】

これらの酸の使用量は、化合物(1-Fda)に対して、通常等モル以上、好ましくは2～10倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。反応温度は、通常室温～100℃であるが、用いる酸の種類によって適宜調節すればよい。トリフルオロ酢酸を用いる場合には、室温で充分である。反応時間は、通常1～24時間、好ましくは1～12時間である。

40

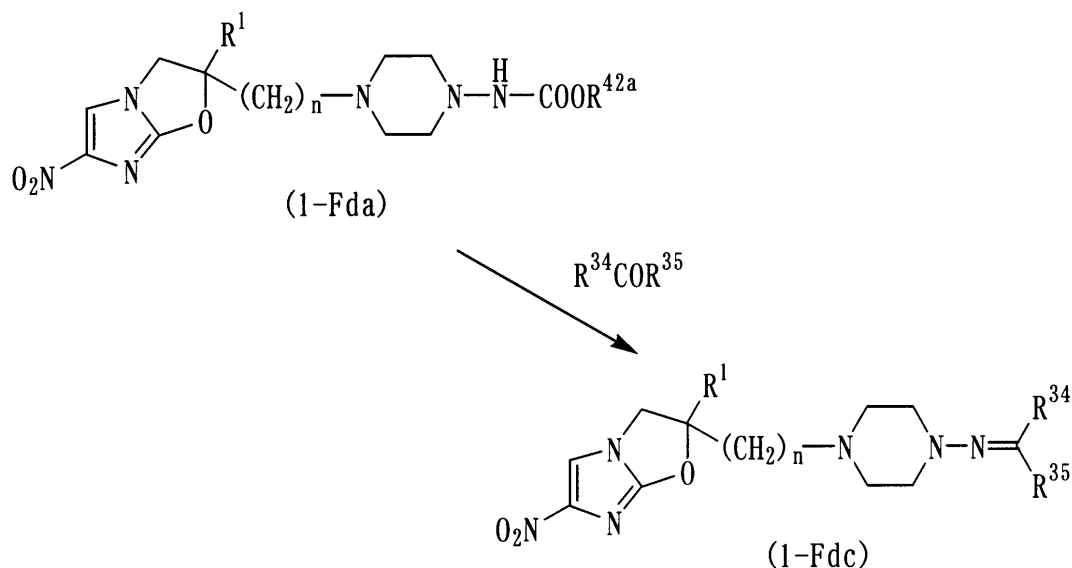
【0687】

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の化合物(1-Fdb)を単離することができる。

【0688】

【化 4 3】

反応工程式－10



10

【0689】

20

[式中、R¹、R^{42a}、n、R³⁴及びR³⁵は前記に同じ。]

化合物(1-Fdc)は、化合物(1-Fda)に、一般式 R³⁴COR³⁵ (R³⁴及びR³⁵は前記に同じ) で表されるアルデヒド又はケトンを反応させることにより製造される。

【0690】

この反応は、酸の存在下、適当な溶媒中で行われる。

【0691】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

30

【0692】

酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、臭素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

【0693】

これらの酸の使用量は、化合物(1-Fda)に対して、通常0.5倍モル以上、好ましくは0.5～1.5倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。

40

【0694】

アルデヒド又はケトンの使用量は、化合物(1-Fda)に対して、通常0.9～3倍モル、好ましくは1～1.5倍モル、より好ましくは1～1.3倍モルである。

【0695】

反応温度は、通常室温～100℃であるが、用いる酸の種類によって適宜調節すればよい。反応時間は、通常1～12時間、好ましくは1～3時間である。

【0696】

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の化合物(1-Fdc)を単離することができる。

50

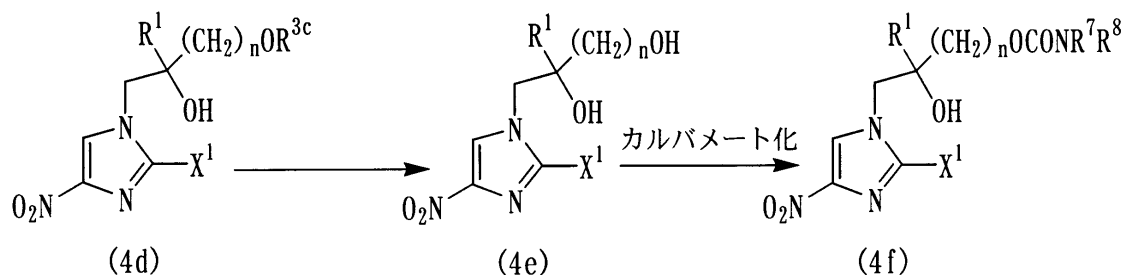
【0697】

次に、本発明化合物を製造するための出発原料及び中間体の製造方法につき説明する。

【0698】

【化44】

反応工程式-11



10

【0699】

[式中、 R^1 、 R^7 、 R^8 、 X^1 及び n は前記に同じ。 R^{3c} はC1～6アルコキシ-C1～6アルキル基、C1～6アルカノイル基又はp-ニトロベンゾイル基を示す。]

化合物(4d)から化合物(4e)に導く反応は、例えば、反応工程式-4における化合物(1-A-A3)又は化合物(1-A-A9)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。例えば、 R^{3c} がC1～6アルコキシ-C1～6アルキル基を示す化合物(4d)の場合には、化合物(1-A-A3)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行うのがよく、 R^{3c} がC1～6アルカノイル基又はp-ニトロベンゾイル基を示す化合物(4d)の場合には、化合物(1-A-A9)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行うのがよい。

20

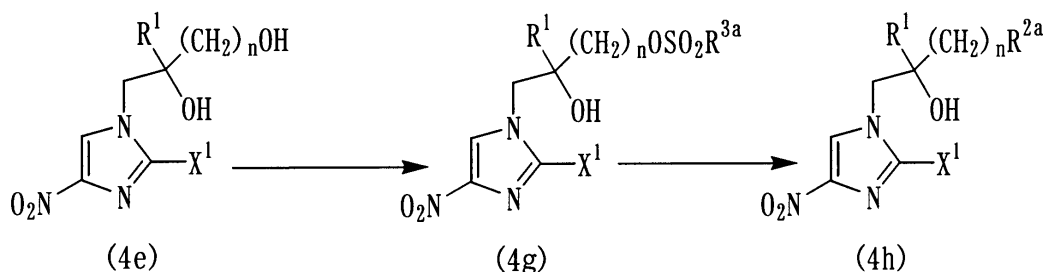
【0700】

化合物(4e)から化合物(4f)に導く反応は、例えば、反応工程式-7における化合物(1-A-A1)から化合物(1-D)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

【0701】

【化45】

反応工程式-12



30

【0702】

[式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{3a} 、 X^1 及び n は前記に同じ。]

40

化合物(4e)から化合物(4g)に導く反応は、例えば、反応工程式-5における化合物(1-A-A1)から化合物(1-A-A7)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

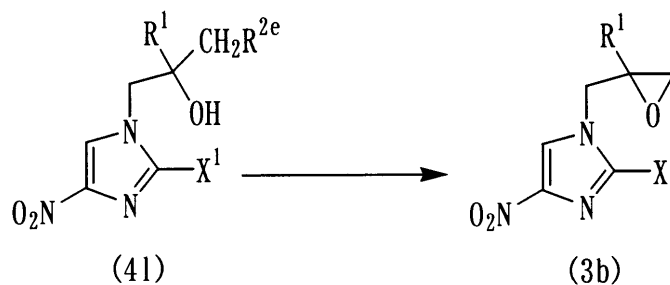
【0703】

化合物(4g)から化合物(4h)に導く反応は、例えば、反応工程式-6における化合物(1-A-A7)から化合物(1b)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

【0704】

【化 4 6】

反応工程式－ 1 3



10

【 0 7 0 5 】

[式中、 R^1 及び X^1 は前記に同じ。 R^{2e} はハロゲン原子、C 1～6 アルキルスルホニルオキシ基又はフェニル環上にC 1～6 アルキル基が置換していてもよいフェニルスルホニルオキシ基を示す。]

化合物 (4 1) から化合物 (3 b) に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下で行われる。

【 0 7 0 6 】

ここで使用できる溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

20

【 0 7 0 7 】

塩基性化合物としては、上記一般式 (2) の化合物と一般式 (3 a) の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

【 0 7 0 8 】

塩基性化合物は、化合物 (4 1) に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モル用いるのがよい。

30

【 0 7 0 9 】

この反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃、より好ましくは0～60℃である。また、反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～4時間である。

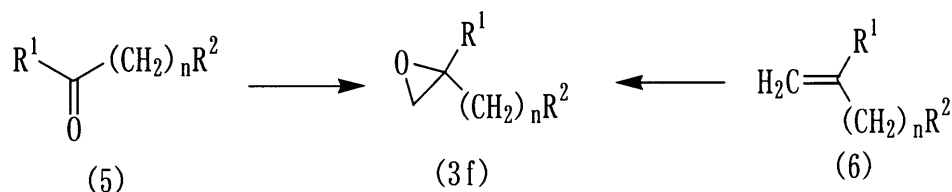
【 0 7 1 0 】

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物 (3 b) を反応混合物から単離精製することができる。

【 0 7 1 1 】

【化 4 7】

反応工程式－ 1 4



40

【 0 7 1 2 】

[式中、 R^1 、 R^2 及び n は前記に同じ。]

50

化合物（５）から化合物（３f）に導く反応は、例えば、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に、化合物（５）をトリメチルスルホキソニウムヨージドで処理することにより行われる。

【０７１３】

ここで使用できる溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【０７１４】

塩基性化合物としては、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド等の金属アルコラート等を挙げることができる。

【０７１５】

これらの塩基性化合物は、化合物（５）に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは１～３倍モル、より好ましくは１～１．５倍モル用いるのがよい。

【０７１６】

また、トリメチルスルホキソニウムヨージドは、化合物（５）に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは１～３倍モル、より好ましくは１～１．５倍モル用いるのがよい。

【０７１７】

この反応の反応温度は、通常０～８０℃、好ましくは１０～５０℃、より好ましくは２０～３５℃である。また、反応時間は、通常１～２４時間、好ましくは１～１２時間、より好ましくは１～４時間である。

【０７１８】

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物（３f）を反応混合物から単離精製することができる。

【０７１９】

化合物（６）から化合物（３f）に導く反応は、例えば、適当な溶媒中、化合物（６）を過酸化物で処理することにより行われる。

【０７２０】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【０７２１】

過酸化物としては、例えば、メタクロロ過安息香酸（mCPBA）、過安息香酸、過酢酸、過酸化水素等が挙げられる。

【０７２２】

これら過酸化物は、化合物（６）に対して、通常等モル～２倍モル、好ましくは等モル～１．５倍モル、より好ましくは等モル～１．３倍モル使用すればよい。

【０７２３】

この反応の反応温度は、通常０～８０℃、好ましくは０～５０℃、より好ましくは２０～３５℃である。また、反応時間は、通常１０分～２４時間、好ましくは１～１２時間、より好ましくは１～８時間である。

【０７２４】

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離

10

20

30

40

50

操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物（3 f）を反応混合物から単離精製することができる。

【0725】

光学活性な化合物（3 f）は、例えば、化合物（6）から次のようにして製造される。

【0726】

光学活性な化合物（3 f）は、上記化合物（6）から化合物（3 f）に導く反応において過酸化物に代えてクメンヒドロパーオキシド又はtert-ブチルヒドロペルオキシドを用い、触媒としてTi（O-iso-C₃H₇）₄及び光学活性な酒石酸ジエチル（D又はL-体）等の酒石酸C1～6アルキルエステル類の共存下に酸化する、いわゆるシャープレス酸化によって製造できる。

10

【0727】

この反応に使用される溶媒としては、本反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0728】

クメンヒドロパーオキシド又はtert-ブチルヒドロペルオキシドは、化合物（6）に対して、通常0.1～2倍モル、好ましくは0.1～1.5倍モル、より好ましくは0.1倍～等モル使用すればよい。

20

【0729】

Ti（O-iso-C₃H₇）₄は、化合物（6）に対して、通常0.1～2倍モル、好ましくは0.1～1.5倍モル、より好ましくは0.1倍モル～等モル使用すればよい。

【0730】

光学活性な酒石酸C1～6アルキルエステル類（D又はL-体）は、化合物（6）に対して、通常等モル～2倍モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.3倍モル使用すればよい。

【0731】

この反応の反応温度は、通常-50～30℃、好ましくは-20～20℃、より好ましくは-20～5℃である。また、反応時間は、通常1～48時間、好ましくは4～24時間、より好ましくは4～12時間である。

30

【0732】

化合物（5）又は化合物（6）において、R¹及び-（CH₂）_nR^{2a}が、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合してピペリジン環を形成している場合には、上記と同様にして、化合物（3 f）において、R¹及び-（CH₂）_nR^{2a}が、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合してピペリジン環を形成している化合物（化合物（3 c））に導くことができる。

【0733】

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、光学活性な化合物（3 f）を反応混合物から単離精製することができる。

40

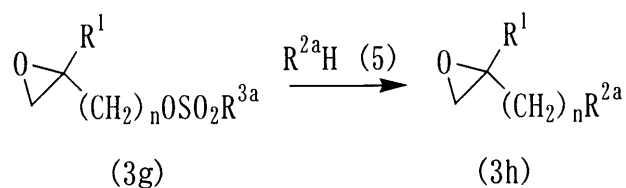
【0734】

本発明の一般式（1）で表される化合物（最終化合物）及び上記各反応工程式において得られる中間体は、立体異性体及び光学異性体を包含する。

【0735】

【化 4 8】

反応工程式－15



【0736】

10

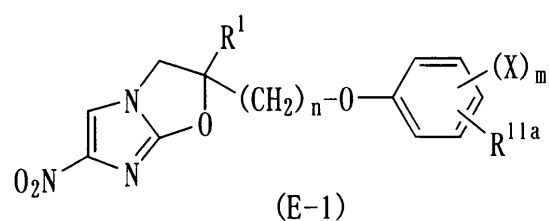
[式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{3a} 及び n は前記に同じ。]

化合物(3g)から化合物(3h)に導く反応は、例えば、反応工程式－6における化合物(1-A-A7)から化合物(1b)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

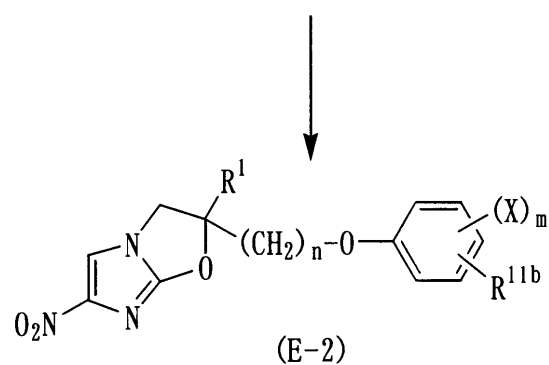
【0737】

【化 4 9】

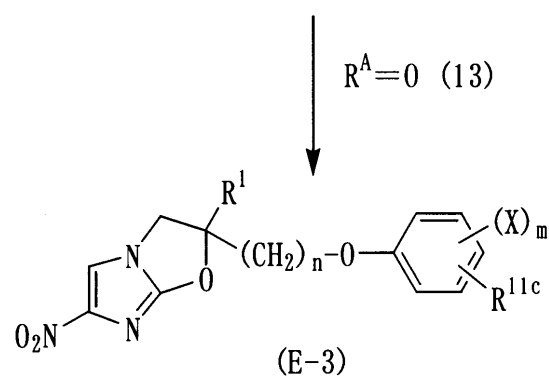
反応工程式－16



20



30



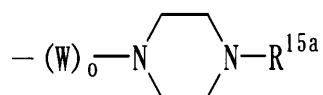
40

【0738】

[式中、 R^1 、 X 、 n 及び m は前記に同じ。 R^{11a} は、基

【0739】

【化 5 0】



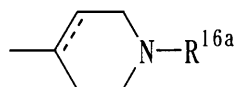
【 0 7 4 0】

(W及びoは前記に同じ。R^{15a}は、C 1～2 0のアルコキシカルボニル基を示す。但し、Wが基C=Oを示す場合、R^{15a}はC 1～6アルコキシカルボニル基を示すものとする。) 又は基

【 0 7 4 1】

10

【化 5 1】

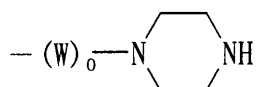


【 0 7 4 2】

(R^{16a}は、C 1～8アルコキシカルボニル基を示す。)を示す。R^{11b}は、基

【 0 7 4 3】

【化 5 2】



20

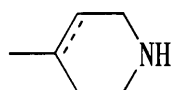
【 0 7 4 4】

(W及びoは前記に同じ。)

又は基

【 0 7 4 5】

【化 5 3】



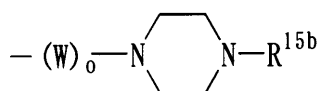
【 0 7 4 6】

30

を示す。R^{11c}は、基

【 0 7 4 7】

【化 5 4】



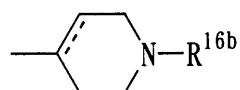
【 0 7 4 8】

(R^{15b}は、C 3～8シクロアルキル基を示す。) 又は基

【 0 7 4 9】

【化 5 5】

40



【 0 7 5 0】

(R^{16b}は、C 3～8シクロアルキル基を示す。)を示す。R^Aは、C 3～8シクロアルキル基を示す。]

化合物 (E-2) は、化合物 (E-1) を加水分解することにより製造される。

【 0 7 5 1】

この加水分解反応は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下に行われる。

50

【0752】

用いられる溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、*tert*-ブタノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、酢酸、蟻酸等の脂肪酸類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルスルホキシド、N，N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0753】

酸としては、例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸等の有機酸を挙げることができる。

10

【0754】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。

【0755】

該反応は、通常0～200℃程度、好ましくは0～150℃程度にて好適に進行し、一般に10分～30時間程度で終了する。

【0756】

酸又は塩基性化合物の使用量は、化合物(E-1) 1モルに対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～10モルであるが、反応溶媒として大過剰に用いてもよい。

20

【0757】

上記加水分解処理後、反応を完結させるために、上記加水分解反応液を、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に通常0～100℃、好ましくは、室温～70℃付近にて、1～30分程度保持してもよい。塩基性化合物としては、例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1，5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1，8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1，4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。また、溶媒としては、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、N，N-ジメチルアセタミド、N，N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水等又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

30

40

【0758】

化合物(E-2)と化合物(13)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行われる。

【0759】

ここで使用される溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、*tert*-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、アセトニトリル、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の脂肪酸、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トル

50

エン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を例示できる。

【0760】

還元剤としては、例えば、蟻酸、蟻酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化トリアセチルオキシ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤又はこれらの水素化還元剤の混合物、パラジウムー黒、パラジウムー炭素、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル等の接触水素還元剤等を例示できる。

【0761】

還元剤として蟻酸を使用する場合、反応温度は通常室温～200℃程度、好ましくは50～150℃程度付近が適当であり、反応は10分～10時間程度にて終了する。蟻酸は、化合物(E-2)に対して大過剰量使用するのがよい。

10

【0762】

また、還元剤として水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常-80～100℃程度、好ましくは-80～70℃程度が適当であり、30分～100時間程度で反応は終了する。水素化還元剤の使用量は、化合物(E-2)に対して、通常等モル～20倍モル量程度、好ましくは等モル～6倍モル程度とするのがよい。特に還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。

20

【0763】

この反応の反応系内には、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等のアミン類を添加してもよく、また、モレキュラーシーヴス 3A(MS-3A)、モレキュラーシーヴス 4A(MS-4A)等のモレキュラーシーヴスを添加してもよい。

【0764】

更に、接触水素還元剤を用いる場合は、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又は蟻酸、蟻酸アンモニウム、シクロヘキセン、放水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30～100℃程度、好ましくは0～60℃程度の温度で反応を行なうのがよく、通常1～12時間程度で反応は終了する。接触水素還元剤の使用量としては、化合物(E-2)に対して、通常0.1～40重量%、好ましくは1～20重量%程度とするのがよい。

30

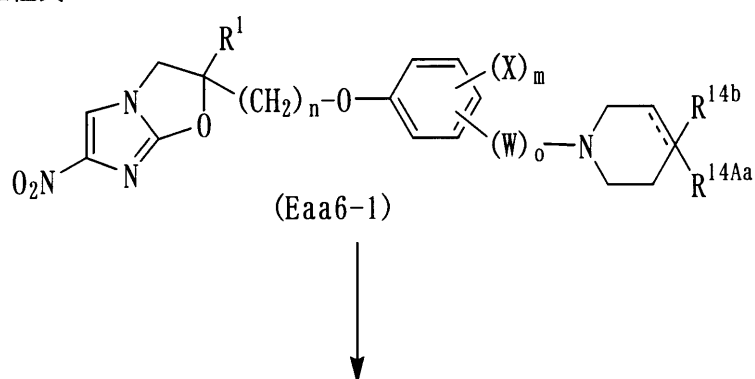
【0765】

化合物(13)の使用量は、化合物(E-2)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量とするのがよい。

【0766】

【化 5 6】

反応工程式－ 1 7



10

【 0 7 6 7】

[式中、 R^1 、 X 、 n 、 m 、 W 及び o は前記に同じ。 R^{14Aa} は、水素原子、水酸基、 $C1 \sim 6$ アルコキシ基又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい）を示す。 R^{14b} は、 $C1 \sim 6$ アルコシカルボニル基を示す。]

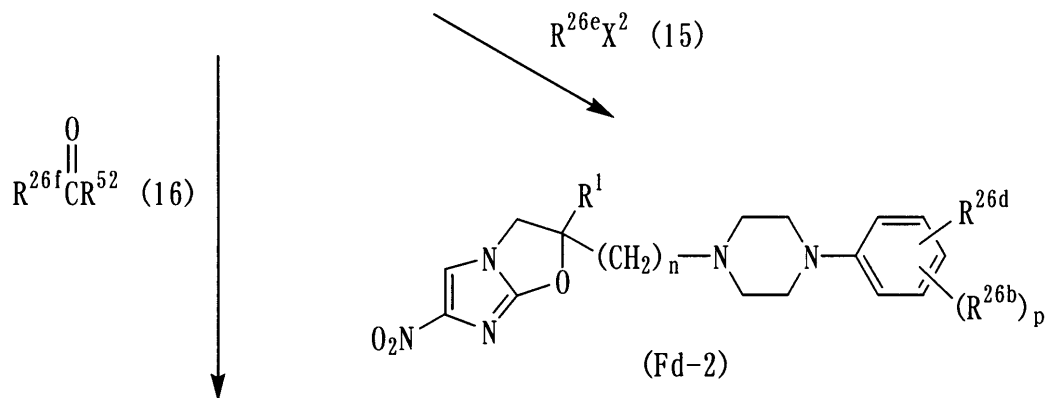
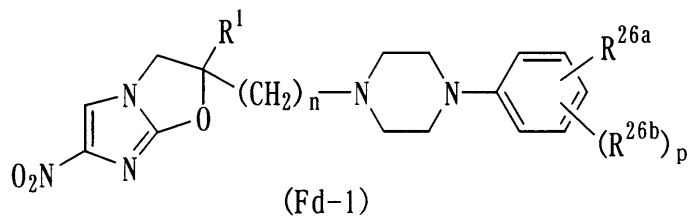
20

化合物（E a a 6－1）を化合物（E a a 5－1）に導く反応は、前記反応工程式－16における化合物（E－1）を化合物（E－2）に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【 0 7 6 8】

【化 5 7】

反応工程式- 1 8



【0 7 6 9】

[式中、 R^1 、 n 、 R^{52} 及び X^2 は前記に同じ。

R^{26b} は、ハロゲン原子、シアノ基、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、アミノC 1～6アルキル基（アミノ基上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）又はフェニルC 1～6アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。

p は0～4の整数を示す。

R^{26a} は、基- NHR^{26h} （ R^{26h} は水素原子又はC 1～6アルキル基を示す。）又は基- W_1-NHR^{26c} （ W_1 は前記に同じ。 R^{26c} は水素原子、C 1～6アルキル基又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）を示す。

R^{26d} は、基- NR^{26e} 、 R^{26h} 又は基- W_1-NR^{26c} 、 R^{26e} を示す。 R^{26e} は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハ

10

20

30

40

50

ロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)又はC 1～6アルキル基を示す。 $R^{26e'}$ はC 1～6アルキル基を示す。

R^{26f} は、C 1～6アルキル基を示す。

R^{26g} は、基 $-N(R^{26h})CHR^{52}R^{26f}$ 又は基 $-W_1-N(R^{26c})CHR^{52}R^{26f}$ を示す。但し前記基 $-N(R^{26h})CHR^{52}R^{26f}$ における $CHR^{52}R^{26f}$ 部分及び基 $-W_1-N(R^{26c})CHR^{52}R^{26f}$ における $CHR^{52}R^{26f}$ 部分の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(F d-1)と化合物(15)との反応は、一般に適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下にて行われる。

10

【0770】

用いられる不活性溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグリウム、ジグリウム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0771】

20

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウムn-ブトキシド等の金属アルコラート類、ピリジン、イミダゾール、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジメチルアニリン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基又はこれらの混合物を挙げることができる。

30

【0772】

化合物(15)は、化合物(F d-1)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～10倍モル量程度使用するのがよい。また、塩基性化合物は、化合物(F d-1)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～10倍モル量程度使用するのがよい。

【0773】

この反応は、通常0～200℃、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～80時間程度にて反応は終了する。

【0774】

この反応の反応系内には、沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物等を添加してもよし、相間移動触媒を添加してもよい。

40

【0775】

相間移動触媒としては、例えば、テトラブチルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、テトラブチルアンモニウムフルオリド、テトラブチルアンモニウムアイオダイド、テトラブチルアンモニウムヒドロキシド、亜硫酸水素テトラブチルアンモニウム、トリブチルメチルアンモニウムクロリド、トリブチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムブロミド、テトラヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクチルアンモニウムクロリド、メチルトリヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクタデカニルアンモニウムクロリド、メチルトリデカニルアンモニウムクロリド、ベンジルトリプロピルアンモ

50

ニウムクロリド、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、フェニルトリエチルアンモニウムクロリド、テトラエチルアンモニウムクロリド、テトラメチルアンモニウムクロリド等の炭素数1～18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基、フェニルC1～6アルキル基及びフェニル基なる群より選ばれた基が置換した4級アンモニウム塩等、テトラブチルホスホニウムクロリド等の炭素数1～18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したホスホニウム塩等、1-ドデカニルピリジニウムクロリド等の炭素数1～18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したピリジニウム塩等を例示できる。

【0776】

相間移動触媒は、化合物(Fd-1)に対して、通常0.1モル～等モル量、好ましくは0.1～0.5倍モル量使用するのがよい。

10

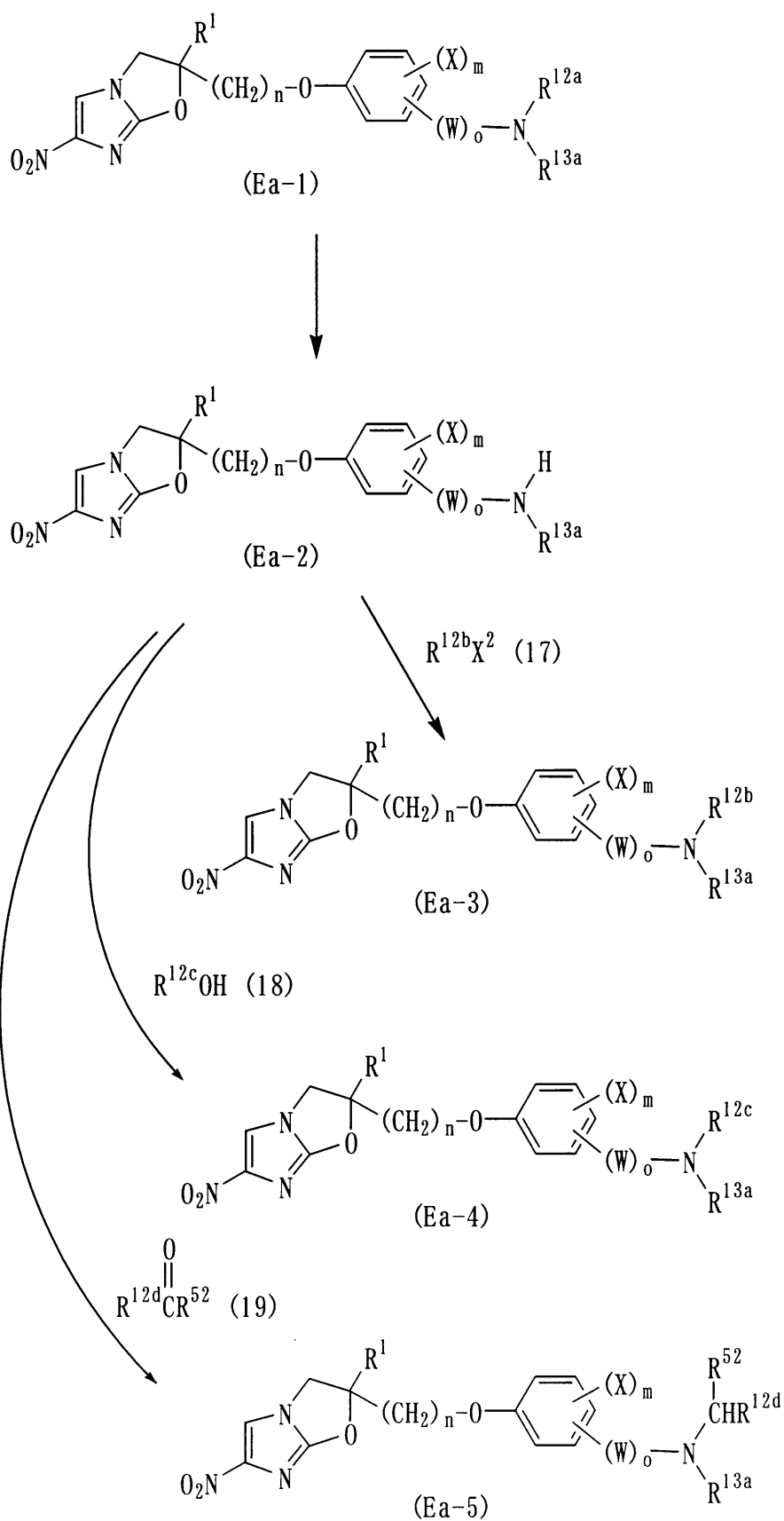
【0777】

化合物(Fd-1)と化合物(16)との反応は、前記反応工程式-16における化合物(E-2)と化合物(13)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0778】

【化 5 8】

反応工程－ 1 9



【 0 7 7 9】

[式中、 R^1 、 n 、 W 、 X 、 m 、 o 、 R^{52} 及び X^2 は前記に同じ。
 R^{12a} はC 1～6アルコキシカルボニル基を示す。

10

20

30

40

50

1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）又はベンゾイルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）を示す。

一般式（E a-5）における基-（W）₀-N（R^{13a}）CHR⁵²R^{12d}を構成するCHR⁵²R^{12d}の部分の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物（E a-1）を化合物（E a-2）に導く反応は、前記反応工程式-16における化合物（E-1）を化合物（E-2）に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

10

【0780】

化合物（E a-2）と化合物（17）との反応は、前記反応工程式-18における化合物（E d-1）と化合物（15）との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0781】

化合物（E a-2）とカルボン酸（18）との反応は、通常のアミド結合生成反応である。該アミド結合生成反応には、公知のアミド結合生成反応の条件を容易に運用することができる。例えば、（イ）混合酸無水物法、即ちカルボン酸（18）にアルキルハロカルボン酸を反応させて混合酸無水物とし、これにアミン（E a-2）を反応させる方法、（ロ）活性エステル法、即ちカルボン酸（18）をフェニル、p-ニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステル、又はベンズオキサゾリン-2-チオンとの活性アミドとし、これにアミン（E a-2）を反応させる方法、（ハ）カルボジイミド法、即ちカルボン酸（18）にアミン（E a-2）をジシクロヘキシルカルボジイミド、1-（3-ジメチルアミノプロピル）-3-エチルカルボジイミド（WSC）、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存在下に縮合反応させる方法、（ニ）その他の方法、例えばカルボン酸（18）を無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン（E a-2）を反応させる方法、カルボン酸（18）と低級アルコールとのエステルにアミン（E a-2）を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸（18）の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン（E a-2）を反応させる方法等を挙げることができる。

20

【0782】

上記混合無水物法（イ）において用いられる混合酸無水物は、通常のリッテンバウマン反応により得られ、これを通常単離することなくアミン（E a-2）と反応させることにより一般式（E a-4）の本発明化合物が製造される。

30

【0783】

上記リッテンバウマン反応は、塩基性化合物の存在下に行われる。用いられる塩基性化合物としては、リッテンバウマン反応に慣用の化合物、例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン-5（DBN）、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン-7（DBU）、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン（DABCO）等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。

40

【0784】

該反応は、通常-20～100℃程度、好ましくは0～50℃程度にて行われ、反応時間は5分～10時間程度、好ましくは5分～2時間程度である。

【0785】

得られた混合酸無水物とアミン（E a-2）との反応は、通常-20～150℃程度、好ましくは10～50℃程度にて行われ、反応時間は5分～10時間程度、好ましくは5

50

分～5時間程度である。

【0786】

混合酸無水物法は、一般に溶媒中で行われる。用いられる溶媒としては混合酸無水物法に慣用されている溶媒がいずれも使用可能であり、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、N，N－ジメチルアセタミド、N，N－ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

10

【0787】

混合酸無水物法において使用されるアルキルハロカルボン酸としては、例えば、クロロ蟻酸メチル、ブromo蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、ブromo蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。該法におけるカルボン酸（18）、アルキルハロカルボン酸及びアミン（Ea-2）の使用割合は、通常等モルずつとするのがよいが、アミン（Ea-2）に対して、アルキルハロカルボン酸及びカルボン酸（18）をそれぞれ等モル～1.5倍モル量程度の範囲内で使用するのが好ましい。

【0788】

また前記活性化剤の存在下に縮合反応させる方法（ハ）においては、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に行われる。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、下記に示す方法（ニ）のカルボン酸ハライドにアミン（Ea-2）を反応させる方法で使用される溶媒をいずれも使用することができる。

20

【0789】

活性化剤の使用量は、化合物（Ea-2）に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量程度とするのがよい。活性化剤としてWSCを使用する場合は、反応系内に1-ヒドロキシベンゾトリアゾールを添加すると反応は有利に進行する。該反応は、通常-20～180℃程度、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～90時間程度で反応は完結する。

【0790】

また前記方法（ニ）の中で、カルボン酸ハライドにアミン（Ea-2）を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中で行われる。用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば、上記ショットテン-バウマン反応に用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。溶媒としては、例えば、上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水等を挙げることができる。

30

【0791】

アミン（Ea-2）とカルボン酸ハライドとの使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択すればよいが、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～5倍モル量程度用いるのがよい。

40

【0792】

該反応は通常-20～180℃程度、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～50時間程度で反応は完結する。

【0793】

更に上記アミド結合生成反応は、カルボン酸（18）とアミン（Ea-2）とを、縮合剤、例えば、ジフェニルホスフィニッククロリド、フェニル-N-フェビルホスホラミドクロリデート、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス（2-オキソ-3-オキサゾリジニル）ホスフィニッククロリド等の燐化合物の存在下に反応させる方法によっても行われる。

50

【0794】

該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン（E a - 2）を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物の存在下に、通常 $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ 程度、好ましくは $0 \sim 100^{\circ}\text{C}$ 程度付近にて行われ、一般に5分 $\sim$ 30時間程度にて反応は終了する。縮合剤及びカルボン酸（18）は、アミン（E a - 2）に対して、それぞれ少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル $\sim$ 2倍モル量程度使用するのがよい。

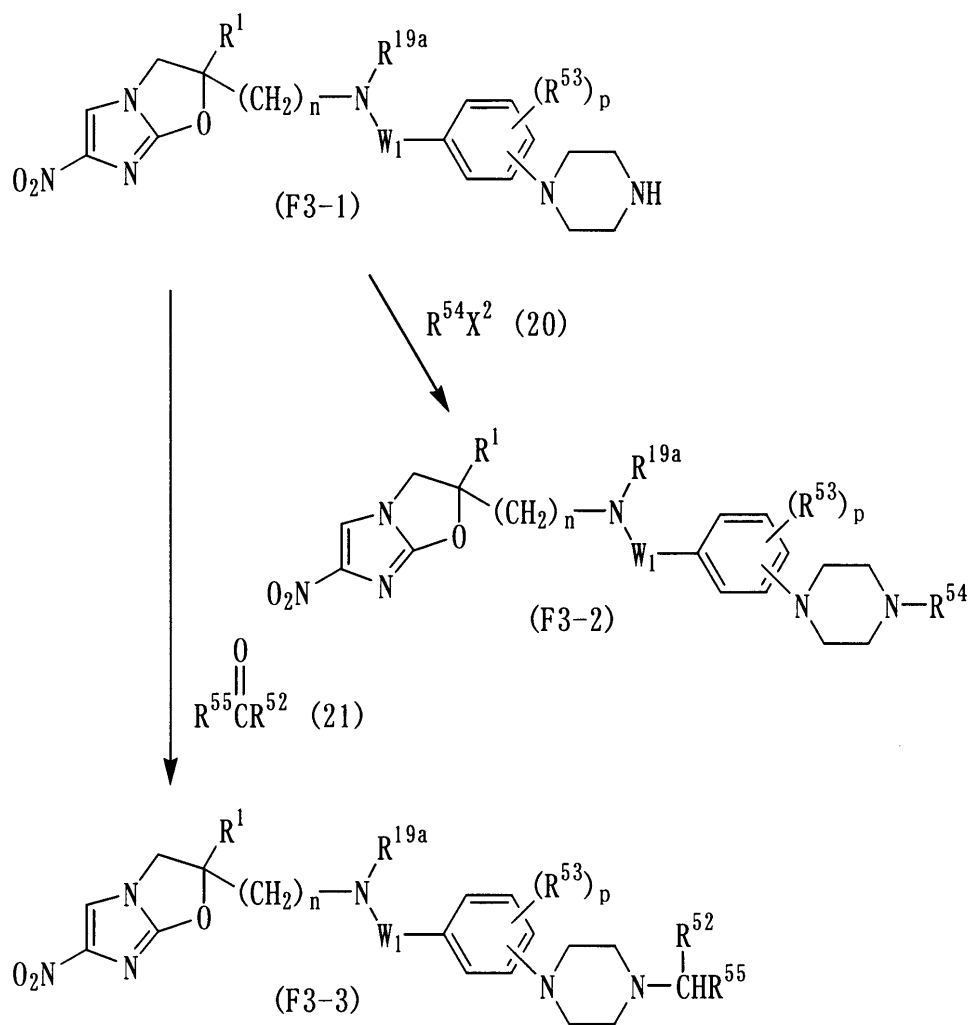
【0795】

化合物（E a - 2）と化合物（19）との反応は、前記反応工程式-16における化合物（E - 2）と化合物（13）との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0796】

【化59】

反応工程式-20



【0797】

[式中、 R^1 、 n 、 R^{52} 、 p 及び X^2 は前記に同じ。

R^{19a} は、前記 F1)~F11)で示される基と同一の基を示す。

R^{53} は、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1 $\sim$ 6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1 $\sim$ 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 $\sim$ 6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1 $\sim$ 6アルコキシ基、置換基としてC1 $\sim$ 6アルキル基及びフェニルC1 $\sim$ 6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1 $\sim$ 6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1 $\sim$ 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても

よい) からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、ピペラジニル基 (ピペラジン環上には、フェニル C 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 又はピペリジニル基 (ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。) を示す。

R⁵⁴は、フェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) を示す。

R⁵⁵は、フェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) 又はフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) を示す。

一般式 (F 3-3) における基-CH R⁵² R⁵⁵の総炭素数は 6 を超えないものとする。]

化合物 (F 3-1) と化合物 (20) との反応は、前記反応工程式-18 における化合物 (F d-1) と化合物 (15) との反応と同様の反応条件下に行われる。

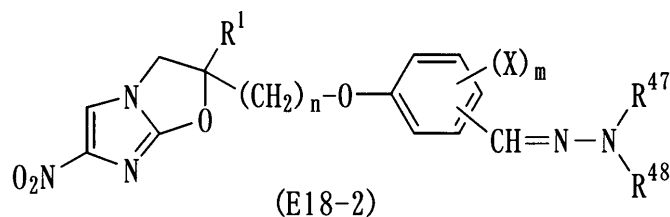
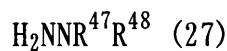
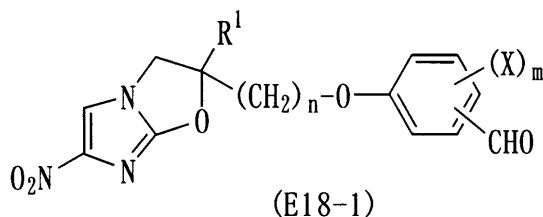
【0798】

化合物 (F 3-1) と化合物 (21) との反応は、前記反応工程式-16 における化合物 (E-2) と化合物 (13) との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0799】

【化60】

反応工程式-21



【0800】

[式中、R¹、n、X、m、R⁴⁷及びR⁴⁸は前記に同じ。]

化合物 (E 18-1) と化合物 (27) との反応は、適当な不活性溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に行われる。

【0801】

使用される塩基性化合物としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基性化合物、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、ピペリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン-5 (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン (DABCO) 等の有機塩基を例示できる。

【0802】

使用される不活性溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであればいずれでもよいが、例えば、水、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N, N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0803】

化合物(27)は、化合物(E18-1)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量程度使用するのがよい。

【0804】

反応温度は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃程度とするのがよく、一般に5分～30時間程度で反応は終了する。

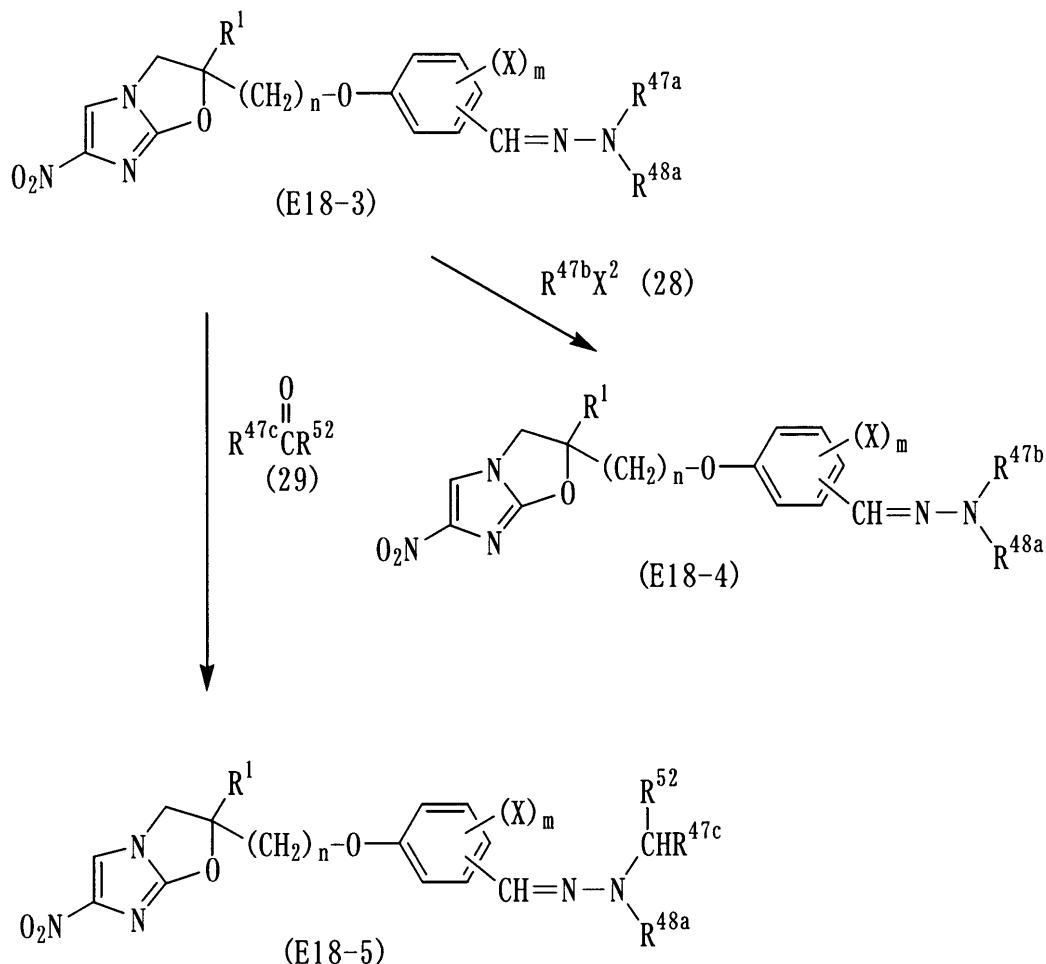
【0805】

10

20

【化 6 1】

反応工程式－ 2 2



【 0 8 0 6 】

[式中、 R^1 、 n 、 X 、 m 、 X^2 及び R^{52} は前記に同じ。

R^{47a} は、水素原子を示す。

R^{48a} は、水素原子、C 1～6 アルキル基、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）又はピリジル基（ピリジン環上には、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1種置換していてもよい）を示す。

R^{47b} は、C 1～6 アルキル基；フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）又はピリジル基（ピリジン環上には、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1種置換していてもよい）を示す。

R^{47c} は、水素原子又はC 1～6 アルキル基を示す。

一般式（E a 1 8－5）における基－CH=N－N（ R^{48a} ）CH R^{47c} R ^{52} を構成するCH R^{47c} R ^{52} の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物（E 1 8－3）と化合物（2 8）との反応は、前記反応工程式－ 1 8における化合物（F d－1）と化合物（1 5）との反応と同様の反応条件下に行われる。

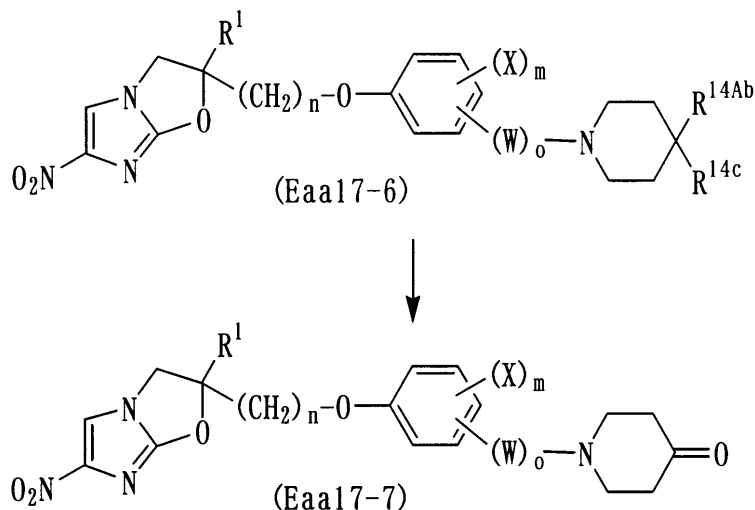
【 0 8 0 7 】

化合物（E 1 8－3）と化合物（2 9）との反応は、前記反応工程式－ 1 6における化合物（E－2）と化合物（1 3）との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0808】

【化62】

反応工程式-23



10

【0809】

[式中、 R^1 、 n 、 X 、 m 、 W 及び o は前記に同じ。 R^{14Ab} 及び R^{14c} は、それぞれC1～6アルコキシ基を示す。]

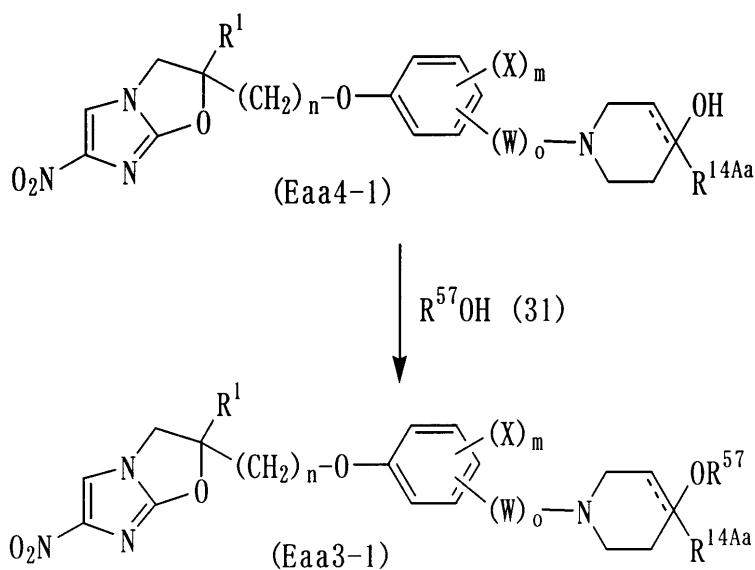
20

化合物(Eaa17-6)を化合物(Eaa17-7)に導く反応は、前記反応工程式-16における化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0810】

【化63】

反応工程式-24



30

40

【0811】

[式中、 R^1 、 n 、 X 、 m 、 W 、 o 、 R^{14Aa} 及びピペリジン環上の点線は前記に同じ。ピペリジン環上の点線が二重結合を示すときは、水酸基が置換しているものとする。

R^{57} は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基、C1～4アルキレン

50

ジオキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、シアノ基、C 2～6 アルケニル基、ニトロ基、フェニル基、置換基としてフェニル基、C 1～6 アルキル基、カルバモイル基及び C 1～6 アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基、C 1～6 アルカノイル置換 C 1～6 アルキル基、水酸基、C 1～6 アルコキシカルボニル置換 C 1～6 アルキル基、フェニル C 1～6 アルキル基、C 1～6 アルカノイル基、C 1～6 アルキルチオ基、1, 2, 4-トリアゾリル基、イソオキサゾリル基、イミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、2H-ベンゾトロアゾリル基、ピロリル基、ベンゾオキサゾリル基、ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ピペリジニル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びカルバモイル基なる群から選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。]

10

化合物 (E a a 4-1) と化合物 (31) との反応は、適当な溶媒中、縮合剤の存在下に行われる。

20

【0812】

ここで使用される溶媒としては、前記反応工程式-19の化合物 (E a-2) と化合物 (18) との反応において、方法 (二) のカルボン酸ハライドにアミン (E a-2) を反応させる際に使用される溶媒をいずれも使用することができる。

【0813】

縮合剤としては、例えば、アゾカルボキシレート類及び燐化合物の混合物等を挙げることができる。アゾカルボキシレート類としては、ジエチルアゾジカルボキシレート、tert-ブチルアゾジカルボキシレート等を例示でき、燐化合物としては、トリフェニルホスフィン等を例示できる。トリフェニルホスフィンは、適当なポリマーに担持されたものであってもよい。このようなトリフェニルホスフィンは、例えば、トリフェニルホスフィン-ポリマー-サポーターイッド (triphenylphosphine polymer supported) 等の商品名で市販されている。

30

【0814】

縮合剤は、化合物 (E a a 4-1) に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～3倍モル量程度使用するのがよい。

【0815】

化合物 (31) は、化合物 (E a a 4-1) に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～2倍モル量程度使用するのがよい。

【0816】

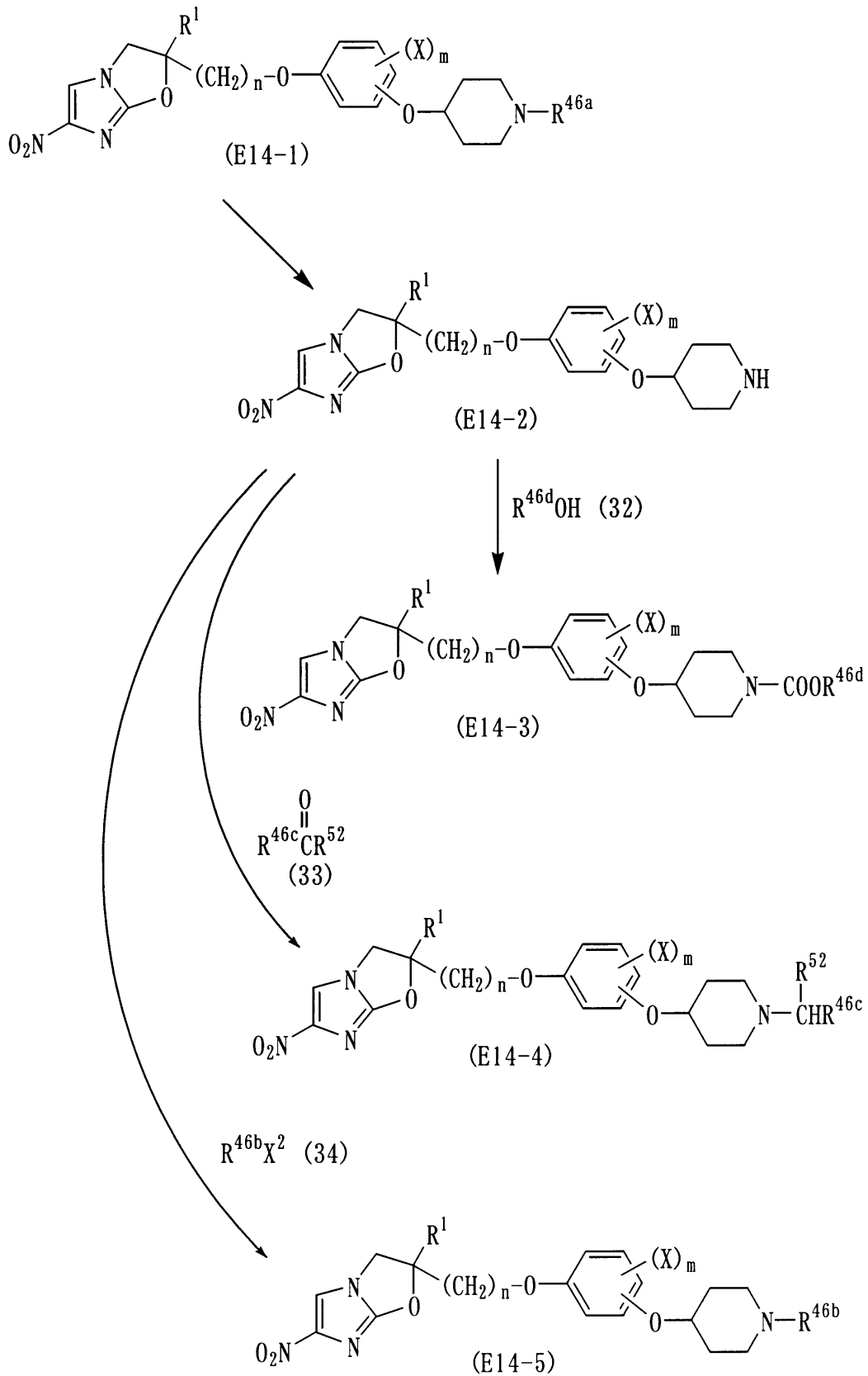
この反応は、通常 0～200℃、好ましくは 0～150℃程度にて好適に進行し、一般に 1～10時間程度で終了する。

40

【0817】

【化 6 4】

反応工程式－25



【0818】

[式中、R¹、n、X、m、X²及びR⁵²は前記に同じ。

R^{46a}は、C 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

R^{46b}は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC

10

20

30

40

50

1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC 1～6アルコシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はC 1～6アルコシカルボニル基を示す。

R^{46c}は、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はフェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)を示す。)

R^{46d}は、フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)又はC 1～6アルキル基を示す。]

化合物(E 1 4-1)を化合物(E 1 4-2)に導く反応は、前記反応工程式-1 6における化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0 8 1 9】

化合物(E 1 4-2)と化合物(3 2)との反応は、適当な溶媒中、縮合剤の存在下に行われる。

【0 8 2 0】

溶媒としては、前記反応工程式-1 9の化合物(E a-2)と化合物(1 8)との反応において、方法(二)のカルボン酸ハライドにアミン(E a-2)を反応させる際に使用した溶媒をいずれも使用することができる。

【0 8 2 1】

縮合剤としては、例えば、N, N'-カルボニルジイミダゾール等を挙げるができる。

【0 8 2 2】

化合物(3 2)及び縮合剤は、化合物(E 1 4-2) 1モルに対してそれぞれ少なくとも等モル、好ましくは1～2モル程度使用するのがよい。該反応は、通常0～1 5 0℃、好ましくは0～1 0 0℃付近にて行われ、一般に1～3 0時間程度で終了する。

【0 8 2 3】

化合物(E 1 4-2)と化合物(3 3)との反応は、前記反応工程式-1 6における化合物(E-2)と化合物(1 3)との反応と同様の反応条件下に行われる。

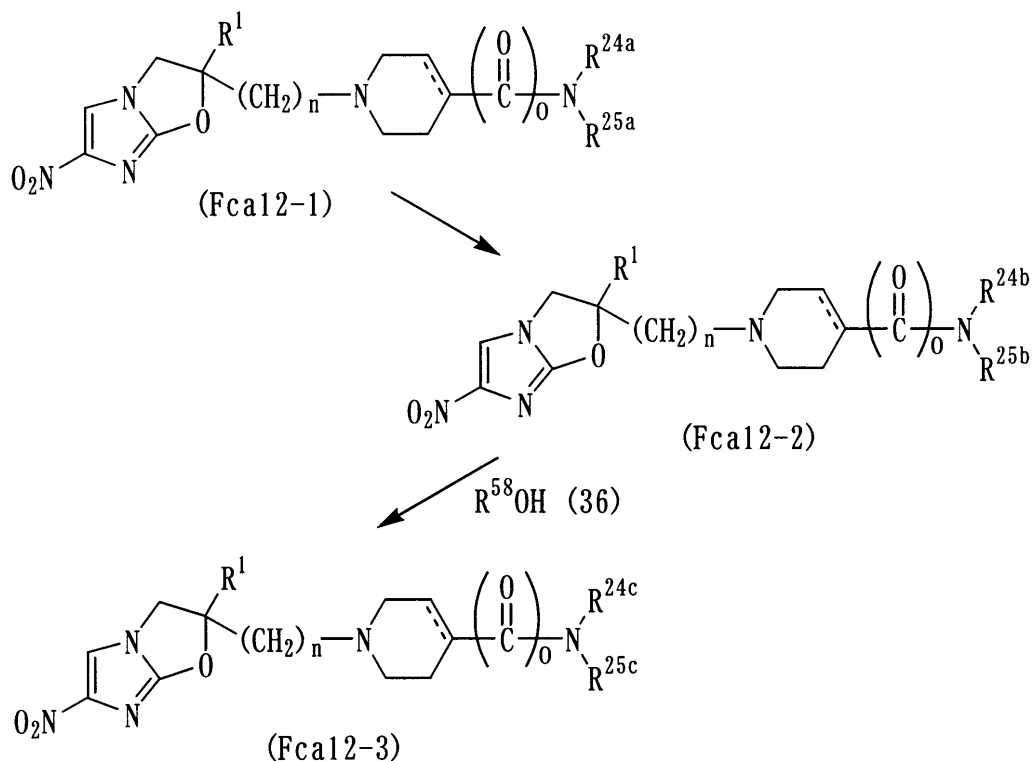
【0 8 2 4】

化合物(E 1 4-2)と化合物(3 4)との反応は、前記反応工程式-1 8における化合物(F d-1)と化合物(1 5)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0 8 2 5】

【化 6 5】

反応工程式-26



【0826】

[式中、 R^1 、 n 及び o は前記に同じ。

R^{24a} 及び R^{25a} は、これらが隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該ピペラジン環上には、C1～6アルコキシカルボニル基；ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC2～6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。但し、ピペラジン環の窒素原子上には、C1～6アルコキシカルボニル基が置換しているものとする。

R^{58} は、フェニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）を示す。

R^{24b} 及び R^{25b} は、隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該ピペラジン環

10

20

30

40

50

上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基；ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。但し、ピペラジン環の窒素原子上には、水素原子が結合しているものとする。

R^{24c}及びR^{25c}は、隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該ピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基；ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。但し、ピペラジン環の窒素原子上には、フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）を有するものとする。

化合物（F c a 1 2－1）を化合物（F c a 1 2－2）に導く反応は、前記反応工程式－1 6における化合物（E－1）を化合物（E－2）に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

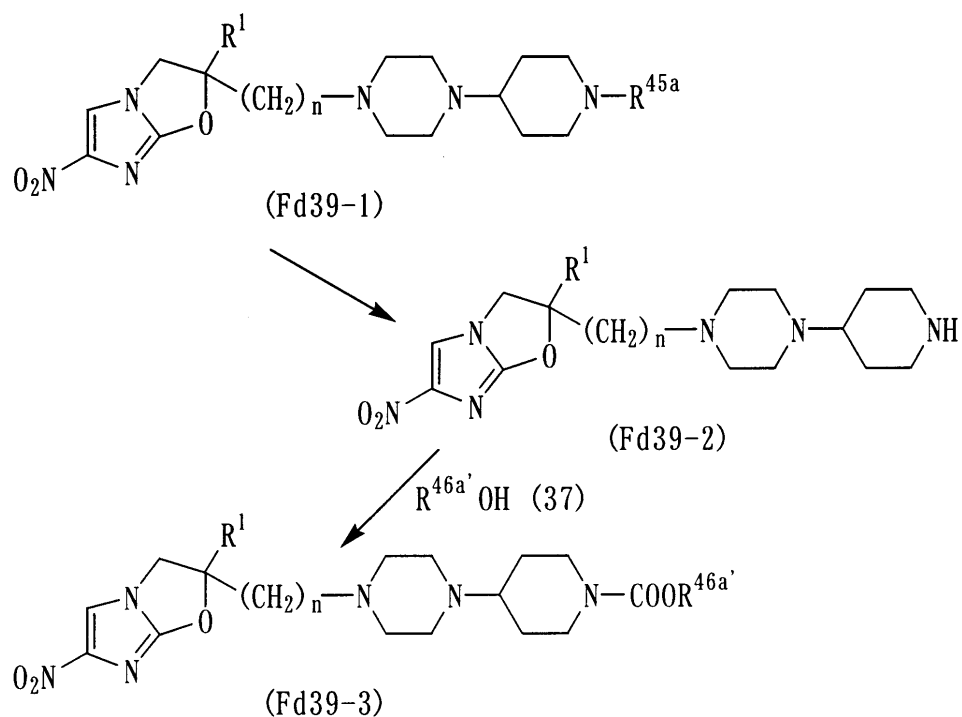
【0 8 2 7】

化合物（F c a 1 2－2）と化合物（3 6）との反応は、前記反応工程式－2 5における化合物（E 1 4－2）と化合物（3 2）との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0 8 2 8】

【化 6 6】

反応工程式－ 2 7



10

20

【 0 8 2 9】

[式中、 R^1 及び n は前記に同じ。 R^{45a} は、C 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。 $R^{46a'}$ は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。]

化合物（F d－3 9－1）を化合物（F d－3 9－2）に導く反応は、前記反応工程式－1 6における化合物（E－1）を化合物（E－2）に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

30

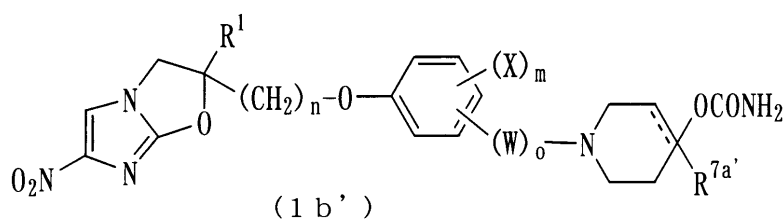
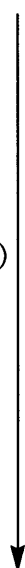
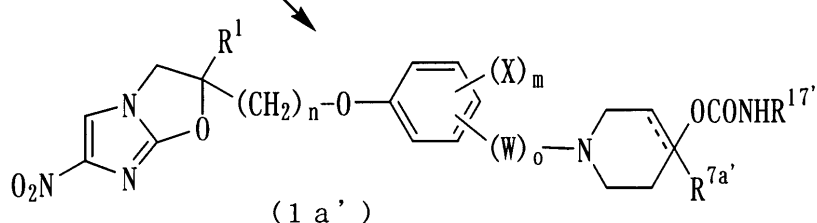
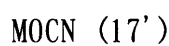
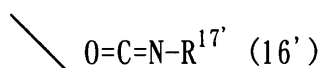
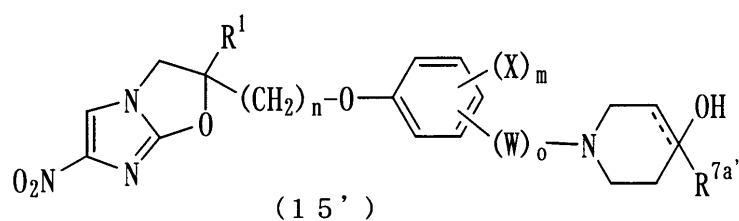
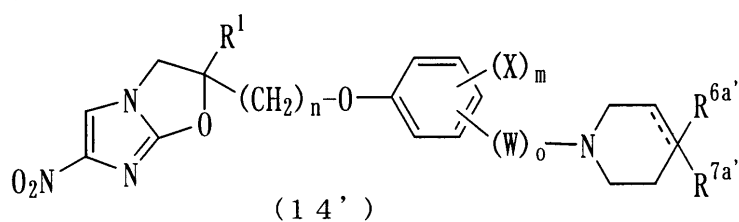
【 0 8 3 0】

化合物（F d－3 9－2）と化合物（3 7）との反応は、前記反応工程式－2 5における化合物（E 1 4－2）と化合物（3 2）との反応と同様の反応条件下に行われる。

【 0 8 3 1】

【化 6 7】

反応工程式－28



【0832】

[式中、 R^1 、 X 、 n 、 m 、 W 及び o は前記に同じ。 $R^{7a'}$ は、水素原子、水酸基、C1～6アルコキシ基又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい）を示す。ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは、ピペリジン環上に水酸基が置換するものとする。 $R^{6a'}$ はテトラヒドロピラニルオキシ基を示す。 $R^{17'}$ は、C1～6アルキル基又はフェニル基（該フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未

10

20

30

40

50

置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。Mはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。]

化合物(14')を化合物(15')に導く反応は、適当な溶媒中又は無溶媒下、酸の存在下で行われる。

【0833】

溶媒としては、反応に影響を与えないものをいずれも使用でき、例えば水、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、蟻酸、酢酸等の脂肪酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。

10

【0834】

酸としては、例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸及び蟻酸、トリフルオロ酢酸、酢酸、ピリジニウムp-トルエンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等の芳香族スルホン酸等の有機酸を挙げることができる。酸の使用量は、特に限定されず広い範囲から適宜選択できるが、通常化合物(14')1モルに対して0.1～10モル程度、好ましくは0.1～2モル程度とするのがよい。

【0835】

該反応は、通常0～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、通常0.5～50時間程度にて反応は終了する。

20

【0836】

化合物(15')と化合物(16')又は(17')の反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に適当な不活性溶媒又は無溶媒下で行われる。

【0837】

ここで用いられる塩基性化合物としては、例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基が挙げられる。

30

【0838】

用いられる溶媒としては、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水、N,N-ジメチルアセタミド、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

40

【0839】

化合物(16')又は(17')の使用量としては、各々、化合物(15')に対して通常等モル～5倍モル量程度、好ましくは等モル～3倍モル量程度とするのがよい。

【0840】

該反応は通常0～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度付近の温度で、通常5分～30時間程度を要して行われる。

【0841】

50

該反応の反応系内には、三弗化硼素ジエチルエーテル錯体等の硼素化合物、塩化第一銅等のハロゲン化銅化合物等を添加してもよい。

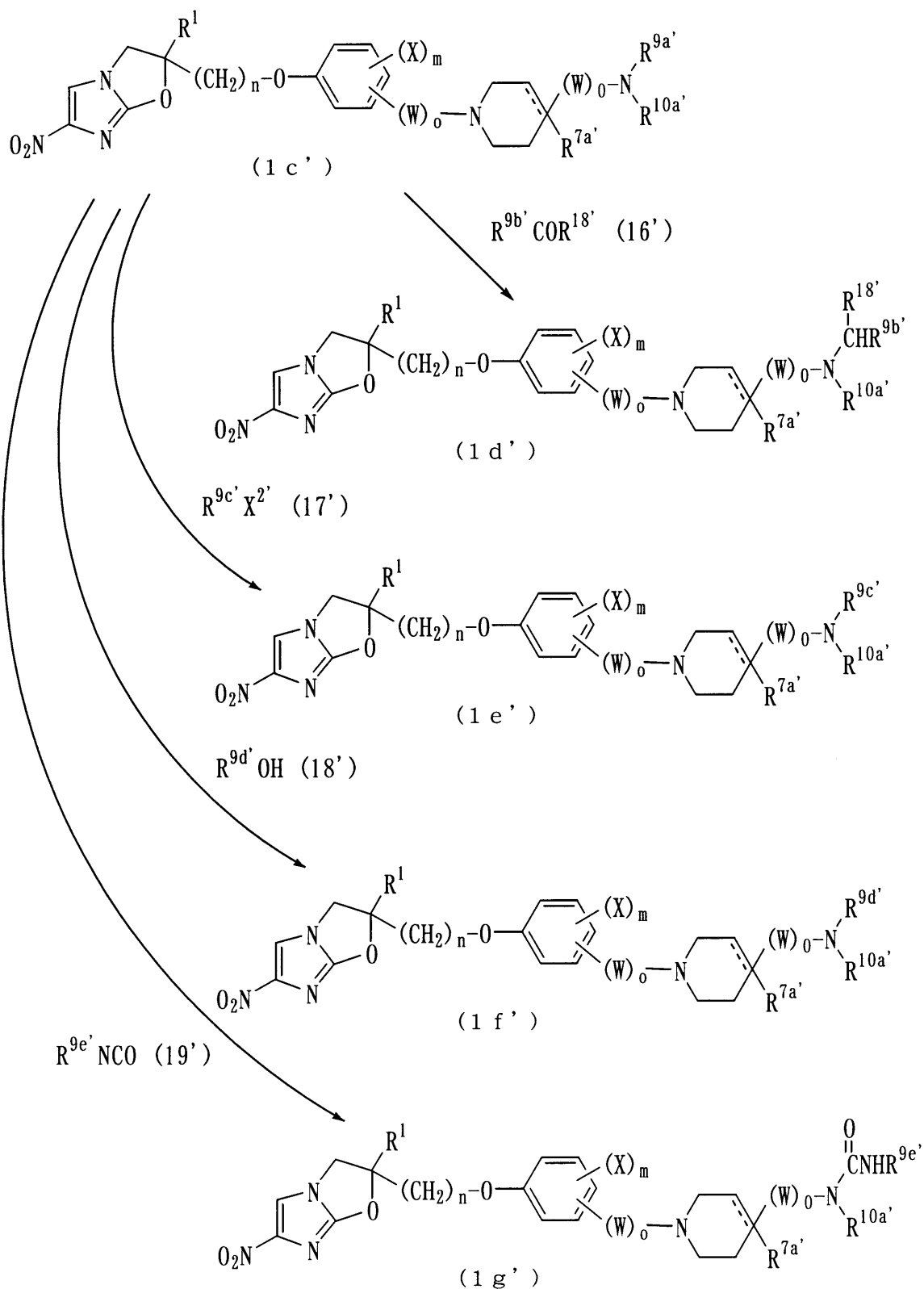
【0842】

化合物（15'）と化合物（17'）の反応では、反応系内にトリフルオロ酢酸等の有機酸を添加すると、反応は有利に進行する。

【0843】

【化 6 8】

反応工程式－29



【0844】

〔式中、 R^1 、 X 、 n 、 m 、 W 、 $\text{R}^{7a'}$ 、 $\text{X}^{2'}$ 及び o は前記に同じ。一般式(1c)～(1g)における二つの W は同一であっても異なってもよい。

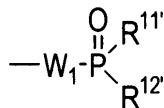
$\text{R}^{9a'}$ は、水素原子を示す。

【0845】

R^{10a'}は、水素原子；置換基として水酸基を有することのあるC 1～6アルキル基；C 1～6アルカノイル基；C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基、置換基としてC 1～6アルカノイル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が少なくとも1個置換していてもよい）、C 1～6アルキルスルホニル基、C 3～8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C 1～6アルキルチオ基；フェニルスルホニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、水酸基置換C 1～6アルキル基及び基

【0846】

【化69】



【0847】

(W₁はC 1～6アルキレン基を示す。R^{11'}及びR^{12'}は、同一又は異なって、C 1～6アルコキシ基を示す。)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、置換基としてC 1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、基—N(R^{11A'})R^{12A'}(R^{11A'}及びR^{12A'}は、同一又は異なって水素原子、C 1～6アルキル基又はフェニル基を示す。R^{11A'}及びR^{12A'}は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい)、フェノキシ基、フェニルC 1～6アルコキシ基、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基置換C 1～6アルコキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～10アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；ベンゾフリルC 1～6アルキル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニルスルホニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基及びC 1～4アルキレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェニルC 2～6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；C 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基；C 2～6アルケニル基；C 1～6アルコキシ置換C 2～6アルカノイル基；C 3～8シクロアルキル置換C 1～6アルキル基；フェノキシC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置

換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ピリジル基 ; ピリジルC 1～6アルキル基 ; イミダゾリルC 1～6アルキル基 ; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; キノリル基 ; インドリル基 ; 置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基 ; インダゾリル基 ; ナフチル基 ; C 3～8シクロアルキル基 ; 置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1～6アルキル基 ; シアノ置換C 1～6アルキル基 ; フリル置換C 1～6アルキル基又はピペラジニル置換C 1～6アルキル基 (ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい) を示す。

【0848】

R^{9b'}は、水素原子 ; 置換基として水酸基を有することのあるC 1～6アルキル基 ; フェニル基 (フェニル環上には、置換基としてC 1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、置換基としてC 1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、基-N (R^{11A'}) R^{12A'} (R^{11A'}及びR^{12A'}は、同一又は異なって水素原子、C 1～6アルキル基又はフェニル基を示す。R^{11A'}及びR^{12A'}は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい) 、フェノキシ基、フェニルC 1～6アルコキシ基、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基置換C 1～6アルコキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～10アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ベンゾフリル [ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; ベンゾフリルC 1～6アルキル基 [ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; C 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基 ; C 3～8シクロアルキル置換C 1～6アルキル基 ; C 3～8シクロアルキル基 ; フェノキシC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ピリジル基 ; ピリジルC 1～6アルキル基 ; イミダゾリル基 ; イミダゾリルC 1～6アルキル基 ; 置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1～6アルキル基 ; シアノ置換C 1～6アルキル基 ; フリル置換C 1～6アルキル基 ; フリル基 ; ピペラジニル基 (ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい) 又はピペラジニル置換C 1～6アルキル基 (ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換して

10

20

30

40

50

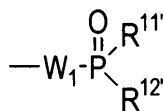
いてもよい)を示す。

【0849】

R^{9c'}は、置換基として水酸基を有することのあるC 1～6アルキル基；C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニル基（該フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基、置換基としてC 1～6アルカノイル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基が少なくとも1個置換していてもよい）、C 1～6アルキルスルホニル基、C 3～8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C 1～6アルキルチオ基；フェニルスルホニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、水酸基置換C 1～6アルキル基及び基

【0850】

【化70】



【0851】

(W₁はC 1～6アルキレン基を示す。R^{11'}及びR^{12'}は、同一又は異なって、C 1～6アルコキシ基を示す。)なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、置換基としてC 1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、基—N(R^{11A'})R^{12A'}(R^{11A'}及びR^{12A'}は、同一又は異なって水素原子、C 1～6アルキル基又はフェニル基を示す。R^{11A'}及びR^{12A'}は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい)、フェノキシ基、フェニルC 1～6アルコキシ基、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基置換C 1～6アルコキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～10アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；ベンゾフリルC 1～6アルキル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；フェニルスルホニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基及びC 1～4アルキレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 2～6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；C 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基；C 2～6アルケニル基；C 3～8シクロアルキル基置換C 1～6アルキル基；フェノキシC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；ピリジル基；ピリジルC 1～6アルキル基；イミダゾリルC 1～6アルキル基；1, 2, 3, 4-テト

ラヒドロキノリル基（１，２，３，４－テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基及びＣ１～６アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい）；キノリル基；インドリル基；インダゾリル基；ナフチル基；Ｃ３～８シクロアルキル基；置換基としてＣ１～６アルキル基を有することのあるアミノ置換Ｃ１～６アルキル基；シアノ置換Ｃ１～６アルキル基；フリル置換Ｃ１～６アルキル基又はピペラジニル置換Ｃ１～６アルキル基（ピペラジン環上には、置換基として少なくとも１個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい〕が置換していてもよい）を示す。

【０８５２】

10

$R^{9d'}$ は、Ｃ１～６アルカノイル基；フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい）；Ｃ１～６アルコキシ置換Ｃ２～６アルカノイル基又はベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい）を示す。

【０８５３】

$R^{9e'}$ は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のＣ１～６アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも１種が置換していてもよい）を示す。

20

【０８５４】

$R^{18'}$ は、水素原子又はＣ１～６のアルキル基を示す。

【０８５５】

ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは、基－（Ｗ） $\circ$ NR^{9a'}R^{10a'}、基－（Ｗ） $\circ$ N（CHR^{18'}R^{9b'}）R^{10a'}、基－（Ｗ） $\circ$ NR^{9c'}R^{10a'}、基－（Ｗ） $\circ$ NR^{9d'}R^{10a'}又は基－（Ｗ） $\circ$ N（CONHR^{9e'}）R^{10a'}が置換するものとする。

【０８５６】

一般式（１ｄ'）における基－N（R^{10a'}）CHR^{18'}R^{9b'}を構成するCHR^{18'}R^{9b'}の総炭素数は６を超えないものとする。]

30

化合物（１ｃ'）と化合物（１６'）との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行われる。

【０８５７】

化合物（１６'）の使用量は、化合物（１ｃ'）に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量とするのがよい。

【０８５８】

該反応において使用される溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、アセトニトリル、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の脂肪酸、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を例示できる。

40

【０８５９】

還元剤としては、例えば、蟻酸、蟻酸ナトリウム等の蟻酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化トリアセチルオキシ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤又はこれらの水素化還元剤の混合物、パラジウム－黒、パラジウム－炭素、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル等の接触水素還元剤等を例示できる。

【０８６０】

50

還元剤として蟻酸及び蟻酸アルカリ金属塩を使用する場合、反応温度は通常室温～20℃程度、好ましくは50～150℃程度付近が適当であり、反応は10分～10時間程度にて終了する。蟻酸の使用量は化合物(1c')に対して大過剰量使用するのがよい。

【0861】

また水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常-80～100℃程度、好ましくは-80～70℃程度が適当であり、30分～100時間程度で反応は終了する。水素化還元剤の使用量は、化合物(1c')に対して通常等モル～20倍モル量程度、好ましくは等モル～6倍モル程度とするのがよい。特に水素化還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。該反応の反応系内には、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等のアミン類、モレキュラーシーヴス 3A (MS-3A)、モレキュラーシーヴス 4A (MS-4A)等のモレキュラーシーヴス等を添加してもよい。

【0862】

更に接触水素還元剤を用いる場合は、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又は蟻酸、蟻酸アンモニウム、シクロヘキセン、放水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30～100℃程度、好ましくは0～60℃程度の温度で反応を行なうのがよく、通常1～12時間程度で反応は終了する。接触水素還元剤の使用量としては、化合物(1c')に対して通常0.1～40重量%、好ましくは1～20重量%程度とするのがよい。

【0863】

化合物(1c')と化合物(17')との反応は、一般に適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下にて行われる。

【0864】

用いられる不活性溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0865】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウムn-ブトキシド等の金属アルコラート類、ピリジン、イミダゾール、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジメチルアニリン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5 (DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7 (DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン (DABCO)等の有機塩基又はこれらの混合物を挙げることができる。

【0866】

塩基性化合物は、化合物(1c')に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル～10倍モル量使用するのがよい。

【0867】

化合物(17')は、化合物(1c')に対して少なくとも等モル量、好ましくは、等モル～10倍モル量使用するのがよい。

【0868】

該反応は、通常0～200℃、好ましくは、0～150℃程度にて行われ、一般に5分～80時間程度にて反応は終了する。

【0869】

該反応系内には沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物等を添加してもよいし、相間移動触媒を添加してもよい。

【0870】

ここで相間移動触媒としては、例えば、テトラブチルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、テトラブチルアンモニウムフルオリド、テトラブチルアンモニウムアイオダイド、テトラブチルアンモニウムヒドロキシド、亜硫酸水素テトラブチルアンモニウム、トリブチルメチルアンモニウムクロリド、トリブチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムブロミド、テトラヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクチルアンモニウムクロリド、メチルトリヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクタデカニルアンモニウムクロリド、メチルトリデカニルアンモニウムクロリド、ベンジルトリプロピルアンモニウムクロリド、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、フェニルトリエチルアンモニウムクロリド、テトラエチルアンモニウムクロリド、テトラメチルアンモニウムクロリド等の炭素数1～18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基、フェニル低級アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が置換した4級アンモニウム塩、テトラブチルホスホニウムクロリド等の炭素数1～18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したホスホニウム塩、1-ドデカニルピリジニウムクロリド等の炭素数1～18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したピリジニウム塩等を例示できる。

【0871】

相間移動触媒の使用量は、化合物(1c')に対して、通常0.1倍モル～等モル量、好ましくは、0.1～0.5倍モル量使用するのがよい。

【0872】

化合物(1c')と化合物(18')との反応は、化合物(1c')と化合物(18')のカルボン酸とを通常のアミド結合生成反応にて反応させる方法である。

【0873】

該アミド結合生成反応には、公知のアミド結合生成反応の条件を広く適用することができる。例えば(イ)混合酸無水物法、即ちカルボン酸(18')にアルキルハロカルボン酸を反応させて混合酸無水物とし、これにアミン(1c')を反応させる方法、(ロ)活性エステル法、即ちカルボン酸(18')を、p-ニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステル、又はベンズオキサゾリン-2-チオンとの活性アミドとし、これにアミン(1c')を反応させる方法、(ハ)カルボジイミド法、即ちカルボン酸(18')にアミン(1c')をジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド(WSC)、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存在下に縮合反応させる方法、(ニ)その他の方法、例えばカルボン酸(18')を無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン(1c')を反応させる方法、カルボン酸(18')と低級アルコールとのエステルにアミン(1c')を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸(18')の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(1c')を反応させる方法等を挙げることができる。

【0874】

上記混合無水物法(イ)において用いられる混合酸無水物は、通常のショットテン-バウマン反応により得られ、これを通常単離することなくアミン(1c')と反応させることにより一般式(1f')の本発明化合物が製造される。

【0875】

上記ショットテン-バウマン反応は塩基性化合物の存在下に行われる。

【0876】

用いられる塩基性化合物としては、ショットテン-バウマン反応に慣用の化合物、例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン-5 (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン (DABCO)等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基が挙げられる。

10

【0877】

該反応は、通常-20~100℃程度、好ましくは0~50℃程度において行われ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~2時間程度である。

【0878】

得られた混合酸無水物とアミン(1c')との反応は、通常-20~150℃程度、好ましくは10~50℃程度にて行われ、反応時間は5分~10時間程度、好ましくは5分~5時間程度である。混合酸無水物法は一般に溶媒中で行われる。

【0879】

用いられる溶媒としては混合酸無水物法に慣用されている溶媒がいずれも使用可能であり、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、N, N-ジメチルアセタミド、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

20

【0880】

混合酸無水物法において使用されるアルキルハロカルボン酸としては、例えば、クロロ蟻酸メチル、プロモ蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、プロモ蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。該法におけるカルボン酸(18')とアルキルハロカルボン酸とアミン(1c')の使用割合は通常等モルずつとするのがよいが、アミン(1c')に対してアルキルハロカルボン酸及びカルボン酸(18')はそれぞれ等モル~1.5倍モル量程度の範囲内で使用することができる。

30

【0881】

また前記活性化剤の存在下に縮合反応させる方法(ハ)においては、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に行われる。

【0882】

ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、下記その他の方法(ニ)のカルボン酸ハライドにアミン(1c')を反応させる方法で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。

【0883】

活性化剤の使用量は、化合物(1c')に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~5倍モル量使用するのがよい。活性化剤としてWSCを使用する場合は、反応系内に1-ヒドロキシベンゾトリアゾールを添加すると反応は有利に進行する。

40

【0884】

該反応は、通常-20~180℃程度、好ましくは0~150℃程度にて行われ、一般に5分~90時間程度で反応は完結する。

【0885】

また前記その他の方法(ニ)の内で、カルボン酸ハライドにアミン(1c')を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中で行われる。

【0886】

50

用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば、上記ショッテン-バウマン反応に用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。

【0887】

用いられる溶媒としては、例えば、上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水等を挙げることができる。

【0888】

アミン(1c')とカルボン酸ハライドとの使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択すればよいが、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～5倍モル量程度用いるのがよい。

10

【0889】

該反応は通常-20～180℃程度、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～50時間程度で反応は完結する。

【0890】

更に上記アミド結合生成反応は、カルボン酸(18')とアミン(1c')とを、ジフェニルホスフィニッククロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリデート、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド等の燐化合物の縮合剤の存在下に反応させる方法によっても実施することができる。

20

【0891】

該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン(1c')を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物の存在下に、通常-20～150℃程度、好ましくは0～100℃程度付近にて行われ、一般に5分～30時間程度にて反応は終了する。縮合剤及びカルボン酸(18')は、アミン(1c')に対してそれぞれ少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～2倍モル量程度使用するのがよい。

【0892】

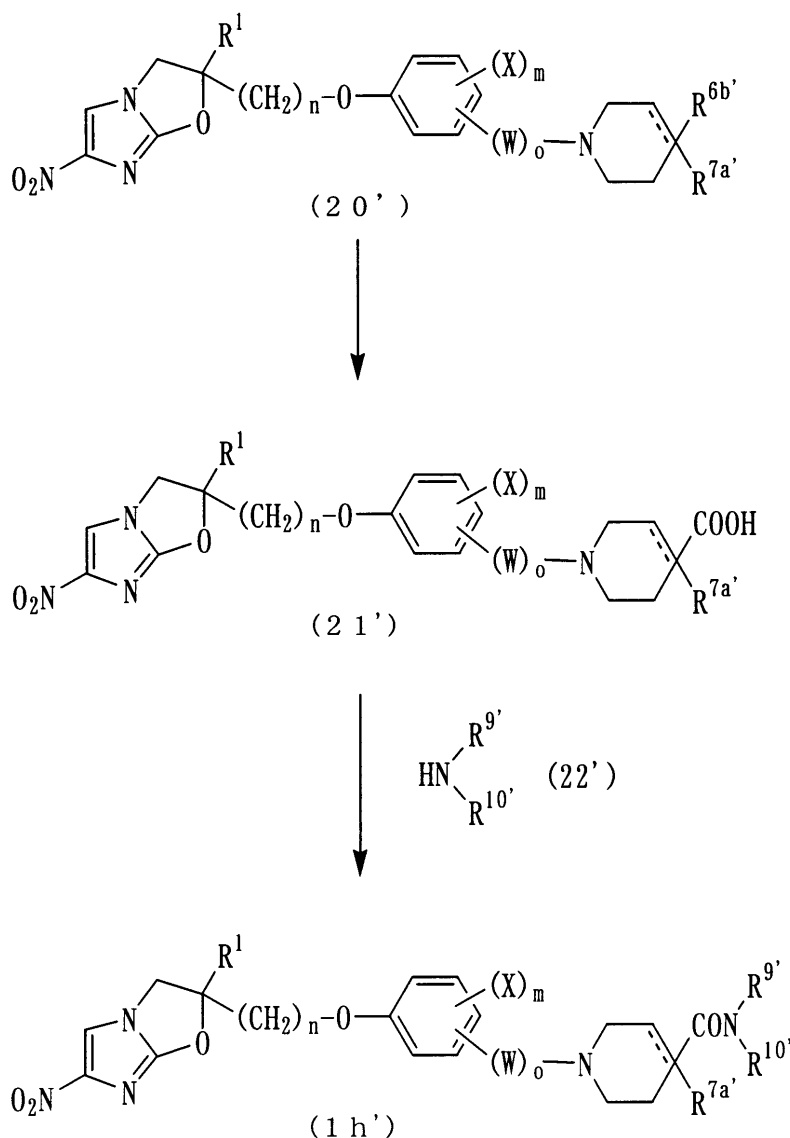
化合物(1c')と化合物(19')との反応は、前記反応工程式-28における化合物(15')と化合物(16')又は(17')との反応と同様の反応条件下に行うことができる。

30

【0893】

【化 7 1】

反応工程式－30



【0894】

[式中、 R^1 、 X 、 n 、 m 、 W 、 $\text{R}^{7a'}$ 、 R^9 、 R^{10} 及び o は前記に同じ。 R^{6b} は、C1～6アルコキシカルボニル基を示す。ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは、基 R^{6b} 、 COOH 基又は基 $-\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ が置換するものとする。]

化合物(21')は、化合物(20')を加水分解することにより製造される。

【0895】

該加水分解反応は、適当な溶媒中又は無溶媒下、酸又は塩基性化合物の存在下に行われる。

【0896】

用いられる溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、tert-ブタノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、酢酸、蟻酸等の脂肪酸類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0897】

10

20

30

40

50

酸としては、例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、P-トルエンスルホン酸等のスルホン酸等の有機酸を挙げることができる。

【0898】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。

【0899】

酸又は塩基性化合物は、化合物(20')に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～10倍モル使用するが、反応溶媒として大過剰に用いてもよい。

【0900】

該反応は、通常0～200℃程度、好ましくは0～150℃程度にて好適に進行し、一般に10分～30時間程度で終了する。

【0901】

上記加水分解処理後、反応を完結させるために適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に通常0～100℃、好ましくは室温～70℃付近にて、1分～30分程度反応させてもよい。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応工程式-29における化合物(1c')と化合物(18')の反応のうち、方法(二)のカルボン酸ハライドにアミン(1c')を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

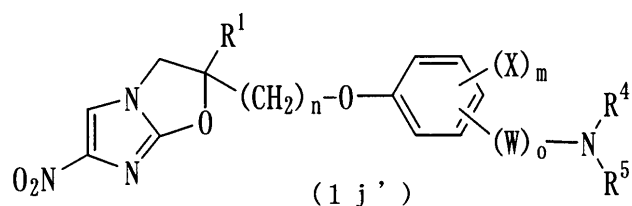
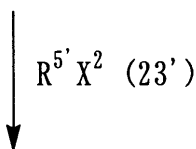
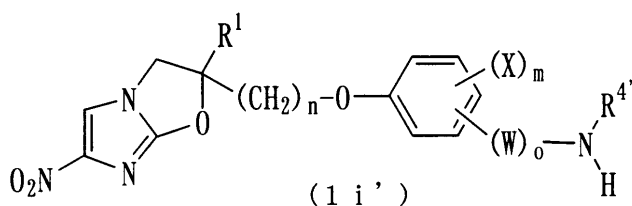
【0902】

化合物(21')と化合物(22')との反応は、前記反応工程式-29における化合物(1c')と化合物(18')との反応と同様の反応条件下に行われる。ただし、使用量は、前記反応工程式-29がアミン(1c')に対してカルボン酸(18')の使用量を換算していたが、該反応では、カルボン酸(18')に対してアミン(22')の使用量を換算する。

【0903】

【化72】

反応工程式-31



【0904】

[式中、R¹、n、X、m、W、o、X²、R^{4'}及びR^{5'}は前記に同じ。]

化合物(1i')と化合物(23')との反応は、前記反応工程式-29における化合

10

20

30

40

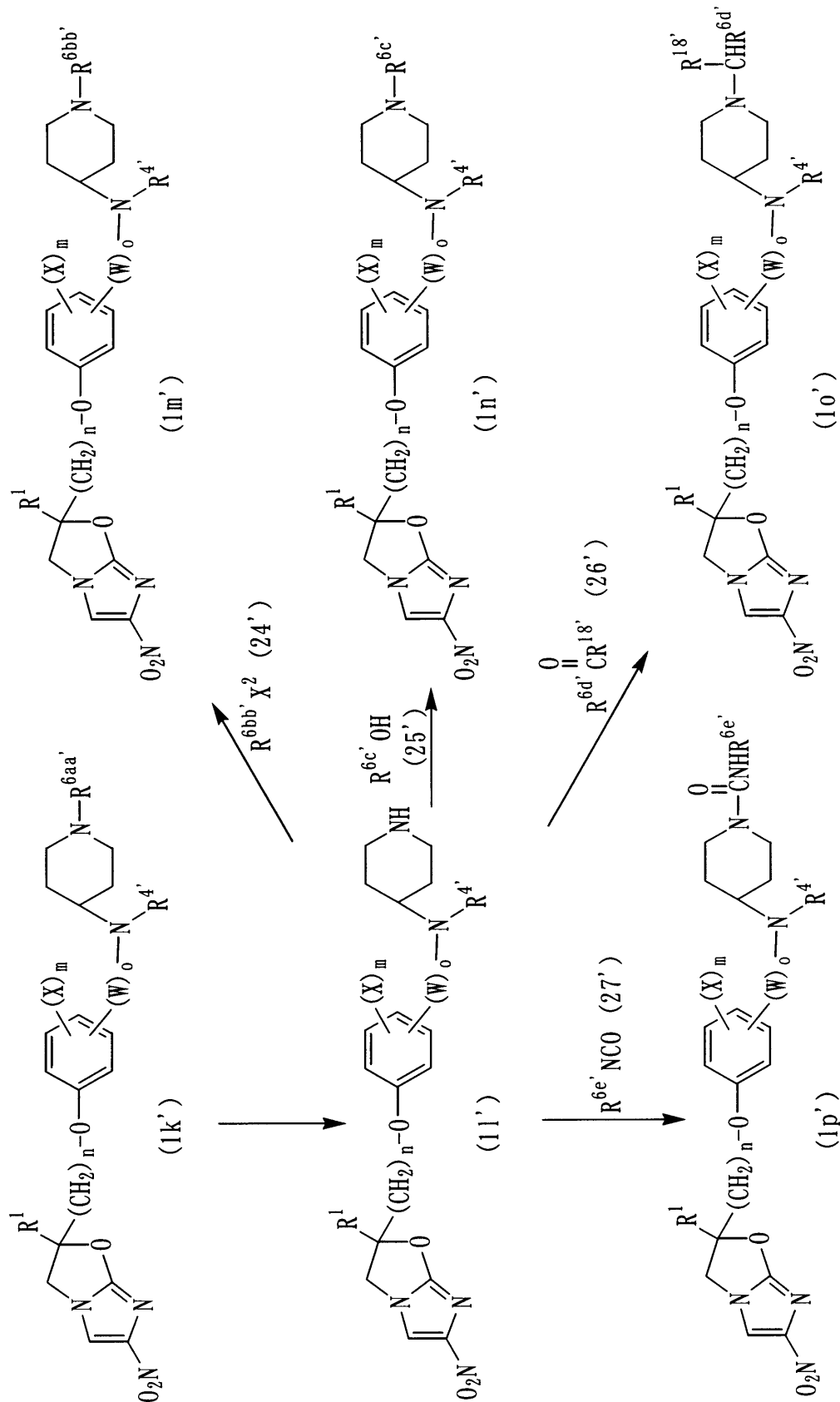
50

物(1c')と化合物(17')との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0905】

【化73】

反応工程-32



【0906】

[式中、 R^1 、 n 、 $R^{18'}$ 、 X 、 m 、 W 、 o 、 $R^{4'}$ 及び X^2 は前記に同じ。

【0907】

R^{6aa'}は、C 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

【0908】

R^{6bb'}は、C 1～6 アルキル基；フェニル基（フェニル環上には、C 1～4 アルキレンジオキシ基、シアノ基、ニトロ基、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ置換スルホニル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、C 1～6 アルキルチオ基、フェノキシ基、フェニルC 1～6 アルコキシ基、ピロリジニル基〔ピロリジン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい〕、イミダゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサゾリル基、フェニルC 1～6 アルキル基、フェニル基、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノC 1～6 アルキル基、ピロリジニルC 1～6 アルコキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；ベンゾフリルC 1～6 アルキル基（ベンゾフラン環上には、置換基として少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；フェノキシC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；チアゾリルC 1～6 アルキル基（チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい）；フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；C 1～6 アルコキシカルボニル基；ベンゾチエニル基；ナフチル基；キノリル基；ベンゾチアゾリル基（ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい）；2, 3-ジヒドロ-1H-インデンル基（2, 3-ジヒドロ-1H-インダン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）；9H-フルオレニル基又はフェニルC 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。

【0909】

R^{6c'}は、ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。

【0910】

R^{6d'}は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；ベンゾフリルC 1～6 アルキル基（ベンゾフラン環上には、置換基として少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；ベンゾフリル基（該ベンゾフラン環上には、置換基としてハロゲン原子を少なくとも1個置換していてもよい）；フェノキシC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；チアゾリルC 1～6 アルキル基（チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくと

も 1 種が置換していてもよい] が置換していてもよい) ; チアゾリル基 (チアゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい] が置換していてもよい) 又はフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) を示す。

【0911】

$R^{6e'}$ は、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) を示す。

10

【0912】

一般式 (1 o') における基 -CHR^{18'}R^{6d'} の総炭素数は 6 を超えないものとする。

]

化合物 (1 k') を化合物 (1 l') に導く反応は、前記反応工程式 - 30 における化合物 (20') を化合物 (21') に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0913】

化合物 (1 l') と化合物 (24') との反応は、前記反応工程式 - 29 における化合物 (1 c') と化合物 (17') との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0914】

20

化合物 (1 l') と化合物 (25') との反応は、前記反応工程式 - 29 における化合物 (1 c') と化合物 (18') との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0915】

化合物 (1 l') と化合物 (26') との反応は、前記反応工程式 - 29 における化合物 (1 c') と化合物 (16') との反応と同様の反応条件下に行われる。

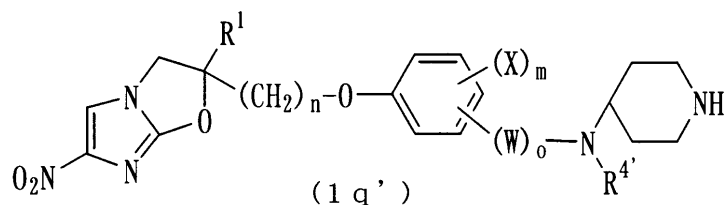
【0916】

化合物 (1 l') と化合物 (27') との反応は、前記反応工程式 - 29 における化合物 (1 c') と化合物 (19') との反応と同様の反応条件下に行われる。

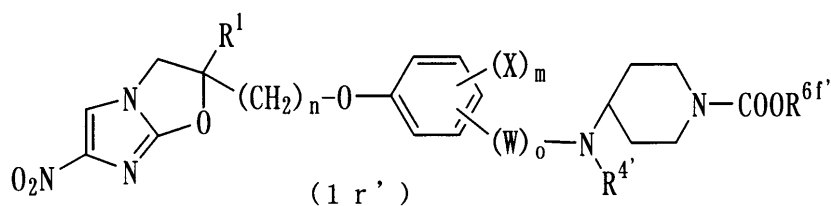
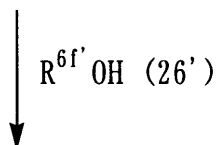
【0917】

【化 7 4】

反応工程式－ 3 3



10



20

【0 9 1 8】

〔式中、R¹、n、X、m、W、o 及び R^{4'} は前記に同じ。R^{6f'} は、C 1～6 アルキル基又はフェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。〕

化合物（1 q'）と化合物（26'）との反応は、適当な溶媒中、縮合剤の存在下に行われる。

30

【0 9 1 9】

ここで使用される溶媒としては、前記反応工程式－ 2 9 における化合物（1 c'）と化合物（18'）との反応のうち、方法（二）のカルボン酸ハライドにアミン（1 c'）を反応させる方法で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。

【0 9 2 0】

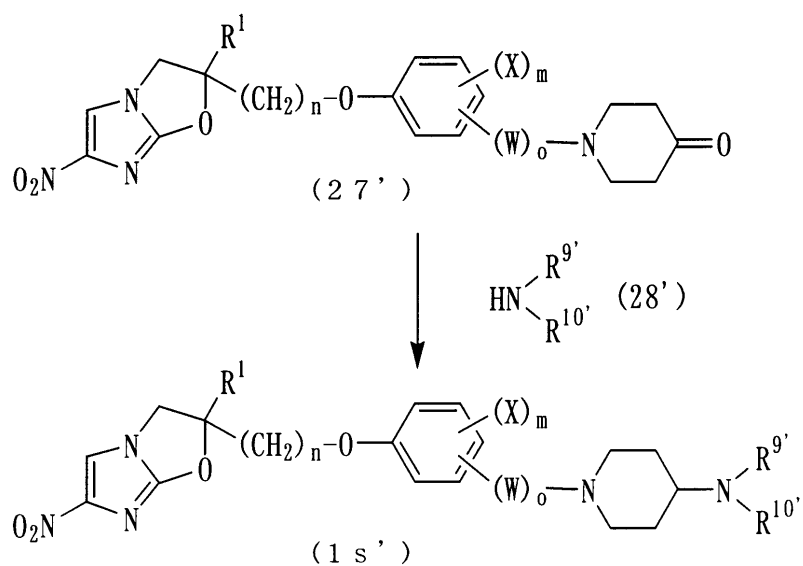
縮合剤としては、例えば、N，N'－カルボニルジイミダゾール等を挙げることができる。化合物（26'）及び縮合剤の使用量は、化合物（1 q'）1 モルに対して少なくとも 1 モル、好ましくは 1～2 モル程度使用するのがよい。該反応は、通常 0～150℃、好ましくは 0～100℃ 付近にて 1～30 時間程度にて終了する。

【0 9 2 1】

40

【化 7 5】

反応工程式－ 3 4



10

【 0 9 2 2 】

[式中、 R^1 、 n 、 X 、 m 、 W 、 o 、 $R^{9'}$ 及び $R^{10'}$ は前記に同じ。]

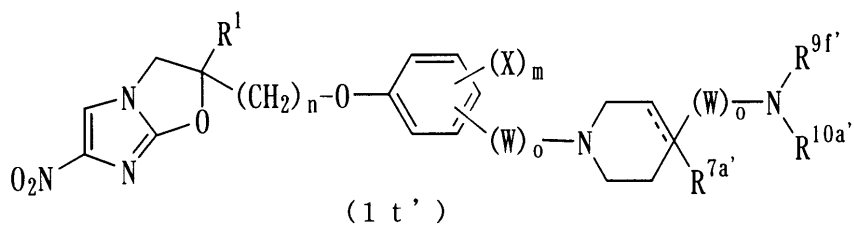
20

化合物 (27') と化合物 (28') との反応は、前記反応工程式－ 2 9 における化合物 (1c') と化合物 (16') との反応と同様の反応条件下に行われる。

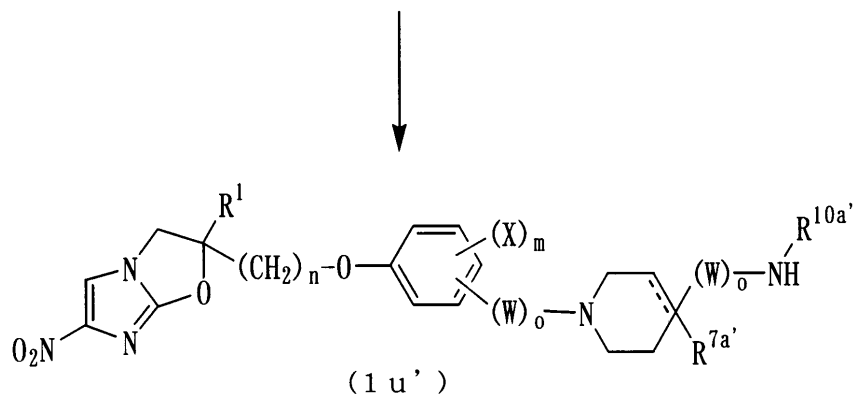
【 0 9 2 3 】

【化 7 6】

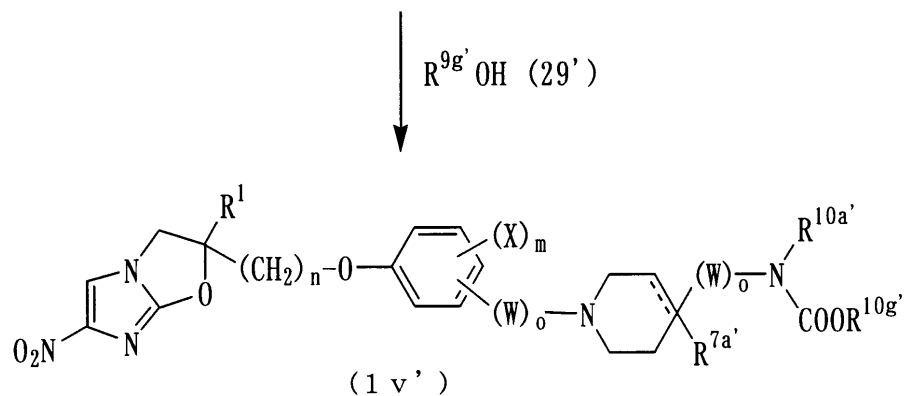
反応工程式－ 3 5



10



20



30

【0 9 2 4】

[式中、 R^1 、 n 、 X 、 m 、 W 、 o 、 $R^{7a'}$ 及び $R^{10a'}$ は前記に同じ。一般式(1 t')～(1 v')における二つの W は同一であっても異なってもよい。 $R^{9f'}$ は、C 1～6アルコキシカルボニル基を示す。ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは、基－(W) o $NR^{9f'}R^{10a'}$ 、基－(W) o $NHR^{10a'}$ 又は基－(W) o $NR^{10a'}$ ($COOR^{10g'}$)が置換するものとする。 $R^{9g'}$ は、C 1～6アルキル基又はフェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。]

40

化合物(1 t')を化合物(1 u')に導く反応は、前記反応工程式－ 3 0における化合物(2 0')を化合物(2 1')に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

【0 9 2 5】

化合物(1 u')と化合物(2 9')との反応は、前記反応工程式－ 3 3における化合物(1 q')と化合物(2 6')との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0 9 2 6】

50

反応工程式－２８の出発原料化合物（１４'）及び反応工程式－３０の出発原料化合物（２０'）は、新規化合物である。これらの化合物は、例えば、対応する出発原料を用い、前記反応工程式－１～－３に示す方法に従うことにより容易に製造することができる。

【０９２７】

本発明の一般式（１）で表される化合物（最終化合物）及び上記各反応工程式において得られる中間体は、立体異性体及び光学異性体を包含する。

【０９２８】

上記に示す各反応工程式で得られる各々の目的化合物は、反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、反応混合物から単離精製することができる。

10

【０９２９】

本発明化合物は、医薬的に許容される塩を包含する。斯かる塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、酢酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ酸塩、乳酸塩等の有機酸塩等が挙げられる。

【０９３０】

次に、本発明化合物を有効成分として含有する医療製剤について説明する。

【０９３１】

上記医療製剤は、本発明化合物を通常の医療製剤の形態に製剤したものであって、通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。

20

【０９３２】

このような医療製剤としては、治療目的に応じて種々の形態の中から選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤（液剤、懸濁剤等）等が挙げられる。

【０９３３】

錠剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、寒天末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第４級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等が挙げられる。

30

【０９３４】

更に、錠剤は、必要に応じて通常の錠皮を施した錠剤、例えば、糖衣剤、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。

40

【０９３５】

丸剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、寒天等の崩壊剤等が挙げられる。

【０９３６】

坐剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類

50

、ゼラチン、半合成グリセライド等が挙げられる。

【0937】

注射剤として調製される場合は、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、かつ血液と等張であるのが好ましい。これらの液剤、乳剤及び懸濁剤の形態に成形する際に用いられる希釈剤としては、公知のものを広く用いられているものを使用することができ、例えば、水、エタノール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルベタン脂肪酸エステル類等が挙げられる。なお、この場合、等張性の溶液を調製するのに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有させてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を、更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を含有させてもよい。

10

【0938】

医療製剤中に含有される本発明化合物の量は、特に限定されず広い範囲内から適宜選択することができるが、通常、医療製剤中に本発明化合物を1～70重量%含有させるのが好ましい。

【0939】

本発明に係る医療製剤の投与方法としては特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別、疾患の状態、その他の条件に応じた方法で投与される。例えば、錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には経口投与される。また、注射剤の場合には、単独あるいはブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内に投与したり、更には必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内に投与することができる。坐剤の場合には、直腸内に投与される。

20

【0940】

上記医療製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別、疾患の程度、その他の条件に応じて適宜選択すればよく、通常、1日あたり体重1kgに対して0.01～100mg、好ましくは0.1～50mgを1回～数回に分けて投与される。

【0941】

上記投与量は、種々の条件で変動するので、上記範囲より少ない投与量で十分な場合もあるし、また上記範囲を超えた投与量が必要な場合もある。

【発明の効果】

30

【0942】

本発明化合物は、特に抗酸菌等の結核菌（結核菌属、非定型抗酸菌属）に対して特異的効力を有している。本発明化合物は、多剤耐性結核菌に対して優れた効果を有している。本発明化合物は、嫌気性菌に対して抗菌作用を有している。

【0943】

本発明化合物は、インビトロで上記活性を示すばかりでなく、経口投与においても上記活性を発現する。

【0944】

本発明化合物は、グラム陽性菌、グラム陰性菌等の一般細菌に対して幅広いスペクトラムを有している公知の抗菌剤に見られるような下痢症を誘発することもなく、既存薬と比べ副作用も少ないことから、長期間の服薬が可能な医療製剤になり得る。

40

【0945】

本発明化合物は、抗酸菌感染症の主な感染臓器である肺組織に対し、良好に分布し得、薬効の持続時間が長い、安全性に優れている等の特性を有することから、高い治療効果が期待できる。

【0946】

本発明化合物は、ヒト由来マクロファージ内寄生結核菌等の細胞内寄生菌に対しても既存の抗結核剤と比較して、強い殺菌力を示すことから、結核症の再燃率の低減、ひいては短期化学療法を可能にし、HIVと結核の混合感染が深刻な問題となっていることから行われている予防的投与薬の主軸としての使用も期待できるものである。

50

【発明を実施するための形態】

【0947】

以下に、製剤例、参考例、実施例及び試験例を掲げる。

【0948】

製剤例1

本発明化合物100g、アビセル（商標名、旭化成（株）製）40g、コーンスターチ30g及びステアリン酸マグネシウム2gを混合研磨後、糖衣R10mmのキネで打錠した。

【0949】

得られた錠剤をTC-5（商標名、信越化学工業（株）製、ヒドロキシプロピルメチルセルロース）10g、ポリエチレングリコール-6000 3g、ひまし油40g及び適量のエタノールからなるフィルムコーティング剤を用いて被膜を行い、上記組成のフィルムコーティング錠を製造した。

10

【0950】

参考例1

4-（2-オキソプロピル）ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル（2.03g、9.22ミリモル）のアセトニトリル（20ml）溶液に、炭酸カリウム（1.27g、9.22ミリモル）、N-エチルジイソプロピルアミン（0.80ml、4.61ミリモル）及びクロロアセトン（1.22ml、13.83ミリモル）を加え、2時間加熱還流した。不溶物を濾過し、酢酸エチルで洗浄した。母液及び洗液を合わせ、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝100／1）にて精製し、微黄色液体の4-（2-オキソプロピル）ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル（2.24g、収率88%）を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.15 (3H, s), 2.35-2.50 (4H, m), 3.21 (2H, s), 3.50-3.62 (4H, m), 5.13 (2H, s), 7.27-7.42 (5H, m)

。

【0951】

参考例2

4-（3-オキソブチル）ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

メチルビニルケトン（2.3g、32.9ミリモル）及びTHF（25ml）の混合物に、氷冷下にてピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル（6g、32.3ミリモル）をTHF（50ml）に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて3日間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）にて精製し、微黄色オイルの4-（3-オキソブチル）ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル（7.2g、収率87%）を得た。

30

。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H, s), 2.17 (3H, s), 2.30-2.42 (4H, m), 2.53-2.70 (4H, m), 3.33-3.47 (4H, m)。

40

【0952】

対応する出発原料を用い、参考例1と同様にして、参考例3～参考例10の化合物を製造した。

【0953】

参考例3

1-〔4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ピペラジン-1-イル〕プロパン-2-オン

収率99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

50

2. 18 (3H, s), 2. 63–2. 68 (4H, m), 3. 27 (2H, s), 3. 30–3. 45 (4H, m), 6. 92 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7. 48 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$)。

【0954】

参考例4

1- (4-フェニルピペラジン-1-イル) プロパン-2-オン

収率95%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2. 19 (3H, s), 2. 65–2. 70 (4H, m), 3. 27–3. 32 (6H, m), 6. 97–7. 01 (2H, m), 7. 24–7. 31 (1H, m), 7. 37–7. 43 (2H, m)。 10

【0955】

参考例5

1- [4- (4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン

収率99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2. 17 (3H, s), 2. 63–2. 67 (4H, m), 3. 18–3. 23 (4H, m), 3. 26 (2H, s), 6. 80–6. 87 (2H, m), 7. 17–7. 23 (2H, m)。

【0956】

20

参考例6

1- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2. 18 (3H, s), 2. 63–2. 68 (4H, m), 3. 20–3. 25 (4H, m), 3. 26 (2H, s), 6. 85–6. 92 (2H, m), 7. 09–7. 13 (2H, m)。

【0957】

参考例7

30

1- [4- (2-ピリジル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン

収率97%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2. 19 (3H, s), 2. 58–2. 63 (4H, m), 3. 25 (2H, s), 3. 57–3. 62 (4H, m), 6. 60–6. 66 (2H, m), 7. 44–7. 51 (1H, m), 8. 17–8. 20 (1H, m)。

【0958】

参考例8

1- [4- (2-ピリミジル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン

収率88%

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2. 19 (3H, s), 2. 53–2. 57 (4H, m), 3. 25 (2H, s), 3. 86–3. 90 (4H, m), 6. 49 (1H, t, $J=4.8\text{ Hz}$), 8. 30 (2H, d, $J=4.8\text{ Hz}$)。

【0959】

参考例9

N- [1- (2-オキソプロピル) ピペリジン-4-イル] -N-メチル-カルバミン酸 tert-ブチルエステル

収率79%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

50

1. 46 (9H, s), 1. 57–1. 63 (2H, m), 1. 70–1. 91 (2H, m), 2. 04–2. 18 (2H, m), 2. 14 (3H, s), 2. 71–2. 74 (1H, m), 2. 74 (3H, s), 2. 90–2. 95 (2H, m), 3. 19 (2H, s)。

【0960】

参考例10

4-(2-オキソプロピル)ホモピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル
収率58%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 46 (9H, s), 1. 75–1. 93 (2H, m), 2. 14 (3H, s), 2. 64–2. 76 (4H, m), 3. 32 (2H, s), 3. 38–3. 58 (4H, m)。

10

【0961】

参考例11

1-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)-4-ヒドロキシピペリジンの製造

4-ヒドロキシピペリジン (1g、9.89ミリモル)、トリエチルアミン (1.7mL、11.9ミリモル) 及び塩化メチレン (20mL) の混合物に、氷冷下にて4-(トリフルオロメチル) 塩化ベンゾイル (1.5mL、9.89ミリモル) を加え、室温下にて30分撹拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) により精製し、白色粉末結晶の1-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)-4-ヒドロキシピペリジン (2.07g、収率77%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 36–2. 07 (4H, m), 3. 07–3. 70 (3H, m), 3. 91–4. 32 (2H, m), 7. 51 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7. 68 (2H, d, $J=8.0\text{Hz}$)。

【0962】

対応する出発原料を用い、参考例11と同様にして参考例12の化合物を製造した。

【0963】

30

参考例12

1-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)-4-ヒドロキシピペリジン
白色粉末結晶、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 34–2. 07 (4H, m), 3. 09–3. 80 (3H, m), 3. 91–4. 32 (2H, m), 7. 25 (2H, d, $J=7.9\text{Hz}$), 7. 45 (2H, d, $J=7.9\text{Hz}$)。

【0964】

参考例13

1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジンの製造

40

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン (1.87g、7.63ミリモル)、2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン (1.75g、8.4ミリモル)、炭酸カリウム (1.16g、8.38ミリモル)、ヨウ化ナトリウム (1.2g、8.01ミリモル) 及びDMF (30mL) の混合物を100℃にて1時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により精製し、無色オイルの1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン (1.69g、

50

収率 59%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.39–2.12 (10H, m), 2.36–2.53 (2H, m), 2.68 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.71–2.92 (2H, m), 3.43–3.63 (2H, m), 3.78–3.94 (2H, m), 4.31–4.47 (1H, m), 4.57–4.67 (1H, m), 6.96 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.52 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$)。

【0965】

参考例 14

2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エタノールの製造

参考例 13 で製造した 1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン (1.69 g、4.53 ミリモル)、ピリジニウム *p*-トルエンスルホネート (114 mg、0.45 ミリモル) 及びエタノール (50 ml) の混合物を 60–70 °C にて 6 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に 10% 苛性ソーダを加え、塩化メチレンにより抽出した。飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により精製し、無色オイルの 2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エタノール (1.19 g、収率 91%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.73–2.10 (4H, m), 2.31–2.47 (2H, m), 2.58 (2H, t, $J=5.5\text{ Hz}$), 2.69–3.00 (3H, m), 3.63 (2H, t, $J=5.5\text{ Hz}$), 4.33–4.48 (1H, m), 6.95 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.53 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$)。

【0966】

参考例 15

2-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エトキシ]テトラヒドロピランの製造
4-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (2.08 g、12.83 ミリモル)、2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン (3 g、14.11 ミリモル)、炭酸カリウム (1.95 g、14.11 ミリモル)、ヨウ化ナトリウム (2 g、13.47 ミリモル) 及び DMF (15 ml) の混合物を 100 °C にて 3 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (*n*-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) により精製し、無色オイルの 2-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エトキシ]テトラヒドロピラン (2.47 g、収率 66%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.41–1.90 (6H, m), 3.45–3.66 (1H, m), 3.76–3.96 (2H, m), 4.02–4.24 (3H, m), 4.63–4.76 (1H, m), 6.98 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.53 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$)。

【0967】

参考例 16

2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エタノールの製造

参考例 15 で製造した 2-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エトキシ]テトラヒドロピラン (2.47 g、8.51 ミリモル) を用い、参考例 14 と同様にして、白色粉末結晶の 2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エタノール (1.32 g、収率 79%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.88–4.14 (4H, m), 6.98 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.55 (

2 H, d, $J = 8.6$ Hz)。

【0968】

参考例 17

1-〔2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル〕-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンの製造

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン 1 塩酸塩 (680 mg、2.43 ミリモル) 及び 2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン (610 mg、2.92 ミリモル) を用い、参考例 15 と同様にして、淡茶オイルの 1-〔2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル〕-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン (425 mg、収率 47%) を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.41-1.92 (6 H, m), 2.45-2.59 (2 H, m), 2.67-2.86 (4 H, m), 3.18-3.31 (2 H, m), 3.43-3.65 (2 H, m), 3.80-4.00 (2 H, m), 4.55-4.65 (1 H, m), 5.98-6.10 (1 H, m), 7.15 (2 H, dd, $J = 2.1$ Hz, 8.8 Hz), 7.38 (2 H, dd, $J = 2.1$ Hz, 8.8 Hz)。

【0969】

参考例 18

2-〔4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル〕エタノールの製造

20

参考例 17 で製造した 1-〔2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル〕-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン (425 mg、1.14 ミリモル) を用い、参考例 14 と同様にして、淡茶オイルの 2-〔4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル〕エタノール (222 mg、収率 68%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.47-2.59 (2 H, m), 2.68 (2 H, t, $J = 5.5$ Hz), 2.79 (2 H, t, $J = 5.5$ Hz), 3.16-3.25 (2 H, m), 3.70 (2 H, t, $J = 5.5$ Hz), 6.00-6.10 (1 H, m), 7.17 (2 H, dd, $J = 2.1$ Hz, 6.7 Hz), 7.40 (2 H, dd, $J = 2.1$ Hz, 6.7 Hz)。

30

【0970】

参考例 19

3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロピン-1-オール の製造

4-ブロモベンゾトリフルオリド (6.5 g、28.89 ミリモル)、プロパルギルアルコール (2.35 ml、40.45 ミリモル)、トリエチルアミン (5.64 ml、40.45 ミリモル)、トリフェニルホスフィン (230 mg、0.87 ミリモル)、ヨウ化第一銅 (110 mg、0.58 ミリモル)、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (210 mg、0.29 ミリモル) 及びトルエン (100 ml) の混合物を窒素雰囲気下、100℃にて2時間攪拌した。反応液を室温に戻し、セライト濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、淡茶オイルの 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロピン-1-オール (3.47 g、収率 60%) を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

4.52 (2 H, d, $J = 6.2$ Hz), 7.53 (2 H, d, $J = 8.7$ Hz), 7.58 (2 H, d, $J = 8.7$ Hz)。

【0971】

参考例 20

2-[N-メチル-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ]エタノールの製造

N-メチル-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミン (4.83 g、24.24

50

ミリモル)、2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン(6.1g、29.03ミリモル)、炭酸カリウム(3.84g、27.76ミリモル)及びDMF(20ml)の混合物を100℃にて5時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)により精製し、微黄色オイルの2-[N-メチル-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ]エタノール(3.1g、収率53%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.96 (3H, s), 3.46 (2H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.81 (2H, q, $J=5.7\text{ Hz}$), 6.74 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.08 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$)。

【0972】

参考例21

8-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカンの製造

1-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン(6.3g、26.14ミリモル)、1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン(3.35ml、26.14ミリモル)、酢酸パラジウム(60mg、0.26ミリモル)、(S)-(-)-2,2-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル(BINAP)(244mg、0.39ミリモル)、tert-ブトキシナトリウム(3.77g、39.23ミリモル)及びトルエン(50ml)の混合物を80℃にて1時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル50mlを加え、濾過した。濾液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、微黄色粉末の8-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン(6.54g、収率83%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.83 (4H, t, $J=5.8\text{ Hz}$), 3.31 (4H, t, $J=5.8\text{ Hz}$), 3.99 (4H, s), 6.90 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.09 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)。

【0973】

参考例22

1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-オンの製造

参考例21で製造した8-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン(1.23g、4.06ミリモル)、濃塩酸(5ml)、水(10ml)及びエタノール(30ml)の混合物を5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧濃縮した。残渣に10%苛性ソーダを加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1)により精製し、無色オイルの1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-オン(848mg、収率81%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.56 (4H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 3.59 (4H, t, $J=6.2\text{ Hz}$), 6.94 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.14 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【0974】

参考例23

1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-オールの製造

参考例22で製造した1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-オン(1.11g、4.28ミリモル)及びメタノール(30ml)の混合物に、氷冷下に

10

20

30

40

50

て水素化ホウ素ナトリウム（324 mg、8.56ミリモル）を加え、同温度下にて30分攪拌した。反応液に10%塩酸を加え、減圧下にて濃縮した。残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。抽出溶液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン／酢酸エチル＝3／1）により精製し、白色粉末の1-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペリジン-4-オール（1.08 g、収率97%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.59–1.76 (2H, m), 1.90–2.06 (2H, m), 2.82–2.98 (2H, m), 3.43–3.57 (2H, m), 3.75–3.91 (1H, m), 6.89 (2H, d, $J=7.1\text{ Hz}$), 7.09 (2H, d, $J=7.1\text{ Hz}$)。

10

【0975】

参考例23と同様にして、参考例24及び参考例25の化合物を製造した。

【0976】

参考例24

1-（4-トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン-4-オール

白色粉末、収率76%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.53–1.71 (2H, m), 1.89–2.04 (2H, m), 2.91–3.11 (2H, m), 3.56–3.71 (2H, m), 3.80–4.00 (1H, m), 6.93 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.46 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$)。

20

【0977】

参考例25

1-（4-メトキシフェニル）ピペリジン-4-オール

白色粉末、収率5%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.64–1.79 (2H, m), 1.92–2.08 (2H, m), 2.74–2.88 (2H, m), 3.32–3.47 (2H, m), 3.70–3.85 (4H, m), 6.84 (2H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, 6.8 Hz), 6.93 (2H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, 6.8 Hz)。

30

【0978】

参考例26

1-（4-クロロフェニル）ピペリジン-4-オールの製造

8-（4-クロロフェニル）-1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカン（2.6 g、10.25ミリモル）、濃塩酸（12 ml）、水（10 ml）及びエタノール（50 ml）の混合物を5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧濃縮した。残渣に10%苛性ソーダを加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。この残渣をメタノール（50 ml）に溶解し、氷冷下にて水素化ホウ素ナトリウム（388 mg、10.25ミリモル）を加え、同温度下にて30分攪拌した。反応液に10%塩酸を加え、減圧下にて濃縮した。残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン／酢酸エチル＝3／1）により精製し、微黄色粉末結晶の1-（4-クロロフェニル）ピペリジン-4-オール（1.73 g、収率80%）を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.55–1.74 (2H, m), 1.89–2.08 (2H, m), 2.79–3.00 (2H, m), 3.43–3.57 (2H, m), 3.75–3.92 (1H, br), 6.89 (2H, d, $J=7.1\text{ Hz}$), 7.09 (2H, d, $J=7.1\text{ Hz}$)。

【0979】

50

対応する出発原料を用い、参考例 26 と同様にして、参考例 27 の化合物を製造した。

【0980】

参考例 27

1-(4-フルオロフェニル)ピペリジン-4-オール

白色粉末、収率 66%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.57–1.79 (2H, m), 1.92–2.08 (2H, m), 2.75–2.92 (2H, m), 3.36–3.50 (2H, m), 3.74–3.89 (1H, m), 6.77–7.00 (4H, m)。

【0981】

参考例 28

4-[4-(tert-ブチルジメチルシロキシ)ピペリジン-1-イル]ベンゾニトリルの製造

4-ブロモベンゾニトリル (2.76 g、15.16 ミリモル)、4-(tert-ブチルジメチルシロキシ)ピペリジン (2.9 g、13.79 ミリモル)、酢酸パラジウム (62 mg、0.28 ミリモル)、(S)-(–)-2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル (BINAP) (258 mg、0.41 ミリモル)、tert-ブトキシナトリウム (1.99 g、20.68 ミリモル) 及びトルエン (60 ml) の混合物を 80℃ にて 1 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル 60 ml を加え、濾過した。濾液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/塩化メチレン = 1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の 4-[4-(tert-ブチルジメチルシロキシ)ピペリジン-1-イル]ベンゾニトリル (2.8 g、収率 66%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.90 (9H, s), 1.50–1.69 (8H, m), 1.73–1.90 (2H, m), 3.18–3.31 (2H, m), 3.50–3.65 (2H, m), 3.90–4.04 (1H, m), 6.85 (2H, d, $J = 7.0 \text{ Hz}$), 7.47 (2H, d, $J = 7.0 \text{ Hz}$)。

【0982】

参考例 29

4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾニトリルの製造

参考例 28 で製造した 4-[4-(tert-ブチルジメチルシロキシ)ピペリジン-1-イル]ベンゾニトリル (2.8 g、8.85 ミリモル) 及び THF (30 ml) の混合物に、氷冷下にて 1M テトラ n-ブチルアンモニウムフロリドの THF 溶液 (10.6 ml、10.2 ミリモル) を加え、室温下にて 16 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル = 1/2) により精製し、白色粉末結晶の 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル)ベンゾニトリル (1.52 g、収率 85%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.50–1.73 (2H, m), 1.90–2.04 (2H, m), 3.00–3.20 (2H, m), 3.59–3.76 (2H, m), 3.84–4.04 (1H, m), 6.86 (2H, dd, $J = 2.0 \text{ Hz}$, 7.1 Hz), 7.48 (2H, dd, $J = 2.0 \text{ Hz}$, 7.1 Hz)。

【0983】

参考例 30

1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステルの製造

10

20

30

40

50

4-ブロモベンゾトリフルオリド (3.15 g、13.99ミリモル) 及びイソニペコチン酸エチル (2.2 g、13.99ミリモル) を用い、参考例 21 と同様にして、淡茶粉末結晶の 1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル (3.18 g、収率 74%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.27 (3H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 1.71–2.10 (4H, m), 2.41–2.55 (1H, m), 2.82–2.98 (2H, m), 3.65–3.80 (2H, m), 4.16 (2H, q, $J=7.2\text{ Hz}$), 6.92 (2H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 7.63 (2H, d, $J=6.9\text{ Hz}$)。

【0984】

10

参考例 31

[1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イル] メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム (1.58 g、41.64ミリモル) を THF (30 ml) に懸濁し、窒素雰囲気下、氷冷下にて参考例 30 で製造した 1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル (3.18 g、10.41ミリモル) を THF (10 ml) に溶解した溶液を滴下した。同温度下にて 30 分攪拌した。反応液に水、10% 苛性ソーダを加え、セライト濾過した。濾液から酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮し、微黄色オイルの [1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イル] メタノール (2.64 g、収率 98%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.31–1.47 (2H, m), 1.61–1.90 (3H, m), 2.74–2.90 (2H, m), 3.45–3.61 (2H, m), 3.83 (2H, d, $J=12.6\text{ Hz}$), 6.92 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.46 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)。

【0985】

参考例 32

1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-オールの製造

4-(トリフルオロメトキシ) ベンズアルデヒド (1 g、5.26ミリモル)、4-ヒドロキシピペリジン (798 mg、7.89ミリモル) 及びアセトニトリル (20 ml) の混合物に、氷冷下にてトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム (1.67 g、7.89ミリモル) を加え、同温度下にて 30 分攪拌後、室温下にて終夜攪拌した。反応液を 7.5% 重曹水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、微黄色オイルの 1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-オール (1.21 g、収率 84%) を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.50–1.74 (2H, m), 1.80–1.98 (2H, m), 2.08–2.24 (2H, m), 2.63–2.84 (2H, m), 3.49 (2H, s), 3.61–3.80 (1H, m), 7.15 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.34 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

40

【0986】

参考例 32 と同様にして、参考例 33 及び実施例 34 の化合物を製造した。

【0987】

参考例 33

1-(4-クロロベンジル) ピペリジン-4-オール

白色粉末、収率 87%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.48–1.63 (2H, m), 1.76–1.91 (2H, m), 2.04–2.2

50

0 (2H, m), 2.61–2.76 (2H, m), 3.45 (2H, s), 3.57–3.72 (1H, m), 7.24 (2H, d, $J=8.8$ Hz), 7.28 (2H, d, $J=8.8$ Hz)。

【0988】

参考例34

1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン-4-オール
白色粉末、収率83%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.43–1.67 (2H, m), 1.80–1.94 (2H, m), 2.06–2.24 (2H, m), 2.63–2.78 (2H, m), 3.67 (2H, s), 3.61–3.72 (1H, m), 7.44 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.57 (2H, d, $J=8.0$ Hz)。

10

【0989】

参考例35

(4-ベンジルピペラジン-1-イル)カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造
4-ベンジルピペラジン-1-イルアミン (36.03 g、188ミリモル) をメタノール (260 ml) に溶解し氷冷した。二炭酸ジtert-ブチル (61.66 g、283ミリモル) をメタノール (100 ml) に溶解した溶液を20分で滴下した。室温に戻し終夜で攪拌した。反応液を濃縮後、シリカゲルカラムクログラフィー (n-ヘキサン/アセトン=3/1) により精製した。得られた固体にイソプロピルエーテル (IPE) (60 ml) 及びn-ヘキサン (20 ml) を加え、攪拌後濾過し、一次晶を得た。母液を濃縮し、イソプロピルエーテル (10 ml) 及びn-ヘキサン (10 ml) を加え、攪拌後濾過し、二次晶を得た。一次晶と二次晶をあわせて減圧乾燥し、白色粉末結晶の(4-ベンジルピペラジン-1-イル)カルバミン酸tert-ブチルエステル (42.22 g、収率77%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45 (9H, s), 2.55–2.58 (4H, m), 2.80 (4H, br), 3.51 (2H, s), 5.35 (1H, br), 7.24–7.31 (5H, m)。

【0990】

参考例36

ピペラジン-1-イルカルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

参考例35で製造した(4-ベンジルピペラジン-1-イル)カルバミン酸tert-ブチルエステル (42.22 g、145ミリモル) をエタノール (300 ml) に溶解した。20%水酸化パラジウム/炭素 (6.0 g) を加え、水素雰囲気下室温で20分攪拌し、更に50℃で30分攪拌した。20%水酸化パラジウム/炭素をセライトで濾去した後、濾液を減圧濃縮した。得られた固体をIPEで洗浄し濾過した。得られた固体を減圧乾燥し、白色粉末結晶のピペラジン-1-イルカルバミン酸tert-ブチルエステル (28.9 g、収率99%) を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H, s), 2.74–2.77 (4H, m), 2.95–2.99 (4H, m), 5.45 (1H, br)。

40

【0991】

参考例37

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (2.22 g、10.0ミリモル)、4-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (1.21 g、7.45ミリモル)、トリn-ブチルホスフィン (2.26 g、11.2ミリモル) 及び1,1'-アゾジカルボニルジピペリジン (2.82 g、11.2ミリモル) をベンゼン (20 ml) に溶解して室温で2日間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸

50

マグネシウムで乾燥後、濾過して、得られた濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクログラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝5／1）により精製した。無色油状物質の4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（1.13 g、収率44%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.48 (9H, s), 1.65–1.82 (2H, m), 1.87–1.97 (2H, m), 3.34–3.44 (2H, m), 3.63–3.74 (2H, m), 4.47–4.58 (1H, m), 6.89–6.97 (2H, m), 7.47–7.55 (2H, m)。

【0992】

10

参考例38

4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジンの製造

参考例37で製造した4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（1.13 g、3.27ミリモル）を塩化メチレン（10ml）に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸（10ml）を滴下して加え、5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。塩化メチレン溶液を水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、白色粉末の4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン（727mg、収率91%）を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.63–1.75 (2H, m), 1.97–2.06 (2H, m), 2.69–2.80 (2H, m), 3.10–3.20 (2H, m), 4.38–4.49 (1H, m), 6.94–6.98 (2H, m), 7.50–7.55 (2H, m)。

【0993】

対応する出発原料を用い、参考例38と同様の方法により、参考例39～参考例43の化合物を製造した。

【0994】

参考例39

4-（4-フルオロフェノキシ）ピペリジン

30

白色粉末、収率76%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.61–1.74 (2H, m), 1.96–2.06 (2H, m), 2.50 (1H, bs), 2.70–2.80 (2H, m), 3.11–3.20 (2H, m), 4.23–4.33 (1H, m), 6.80–6.89 (2H, m), 6.91–7.00 (2H, m)。

【0995】

参考例40

4-（3-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン

40

白色粉末、収率48%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.62–1.76 (2H, m), 1.80 (1H, bs), 1.97–2.08 (2H, m), 2.71–2.81 (2H, m), 3.11–3.20 (2H, m), 4.37–4.47 (1H, m), 7.05–7.20 (3H, m), 7.34–7.41 (1H, m)。

【0996】

参考例41

4-（4-トリフルオロメトキシフェノキシ）ピペリジン

白色粉末、収率88%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

50

1. 59–1. 73 (3H, m), 1. 97–2. 04 (2H, m), 2. 68–2. 78 (2H, m), 3. 10–3. 19 (2H, m), 4. 29–4. 36 (1H, m), 6. 85–6. 92 (2H, m), 7. 10–7. 14 (2H, m)。

【0997】

参考例 4 2

4-(4-シアノフェノキシ)ピペリジン

白色粉末、収率 83%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 63–1. 77 (3H, m), 1. 98–2. 08 (2H, m), 2. 72–2. 82 (2H, m), 3. 12–3. 21 (2H, m), 4. 42–4. 51 (1H, m), 6. 92–6. 98 (2H, m), 7. 55–7. 61 (2H, m)。

10

【0998】

参考例 4 3

4-(4-クロロフェノキシ)ピペリジン

白色粉末、収率 62%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 50 (1H, bs), 1. 56–1. 71 (2H, m), 1. 94–2. 04 (2H, m), 2. 66–2. 76 (2H, m), 3. 08–3. 18 (2H, m), 4. 25–4. 35 (1H, m), 6. 80–6. 86 (2H, m), 7. 18–7. 25 (2H, m)。

20

【0999】

参考例 4 4

1-エチル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾールの製造

1-エチル-5-メチル-1H-テトラゾール (0. 80 g、7. 13 ミリモル) の THF (15 ml) 溶液に -70°C に冷却攪拌下、*n*-ブチルリチウム (1. 53 M) ヘキサン溶液 (6. 5 ml、9. 98 ミリモル) を滴下して 1. 5 時間攪拌し、同温で 3-クロロ-2-メチル-1-プロペン (0. 77 ml、7. 84 ミリモル) の THF (5 ml) 溶液を加え、更に同温で 2 時間攪拌した。反応混合液に水を加え、酢酸エチルで抽出して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。茶色液体の 1-エチル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾール (0. 95 g、収率 80%) を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 56 (3H, t, $J=7. 3\text{ Hz}$), 1. 80 (3H, s), 2. 44–2. 67 (2H, m), 2. 90–3. 06 (2H, m), 4. 32 (2H, q, $J=7. 3\text{ Hz}$), 4. 65–4. 77 (1H, m), 4. 77–4. 87 (1H, m)。

【1000】

対応する出発原料を用い、参考例 4 4 と同様にして、参考例 4 5 及び 4 6 の化合物を製造した。

【1001】

参考例 4 5

1-フェニル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾール

40

白色粉末、収率 45%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 67 (3H, s), 2. 49 (2H, t, $J=8. 1\text{ Hz}$), 3. 04 (2H, t, $J=8. 1\text{ Hz}$), 4. 58–4. 65 (1H, m), 4. 71–4. 77 (1H, m), 7. 43–7. 47 (2H, m), 7. 59–7. 62 (3H, m)。

【1002】

参考例 4 6

1-(4-クロロフェニル)-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾール

白色粉末、収率 55%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

50

1. 68 (3H, s), 2. 50 (2H, t, $J=8.1$ Hz), 3. 03 (2H, t, $J=8.1$ Hz), 4. 58–4. 63 (1H, m), 4. 71–4. 77 (1H, m), 7. 38–7. 44 (2H, m), 7. 56–7. 62 (2H, m)。

【1003】

参考例47

3-(4-メチル-4-ペンテニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

メチルトリフェニルホスホニウムブロミド (11 g、30. 8ミリモル) 及びTHF (100 ml) の混合物に、氷冷下にてtert-ブトキシカリウム (3. 5 g、31. 2ミリモル) を徐々に加え、同温度下にて20分攪拌した。同温度下にて3-(4-オキソペンチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (5. 6 g、25. 6ミリモル) をTHF (10 ml) に溶解した溶液を徐々に滴下して加えた。室温下にて2時間攪拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1) により精製し、無色オイルの3-(4-メチル-4-ペンテニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (3. 4 g、収率61%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 73 (3H, s), 1. 84–2. 16 (4H, m), 3. 83 (2H, t, $J=7. 3$ Hz), 4. 75 (2H, d, $J=12. 7$ Hz), 6. 97 (1H, d, $J=8. 2$ Hz), 7. 02–7. 28 (3H, m)。

【1004】

参考例48

3-(5-メチル-5-ヘキセニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-(5-オキソヘキシル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1. 4 g、6ミリモル) を用い、参考例47と同様にして、無色オイルの3-(5-メチル-5-ヘキセニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1. 1 g、収率79%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 42–1. 60 (2H, m), 1. 65–1. 83 (5H, m), 2. 00–2. 16 (2H, m), 3. 84 (2H, t, $J=6. 9$ Hz), 4. 69 (2H, d, $J=11. 7$ Hz), 6. 97 (1H, d, $J=7. 9$ Hz), 7. 02–7. 23 (3H, m)。

【1005】

参考例49

5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オンの製造

4-トリフルオロメトキシ安息香酸ヒドラジド (5. 06 g、22. 98ミリモル) のTHF (150 ml) 溶液に氷冷攪拌下、トリエチルアミン (3. 52 ml、25. 28ミリモル) 及び1, 1'-カルボニルジイミダゾール (4. 84 g、29. 87ミリモル) を加え、室温で2時間攪拌した。減圧濃縮し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。白色固体の5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン (5. 34 g、収率94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

7. 01 (1H, s), 7. 47–7. 59 (2H, m), 7. 86–7. 98 (2H, m)。

【1006】

対応する出発原料を用い、参考例49と同様にして、参考例50～参考例61の化合物を製造した。

【1007】

参考例50

10

20

30

40

50

5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率97%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

7.90 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.99 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$).

【1008】

参考例51

5-(4-ビフェニリル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率97%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

7.35-7.52 (3H, m), 7.68-7.73 (2H, m), 7.76-7.87 (4H, m).

【1009】

参考例52

5-フェニル-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率92%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.40-7.58 (3H, m), 7.77-7.91 (2H, m).

【1010】

参考例53

5-(4-クロロフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率80%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

7.61 (2H, dd, $J=1.9\text{ Hz}$, 6.6 Hz), 7.80 (2H, dd, $J=1.9\text{ Hz}$, 6.6 Hz).

【1011】

参考例54

5-(4-フルオロフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率74%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

7.30-7.49 (2H, m), 7.78-7.92 (2H, m).

【1012】

参考例55

5-(4-ブロモフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率87%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

7.65-7.78 (4H, m).

【1013】

参考例56

5-(4-クロロベンジル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率83%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

3.94 (2H, s), 7.31 (2H, dd, $J=2.1\text{ Hz}$, 6.4 Hz), 7.41 (2H, dd, $J=2.1\text{ Hz}$, 6.4 Hz).

【1014】

参考例57

5-[2-(4-クロロフェニル)エチル]-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率78%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

10

20

30

40

50

2. 76–3. 00 (4H, m), 7. 27 (2H, d, $J=8. 5\text{ Hz}$), 7. 35 (2H, d, $J=8. 5\text{ Hz}$), 12. 03 (1H, s)。

【1015】

参考例58

5-(4-クロロスチリル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン
白色粉末、収率88%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

6. 99 (1H, d, $J=16. 5\text{ Hz}$), 7. 32 (1H, d, $J=16. 5\text{ Hz}$),
7. 47 (2H, d, $J=8. 6\text{ Hz}$), 7. 75 (2H, d, $J=8. 6\text{ Hz}$), 12. 06 (1H, s)。

10

【1016】

参考例59

5-(4-クロロフェノキシメチル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン
白色粉末、収率68%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

5. 07 (2H, s), 7. 07 (2H, d, $J=6. 8\text{ Hz}$), 7. 37 (2H, d, $J=6. 8\text{ Hz}$), 12. 41 (1H, br)。

【1017】

参考例60

5-(4-ピリジル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン
白色粉末、収率40%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

7. 72 (2H, dd, $J=1. 6\text{ Hz}$, 4. 6 Hz), 8. 76 (2H, dd, $J=1. 6\text{ Hz}$, 4. 6 Hz), 12. 90 (1H, s)。

20

【1018】

参考例61

5-(2-ピリミジル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン
白色粉末、収率70%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

8. 68–8. 86 (2H, m), 9. 12 (1H, d, $J=1. 4\text{ Hz}$), 12. 97 (1H, s)。

30

【1019】

参考例62

(S)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(トリフルオロメトキシ)フェノール (2. 1 g、11. 8ミリモル)、(S)-2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (2 g、9. 8ミリモル)、アゾジカルボン酸ジエチル (2. 3 ml、14. 7ミリモル)、トリフェニルホスフィン (3. 86 g、14. 7ミリモル) 及びTHF (30 ml) の混合物を1時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=10/1) により精製し、微黄色オイルの(S)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (2. 96 g、収率65%) を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 48 (9H, s), 1. 78–2. 10 (4H, m), 3. 27–3. 49 (2H, m), 3. 73–3. 98 (1H, m), 4. 04–4. 20 (2H, m), 6. 90 (2H, dd, $J=2. 2\text{ Hz}$, 7. 0 Hz), 7. 12 (2H, dd, $J=2. 2\text{ Hz}$, 7. 0 Hz)。

【1020】

50

参考例 6 3

(S)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジンの製造

参考例 6 2 で製造した (S)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.31 g、6.39 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (20 ml) 及び塩化メチレン (20 ml) の混合物を室温下にて 4 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に 10% 苛性ソーダを加え塩基性とし、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮し、淡茶オイルの (S)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン (1.65 g、収率 99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45–1.63 (1H, m), 1.65–2.04 (3H, m), 2.70 (1H, bs), 2.88–3.08 (2H, m), 3.43–3.59 (1H, m), 3.78–3.96 (2H, m), 6.88 (2H, dd, $J=2.3\text{ Hz}$, 8.4 Hz), 7.11 (2H, dd, $J=2.3\text{ Hz}$, 8.4 Hz)。

【1021】

参考例 6 4

3-オキソ-4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

3-オキソピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (4.1 g、20.4 ミリモル) 及び DMF (30 ml) の混合物に、氷冷下にて水素化ナトリウム (840 mg、24.5 ミリモル) を徐々に加え、室温下にて 30 分攪拌した。4-トリフルオロメチルベンジルクロリド (5 g、20.9 ミリモル) を DMF (5 ml) に溶解した溶液を氷冷下にて滴下し、室温下にて 2 時間攪拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン) により精製し、白色粉末結晶の 3-オキソ-4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.7 g、収率 91%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.47 (9H, s), 3.27 (2H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.62 (2H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 4.18 (2H, s), 4.67 (2H, s), 7.39 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.61 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$)。

【1022】

参考例 6 5

1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オンの製造

参考例 6 4 で製造した 3-オキソ-4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.7 g、18.7 ミリモル) を用い、参考例 6 3 と同様にして、微黄色粉末の 1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オン (4.5 g、収率 93%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.06 (2H, t, $J=5.2\text{ Hz}$), 3.24 (2H, t, $J=5.2\text{ Hz}$), 3.62 (2H, s), 4.60 (2H, s), 7.39 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.59 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$)。

【1023】

参考例 6 6

4'-トリフルオロメトキシビフェニル-4-カルボアルデヒドの製造

1-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン (1.53 g、6.35 ミリモル)、4-ホルミルベンゼンボロン酸 (1 g、6.67 ミリモル)、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム (147 mg、0.13 ミリモル)、リン酸カリウム (2.02 g、9.53 ミリモル) 及び DMF (10 ml) の混合物を 100°C にて 5 時間攪

10

20

30

40

50

拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより抽出し、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／塩化メチレン＝3／1）により精製し、白色粉末の4'-トリフルオロメトキシビフェニル-4-カルボアルデヒド（1.56 g、収率92%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.33 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.60–7.80 (4H, m), 7.97 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 10.07 (1H, s)。

【1024】

参考例66と同様にして、対応するヨードベンゼン又は臭化ベンゼン化合物とホルミルベンゼンボロン酸から参考例67～参考例73の化合物を製造した。

【1025】

参考例67

4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-カルボアルデヒド

無色粉末晶、収率27%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.68–7.81 (6H, m), 7.99 (2H, dd, $J=1.7\text{ Hz}$, 6.5 Hz), 10.09 (1H, s)。

【1026】

参考例68

4'-トリフルオロメチルビフェニル-3-カルボアルデヒド

黄色オイル、収率83%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.33 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.60–7.80 (4H, m), 7.97 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 10.07 (1H, s)。

【1027】

参考例69

4'-ジメチルアミノビフェニル-4-カルボアルデヒド

黄色粉末、収率46%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.03 (6H, s), 6.81 (2H, dd, $J=2.1\text{ Hz}$, 6.8 Hz), 7.58 (2H, dd, $J=2.1\text{ Hz}$, 6.8 Hz), 7.71 (2H, dd, $J=1.8\text{ Hz}$, 6.6 Hz), 7.90 (2H, dd, $J=1.8\text{ Hz}$, 6.6 Hz), 10.00 (1H, s)。

【1028】

参考例70

4'-クロロビフェニル-4-カルボアルデヒド

微黄色粉末結晶、収率47%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.45 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.57 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.73 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.96 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 10.06 (1H, s)。

【1029】

参考例71

2'-クロロビフェニル-4-カルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率46%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.30–7.40 (3H, m), 7.38–7.58 (1H, m), 7.63 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.96 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 10.08 (1H, s)。

10

20

30

40

50

【1030】

参考例 72

3', 4'-ジクロロビフェニル-4-カルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率 24%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.46 (1H, dd, $J=2.1\text{ Hz}$, 8.4 Hz), 7.56 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.70-7.80 (3H, m), 7.97 (2H, dd, $J=1.8\text{ Hz}$, 6.6 Hz), 10.07 (1H, s)。

【1031】

参考例 73

4'-メトキシビフェニル-4-カルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率 45%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.87 (3H, s), 7.01 (2H, d, $J=6.8\text{ Hz}$), 7.59 (2H, d, $J=6.8\text{ Hz}$), 7.72 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.93 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 10.04 (1H, s)。

【1032】

参考例 74

4-(ピリジン-3-イル)ベンズアルデヒドの製造

4-ブロモベンズアルデヒド (2 g、10.8 ミリモル)、ジエチル (3-ピリジル) ボラン (1.75 g、11.9 ミリモル)、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (375 mg、0.32 ミリモル)、2N-炭酸ナトリウム (10.8 ml、21.6 ミリモル) 及びトルエン (40 ml) の混合物を窒素雰囲気下にて、終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより希釈した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル = 1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の 4-(ピリジン-3-イル)ベンズアルデヒド (1.43 g、収率 72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.33-7.50 (1H, m), 7.76 (2H, dd, $J=1.8\text{ Hz}$, 6.6 Hz), 7.89-8.06 (3H, m), 8.56-8.69 (1H, m), 8.90 (1H, dd, $J=0.7\text{ Hz}$, 1.7 Hz), 10.09 (1H, s)。

【1033】

参考例 75

4-(イミダゾール-1-イル)ベンズアルデヒドの製造

4-フルオロベンズアルデヒド (4.96 g、40 ミリモル)、イミダゾール (2.86 g、42 ミリモル)、炭酸カリウム (6.08 g、44 ミリモル) 及び DMSO (40 ml) の混合物を 110 °C にて終夜攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水 (100 ml) 中に注ぎ、析出晶を濾取した。水洗後、酢酸エチルにより洗浄し、微黄色粉末結晶の 4-(イミダゾール-1-イル)ベンズアルデヒド (2.33 g、収率 34%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.20-7.30 (1H, m), 7.38 (1H, dd, $J=1.3\text{ Hz}$, 1.4 Hz), 7.58 (2H, dd, $J=1.8\text{ Hz}$, 6.8 Hz), 7.98-8.10 (3H, m), 10.05 (1H, s)。

【1034】

対応する出発原料を用い、参考例 75 と同様にして、参考例 76 の化合物を製造した。

【1035】

参考例 76

4-(ピペリジン-1-イル)ベンズアルデヒド

黄色粉末結晶、収率 46%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 58–1. 75 (6H, m), 3. 33–3. 50 (4H, m), 6. 89 (2H, dd, $J=1. 9\text{ Hz}$, 7. 0 Hz), 7. 73 (2H, dd, $J=1. 9\text{ Hz}$, 7. 0 Hz), 9. 75 (1H, s)。

【1036】

参考例 77

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-プロモベンゾトリフルオリド (3. 0 g、13. 3ミリモル)、ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2. 9 g、15. 3ミリモル)、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム (306 mg、0. 53ミリモル)、トリ-*o*-トリルホスフィン (162 mg、0. 53ミリモル) 及び tert-ブトキシナトリウム (2. 2 g、22. 7ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (60 ml) 中にて4時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (*n*-ヘキサン/塩化メチレン=2/1) により精製し、白色粉末の4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3. 8 g、収率87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 49 (9H, s), 3. 21–3. 26 (4H, m), 3. 56–3. 61 (4H, m), 6. 90–6. 93 (2H, m), 7. 47–7. 51 (2H, m)。

【1037】

対応する出発原料を用い、参考例77と同様にして、参考例78～参考例84の化合物を製造した。

【1038】

参考例 78

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率95%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 48 (9H, s), 3. 09–3. 13 (4H, m), 3. 55–3. 60 (4H, m), 6. 87–6. 91 (2H, m), 7. 10–7. 14 (2H, m)。

【1039】

参考例 79

4-(4-ビフェニリル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率95%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 49 (9H, s), 3. 16–3. 21 (4H, m), 3. 58–3. 62 (4H, m), 6. 97–7. 01 (2H, m), 7. 27–7. 32 (1H, m), 7. 37–7. 44 (2H, m), 7. 50–7. 58 (4H, m)。

【1040】

参考例 80

4-(4-ジメチルアミノフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率79%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 48 (9H, s), 2. 87 (6H, s), 2. 96–3. 00 (4H, m), 3. 54–3. 59 (4H, m), 6. 72–6. 77 (2H, m), 6. 87–6. 92 (2H, m)。

【1041】

参考例 8 1

4- (3-ピリジル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率 99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 49 (9H, s), 3. 14-3. 19 (4H, m), 3. 57-3. 62 (4H, m), 7. 17-7. 19 (2H, m), 8. 12-8. 14 (1H, m), 8. 31-8. 33 (1H, m)。

【1042】

参考例 8 2

4- (4-エトキシカルボニルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率 42%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 37 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 1. 48 (9H, s), 3. 27-3. 32 (4H, m), 3. 56-3. 60 (4H, m), 4. 33 (2H, q, $J=7.1\text{ Hz}$), 6. 84-6. 88 (2H, m), 7. 92-7. 96 (2H, m)。

【1043】

参考例 8 3

4- (4-メチルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率 55%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 48 (9H, s), 2. 27 (3H, s), 3. 04-3. 09 (4H, m), 3. 55-3. 59 (4H, m), 6. 82-6. 87 (2H, m), 7. 06-7. 10 (2H, m)。

【1044】

参考例 8 4

4- (4-シアノフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率 86%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 49 (9H, s), 3. 28-3. 33 (4H, m), 3. 56-3. 60 (4H, m), 6. 83-6. 87 (2H, m), 7. 49-7. 53 (2H, m)。

【1045】

参考例 8 5

1- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジンの製造

参考例 77 で製造した 4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3. 8 g, 11. 5 ミリモル) を塩化メチレン (40 ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (10 ml) を滴下して加え室温で終夜攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で中和して塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して白色粉末の 1- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン (2. 5 g、収率 96%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3. 01-3. 06 (4H, m), 3. 21-3. 26 (4H, m), 6. 92 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7. 48 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$)。

【1046】

対応する出発原料を用い、参考例 8 5 と同様にして、参考例 8 6 ~ 参考例 8 9 の化合物を製造した。

【1047】

参考例 8 6

10

20

30

40

50

1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン

白色粉末、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.61 (1H, s), 3.00–3.05 (4H, m), 3.10–3.15 (4H, m), 6.85–6.92 (2H, m), 7.08–7.13 (2H, m)。

【1048】

参考例87

1-(4-ジメチルアミノフェニル)ピペラジン

白色粉末、収率99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.60 (1H, br), 2.86 (6H, s), 3.01 (8H, br), 6.71–6.78 (2H, m), 6.87–6.92 (2H, m)。

【1049】

参考例88

1-(3-ピリジル)ピペラジン

白色粉末、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.09 (1H, s), 3.03–3.09 (4H, m), 3.14–3.20 (4H, m), 7.16–7.18 (2H, m), 8.09–8.11 (1H, m), 8.31 (1H, s)。

【1050】

参考例89

1-(4-エトキシカルボニルフェニル)ピペラジン

白色粉末、収率95%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.37 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 1.84 (1H, s), 3.00–3.04 (4H, m), 3.26–3.31 (4H, m), 4.33 (2H, q, $J=7.1\text{ Hz}$), 6.83–6.89 (2H, m), 7.89–7.96 (2H, m)。

【1051】

参考例90

4-(ピペラジン-1-イル)安息香酸tert-ブチルエステルの製造

4-ブロモ安息香酸tert-ブチルエステル(4.8g、18.8ミリモル)、ピペラジン(9.7g、0.11モル)、酢酸パラジウム(85mg、0.38ミリモル)、(S)-(–)-BINAP(352mg、0.57ミリモル)及びtert-ブトキシナトリウム(2.7g、28.2ミリモル)をトルエン(50ml)中、窒素雰囲気下にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=5/1)により精製し、灰色粉末の4-(ピペラジン-1-イル)安息香酸tert-ブチルエステル(3.8g、収率77%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.57 (9H, s), 3.00–3.04 (4H, m), 3.24–3.29 (4H, m), 6.83–6.87 (2H, m), 7.85–7.89 (2H, m)。

【1052】

参考例91

ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造

4-トリフルオロメトキシベンジルアルコール(25g、130.11ミリモル)及びクロロギ酸フェニル(20.37g、130.11ミリモル)を酢酸エチル(125ml)に溶解し、3℃まで冷却した。ピリジン(11.6ml、143.12ミリモル)を

10

20

30

40

50

酢酸エチル（50 ml）に溶解した溶液を15℃以下にて35分かけて滴下した。同温度下にて30分攪拌した。反応液を水、3規定塩酸、10%炭酸カリウム水溶液、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、カーボネートを無色オイルとして得た。ピペラジン（33.62 g、390.34ミリモル）をメタノール（125 ml）に溶解し、3℃まで冷却した。そこへ先程のカーボネートを酢酸エチル（50 ml）に溶解した溶液を10℃以下にて25分かけて滴下した。同温度下にて1時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝10／1）により精製した。無色オイルのピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル（35.33 g、収率89%）を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.57–2.96 (4H, m), 3.42–3.63 (4H, m), 5.13 (2H, s), 7.21 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.39 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)

。

【1053】

参考例92

ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステルの製造

3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペン-1-オール（1 g、4.95ミリモル）、クロロギ酸フェニル（0.72 ml、5.69ミリモル）及び酢酸エチル（5 ml）の混合物に、氷冷下にてピリジン（0.5 ml、6.18ミリモル）を酢酸エチル（2 ml）に溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて1時間攪拌した。反応液を水、3規定塩酸、10%炭酸カリウム水溶液、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、カーボネートを無色オイルとして得た。ピペラジン（1.28 g、14.84ミリモル）をメタノール（5 ml）に溶解し、氷冷下にて先程のカーボネートを酢酸エチル（5 ml）に溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて2.5時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝10／1）により精製した。無色オイルのピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル（1.4 g、収率90%）を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.75–2.95 (4H, m), 3.43–3.57 (4H, m), 4.78 (2H, dd, $J=1.2\text{ Hz}$, 6.0 Hz), 6.33–6.43 (1H, m), 6.66 (1H, d, 16.0 Hz), 7.48 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.57 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$)。

【1054】

対応する出発原料を用い、参考例92と同様にして、参考例93の化合物を製造した。

【1055】

参考例93

ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルエステル

40

無色オイル、収率90%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.75–2.88 (4H, m), 3.44–3.52 (4H, m), 4.75 (2H, dd, $J=1.3\text{ Hz}$, 6.2 Hz), 6.29 (1H, dt, $J=6.2\text{ Hz}$, 15.9 Hz), 6.62 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.15–7.18 (2H, m), 7.38–7.42 (2H, m)。

【1056】

参考例94

4-(4-クロロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニル

50

クロリドの製造

4-(4-クロロフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン塩酸塩 (1 g、4.3ミリモル)、ピリジン (680 mg、8.6ミリモル)、トリホスゲン (430 mg、1.45ミリモル) 及びトルエン (20 ml) の混合物を3時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、ジエチルエーテルにより希釈した。10%塩酸、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルの4-(4-クロロフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド (1 g、収率90%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.51–2.72 (2H, m), 3.81–4.00 (2H, m), 4.26–4.40 (2H, m), 5.93–6.09 (1H, m), 7.16–7.35 (4H, m)。

【1057】

参考例95

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-オール

の製造
4-ブロモベンゾトリフルオリド (1 g、4.44ミリモル) をTHF (15 ml) に溶解し、 -70°C にてn-ブチルリチウム (1.5M) ヘキサン溶液 (3.1 ml、4.67ミリモル) を滴下した。同温度下にて1-ベンジル-4-ピペリドンをTHF (15 ml) に溶解した溶液を滴下し、2時間攪拌後、室温下にて2時間攪拌した。酢酸エチルにより希釈し、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) により精製し、白色粉末結晶の1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-オール (692 mg、収率46%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.60–1.78 (2H, m), 2.07–2.25 (2H, m), 2.38–2.54 (2H, m), 2.74–2.87 (2H, m), 3.59 (2H, s), 7.20–7.38 (5H, m), 7.51–7.67 (4H, m)。

【1058】

参考例96

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンの製造

参考例95で製造した1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-オール (692 mg、2.06ミリモル)、濃塩酸 (4.5 ml)、及び酢酸 (10 ml) の混合物を終夜、加熱還流した。反応液を室温に戻し、塩化メチレンにより希釈した。水、10%苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=4/1) により精製し、微黄色粉末結晶の1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン (528 mg、収率80%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.50–2.60 (2H, m), 2.62–2.76 (2H, m), 3.11–3.22 (2H, m), 3.65 (2H, s), 6.10–6.20 (1H, m), 7.20–7.54 (9H, m)。

【1059】

参考例97

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン塩酸塩の製造

参考例96で製造した1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン (2 g、6.3ミリモル) を塩化メチレン (20 ml) に溶解し、窒素雰囲気下、氷冷下にて2-クロロエチルクロロホルメート (1.67 g、11.68ミリモル) を滴下し、同温度下にて3時間攪拌した。メタノール (20 ml

10

20

30

40

50

）を加え、1時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、ジエチルエーテルを加え、析出する結晶を濾取することにより白色粉末結晶の4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン塩酸塩(1.44g、収率87%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

2.64-2.80 (2H, m), 3.18-3.34 (2H, m), 3.68-3.80 (2H, m), 6.25-6.39 (1H, m), 7.61-7.80 (4H, m)。

【1060】

参考例98

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリドの製造

参考例97で製造した4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン塩酸塩(300mg、1.14ミリモル)、ピリジン(0.18ml、2.28ミリモル)及びトリホスゲン(112mg、0.38ミリモル)を用い、参考例94と同様にして、黄色オイルの4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド(220mg、収率67%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.57-2.75 (2H, m), 3.82-4.00 (2H, m), 4.25-4.40 (2H, m), 6.05-6.16 (1H, m), 7.47 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 7.59 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$)。

【1061】

参考例99

4-(4-クロロフェニル)ピペリジン塩酸塩の製造

4-(4-クロロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン塩酸塩(2g、8.7ミリモル)をエタノール(100ml)に溶解し、酸化白金(100mg)を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテル処理することによって得られる結晶を濾取し、淡灰粉末の4-(4-クロロフェニル)ピペリジン塩酸塩(1.9g、収率94%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.75-1.95 (4H, m), 2.74-3.05 (3H, m), 3.25-3.44 (2H, m), 7.25 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.38 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【1062】

参考例100

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジンの製造

参考例96で製造した1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン(528mg、1.66ミリモル)を酢酸(5ml)に溶解し、10%パラジウム/炭素(50mg)を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、水、10%苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルの4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン(400mg、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.72-2.00 (4H, m), 2.61-2.84 (3H, m), 3.07-3.27 (2H, m), 7.32 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 7.56 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$)。

【1063】

参考例101

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

参考例100で製造した4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン(760

10

20

30

40

50

mg、3.32ミリモル)を用い、参考例94と同様にして、淡茶オイルの4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-カルボニルクロリド(粗製体)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.65–1.84 (2H, m), 1.86–2.02 (2H, m), 2.77–3.28 (3H, m), 4.42–4.60 (2H, m), 7.32 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.59 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$)。

【1064】

参考例102

2-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル]フタルイミドの製造
4-(トリフルオロメチル)シンナミルアルコール(3g、14.84ミリモル)をTHF(60ml)に溶解し、フタルイミド(2.84g、19.29ミリモル)及びトリフェニルホスフィン(5.84g、22.26ミリモル)を加え、アゾジカルボン酸ジエチル(3.87g、22.26ミリモル)をTHF(20ml)に溶解した溶液を徐々に滴下した。この混合物を室温下にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/塩化メチレン=1/1)により精製し、白色粉末の2-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル]フタルイミド(4.57g、収率93%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

4.47 (2H, dd, $J=1.2\text{ Hz}$, 6.3 Hz), 6.27–6.41 (1H, m), 6.68 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.44 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.54 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.74 (2H, dd, $J=2.0\text{ Hz}$, 7.0 Hz), 7.85 (2H, dd, $J=2.0\text{ Hz}$, 7.0 Hz)。

【1065】

参考例103

3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルアミンの製造

参考例102で製造した2-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル]フタルイミド(4.57g、13.79ミリモル)、ヒドラジン水和物(897mg、17.93ミリモル)及びエタノール(80ml)の混合物を3時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチルを加え、1規定苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、淡茶粉末結晶の3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルアミン(2.78g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.51 (2H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 6.31–6.47 (1H, m), 6.55 (1H, d, $J=16.0\text{ Hz}$), 7.45 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$)。

【1066】

参考例104

ピペラジン-1-イル-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン)アミンの製造

1-アミノピペラジン(29g、287ミリモル)をイソプロピルアルコール(173ml)に溶解し、5-クロロベンゾフラン-2-アルデヒド(34.52g、191ミリモル)を加え、室温下にて16時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し、黄色粉末結晶のピペラジン-1-イル-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン)アミン(49.49g、収率98%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.95–3.10 (4H, m), 3.17–3.29 (4H, m), 6.70 (1H, s), 7.20 (1H, dd, $J=2.1\text{ Hz}$, 8.7 Hz), 7.38–7.52 (3H, m)。

【1067】

10

20

30

40

50

参考例 105

ピペラジン-1-イル-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミンの製造

ピペラジン-1-イル-カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (403 mg、2.0 ミリモル) を塩化メチレン (4 ml) に懸濁し、トリフルオロ酢酸 (1.6 ml) を加え、室温で5分間攪拌した。反応混合液に4-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒド (0.3 ml、2.2 ミリモル) を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=9/1) により精製し、白色固体のピペラジン-1-イル-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミン (432 mg、収率84%) を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.00–3.29 (8H, m), 7.43–7.62 (3H, m), 7.68 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$)。

【1068】

参考例 106

ピペラジン-1-イル-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)アミンの製造

4-ベンジルピペラジン-1-イルアミン (43.18 g、225 ミリモル) にエタノール (400 ml) を加え、水酸化パラジウム/炭素 (6.50 g) のエタノール (30 ml) 懸濁液を加え、水素雰囲気下、室温で3時間、50℃で2時間攪拌した。反応混合液をセライト濾過し、濾液に4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアルデヒド (42.92 g、225 ミリモル) を加え、室温下にて1.5時間攪拌した。反応混合液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、微黄色粉末結晶のピペラジン-1-イル-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)アミン (56.88 g、収率93%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.00–3.23 (8H, m), 7.18 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.58 (1H, s), 7.62 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$)。

【1069】

対応する出発原料を用い、参考例106と同様にして、参考例107の化合物を製造した。

30

【1070】

参考例 107

ピペラジン-1-イル-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレン)アミン

微黄色粉末結晶、収率77%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.00–3.14 (4H, m), 3.23–3.32 (4H, m), 6.79 (1H, s), 7.41–7.59 (3H, m), 7.82 (1H, s)。

【1071】

参考例 108

(4-ベンジルピペラジン-1-イル)-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミンの製造

4-ブロモベンゾトリフルオリド (3.00 g、13.3 ミリモル)、4-ベンジルピペラジン-1-イルアミン (3.06 g、16.0 ミリモル)、酢酸パラジウム (60 mg、0.267 ミリモル)、(S)-(–)-BINAP (174 mg、0.280 ミリモル)、*tert*-ブトキシナトリウム (1.92 g、20.0 ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (60 ml) 中にて7時間加熱還流した。水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=4/1) により精製し、微黄色液体の(4-ベンジルピペラジン-1-イル)-(4-トリフル

40

50

オロメチルフェニル) アミン (2.666 g、収率59%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.58 (4H, br), 2.76 (4H, br), 3.55 (2H, s), 4.65 (1H, br), 6.90 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.23–7.35 (5H, m), 7.41 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$)。

【1072】

参考例109

ピペラジン-1-イル- (4-トリフルオロメチルフェニル) アミンの製造

参考例108で製造した (4-ベンジルピペラジン-1-イル) - (4-トリフルオロメチルフェニル) アミンをエタノール (50 ml) に溶解した。10%パラジウム/炭素 (0.53 g) を加え、水素雰囲気下、室温で6時間攪拌した。さらに60℃で10時間攪拌した。反応液をセライト濾過後、濾液に10%パラジウム/炭素 (0.53 g) を加え、水素雰囲気下、60℃で8時間攪拌した。10%パラジウム/炭素をセライトで濾去後、濾液を減圧下濃縮した。得られた固体を減圧乾燥し、無色固体のピペラジン-1-イル- (4-トリフルオロメチルフェニル) アミン (1.76 g、収率90%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.71 (4H, br), 3.00 (4H, t, $J=4.8\text{ Hz}$), 4.71 (1H, br), 6.92 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.42 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【1073】

参考例110

4- (3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.396 g、1.97ミリモル) をDMF (5 ml) に溶解し、水素化ナトリウム (0.086 g、2.16ミリモル) を加え室温1時間攪拌した。氷冷下、シンナミルクロリド (0.300 g、1.97ミリモル) を加え、室温まで昇温後、終夜攪拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=6/1) により精製し、黄色液体の4- (3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.314 g、収率50%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H, s), 1.48–1.59 (2H, m), 1.81–1.93 (2H, m), 3.01–3.15 (2H, m), 3.50–3.61 (1H, m), 3.74–3.87 (2H, m), 4.19 (2H, d, $J=5.9\text{ Hz}$), 6.29 (1H, dd, $J=5.9\text{ Hz}$, 5.9 Hz, 15.9 Hz), 6.61 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.18–7.43 (5H, m)。

【1074】

参考例111

4- (3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジンの製造

参考例110で製造した4- (3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.314 g、0.989ミリモル) をエタノール (10 ml) に溶解し、6規定塩酸 (3 ml、18ミリモル) を加え60℃で1時間攪拌した。反応液を水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性にした後、塩化メチレンで抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、減圧下乾燥することにより黄色液体の4- (3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン (0.198 g、収率92%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40–1.57 (2H, m), 1.91–2.02 (2H, m), 2.56–2.7

0 (2H, m), 3.12 (2H, ddd, $J=4.2\text{ Hz}$, 4.2 Hz , 12.8 Hz), 3.42–3.52 (1H, m), 4.19 (2H, d, $J=5.9\text{ Hz}$), 6.30 (1H, ddd, $J=5.9\text{ Hz}$, 5.9 Hz , 15.9 Hz), 6.57 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.20–7.43 (5H, m)。

【1075】

参考例112

4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.58 g、17.8ミリモル) を DMF (30 ml) に溶解し、水素化ナトリウム (0.71 g、17.8ミリモル) を加え室温2時間撹拌した。

10

【1076】

一方、4-クロロシンナミルアルコール (3.00 g、17.8ミリモル) を塩化メチレン (60 ml) に溶解し、トリエチルアミン (5 ml、35.6ミリモル) 及びメタンスルホニルクロライド (2.1 ml、26.7ミリモル) を氷冷下滴下し、室温で1.5時間撹拌した。水を加え塩化メチレンで抽出し、有機相を合わせ、塩酸水溶液、重曹水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を DMF 10 ml に溶解した。

【1077】

この溶液に、先に調整した DMF 溶液を氷冷下にて加え、室温まで昇温後、終夜撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=6/1) により精製し、黄色液体の4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.759 g、収率12%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H, s), 1.50–1.62 (2H, m), 1.83–1.94 (2H, m), 3.03–3.14 (2H, m), 3.53–3.58 (1H, m), 3.77–3.83 (2H, m), 4.17 (1H, d, $J=5.7\text{ Hz}$), 4.18 (1H, d, $J=5.7\text{ Hz}$), 6.27 (1H, ddd, $J=5.7\text{ Hz}$, 5.7 Hz , 15.9 Hz), 6.57 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.20–7.33 (4H, m)。

30

【1078】

参考例113

4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジンの製造

参考例112で製造した4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.350 g、0.995ミリモル) を用い、参考例111と同様にして、茶色液体の4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン (0.291 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.38–1.56 (2H, m), 1.91–2.01 (2H, m), 2.55–2.69 (2H, m), 3.11 (2H, ddd, $J=4.0\text{ Hz}$, 4.0 Hz , 13.0 Hz), 3.39–3.51 (1H, m), 4.18 (2H, d, $J=5.8\text{ Hz}$), 6.28 (1H, ddd, $J=5.8\text{ Hz}$, 5.8 Hz , 15.9 Hz), 6.57 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.25–7.35 (4H, m)。

40

【1079】

参考例114

4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

参考例112で製造した4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.37 g、1.05ミリモル)

50

）をエタノール（10 ml）に溶解し、酸化白金（37 mg）を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝4／1）により精製し、黄色液体の4-〔3-（4-クロロフェニル）プロポキシ〕ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（0.151 g、収率40%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40–1.51 (2H, m), 1.46 (9H, s), 1.77–1.90 (4H, m), 2.67 (2H, t, $J=7.9$ Hz), 3.02–3.12 (2H, m), 3.38–3.45 (3H, m), 3.73–3.79 (2H, m), 7.11 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.24 (2H, d, $J=8.4$ Hz)。

10

【1080】

参考例115

4-〔3-（4-クロロフェニル）プロポキシ〕ピペリジンの製造

参考例114で製造した4-〔3-（4-クロロフェニル）プロポキシ〕ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルを（0.151 g、0.427ミリモル）を塩化メチレン（4 ml）に溶解し、トリフルオロ酢酸を加え、室温で終夜攪拌した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性にした後、塩化メチレンで2回抽出した。有機相を合わせ飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、減圧下乾燥することにより茶色液体の4-〔3-（4-クロロフェニル）プロポキシ〕ピペリジン（0.109 g、収率92%）を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.35–1.51 (2H, m), 1.83–1.94 (4H, m), 2.54–2.70 (4H, m), 3.03–3.14 (2H, m), 3.22–3.38 (1H, m), 3.43 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 7.12 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.25 (2H, d, $J=8.4$ Hz)。

【1081】

参考例116

4-〔2-（4-クロロフェニル）エトキシ〕ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル

（4-クロロベンジル）-トリフェニル-ホスホニウムクロリド（1.191 g、2.81ミリモル）をDMSO（20 ml）に溶解し、氷冷下水素化ナトリウム（0.118 g、2.95ミリモル）を加え室温で1時間攪拌した。そこへ4-ホルミルオキシピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（0.500 g、2.34ミリモル）を加え、室温で終夜攪拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／ヘキサン＝9／1）により精製し、無色液体を得た。

30

【1082】

得られた液体を用い、参考例114と同様の方法により、無色液体の4-〔2-（4-クロロフェニル）エトキシ〕ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（0.127 g、収率16%）を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40–1.51 (2H, m), 1.45 (9H, s), 1.71–1.79 (2H, m), 2.83 (2H, t, $J=6.9$ Hz), 3.02–3.13 (2H, m), 3.38–3.44 (1H, m), 3.62–3.75 (4H, m), 7.15 (2H, d, $J=8.5$ Hz), 7.25 (2H, d, $J=8.5$ Hz)。

【1083】

参考例117

4-〔2-（4-クロロフェニル）エトキシ〕ピペリジンの製造

参考例116で製造した4-〔2-（4-クロロフェニル）エトキシ〕ピペリジン-1

50

ーカルボン酸 *tert*-ブチルエステル (0.127 g、0.374 ミリモル) を用い、参考例 115 と同様にして、無色液体の 4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ピペリジン (0.080 g、収率 89%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.37–1.48 (2H, m), 1.84–1.91 (2H, m), 2.53–2.63 (2H, m), 2.83 (2H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 3.01–3.09 (2H, m), 3.25–3.41 (1H, m), 3.64 (2H, t, $J=7.0\text{ Hz}$), 7.15 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.25 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$).

【1084】

参考例 118

10

1-(2-ニトロビニル)-4-トリフルオロメチルベンゼンの製造

4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド (3.00 g、17.2 ミリモル) をニトロメタン (10 ml) に溶解し、酢酸アンモニウム (1.341 g、17.4 ミリモル) を加え 2 時間過熱環流した。水を加え塩化メチレンで抽出し、有機相を合わせ飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (*n*-ヘキサン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色固体の 1-(2-ニトロビニル)-4-トリフルオロメチルベンゼン (1.596 g、収率 43%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7.58–7.74 (5H, m), 8.02 (1H, d, $J=13.8\text{ Hz}$).

20

【1085】

参考例 119

2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミンの製造

水素化リチウムアルミニウム (0.558 g、14.7 ミリモル) を THF (10 ml) に懸濁した。そこに参考例 118 で製造した 1-(2-ニトロビニル)-4-トリフルオロメチルベンゼン (1.596 g、7.35 ミリモル) を THF (10 ml) に溶解した溶液を氷冷下滴下し、2 時間加熱環流した。メタノールを発泡しなくなるまで徐々に加えた。水 (0.6 ml)、15% 水酸化ナトリウム水溶液 (0.6 ml)、水 (1.8 ml) の順に加え、析出物を濾去した。濾液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩基性シリカゲル、塩化メチレン/*n*-ヘキサン=4/1) により精製し、橙色液体の 2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミン (0.431 g、収率 31%) を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.81 (2H, t, $J=6.9\text{ Hz}$), 3.03 (2H, t, $J=6.9\text{ Hz}$), 7.32 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.56 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$).

【1086】

参考例 120

N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

参考例 119 で製造した 2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミン (0.431 g、2.28 ミリモル) 及び 1-ベンジル-4-ピペリドン (0.517 g、2.73 ミリモル) をメタノール (15 ml) に溶解し、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (0.429 g、6.83 ミリモル) 及び酢酸 (0.52 ml、9.11 ミリモル) を加え、室温で終夜攪拌した。減圧濃縮後、酢酸エチルで抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣をメタノール (5 ml) に溶解し、二炭酸ジ *tert*-ブチル (0.597 g、2.74 ミリモル) を加え室温で終夜攪拌した。酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (*n*-ヘキサン/酢酸エチル=3/1) により精製し、無色液体の N-(1-ベンジルピペリジン-4-

40

50

イル) -N- [2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(0.437g、収率41%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.55 (9H, s), 1.59-1.73 (4H, m), 1.90-2.10 (2H, m), 2.82-2.96 (4H, m), 3.24-3.28 (2H, m), 3.49 (2H, s), 4.00 (1H, bs), 7.26-7.31 (7H, m), 7.54 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$)。

【1087】

参考例121

N-(ピペリジン-4-イル)-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造 10

参考例120で製造したN-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(0.437g、0.944ミリモル)をエタノール(20ml)に溶解し、20%水酸化パラジウム/炭素(100mg)を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮することにより、無色液体のN-(ピペリジン-4-イル)-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(0.332g、収率94%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.49 (9H, s), 1.51-1.80 (4H, m), 2.62-3.49 (9H, m), 7.28-7.31 (2H, m), 7.54 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$)。 20

【1088】

参考例122

4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.88g、9.34ミリモル)をTHF(20ml)に溶解した。この溶液に、氷冷下、水素化ナトリウム(411mg、10.3ミリモル)を加え、1時間攪拌した。この混合物に4-(トリフルオロメチル)ベンジルブロミド(2.23g、9.34ミリモル)を加え、室温で2時間攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。この抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過して、得られた濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、淡黄色油状物質の4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.56g、収率76%)を得た。 30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H, s), 1.51-1.67 (2H, m), 1.83-1.91 (2H, m), 3.07-3.18 (2H, m), 3.52-3.63 (1H, m), 3.73-3.83 (2H, m), 4.61 (2H, m), 7.46 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 7.60 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$)。 40

【1089】

対応する出発原料を用い、参考例122と同様にして、参考例123の化合物を製造した。

【1090】

参考例123

4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

淡黄色油状物、収率74%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H, s), 1.51-1.65 (2H, m), 1.82-1.90 (2H, m), 3.06-3.17 (2H, m), 3.52-3.62 (1H, m), 3.73- 50

3. 83 (2H, m), 4. 54 (2H, s), 7. 17-7. 20 (2H, m), 7. 35-7. 38 (2H, m)。

【1091】

参考例124

4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジンの製造

参考例122で製造した4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.56g、7.12ミリモル)を塩化メチレン(20ml)に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸(10ml)を滴下して加え、5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、白色粉末の4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン(1.85g、収率99%)を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 46-1. 60 (2H, m), 1. 87 (1H, s), 1. 93-2. 01 (2H, m), 2. 58-2. 69 (2H, m), 3. 07-3. 16 (2H, m), 3. 43-3. 54 (1H, m), 4. 61 (2H, s), 7. 44-7. 48 (2H, m), 7. 57-7. 61 (2H, m)。

【1092】

対応する出発原料を用い、参考例124と同様にして、参考例125~128の化合物を製造した。

20

【1093】

参考例125

4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)ピペリジン

白色粉末、収率74%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 45-1. 60 (2H, m), 1. 92-2. 02 (2H, m), 2. 11 (1H, s), 2. 59-2. 70 (2H, m), 3. 07-3. 17 (2H, m), 3. 43-3. 54 (1H, m), 4. 55 (2H, s), 7. 17-7. 20 (2H, m), 7. 35-7. 40 (2H, m)。

【1094】

30

参考例126

4-(4-クロロベンジルオキシ)ピペリジン

白色粉末、収率94%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 39-1. 56 (3H, m), 1. 90-1. 99 (2H, m), 2. 55-2. 66 (2H, m), 3. 06-3. 11 (2H, m), 3. 39-3. 51 (1H, m), 4. 52 (2H, s), 7. 25-7. 33 (4H, m)。

【1095】

参考例127

4-(3, 4-ジクロロベンジルオキシ)ピペリジン

40

白色粉末、収率99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 45-1. 60 (2H, m), 1. 91-2. 01 (2H, m), 2. 19 (1H, s), 2. 59-2. 70 (2H, m), 3. 07-3. 16 (2H, m), 3. 42-3. 52 (1H, m), 4. 50 (2H, s), 7. 17 (1H, dd, $J=1.9\text{ Hz}$, 8.2 Hz), 7. 40 (1H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 7. 45 (1H, d, $J=1.9\text{ Hz}$)。

【1096】

参考例128

4-(4-フェニルベンジルオキシ)ピペリジン

50

白色粉末、収率16%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45–1.60 (2H, m), 1.72 (1H, s), 1.95–2.02 (2H, m), 2.57–2.68 (2H, m), 3.07–3.16 (2H, m), 3.45–3.56 (1H, m), 4.60 (2H, s), 7.25–7.60 (9H, m)。

【1097】

参考例129

(1-ベンジルピペリジン-4-イル) - (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミンの製造

1-ブロモ-4-トリフルオロメトキシベンゼン (2.0 g、8.3ミリモル)、4-アミノ-1-ベンジルピペリジン (1.73 g、9.13ミリモル)、酢酸パラジウム (37 mg、0.17ミリモル)、(R) - (+) - BINAP (155 mg、0.25ミリモル) 及び *tert*-ブトキシナトリウム (1.2 g、11.6ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (30 ml) 中にて5時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、黒色油状物質の (1-ベンジルピペリジン-4-イル) - (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミン (3.0 g、収率99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.39–1.55 (2H, m), 1.98–2.05 (2H, m), 2.09–2.20 (2H, m), 2.80–2.89 (2H, m), 3.21–3.28 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.52–3.59 (1H, m), 6.48–6.55 (2H, m), 6.98–7.02 (2H, m), 7.22–7.33 (5H, m)。

【1098】

参考例130

ピペリジン-4-イル - (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミンの製造

(1-ベンジルピペリジン-4-イル) - (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミン (3.0 g、8.3ミリモル) をエタノール (30 ml) に溶解し、10%パラジウム/炭素を触媒量加え、水素雰囲気下20時間加熱還流した。反応液をセライト濾過し、得られた濾液を減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、無色固体のピペリジン-4-イル - (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミン (2.02 g、収率94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.24–1.39 (2H, m), 2.03–2.08 (2H, m), 2.65–2.77 (2H, m), 3.08–2.16 (2H, m), 3.24–3.41 (1H, m), 3.59 (1H, br), 6.50–6.58 (2H, m), 6.99–7.03 (2H, m)。

【1099】

参考例131

4-(4-クロロフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

p-ブロモクロロベンゼン (1.91 g、9.99ミリモル)、4-アミノピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.0 g、9.99ミリモル)、酢酸パラジウム (45 mg、0.2ミリモル)、(R) - (+) - BINAP (187 mg、0.3ミリモル) 及び *tert*-ブトキシナトリウム (1.35 g、14.0ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (20 ml) 中にて1時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10

0/1)により精製し、黄色粉末の4-(4-クロロフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.67g、収率86%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.21-1.54 (2H, m), 1.46 (9H, s), 1.99-2.05 (2H, m), 2.85-2.97 (2H, m), 3.37 (1H, br), 3.51 (1H, br), 4.01-4.07 (2H, m), 6.48-6.54 (2H, m), 7.07-7.14 (2H, m)。

【1100】

対応する出発原料を用い、参考例131と同様にして、参考例132～参考例133の化合物を製造した。

10

【1101】

参考例132

4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

黄色粉末、収率93%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.21-1.58 (2H, m), 1.47 (9H, s), 2.00-2.06 (2H, m), 2.88-2.99 (2H, m), 3.47 (1H, br), 3.88 (1H, bs), 4.03-4.09 (1H, m), 6.56 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.39 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$)。

20

【1102】

参考例133

4-(4-シアノフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

黄色粉末、収率92%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.26-1.54 (2H, m), 1.47 (9H, s), 1.99-2.05 (2H, m), 2.87-2.99 (2H, m), 3.41-3.53 (1H, br), 4.02-4.14 (3H, m), 6.52-6.58 (2H, m), 7.39-7.45 (2H, m)。

30

【1103】

参考例134

4-(4-クロロフェニルアミノ)ピペリジンの製造

参考例131で製造した4-(4-クロロフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.67g、8.59ミリモル)を塩化メチレン(20ml)に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸(15ml)を滴下して加え、5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリとし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、微黄色粉末の4-(4-クロロフェニルアミノ)ピペリジン(1.76g、収率97%)を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.22-1.38 (2H, m), 2.02-2.07 (2H, m), 2.65-2.76 (2H, m), 3.08-3.16 (2H, m), 3.25-3.38 (1H, m), 3.50-3.54 (1H, m), 6.48-6.55 (2H, m), 7.06-7.26 (2H, m)。

【1104】

対応する出発原料を用い、参考例134と同様にして、参考例135～136の化合物を製造した。

【1105】

参考例135

50

4- (4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン

黄色粉末、収率97%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.26-1.42 (2H, m), 2.04-2.09 (2H, m), 2.67-2.78 (2H, m), 3.09-3.17 (2H, m), 3.34-3.46 (1H, m), 3.86-3.90 (1H, m), 6.59 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.38 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$)。

【1106】

参考例136

4- (4-シアノフェニルアミノ) ピペリジン

10

黄色粉末、収率98%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.27-1.45 (2H, m), 2.02-2.07 (2H, m), 2.67-2.78 (2H, m), 3.09-3.17 (2H, m), 3.34-3.46 (1H, m), 4.09-4.13 (1H, m), 6.51-6.57 (2H, m), 7.38-7.44 (2H, m)。

【1107】

参考例137

4- (トルエン-4-スルホニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

20

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.22 g、10.0ミリモル) をアセトニトリル (40 ml) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン (2.74 ml、19.7ミリモル) 及びN, N, N', N'-テトラメチル-1, 6-ジアミノヘキサン (0.57 ml、2.64ミリモル) を加えて氷冷した。この混合物に、p-トルエンスルホニルクロリド (2.75 g、14.4ミリモル) を加え、室温まで昇温しつつ終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、淡黄色粉末の4- (トルエン-4-スルホニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (4.16 g、収率89%) を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.44 (9H, s), 1.64-1.82 (4H, m), 2.44 (3H, s), 3.19-3.30 (2H, m), 3.54-3.64 (2H, m), 4.63-4.72 (1H, m), 7.31-7.37 (2H, m), 7.78-7.82 (2H, m)。

【1108】

参考例138

4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4- (トリフルオロメトキシ) チオフェノール (2.0 g、10.3ミリモル) をTHF (30 ml) に溶解して氷冷した。水素化ナトリウム (453 mg、11.3ミリモル) を加え30分攪拌した後、参考例137で製造した4- (トルエン-4-スルホニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.66 g、10.3ミリモル) を加えて30分間室温で攪拌し、その後1時間加熱還流した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過して、得られた濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製した。無色油状物質の4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.12 g、収率80%) を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45 (9H, s), 1.46-1.60 (2H, m), 1.87-1.95 (2H,

50

m), 2.86–2.98 (2H, m), 3.14–3.23 (1H, m), 3.94–4.00 (2H, m), 7.13–7.17 (2H, m), 7.40–7.47 (2H, m)。

【1109】

参考例139

4-(4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル)ピペリジンの製造

参考例138で製造した4-(4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルを用い、参考例134と同様にして、無色油状物質の4-(4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル)ピペリジン(収率92%)を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.43–1.59 (2H, m), 1.91–1.98 (2H, m), 2.59–2.70 (2H, m), 3.06–3.20 (3H, m), 7.12–7.16 (2H, m), 7.40–7.46 (2H, m)。

【1110】

参考例140

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

トリフェニルー(4-トリフルオロメトキシベンジル)ホスホニウムブロミド(2.0g、3.87ミリモル)をDMSOに溶解し、水素化ナトリウムを加え30分間攪拌した。4-オキソピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(700mg、3.51ミリモル)を加え、60℃で2時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、白色固体を得た。

20

【1111】

この白色固体をメタノールに溶解し、10%Pd-Cを触媒量加え、水素雰囲気下、室温にて3時間攪拌した。反応液を濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮することにより無色油状物質の4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.28g、収率60%)を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.06–1.21 (2H, m), 1.45 (9H, s), 1.57–1.70 (3H, m), 2.52–2.69 (4H, m), 4.08 (2H, br), 7.09–7.17 (4H, m)。

【1112】

参考例141

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジンの製造

参考例140で製造した4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルを用い、参考例134と同様にして、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジンを製造した。

40

無色固体、収率99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.06–1.22 (2H, m), 1.50 (1H, s), 1.53–1.68 (3H, m), 2.48–2.60 (4H, m), 3.02–3.08 (2H, m), 7.09–7.17 (4H, m)。

【1113】

参考例142

1-ベンジルー4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)ピペリジンの製造

トリフェニルー(4-トリフルオロメトキシベンジル)-ホスホニウムブロミド(21.6g、41.75ミリモル)をDMSOに溶解し、水素化ナトリウム(1.82g、4

50

5. 52ミリモル)を加え、30分間攪拌した。1-ベンジル-4-ピペリドン(7.18g、37.96ミリモル)を加え、60℃で2時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、黄色油状物質の1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)ピペリジン(9.75g、収率74%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.36–2.55 (8H, m), 3.53 (2H, s), 6.23 (1H, s), 7.11–7.34 (9H, m)。

10

【1114】

対応する出発原料を用い、参考例142と同様にして、参考例143の化合物を製造した。

【1115】

参考例143

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)ピペリジン

黄色油状物、収率52%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.38–2.57 (8H, m), 3.53 (2H, s), 6.28 (1H, m), 7.24–7.56 (9H, m)。

20

【1116】

参考例144

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジンの製造(参考例141の化合物の別途合成法)

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)ピペリジン(9.7g、27.92ミリモル)をエタノール(100ml)に溶解し、6規定塩酸(9.3ml)を加え氷冷した。10%パラジウム/炭素(970mg)を加え水素雰囲気下、50℃にて5時間攪拌した。反応液をセライト濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣に水、10%水酸化ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮して無色固体の4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン(6.77g、収率94%)を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.06–1.22 (2H, m), 1.50 (1H, s), 1.53–1.68 (3H, m), 2.48–2.60 (4H, m), 3.02–3.08 (2H, m), 7.09–7.17 (4H, m)。

【1117】

対応する出発原料を用い、参考例144と同様にして、参考例145及び参考例146の化合物を製造した。

【1118】

40

参考例145

4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン

白色固体、収率94%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.06–1.29 (2H, m), 1.50–1.69 (4H, m), 2.48–2.60 (4H, m), 3.02–3.09 (2H, m), 7.23–7.29 (2H, m), 7.51–7.54 (2H, m)。

【1119】

参考例146

4-(4-クロルベンジル)ピペリジン

50

白色固体、収率94%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.07–1.21 (2H, m), 1.53–1.82 (4H, m), 2.47–2.59 (4H, m), 3.02–3.08 (2H, m), 7.04–7.08 (2H, m), 7.22–7.27 (2H, m)。

【1120】

参考例147

1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸N-メチル-N-メトキシアミドの製造

1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸塩酸塩 (21g、82.3ミリモル) をクロロホルムに懸濁し、室温下DMF (1ml) 及び塩化チオニル (30ml) を加え、2時間加熱還流した。これを減圧下濃縮し、酸クロリドを調整した。

10

【1121】

別の容器にN, O-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (12g、0.12モル) をアセトン (200ml) - 水 (20ml) に溶解し、炭酸カリウム (34.12g、246.9ミリモル) を加え、氷冷下撹拌した。そこへ先の酸クロリドのアセトン溶液 (120ml) を滴下して加え、室温で2時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、水を加え塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮することにより茶色油状物質の1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸N-メチル-N-メトキシアミド (16.8g、収率78%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.65–1.92 (4H, m), 1.97–2.07 (2H, m), 2.62–2.68 (1H, m), 2.91–2.96 (2H, m), 3.17 (3H, s), 3.51 (2H, s), 3.69 (3H, s), 7.20–7.32 (5H, m)。

20

【1122】

参考例148

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジンの製造

1-ブロモ-4-トリフルオロメトキシベンゼン (5.3g、22.0ミリモル) を窒素雰囲気下、乾燥THF (70ml) に溶解し、 -60°C に冷却し撹拌した。n-ブチルリチウム (1.6M) ヘキサン溶液 (15ml、24.0ミリモル) を滴下して加え、 -30°C まで昇温しつつ1時間撹拌した。再び -60°C に冷却し、参考例147で製造した1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸N-メチル-N-メトキシアミド (4.1g、15.6ミリモル) のTHF (10ml) 溶液を滴下して加え、同温で1時間、 0°C で3時間撹拌した。反応液を氷-飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1) により精製し、淡黄色油状物質の1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジン (4.8g、収率85%) を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.80–1.89 (4H, m), 2.04–2.18 (2H, m), 2.94–3.01 (2H, m), 3.15–3.24 (1H, m), 3.55 (2H, s), 7.19–7.34 (7H, m), 7.95–8.01 (2H, m)。

40

【1123】

対応する出発原料を用い、参考例148と同様にして、参考例149の化合物を製造した。

【1124】

参考例149

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペリジン

淡黄色油状物、収率66%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.78–1.89 (4H, m), 2.09–2.19 (2H, m), 2.94–3.0

50

2 (2H, m), 3.16–3.29 (1H, m), 3.55 (2H, m), 7.26–7.34 (5H, m), 7.70–7.74 (2H, m), 8.00–8.04 (2H, m)。

【1125】

参考例150

4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジンの製造

参考例148で製造した1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジン(4.8g、13.22ミリモル)を塩化メチレン(60ml)に溶解し氷冷した。クロロギ酸1-クロロエチル(2.9ml、26.4ミリモル)を滴下して加え同温にて30分撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮して残渣にメタノール(100ml)を加え、15分加熱還流した。反応液に水を加え30分撹拌して、水酸化ナトリウムでアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、淡橙色固体の4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジン(1.3g、収率36%)を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.57–1.88 (5H, m), 2.71–2.81 (2H, m), 3.15–3.23 (2H, m), 3.29–3.42 (1H, m), 7.27–7.28 (2H, m), 7.95–8.05 (2H, m)。

【1126】

20

対応する出発原料を用い、参考例150と同様にして、参考例151及び参考例152の化合物を製造した。

【1127】

参考例151

4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペリジン
白色固体、収率68%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.61–1.76 (3H, m), 1.82–1.89 (2H, m), 2.72–2.83 (2H, m), 3.16–3.24 (2H, m), 3.32–3.44 (1H, m), 7.72–7.76 (2H, m), 8.01–8.05 (2H, m)。

30

【1128】

参考例152

4-(4-クロルベンゾイル)ピペリジン
白色固体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.60–1.84 (5H, m), 2.72–2.83 (2H, m), 3.16–3.24 (2H, m), 3.30–3.40 (1H, m), 7.41–7.47 (2H, m), 7.85–7.91 (2H, m)。

【1129】

参考例153

40

N-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジーン-1-イル]エチル}フタルイミドの製造

1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン(5.2g、22.59ミリモル)、N-(2-ブromoエチル)フタルイミド(5.22g、20.53ミリモル)及び炭酸カリウム(3.36g、24.28ミリモル)をDMF(30ml)中100℃で2時間撹拌した。反応液を冷却して水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=50/1)により分離精製し、得られた結晶をメタノールにより洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末のN-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジーン-1-イル]

50

エチル} フタルイミド (4.85 g、収率53%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.64–2.72 (6H, m), 3.18–3.23 (4H, m), 3.86 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 6.89 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.45 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.70–7.75 (2H, m), 7.81–7.86 (2H, m)

。

【1130】

参考例154

2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチルアミンの製造

参考例153で製造したN-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチル}フタルイミド(4g、9.92ミリモル)をエタノール(30ml)に懸濁し、ヒドラジン1水和物(0.53ml、10.91ミリモル)を加え、加熱還流して5時間攪拌した。反応液を冷却して析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=100/1)により分離精製して、白色結晶の2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチルアミン(2.87g、収率100%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.33 (2H, bs), 2.49 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.59–2.63 (4H, m), 2.84 (2H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 3.26–3.31 (4H, m), 6.92 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.48 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$)。

【1131】

参考例155

N-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチル}ホルムアミドの製造

参考例154で製造した2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチルアミン(906mg、3.32ミリモル)をギ酸エチル(10ml)中、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製して、白色粉末のN-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチル}ホルムアミド(942mg、収率94%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.53–2.65 (6H, m), 3.26–3.31 (4H, m), 3.42–3.49 (2H, m), 6.05 (1H, bs), 6.92 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.49 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.21 (1H, s)。

【1132】

参考例156

N-メチル-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチルアミンの製造

水素化リチウムアルミニウム(237mg、6.25ミリモル)をTHF(20ml)に懸濁し、氷冷下攪拌した。そこへ参考例155で製造したN-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチル}ホルムアミド(942mg、3.13ミリモル)のTHF(10ml)溶液を滴下して加え、室温で2時間攪拌後、2時間加熱還流した。反応液を冷却して水、15%水酸化ナトリウム水溶液を注意深く加え反応を終了させた。硫酸ナトリウムを加え激しく攪拌して、セライト濾過した。濾液を減圧濃縮して、黄色油状物質のN-メチル-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]エチルアミン(900mg、収率100%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.47 (3H, s), 2.52–2.74 (8H, m), 3.26–3.30 (4H, m), 3.71–3.77 (1H, m), 6.91 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.

4.7 (2H, d, $J = 8.7$ Hz)。

【1133】

参考例157

4-(2-メチルアミノエチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-(2-クロロエチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.13 g、12.58 mmol) をメタノール (20 ml) に溶解し、メチルアミンメタノール溶液 (30 ml) を加え、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで希釈して飽和炭酸水素ナトリウムで洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮して、微黄色油状物質の4-(2-メチルアミノエチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.0 g、収率98%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H, m), 1.66 (1H, s), 2.36–2.41 (4H, m), 2.45 (3H, s), 2.46–2.53 (2H, m), 2.65–2.70 (2H, m), 3.40–3.44 (4H, m)。

【1134】

参考例158

N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]フタルイミドの製造

N-(2-ヒドロキシエチル)フタルイミド (3.59 g、18.75 mmol)、4-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (3.04 g、18.75 mmol)、アゾジカルボン酸ジエチル (4.37 ml、28.13 mmol) 及びトリフェニルホスフィン (7.38 g、28.13 mmol) をTHF (50 ml) に溶解して室温にて終夜攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクログラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル = 5/1) により精製した。白色結晶のN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]フタルイミド (4.05 g、収率69%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

4.11–4.16 (2H, m), 4.25–4.30 (2H, m), 6.92–6.96 (2H, m), 7.48–7.52 (2H, m), 7.72–7.77 (2H, m), 7.83–7.89 (2H, m)。

【1135】

参考例159

2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチルアミンの製造

参考例158で製造したN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]フタルイミドを用い、参考例154と同様にして、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチルアミンを得た。

無色油状物、収率95%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.36 (2H, s), 3.11 (2H, t, $J = 5.1$ Hz), 4.03 (2H, t, $J = 5.1$ Hz), 6.97 (2H, d, $J = 8.6$ Hz), 7.54 (2H, d, $J = 8.6$ Hz)。

【1136】

参考例160

N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]ホルムアミドの製造

参考例159で製造した2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチルアミン (1.38 g、6.72 mmol) をギ酸エチル (10 ml) 中、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 100/1) により分離精製して、白色粉末のN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]ホルムアミド (1.51 g、収率97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3. 72–3. 78 (2H, m), 4. 09–4. 13 (2H, m), 6. 02 (1H, bs), 6. 96 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7. 56 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 8. 24 (1H, s)。

【1137】

参考例161

N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミンの製造

参考例160で製造したN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]ホルムアミド(2.02g、8.66ミリモル)をTHF(20ml)に溶解した。氷冷下ボラン-THF錯体1M溶液(21.7ml、21.7ミリモル)を滴下して加え、終夜攪拌した。反応液を冷却して水、6N塩酸を加え20分攪拌した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性として塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製することにより、白色粉末のN-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミン(1.05g、収率55%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2. 68 (3H, d, $J=5.8\text{ Hz}$), 3. 05–3. 28 (2H, m), 4. 06 (1H, br), 4. 10–4. 18 (1H, m), 4. 45–4. 54 (1H, m), 6. 98 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7. 58 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【1138】

参考例162

N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]アミンの製造

1-(2-ブロモエトキシ)-4-トリフルオロメトキシベンゼン(2.2g、7.72ミリモル)をメタノール(20ml)に溶解し、40%メチルアミンメタノール溶液(20ml)を加え、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで希釈して飽和炭酸水素ナトリウムで洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮して、微黄色油状物質のN-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]アミン(1.44g、収率79%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 54 (1H, s), 2. 51 (3H, s), 2. 97 (2H, t, $J=5.1\text{ Hz}$), 4. 06 (2H, t, $J=5.1\text{ Hz}$), 6. 85–6. 92 (2H, m), 7. 10–7. 17 (2H, m)。

【1139】

参考例163

N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミンの製造

1-(2-ブロモエトキシ)-4-(トリフルオロメチル)ベンゼンを用い、参考例162と同様にして、N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミンを製造した。

白色粉末、収率82%。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2. 68 (3H, d, $J=5.8\text{ Hz}$), 3. 02–3. 28 (2H, m), 3. 92–4. 18 (2H, m), 4. 41–4. 54 (1H, m), 6. 98 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7. 58 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【1140】

参考例164

N, N'-ジメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2-エチレンジアミンの製造

4-ブロモベンゾトリフルオリド(3.0g、13.3ミリモル)、N, N'-ジメチルエチレンジアミン(9.4g、0.11モル)、酢酸パラジウム(60mg、0.27ミリモル)、BINAP(250mg、0.40ミリモル)及びtert-ブトキシナト

10

20

30

40

50

リウム (1.80 g、18.7ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (20 ml) 中にて3時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、淡黄色油状物質の N, N'-ジメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2-エチレンジアミン (650 mg、収率21%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.53 (1H, s), 2.47 (3H, s), 2.82 (2H, t, $J=6.7\text{ Hz}$), 3.02 (3H, s), 3.52 (2H, t, $J=6.7\text{ Hz}$), 6.74 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 7.43 (2H, d, $J=8.8\text{ Hz}$)。

10

【1141】

参考例165

N-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

p-プロモクロロベンゼン (3.13 g、16.3ミリモル)、(ピペリジン-4-イル)-N-メチルカルバミン酸 tert-ブチルエステル (3.5 g、10.8ミリモル)、酢酸パラジウム (73 mg、0.33ミリモル)、(S)-(-)-BINAP (305 mg、0.49ミリモル) 及び tert-ブトキシナトリウム (2.2 g、22.9ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (30 ml) 中にて3時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) により精製し、黄色粉末の N-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸 tert-ブチルエステル (4.7 g、収率89%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.47 (9H, s), 1.70-1.90 (4H, m), 2.73-2.82 (2H, m), 2.74 (3H, s), 3.64-3.71 (2H, m), 4.08 (1H, br), 6.81-6.87 (2H, m), 7.15-7.22 (2H, m)。

30

【1142】

対応する出発原料を用い、参考例165と同様にして、参考例166～参考例168の化合物を製造した。

【1143】

参考例166

N-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸 tert-ブチルエステル

収率88%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.48 (9H, s), 1.72-1.91 (4H, m), 2.76 (3H, s), 2.79-2.85 (2H, m), 3.67-3.73 (2H, m), 4.10 (1H, br), 6.86-6.93 (2H, m), 7.07-7.11 (2H, m)。

40

【1144】

参考例167

N-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

収率91%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.47 (9H, s), 1.72-1.87 (4H, m), 2.74 (3H, s), 2.82-2.94 (2H, m), 3.83-3.89 (2H, m), 4.12 (1H, br)

50

), 6.92 (2H, d, J = 8.7 Hz), 7.46 (2H, d, J = 8.7 Hz)。

【1145】

参考例168

N-[1-(4-シアノフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

収率73%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.47 (9H, s), 1.69-1.77 (4H, m), 2.73 (3H, s), 2.87-3.00 (2H, m), 3.89-3.97 (2H, m), 4.16 (1H, br), 6.84-6.89 (2H, m), 7.45-7.51 (2H, m)。

10

【1146】

参考例169

N-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミンの製造

参考例165で製造したN-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸 tert-ブチルエステル (4.71g、14.5ミリモル) を塩化メチレン (30ml) に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸 (20ml) を滴下して加え、5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解し、水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、薄茶色粉末のN-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン (3.1g、収率95%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.99 (1H, s), 1.38-1.54 (2H, m), 1.95-2.00 (2H, m), 2.44-2.54 (1H, m), 2.46 (3H, s), 2.71-2.82 (2H, m), 3.55-3.63 (2H, m), 6.81-6.87 (2H, m), 7.14-7.21 (2H, m)。

【1147】

対応する出発原料を用い、参考例169と同様にして、参考例170～参考例172の化合物を製造した。

【1148】

30

参考例170

N-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン

薄茶色粉末、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.96 (1H, s), 1.39-1.55 (2H, m), 1.96-2.02 (2H, m), 2.44-2.57 (1H, m), 2.47 (3H, s), 2.73-2.84 (2H, m), 3.58-3.66 (2H, m), 6.86-6.92 (2H, m), 7.05-7.10 (2H, m)。

【1149】

40

参考例171

N-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン

薄茶色粉末、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.96 (1H, s), 1.36-1.52 (2H, m), 1.96-2.02 (2H, m), 2.47 (3H, s), 2.50-2.62 (1H, m), 2.82-2.94 (2H, m), 3.72-3.80 (2H, m), 6.92 (2H, d, J = 8.8 Hz), 7.45 (2H, d, J = 8.8 Hz)。

【1150】

50

参考例 172

N-〔1-(4-シアノフェニル)ピペリジン-4-イル〕-N-メチルアミン

薄茶色粉末、収率99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.05 (1H, s), 1.34-1.49 (2H, m), 1.95-2.02 (2H, m), 2.47 (3H, s), 2.55-2.67 (1H, m), 2.90-3.01 (2H, m), 3.76-3.84 (2H, m), 6.82-6.90 (2H, m), 7.43-7.50 (2H, m)。

【1151】

参考例 173

N-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸ベンジルエステルの製造

2-メタリルアミン塩酸塩 (21.52 g、0.2モル) を水 (200 ml) に溶解し、クロロギ酸ベンジル (37.53 g、0.22モル) を加え氷冷した。炭酸ナトリウム (46.63 g、0.44モル) を少しずつ加え、3時間室温で攪拌した。塩化メチレンにより2回抽出後、有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=7/1) により精製し、無色液体のN-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸ベンジルエステル (41.58 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.74 (3H, s), 3.75 (2H, d, $J=6.2\text{ Hz}$), 4.69-4.94 (2H, m), 5.13 (2H, s), 7.26-7.39 (5H, m)。

【1152】

参考例 174

N-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステルの製造

4-クロロベンジルアルコール (3.00 g、21.0ミリモル) 及びトリホスゲン (3.12 g、10.5ミリモル) をトルエン (15 ml) に溶解し、氷冷下N-エチルジイソプロピルアミン (3.6 ml、21.0ミリモル) を加え、1時間攪拌した。塩化メチレンと水を加え抽出し、有機相を合わせ硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣に水 (40 ml)、2-メタリルアミン塩酸塩 (2.49 g、23.1ミリモル) を加え、氷冷下炭酸ナトリウム (5.15 g、48.6ミリモル) を加え15分攪拌した。塩化メチレンを加えて抽出し、有機相を合わせ、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=10/1) により精製し、無色液体のN-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステル (4.06 g、収率80%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.74 (3H, s), 3.74 (2H, d, $J=5.8\text{ Hz}$), 4.73-4.91 (2H, m), 5.08 (2H, s), 7.26-7.41 (4H, m)。

【1153】

参考例 175

N-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステルの製造

4-フルオロベンジルアルコール (3.00 g、23.8ミリモル) をTHF (60 ml) に溶解し、氷冷下1,1'-カルボニルジイミダゾール (4.05 g、25.0ミリモル) を加え30分攪拌した。2-メタリルアミン塩酸塩 (2.81 g、26.2ミリモル)、トリエチルアミン (3.98 g、28.5ミリモル) を加え、氷冷下2時間攪拌した。減圧濃縮後、塩化メチレンと水を加えて抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を減圧下濃縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=10/1) で精製し、無色液体のN-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル (4.69 g、収率88%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

10

20

30

40

50

1. 73 (3H, s), 3. 74 (2H, d, $J=5.8$ Hz), 4. 55–4. 95 (3H, m), 5. 08 (2H, s), 6. 95–7. 14 (2H, m), 7. 27–7. 41 (2H, m)。

【1154】

参考例176

3-メトキシメトキシ-2-メチル-1-プロペンの製造

2-メチル-2-プロペン-1-オール (50 g、693ミリモル) のTHF (500 ml) 溶液に氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエーテル (105 ml、1386ミリモル) とN-エチルジイソプロピルアミン (265 ml、1525ミリモル) を加え、室温で2時間攪拌した。反応混合液を濾過し、ジエチルエーテルで洗浄し、濾液を減圧濃縮した。残渣をジエチルエーテルに溶解し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して、無色液体の3-メトキシメトキシ-2-メチル-1-プロペン (9. 7 g、収率12%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 76 (3H, s), 3. 39 (3H, s), 3. 97 (2H, s), 4. 65 (2H, s), 4. 85–4. 94 (1H, m), 4. 98–5. 06 (1H, m)。

【1155】

参考例177

2-メトキシメトキシメチル-2-メチルオキシランの製造

参考例176で製造した3-メトキシメトキシ-2-メチルプロペン (9. 7 g、84ミリモル) の塩化メチレン (200 ml) 溶液に、m-クロロ過安息香酸 (22. 7 g、92ミリモル) を氷冷攪拌下、少量ずつ加え、室温下6時間攪拌後、炭酸水素ナトリウム (14. 1 g、168ミリモル) 及び塩化メチレンを加え、攪拌した。分液し、炭酸水素ナトリウム水溶液、チオ硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して、緑色液体の2-メトキシメトキシメチル-2-メチルオキシラン (6. 8 g、収率62%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 40 (3H, s), 2. 65 (1H, d, $J=4.9$ Hz), 2. 78 (1H, d, $J=4.9$ Hz), 3. 38 (3H, s), 3. 53 (1H, d, $J=11.1$ Hz), 3. 62 (1H, d, $J=11.1$ Hz), 4. 65 (2H, s)。

【1156】

参考例178

4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (1. 5 g、8. 05ミリモル) のDMF (10 ml) 溶液に、炭酸カリウム (1. 45 g、10. 47ミリモル) 及び4-クロロベンジルクロリド (1. 82 g、8. 86ミリモル) を加え、50℃で1時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、無色液体の4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (2. 50 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 45 (9H, s), 2. 36 (4H, t, $J=5.0$ Hz), 3. 42 (4H, t, $J=5.0$ Hz), 3. 46 (2H, s), 7. 23–7. 31 (4H, m)。

【1157】

参考例179

1-(4-クロロベンジル) ピペラジンの製造

参考例178で製造した4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (2. 50 g、8. 05ミリモル) の塩化メチレン (16 ml) 溶液にトリフルオロ酢酸 (8 ml) を加え、室温で5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した

。残渣に苛性ソーダ水溶液を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を濃縮し、無色液体の1-(4-クロロベンジル)ピペラジン(1.70 g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

2.55–2.74 (4H, m), 3.57–3.76 (6H, m), 7.35–7.45 (4H, m), 8.55–8.88 (1H, br)。

【1158】

参考例180

1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジンの製造

4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルを用い、参考例179と同様にして、1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジンを製造した。

10

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.72 (4H, t, $J=4.9\text{ Hz}$), 3.16–3.26 (4H, m), 3.62 (2H, s), 7.44 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.59 (2H, d, $J=8.1\text{ Hz}$)。

【1159】

参考例181

1-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジンの製造

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルを用い、参考例179と同様にして、1-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジンを製造した。

20

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.70 (4H, t, $J=4.9\text{ Hz}$), 3.19 (4H, t, $J=4.9\text{ Hz}$), 3.56 (2H, s), 7.17 (2H, d, $J=7.9\text{ Hz}$), 7.33 (2H, d, $J=7.9\text{ Hz}$)。

【1160】

参考例182

4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノールの製造

4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン(3 g、16.8ミリモル)及び4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド(3.36 g、17.7ミリモル)をメタノール(60 ml)及び塩化メチレン(15 ml)に溶解した。この溶液に、氷冷下、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(1.59 g、25.3ミリモル)及び酢酸(1.6 ml)を加え、室温まで昇温させ2時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え、攪拌し、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製し、白色粉末結晶の4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノール(3.36 g、収率57%)を得た。

30

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.59–2.64 (4H, m), 3.05–3.10 (4H, m), 3.56 (2H, s), 4.90–5.40 (1H, br), 6.69–6.75 (2H, m), 6.79–6.85 (2H, m), 7.16 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.37 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$)。

【1161】

参考例183

1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオ

50

ロメトキシフェニル) ピペラジンの製造

1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (4.4 g、17.8ミリモル)、2- (4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (4.6 g、17.8ミリモル)、酢酸パラジウム (159 mg、0.71ミリモル)、BINAP (666 mg、1.07ミリモル) 及びtert-ブトキシナトリウム (2.2 g、23.1ミリモル) を窒素雰囲気下、トルエン (40 ml) 中にて5時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、白色粉末の1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (2.7 g、収率35%) を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.54-2.05 (6H, m), 3.21-3.34 (8H, m), 3.55-3.64 (1H, m), 3.89-3.99 (1H, m), 5.31-5.34 (1H, m), 6.90-7.03 (6H, m), 7.11-7.16 (2H, m)。

【1162】

本化合物は、参考例185の方法でも製造した。

【1163】

参考例184

20

1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジンの製造

2- (4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (7.8 g、30.3ミリモル)、ピペラジン (15.7 g、180ミリモル)、酢酸パラジウム (136 mg、0.61ミリモル)、BINAP (567 mg、0.91ミリモル) 及びtert-ブトキシナトリウム (3.8 g、39.4ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (50 ml) 中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、淡灰色粉末の1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジン (6.8 g、収率85%) を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.57-2.04 (6H, m), 3.00-3.06 (8H, m), 3.53-3.66 (1H, m), 3.89-3.99 (1H, m), 5.29-5.32 (1H, m), 6.84-6.90 (2H, m), 6.95-7.02 (2H, m)。

【1164】

参考例185

1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジンの製造 (参考例183の化合物の別途合成法)

参考例184で製造した1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジン (2.1 g、8.05ミリモル)、4-トリフルオロメトキシ-1-ブロモベンゼン (1.9 g、8.05ミリモル)、酢酸パラジウム (72 mg、0.32ミリモル)、BINAP (300 mg、0.48ミリモル) 及びtert-ブトキシナトリウム (1.0 g、10.5ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (30 ml) 中にて5時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、白色粉末の1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (3.1 g、収率90%) を得た。

40

50

【1165】

参考例186

4-〔4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペラジン-1-イル〕フェノールの製造

参考例185で製造した1-〔4-（テトラヒドロピラン-2-イルオキシ）フェニル〕-4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペラジン（2.65g、6.27ミリモル）をエタノール（50ml）に懸濁し、ピリジニウムp-トルエンスルホナート（473mg、1.88ミリモル）を加え70℃で5時間攪拌した。エタノールを減圧留去して残渣に塩化メチレン、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え攪拌した。これを塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝10／1）により精製し、白色粉末の4-〔4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペラジン-1-イル〕フェノール（1.95g、収率92%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

3.19-3.24 (4H, m), 3.29-3.34 (4H, m), 4.50 (1H, s), 6.76-6.80 (2H, m), 6.87-6.97 (4H, m), 7.11-7.15 (2H, m)。

【1166】

対応する出発原料を用い、参考例186と同様にして、参考例187及び参考例188の化合物を製造した。

【1167】

参考例187

4-〔4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ピペラジン-1-イル〕フェノール
白色粉末、収率82%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

3.18-3.23 (4H, m), 3.41-3.45 (4H, m), 4.47 (1H, s), 6.76-6.82 (2H, m), 6.87-7.00 (4H, m), 7.48-7.52 (2H, m)。

【1168】

参考例188

4-〔4-（4-クロロフェニル）ピペラジン-1-イル〕フェノール
白色粉末、収率23%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

3.18-3.23 (4H, m), 3.28-3.32 (4H, m), 4.45 (1H, s), 6.77-6.81 (2H, m), 6.87-6.92 (4H, m), 7.21-7.24 (2H, m)。

【1169】

参考例189

4-（4-トリフルオロメトキシフェノキシ）ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル（56.5g、0.28モル）、4-トリフルオロメトキシフェノール（50g、0.28モル）及びトリフェニルホスフィン（108g、0.42モル）をTHF（500ml）に溶解した。これを加熱還流下アゾジカルボン酸ジエチル（65ml、0.42モル）を滴下して加え、5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン／酢酸エチル＝5／1）により精製し、無色オイルの4-（4-トリフルオロメトキシフェノキシ）ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル（92g、収率91%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.47 (9H, s), 1.69-1.80 (2H, m), 1.85-1.96 (2H,

10

20

30

40

50

m), 3. 28–3. 39 (2 H, m), 3. 64–3. 75 (2 H, m), 4. 40–4. 46 (1 H, m), 6. 85–6. 92 (2 H, m), 7. 11–7. 15 (2 H, m)。

【1170】

参考例190

4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジンの製造

参考例189で製造した4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (92 g、254. 59ミリモル) を塩化メチレン (100 ml) に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸 (200 ml) を滴下して加え、終夜攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=5/1) により精製し、白色粉末の4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン (55 g、収率83%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 65–1. 78 (2 H, m), 2. 00–2. 07 (2 H, m), 2. 73–2. 83 (2 H, m), 3. 12–3. 21 (2 H, m), 4. 32–4. 38 (2 H, m), 6. 85–6. 92 (2 H, m), 7. 10–7. 15 (2 H, m)。

【1171】

参考例191

1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジンの製造

参考例190で製造した4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン (30. 3 g、0. 116モル)、2- (4-ブromoフェノキシ) テトラヒドロピラン (30 g、0. 116モル)、酢酸パラジウム (1. 0 g、4. 64ミリモル)、BINAP (4. 3 g、6. 96ミリモル) 及び炭酸セシウム (49 g、0. 151モル) を窒素雰囲気下トルエン (300 ml) 中にて30時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、黄色粉末の1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン (32. 6 g、収率64%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 55–1. 75 (3 H, m), 1. 81–2. 20 (7 H, m), 2. 95–3. 04 (2 H, m), 3. 38–3. 42 (2 H, m), 3. 55–3. 66 (1 H, m), 3. 87–3. 99 (1 H, m), 4. 36–4. 45 (1 H, m), 5. 29–5. 32 (1 H, m), 6. 89–7. 01 (6 H, m), 7. 11–7. 16 (2 H, m)。

【1172】

参考例192

4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノールの製造

参考例191で製造した1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン (30. 1 g、68. 8ミリモル) をエタノール (450 ml) に懸濁し、プリジニウム p-トルエンスルホナート (5. 2 g、20. 6ミリモル) を加え、70℃で24時間攪拌した。エタノールを減圧留去して残渣に塩化メチレン及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え攪拌した。これを塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1

10

20

30

40

50

）により精製し、薄茶色粉末の4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペラジン-1-イル] フェノール (22.9 g、収率94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.88–2.02 (2H, m), 2.06–2.16 (2H, m), 2.92–3.02 (2H, m), 3.30–3.39 (2H, m), 4.36–4.44 (1H, m), 4.74 (1H, s), 6.71–6.78 (2H, m), 6.85–6.94 (4H, m), 7.10–7.16 (2H, m)。

【1173】

参考例193

4- [2-クロロ-4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.94 g、21.6ミリモル)、2- (4-ブロモ-3-クロロフェノキシ) テトラヒドロピラン (5.61 g、19.2モル)、酢酸パラジウム (86.4 mg、0.39ミリモル)、BINAP (172 mg、0.58ミリモル) 及び tert-ブトキシナトリウム (2.4 g、25.0ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (40 ml) 中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、黄色油状物質の4- [2-クロロ-4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (4.72 g、収率62%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.48 (9H, s), 1.51–2.04 (6H, m), 2.88–2.93 (4H, m), 3.56–3.63 (5H, m), 3.83–3.94 (1H, m), 5.31–5.34 (1H, m), 6.88–6.96 (2H, m), 7.10–7.13 (1H, m)。

【1174】

参考例194

4- (2-クロロ-4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

参考例193で製造した4- [2-クロロ-4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (4.73 g、11.9ミリモル) をエタノール (50 ml) に懸濁し、ピリジニウム p-トルエンスルホナートを触媒量加え70℃で1時間攪拌した。エタノールを減圧留去し、残渣に塩化メチレン及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え攪拌した。析出物を濾取後、減圧乾燥し、白色粉末の4- (2-クロロ-4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.68 g、収率72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.49 (9H, s), 2.87–2.91 (4H, m), 3.55–3.60 (4H, m), 5.19 (1H, br), 6.68–6.74 (1H, m), 6.88–6.93 (2H, m)。

【1175】

参考例195

4- (4-アセトキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

p-アセトキシ安息香酸 (11 g、61.1ミリモル) を塩化メチレン (100 ml) に溶解し、DMF (3滴) 及び塩化チオニル (5.54 ml、76.3ミリモル) を加え2時間加熱還流した。これを氷冷しピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (10.3 g、55.5ミリモル) 及びピリジン (12 ml、0.15モル) の塩化メ

10

20

30

40

50

チレン (100 ml) 溶液を滴下して加え、2 時間室温で攪拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し水、10% 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 20/1) で分離精製し、白色固体の 4-(4-アセトキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (18.5 g、収率 87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.47 (9H, s), 2.31 (3H, s), 3.46 (8H, br), 7.12-7.18 (2H, m), 7.41-7.46 (2H, m)。

【1176】

参考例 196

4-(4-ヒドロキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

参考例 195 で製造した 4-(4-アセトキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (18.5 g、53.1 ミリモル) をメタノール (200 ml) に溶解し、炭酸カリウム (370 mg、2.65 ミリモル) を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に 5% 塩酸及び塩化メチレンを加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、塩化メチレンで洗浄後、減圧乾燥して、白色粉末の 4-(4-ヒドロキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (14.9 g、収率 92%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.48 (9H, s), 3.46 (4H, br), 3.60 (4H, br), 6.75-6.79 (2H, m), 7.22-7.28 (2H, m)。

【1177】

参考例 197

1-ベンジル-4-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル] ピペリジン-4-オール の製造

2-(4-ブromoフェノキシ) テトラヒドロピラン (7.2 g、28 ミリモル) を THF (70 ml) に溶解し、 -60°C に冷却した。n-ブチルリチウム (1.53 M) ヘキサン溶液 (20 ml、30.8 ミリモル) を滴下して加え、30 分攪拌した。1-ベンジル-4-ピペリドン (5.3 g、28 ミリモル) の THF (20 ml) 溶液を滴下して加え、 0°C まで昇温しつつ 3 時間攪拌した。反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル = 20/1) で分離精製し、橙色油状物質の 1-ベンジル-4-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル] ピペリジン-4-オール (5.27 g、収率 51%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.52-2.21 (11H, m), 2.41-2.52 (2H, m), 2.74-2.78 (2H, m), 3.57 (2H, s), 3.56-3.63 (1H, m), 3.83-3.96 (1H, m), 5.39-5.42 (1H, m), 6.98-7.04 (2H, m), 7.20-7.44 (7H, m)。

【1178】

参考例 198

4-(4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

参考例 197 で製造した 1-ベンジル-4-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル] ピペリジン-4-オール (1.67 g、4.55 ミリモル) をアセトニトリル (45 ml) に溶解し、 -10°C に冷却した。この冷却液にトリエチルシラン (2.9 ml、18.2 ミリモル) 及び三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体 (1.1 ml、

10

20

30

40

50

9. 1ミリモル)を加え、室温で2日間攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノール(50ml)に溶解し、20%水酸化パラジウム/炭素を触媒量加え、水素雰囲気下室温で終夜攪拌した。反応液をセライト濾過し、濾液に二炭酸ジtert-ブチル(1.1ml、4.78ミリモル)を加え、室温で30分攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)で分離精製し、白色固体の4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.07g、収率85%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.41–1.63 (2H, m), 1.49 (9H, s), 1.73–1.80 (2H, m), 2.50–2.62 (1H, m), 2.73–2.83 (2H, m), 4.19–4.24 (2H, m), 5.87 (1H, bs), 6.76–6.81 (2H, m), 7.02–7.08 (2H, m)。

【1179】

参考例199

4-[3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.94g、15.8ミリモル)、2-(3-ブロモフェノキシ)テトラヒドロピラン(3.69g、14.4ミリモル)、酢酸パラジウム(64mg、0.29ミリモル)、BINAP(285mg、0.43ミリモル)及びtert-ブトキシナトリウム(1.8g、18.7ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(40ml)中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1)により精製し、無色油状物質の4-[3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(5.3g、収率99%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.48 (9H, s), 1.52–2.04 (6H, m), 3.10–3.15 (4H, m), 3.53–3.64 (5H, m), 3.87–3.94 (1H, m), 5.38–5.41 (1H, m), 6.53–6.63 (3H, m), 7.12–7.19 (1H, m)。

【1180】

参考例200

4-(3-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

参考例199で製造した4-[3-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(5.20g、14.4ミリモル)をエタノール(100ml)に懸濁し、ピリジニウムp-トルエンスルホナートを触媒量加え、70℃で1.5時間攪拌した。エタノールを減圧留去し、残渣に塩化メチレン、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え攪拌した。析出物を濾取後、減圧乾燥し、淡茶色粉末の4-(3-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(3.73g、収率93%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.49 (9H, s), 3.09–3.14 (4H, m), 3.54–3.59 (4H, m), 5.38 (1H, br), 6.33–6.41 (2H, m), 6.47–6.52 (1H, m), 7.08–7.15 (1H, m)。

【1181】

参考例201

10

20

30

40

50

3-メチル-2-メチレンブチルアルデヒドの製造

ジャーナル オブ アメリカンケミカルソサイエティ、1957年 p. 3267 (J. Am. Chem. Soc., 3267, 1957) 記載の方法に従って、3-メチル-2-メチレンブチルアルデヒドを製造した。即ち、イソバレルアルデヒド (100 ml、932 ミリモル)、37%ホルマリン (83.8 ml、1120 ミリモル) 及びジメチルアミン塩酸塩 (91.2 g、1120 ミリモル) を70℃で30時間攪拌した。水蒸気蒸留し、留分を分液し、水相からジエチルエーテルで抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮した。濃縮液を蒸留して、無色液体の3-メチル-2-メチレンブチルアルデヒド (65.5 g、収率72%) を得た。

沸点105-115℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.08 (6H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 2.75-2.89 (1H, m), 5.95 (1H, s), 6.24 (1H, s), 9.53 (1H, s)。

【1182】

参考例202

3-メチル-2-メチレンブタン-1-オールの製造

参考例201で製造した3-メチル-2-メチレンブチルアルデヒド (65 g、668 ミリモル) のTHF (30 ml) 溶液を、水素化リチウムアルミニウム (14.15 g、373 ミリモル) のTHF (1000 ml) の懸濁液に氷冷攪拌下、滴下し、更に自然昇温させて2時間攪拌した。氷冷下、水、15%水酸化ナトリウム水溶液、水を加え、濾過して硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の3-メチル-2-メチレンブタン-1-オール (61.5 g、収率93%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.07 (6H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 1.42 (1H, t, $J=6.1\text{ Hz}$), 2.25-2.43 (1H, m), 4.13 (2H, d, $J=6.1\text{ Hz}$), 4.84-4.93 (1H, m), 4.98-5.05 (1H, m)。

【1183】

参考例203

2-メトキシメトキシメチル-3-メチル-1-ブテンの製造

参考例202で製造した3-メチル-2-メチレンブタン-1-オール (61.5 g、615 ミリモル) のTHF (500 ml) 溶液に氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエーテル (98 ml、1292 ミリモル) 及びN-エチルジイソプロピルアミン (234 ml、1344 ミリモル) を加え、室温で22時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。ジエチルエーテルを加え、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2-メトキシメトキシメチル-3-メチル-1-ブテン (89 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.07 (6H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 2.25-2.41 (1H, m), 3.39 (3H, s), 4.05 (2H, s), 4.65 (2H, s), 4.87-4.95 (1H, m), 5.00-5.05 (1H, m)。

【1184】

参考例204

2-メチレンブチルアルデヒドの製造

ブチルアルデヒド (100 ml、1110 ミリモル)、37%ホルマリン (99.8 ml、1330 ミリモル) 及びジメチルアミン塩酸塩 (108.6 g、1330 ミリモル) の混合物を70℃で23時間攪拌した。水蒸気蒸留し、留分を分液し、水相からジエチルエーテルで抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮した。濃縮液を蒸留して、無色液体の2-メチレンブチルアルデヒド (66.9 g、収率72%) を得た。

沸点70-93℃

10

20

30

40

50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 08 (3H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 2. 27 (2H, q, $J=7.5\text{ Hz}$), 5. 98 (1H, s), 6. 25 (1H, s), 9. 56 (1H, s)。

【1185】

参考例 205

2-メチレン-1-ブタノールの製造

参考例 204 で製造した 2-メチレンブチルアルデヒド (66. 9 g、796 ミリモル) を水素化リチウムアルミニウム (15. 1 g、398 ミリモル) の THF (1000 ml) の懸濁液に氷冷攪拌下滴下し、同温度下で 1 時間攪拌した。水、15% 水酸化ナトリウム水溶液、水を加え、濾過して硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の 2-メチレン-1-ブタノール (65. 1 g、収率 95%) を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 07 (3H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 1. 44 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2. 13 (2H, q, $J=7.5\text{ Hz}$), 4. 09 (2H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 4. 82-4. 93 (1H, m), 4. 98-5. 07 (1H, m)。

【1186】

参考例 206

2-メトキシメトキシメチル-1-ブテンの製造

参考例 205 で製造した 2-メチレン-1-ブタノール (65. 1 g、757 ミリモル) の THF (750 ml) 溶液に氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエーテル (103. 4 ml、1363 ミリモル) 及び N-エチルジイソプロピルアミン (247. 2 ml、1419 ミリモル) を加え、室温で 3 日間攪拌した。反応混合液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をジエチルエーテルに溶解し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の 2-メトキシメトキシメチル-1-ブテン (98 g、定量的) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 07 (3H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 2. 09 (2H, q, $J=7.5\text{ Hz}$), 3. 38 (3H, s), 4. 01 (2H, s), 4. 64 (2H, s), 4. 86-4. 95 (1H, m), 5. 00-5. 05 (1H, m)。

【1187】

参考例 207

4-[2-オキソ-2-(4-オキソピペリジン-1-イル)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

1-(2-クロロアセチル)ピペリジン-4-オン (5. 17 g、29. 4 ミリモル) をアセトニトリル (50 ml) に溶解した。この溶液にピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (5. 48 g、29. 4 ミリモル) 及び N-エチルジイソプロピルアミン (6. 2 ml、35. 3 ミリモル) を加え、2 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) で精製して淡黄色固体の 4-[2-オキソ-2-(4-オキソピペリジン-1-イル)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6. 49 g、収率 68%) を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 46 (9H, s), 2. 44-2. 54 (8H, m), 3. 28 (2H, s), 3. 42-3. 47 (4H, m), 3. 85-3. 90 (4H, m)。

【1188】

参考例 208

酢酸 4-メチル-4-ペンテニルエステルの製造

メチルトリフェニルホスホニウムブロミド (30 g、84 ミリモル) 及び THF (300 ml) の混合物に tert-ブトキシカリウム (9. 4 g、84 ミリモル) を加え、室温

50

下にて40分撹拌した。氷冷下にて酢酸4-オキソペンチルエステル(9.9g、68.8ミリモル)をTHF(30ml)に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて2時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、ジエチルエーテルにより2回抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し(n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1)、無色オイルの酢酸4-メチル-4-ペンテニルエステル(5.9g、収率60.4%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.70–1.86 (5H, m), 2.00–2.14 (5H, m), 4.07 (2H, t, $J=6.7\text{ Hz}$), 4.69 (1H, s), 4.74 (1H, s)。

【1189】

参考例209

4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

水素化ナトリウム(0.37g、9.32ミリモル)のDMSO(20ml)懸濁液に氷冷撹拌下、トリメチルスルホキシニウムヨード(1.96g、8.91ミリモル)を加え、室温で30分間撹拌し、4-(2-オキソプロピル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル(2.24g、8.10ミリモル)のDMSO(10ml)溶液を加え、更に室温で1時間撹拌した。氷水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色液体の4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル(1.51g、収率64%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.37 (3H, s), 2.27–2.63 (8H, m), 3.44–3.63 (4H, m), 5.13 (2H, s), 7.29–7.44 (5H, m)。

【1190】

参考例210

4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ホモピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

水素化ナトリウム(4.3g、109ミリモル)をDMSO(200ml)に懸濁し、トリメチルスルホキシニウムヨード(22.95g、104ミリモル)を徐々に加え、室温下にて2時間撹拌した。得られる混合物に、参考例10で製造した4-(2-オキソプロピル)ホモピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(24.3g、94.8ミリモル)をDMSO(25ml)に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて1時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、ジエチルエーテルにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し(塩化メチレン/メタノール=100/1)、微黄色オイルの4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ホモピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(15.38g、収率60%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.38 (3H, s), 1.43 (9H, s), 1.69–1.90 (2H, m), 2.40–2.75 (8H, m), 3.36–3.55 (4H, m)。

【1191】

参考例211

4-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

窒素雰囲気下、水素化ナトリウム(1.2g、35ミリモル)をDMSO(120ml)に懸濁し、トリメチルスルホキシニウムヨード(7.8g、35ミリモル)を徐々に加え、室温下にて2時間撹拌した。得られる混合物に、4-(3-オキソブチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(6.1g、23.8ミリモル)をDM

10

20

30

40

50

SO (10 ml) に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて 1.5 時間攪拌後、50～60℃にて 1.5 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより 3 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、微黄色オイルの 4- [2- (2-メチル-2-オキシラニル) エチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (5.6 g、収率 87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.33 (3H, s), 1.46 (9H, s), 1.66–1.85 (2H, m), 2.28–2.50 (6H, m), 2.55–2.66 (2H, m), 3.34–3.47 (4H, m)。

10

【1192】

参考例 212

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジンの製造

ジメチルスルホキシド (30 ml) に水素化ナトリウム (484 mg、12.1 ミリモル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキシニウムヨード (2.5 g、11.6 ミリモル) を少しずつ加え、室温で 1 時間攪拌した。得られる混合物に、1- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン (3.4 g、11.9 ミリモル) をジメチルスルホキシド (20 ml) に溶解した溶液を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、淡黄色粉末の 1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン (3.2 g、収率 98%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40 (3H, s), 2.33 (1H, d, $J=13.0$ Hz), 2.53–2.73 (7H, m), 3.26–3.30 (4H, m), 6.91 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 7.47 (2H, d, $J=8.7$ Hz)。

【1193】

参考例 212 と同様にして、参考例 213～参考例 217 の化合物を製造した。

30

【1194】

参考例 213

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4- (4-ビフェニル) ピペラジン
淡黄色粉末、収率 99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.41 (3H, s), 2.37 (1H, d, $J=12.9$ Hz), 2.58–2.76 (7H, m), 3.23–3.28 (4H, m), 6.97–7.01 (2H, m), 7.24–7.30 (1H, m), 7.37–7.43 (2H, m), 7.49–7.58 (4H, m)。

【1195】

40

参考例 214

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4- (4-クロロフェニル) ピペラジン
淡黄色粉末、収率 99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.39 (3H, s), 2.34 (1H, d, $J=12.9$ Hz), 2.54–2.73 (7H, m), 3.14–3.18 (4H, m), 6.81–6.87 (2H, m), 7.16–7.22 (2H, m)。

【1196】

参考例 215

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン

50

ル) ピペラジン

淡黄色粉末、収率 99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40 (3H, s), 2.34 (1H, d, $J=12.9\text{ Hz}$), 2.54–2.73 (7H, m), 3.16–3.20 (4H, m), 6.85–6.92 (2H, m), 7.08–7.13 (2H, m)。

【1197】

参考例 216

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(ピリジン-2-イル) ピペラジン

淡黄色粉末、収率 99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.41 (3H, s), 2.35 (1H, d, $J=12.9\text{ Hz}$), 2.50–2.69 (7H, m), 3.48–3.60 (4H, m), 6.59–6.66 (2H, m), 7.43–7.50 (1H, m), 8.17–8.20 (1H, m)。

【1198】

参考例 217

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(ピリミジン-2-イル) ピペラジン

淡黄色粉末、収率 99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.41 (3H, s), 2.36 (1H, d, $J=12.9\text{ Hz}$), 2.45–2.64 (7H, m), 3.81–3.85 (4H, m), 6.47 (1H, t, $J=4.8\text{ Hz}$), 8.30 (2H, d, $J=4.8\text{ Hz}$)。

【1199】

参考例 218

N-メチル-[1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

ジメチルスルホキシド (20 ml) に水素化ナトリウム (372 mg、9.32 ミリモル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキシニウムヨード (1.96 g、8.89 ミリモル) を少しずつ加え、室温で 1.5 時間攪拌した。得られる混合物に、N-メチル-[1-(2-オキソプロピル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (2.3 g、8.5 ミリモル) をジメチルスルホキシド (20 ml) に溶解した溶液を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、淡黄色油状物質の N-メチル-[1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (2.1 g、収率 86%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.36 (3H, s), 1.46 (9H, s), 1.55–1.79 (5H, m), 1.97–2.13 (2H, m), 2.30 (1H, d, $J=12.9\text{ Hz}$), 2.49 (1H, d, $J=12.9\text{ Hz}$), 2.59 (2H, s), 2.74 (3H, s), 2.88–3.06 (2H, m)。

【1200】

参考例 219

3-(2-メチル-2-オキシラニル) ピリジンの製造

3-アセチルピリジン (8 g、66.1 ミリモル) を用い、参考例 218 と同様にして、淡茶オイルの 3-(2-メチル-2-オキシラニル) ピリジン (7 g、収率 78.4%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

10

20

30

40

50

1. 74 (3H, s), 2. 82 (1H, d, $J = 5.2$ Hz), 3. 02 (1H, d, $J = 5.2$ Hz), 7. 21–7. 33 (1H, m), 7. 58–7. 70 (1H, m), 8. 54 (1H, dd, 1. 6 Hz, 4. 8 Hz), 8. 65 (1H, d, $J = 2.3$ Hz)。

【1201】

参考例220

1-オキサー-6-アザスピロ[2, 5]オクタン-6-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

ジメチルスルホキシド (600 ml) に水素化ナトリウム (13. 3 g、0. 33 モル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキソニウムヨード (70 g、0. 32 モル) を少しずつ加え、室温で1時間攪拌した。得られる混合物に、4-オキソ-ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (58 g、0. 291 モル) をゆっくり加え、55℃で1時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ込み、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をn-ヘキサンで結晶化して白色粉末の1-オキサー-6-アザスピロ[2, 5]オクタン-6-カルボン酸 tert-ブチルエステル (61. 7 g、収率96%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 40–1. 53 (2H, m), 1. 47 (9H, s), 1. 72–1. 85 (2H, m), 2. 69 (2H, s), 3. 37–3. 48 (2H, m), 3. 67–3. 77 (2H, m)。

【1202】

参考例221

4-[2-(1-オキサー-6-アザスピロ[2, 5]オクタン-6-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

ジメチルスルホキシド (50 ml) に水素化ナトリウム (385 mg、9. 64 ミリモル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキソニウムヨード (2. 02 g、9. 20 ミリモル) を少しずつ加え、室温で1時間攪拌した。得られる混合物に、4-[2-オキソ-2-(4-オキソピペリジン-1-イル)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2. 85 g、8. 76 ミリモル) のDMSO (10 ml) 溶液を加え、室温で2時間、55℃で1時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ込み、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、白色固体の4-[2-(1-オキサー-6-アザスピロ[2, 5]オクタン-6-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2. 97 g、収率99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 45–1. 54 (2H, m), 1. 48 (9H, s), 1. 78–1. 93 (2H, m), 2. 44–2. 49 (4H, m), 2. 62 (2H, s), 2. 73 (2H, s), 3. 15–3. 36 (2H, m), 3. 42–3. 47 (2H, m), 3. 52–3. 68 (1H, m), 3. 77–3. 88 (1H, m), 4. 02–4. 22 (2H, m)。

【1203】

参考例222

6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-オキサー-6-アザスピロ[2, 5]オクタンの製造

ジメチルスルホキシド (30 ml) へ水素化ナトリウム (361 mg、9. 02 ミリモル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキソニウムヨード (2. 00 g、9. 02 ミリモル) を少しずつ加え、室温で1時間攪拌した。得られる混合物に、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-オン (2. 00 g、8. 2 ミリモル) のDMSO (10 ml) 溶液を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチ

ルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝5／1）により精製し、淡黄色固体の6-（4-トリフルオロメチルフェニル）-1-オキサ-6-アザスピロ[2, 5]オクタン（1.51 g、収率72%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.54–1.65 (2H, m), 1.91–2.04 (2H, m), 2.54–2.59 (2H, m), 2.73 (2H, s), 3.38–3.48 (1H, m), 3.52–3.62 (1H, m), 6.95 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.48 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$)。

10

【1204】

参考例223

酢酸3-（2-メチル-2-オキシラニル）プロピルエステルの製造

参考例208で製造した酢酸4-メチル-4-ペンテニルエステル（5.9 g、41.5ミリモル）及び塩化メチレン（60 ml）の混合物に、氷冷下にて*m*-クロロ過安息香酸（12.3 g、71.30ミリモル）を徐々に加え、室温下にて2時間攪拌した。氷冷下にて飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸ナトリウム水溶液を加え、30分攪拌後、分液した。水相をさらに塩化メチレンにより抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、無色オイルの酢酸3-（2-メチル-2-オキシラニル）プロピルエステル（6.9 g、定量的）を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.33 (3H, s), 1.56–1.79 (4H, m), 2.05 (3H, s), 2.56–2.70 (2H, m), 4.08 (2H, t, $J=6.5\text{ Hz}$)。

【1205】

参考例224

1-エチル-5-〔2-（2-メチル-2-オキシラニル）エチル〕-1*H*-テトラゾールの製造

1-エチル-5-（3-メチル-3-ブテニル）-1*H*-テトラゾール（0.95 g、5.71ミリモル）の塩化メチレン（20 ml）溶液に氷冷攪拌下、*m*-クロロ過安息香酸（1.97 g、7.99ミリモル）を少量ずつ加え、更に室温で21時間攪拌した。反応混合液にチオ硫酸ナトリウム水溶液と炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、濾過して塩化メチレン相を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色液体の1-エチル-5-〔2-（2-メチル-2-オキシラニル）エチル〕-1*H*-テトラゾール（1.2 g、定量的）を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40 (3H, s), 1.55 (3H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 2.00–2.16 (1H, m), 2.20–2.37 (1H, m), 2.66 (2H, s), 2.78–2.98 (2H, m), 4.32 (2H, q, $J=7.3\text{ Hz}$)。

【1206】

40

対応する出発原料を用い、参考例224と同様にして、参考例225及び参考例226の化合物を製造した。

【1207】

参考例225

1-フェニル-5-〔2-（2-メチル-2-オキシラニル）エチル〕-1*H*-テトラゾール

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.32 (3H, s), 2.01–2.28 (2H, m), 2.59 (2H, s), 2.92–2.99 (2H, m), 7.43–7.47 (2H, m), 7.58–7.63 (

50

3 H, m)。

【1208】

参考例226

1-(4-クロロフェニル)-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]-1H-テトラゾール

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.33 (3H, s), 2.00-2.12 (1H, m), 2.19-2.31 (1H, m), 2.60 (2H, s), 2.90-2.97 (2H, m), 7.39-7.45 (2H, m), 7.56-7.62 (2H, m)。

10

【1209】

参考例227

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オンの製造

1-(2-メチル-2-プロペニル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン (7.09 g、34.88ミリモル) の塩化メチレン (150ml) 溶液にm-クロロ過安息香酸 (13.76 g、55.81ミリモル) を加え、室温で24時間攪拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液及び炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、濾過して塩化メチレン相を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1) により精製し、微黄色液体の1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン (5.13 g、67%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.39 (3H, s), 2.70 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 2.78 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 3.79 (1H, d, $J=15.5\text{ Hz}$), 4.51 (1H, d, $J=15.5\text{ Hz}$), 5.23 (2H, s), 7.04-7.13 (2H, m), 7.21-7.27 (1H, m), 7.29-7.38 (1H, m)。

【1210】

参考例228

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-(2-メチル-2-プロペニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.66 g、8.77ミリモル) 及び塩化メチレン (30ml) の混合物に、氷冷下にてm-クロロ過安息香酸 (1.66 g、9.65ミリモル) を加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液を濾過し、濾液を20%亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン/n-ヘキサンにより処理し、析出物を濾取することにより白色粉末の3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.78 g、収率99%) を得た。

30

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.38 (3H, s), 2.73 (1H, d, $J=4.3\text{ Hz}$), 2.81 (1H, d, $J=4.3\text{ Hz}$), 3.68 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.26 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 7.09-7.29 (4H, m)。

【1211】

対応する出発原料を用い、参考例228と同様にして、参考例229～参考例232の化合物を製造した。

【1212】

参考例229

5-クロロ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール

50

－２－オン

収率 93%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.38 (3H, s), 2.75 (1H, d, $J=4.2\text{ Hz}$), 2.79 (1H, d, $J=4.2\text{ Hz}$), 3.60 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 4.28 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 7.05–7.16 (2H, m), 7.20–7.27 (1H, m)。

【1213】

参考例 230

5-フルオロ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン 10

収率 97%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.38 (3H, s), 2.75 (1H, d, $J=4.3\text{ Hz}$), 2.80 (1H, d, $J=4.3\text{ Hz}$), 3.60 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 4.29 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 6.75–6.85 (1H, m), 7.01 (1H, dd, $J=2.6\text{ Hz}$, 7.9 Hz), 7.13 (1H, dd, $J=4.2\text{ Hz}$, 8.8 Hz)。

【1214】

参考例 231

5-フェニル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン 20

収率 92%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40 (3H, s), 2.74 (1H, d, $J=4.3\text{ Hz}$), 2.82 (1H, d, $J=4.3\text{ Hz}$), 3.70 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.32 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 7.25 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.29–7.49 (5H, m), 7.57 (2H, dd, $J=1.6\text{ Hz}$, 8.5 Hz)。

【1215】

参考例 232

5-ブromo-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン 30

収率 80%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.38 (3H, s), 2.75 (1H, d, $J=4.2\text{ Hz}$), 2.79 (1H, d, $J=4.2\text{ Hz}$), 3.61 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 4.27 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 7.08 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.18–7.31 (1H, m), 7.38 (1H, d, $J=1.9\text{ Hz}$)。

【1216】

参考例 233

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造 40

1-(2-メチル-2-プロペニル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (720 mg、2.72 ミリモル) を用い、参考例 228 と同様にして、微黄色オイルの 1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (758 mg、収率 99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40 (3H, s), 2.73 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.86 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.82 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.38 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 7.02–7.30 (4H, m), 7.34–7.45 (1H, m), 7.50–7.57 (4H, m)。

【1217】

対応する出発原料を用い、参考例233と同様にして、参考例234～参考例245の化合物を製造した。

【1218】

参考例234

1-(4-フルオロフェニル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率96%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40 (3H, s), 2.73 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.85 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.81 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.38 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 7.00–7.30 (6H, m), 7.43–7.57 (2H, m)。

【1219】

参考例235

1-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率40%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.34 (3H, s), 1.54 (9H, s), 1.71–1.87 (2H, m), 2.20–2.42 (2H, m), 2.70 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.71–2.89 (3H, m), 3.75 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.20–4.53 (4H, m), 7.00–7.13 (3H, m), 7.15–7.25 (1H, m)。

【1220】

参考例236

1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率68%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.34 (3H, s), 2.69 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.78 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.44 (3H, s), 3.76 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.31 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 6.91–7.00 (1H, m), 7.05–5.25 (3H, m)。

【1221】

参考例237

5-クロロ-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率89%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.34 (3H, s), 2.70 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 2.76 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 3.42 (3H, s), 3.69 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 4.28 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 6.88 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.09 (1H, dd, $J=1.9\text{ Hz}$, 8.3 Hz), 7.22 (1H, d, $J=1.9\text{ Hz}$)。

【1222】

参考例238

1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-トリフルオロメチル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

10

20

30

40

50

1. 36 (3H, s), 2. 71 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 2. 77 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 3. 47 (3H, s), 3. 74 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 4. 38 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 7. 04 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 7. 39 (1H, dd, $J=1.9$ Hz, 8. 2 Hz), 7. 45 (1H, d, $J=1.9$ Hz)。

【1223】

参考例239

6-クロロ-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率99%

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 32 (3H, s), 2. 69 (1H, d, $J=4.6$ Hz), 2. 75 (1H, d, $J=4.6$ Hz), 3. 41 (3H, s), 3. 68 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 4. 33 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 6. 97 (1H, d, $J=1.9$ Hz), 7. 07 (1H, dd, $J=1.9$ Hz, 8. 4 Hz), 7. 13 (1H, d, $J=8.4$ Hz)。

【1224】

参考例240

5-フルオロ-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

20

収率66%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 34 (3H, s), 2. 70 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 2. 77 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 3. 42 (3H, s), 3. 77 (1H, d, $J=15.0$ Hz), 4. 33 (1H, d, $J=15.0$ Hz), 6. 74-6. 91 (2H, m), 7. 00 (1H, dd, $J=2.2$ Hz, 8. 6 Hz)。

【1225】

参考例241

5-クロロ-1-エチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

30

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 25-1. 39 (6H, m), 2. 70 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 2. 76 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 3. 69 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 3. 93 (2H, q, $J=7.3$ Hz), 4. 30 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 6. 90 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 7. 07 (1H, dd, $J=2.0$ Hz, 8. 3 Hz), 7. 23 (1H, d, $J=2.0$ Hz)。

【1226】

参考例242

5-クロロ-1-イソプロピル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

40

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 34 (3H, s), 1. 53 (6H, dd, $J=2.1$ Hz, 6. 7 Hz), 2. 70 (1H, d, $J=4.5$ Hz), 2. 75 (1H, d, $J=4.5$ Hz), 3. 68 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 4. 28 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 4. 65-4. 79 (1H, m), 7. 04 (2H, s), 7. 22 (1H, s)。

【1227】

参考例243

5-ジメチルアミノ-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,

50

3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.33 (3H, s), 2.69 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.79 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.92 (6H, s), 3.39 (3H, s), 3.67 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.32 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 6.55 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, 8.6 Hz), 6.71 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 6.85 (1H, d, $J=8.6\text{ Hz}$)。

【1228】

参考例244

10

5-クロロ-1-(n-ヘキシル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.87 (3H, t, $J=6.9\text{ Hz}$), 1.18-1.43 (9H, m), 1.64-1.80 (2H, m), 2.70 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 2.75 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 3.69 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 3.86 (2H, t, $J=7.4\text{ Hz}$), 4.30 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 6.88 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.06 (1H, dd, $J=1.9\text{ Hz}$, 8.4 Hz), 7.22 (1H, d, $J=1.9\text{ Hz}$)。

20

【1229】

参考例245

5-エトキシカルボニル-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.32-1.43 (6H, m), 2.69 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.78 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.47 (3H, s), 3.87 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.28 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.39 (2H, q, $J=7.2\text{ Hz}$), 7.00 (1H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 7.85 (1H, d, $J=1.5\text{ Hz}$), 7.90 (1H, dd, $J=1.5\text{ Hz}$, 8.2 Hz)。

30

【1230】

参考例246

1-ベンジル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オンの製造

1-ベンジル-3-(2-メチル-2-プロペニル)イミダゾリジン-2-オン (1.63 g、7.05ミリモル) を用い、参考例228と同様にして、微黄色オイルの1-ベンジル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オン (680 mg、収率39%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

40

1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2.69 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 3.05-3.25 (3H, m), 3.27-3.49 (2H, m), 3.61 (1H, d, $J=14.6\text{ Hz}$), 4.39 (2H, s), 7.20-7.34 (5H, m)。

【1231】

対応する出発原料を用い、参考例246と同様にして、参考例247～参考例250の化合物を製造した。

【1232】

参考例247

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オン

50

収率 58%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 37 (3H, s), 2. 65 (1H, d, $J=4.6\text{ Hz}$), 2. 72 (1H, d, $J=4.6\text{ Hz}$), 3. 18 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 3. 48–3. 61 (2H, m), 3. 64 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 3. 77–3. 91 (2H, m), 7. 03 (1H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 7. 25–7. 36 (2H, m), 7. 56 (2H, d, $J=7.9\text{ Hz}$).

【1233】

参考例 248

1-(4-フルオロベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オン

10

収率 34%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 35 (3H, s), 2. 62 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2. 68 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 3. 12 (1H, d, $J=14.6\text{ Hz}$), 3. 16–3. 20 (2H, m), 3. 27–3. 45 (2H, m), 3. 61 (1H, d, $J=14.6\text{ Hz}$), 4. 35 (2H, s), 6. 89–7. 07 (2H, m), 7. 14–7. 27 (2H, m).

【1234】

参考例 249

1-(4-ブロモベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オン

20

収率 51%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 34 (3H, s), 2. 62 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2. 67 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 3. 12 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 3. 16–3. 25 (2H, m), 3. 27–3. 50 (2H, m), 3. 61 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 4. 33 (2H, s), 7. 15 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7. 45 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$).

【1235】

参考例 250

1-(4-メトキシベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オン

30

収率 43%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 34 (3H, s), 2. 61 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2. 67 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 3. 07–3. 23 (3H, m), 3. 27–3. 50 (2H, m), 3. 58 (1H, d, $J=14.6\text{ Hz}$), 3. 80 (3H, s), 4. 32 (2H, s), 6. 86 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7. 19 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$).

【1236】

参考例 251

1-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オンの製造

40

トルエン-4-スルホン酸 2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (500 mg、2. 37 ミリモル) を DMF 5 ml に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム (99 mg、2. 49 ミリモル) を加え、室温下にて 1 時間攪拌した。1-(4-クロロベンジル)イミダゾリジン-2-オン (633 mg、2. 61 ミリモル) を DMF 5 ml に溶解した溶液を氷冷下にて加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、ジエチルエーテルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナト

50

リウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／アセトン＝3／1）により精製し、微黄色オイルの1-（4-クロロベンジル）-3-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）イミダゾリジン-2-オン（399mg、60%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2.68 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 3.05-3.25 (3H, m), 3.27-3.49 (2H, m), 3.61 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 4.35 (2H, s), 7.21 (2H, dd, $J=2.0\text{ Hz}$, 6.7 Hz), 7.30 (2H, dd, $J=2.0\text{ Hz}$, 6.7 Hz)。

10

【1237】

対応する出発原料を用い、参考例251と同様にして、参考例252及び参考例253の化合物を製造した。

【1238】

参考例252

1-（1-ベンジルピペリジン-4-イル）-3-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）イミダゾリジン-2-オン

収率54%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.35 (3H, s), 1.59-1.80 (4H, m), 2.00-2.16 (2H, m), 2.60 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2.66 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2.84-3.00 (2H, m), 3.07 (1H, d, $J=14.6\text{ Hz}$), 3.22-3.43 (4H, m), 3.50 (2H, s), 3.54 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 3.68-3.86 (1H, m), 7.16-7.34 (5H, m)。

20

【1239】

参考例253

1-（2,4-ジメトキシベンジル）-3-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）イミダゾリジン-2-オン

収率40%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.34 (3H, s), 2.60 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2.67 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 3.10 (1H, d, $J=14.6\text{ Hz}$), 3.14-3.34 (4H, m), 3.56 (1H, d, $J=14.6\text{ Hz}$), 3.80 (6H, s), 4.35 (2H, s), 6.32-6.43 (2H, m), 7.18 (1H, d, $J=8.9\text{ Hz}$)。

30

【1240】

参考例254

1-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）ピロリジン-2,5-ジオンの製造

1-（2-メチル-2-プロペニル）ピロリジン-2,5-ジオンを用い、参考例228と同様にして、1-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）ピロリジン-2,5-ジオンを製造した。

40

収率86%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.34 (3H, s), 2.58 (1H, d, $J=4.6\text{ Hz}$), 2.67-2.79 (5H, m), 3.56 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 3.84 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$)。

【1241】

参考例255

2-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）フタルイミドの製造

2-（2-メチル-2-プロペニル）フタルイミドを用い、参考例228と同様にして

50

、2-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)フタルイミドを製造した。

収率98%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.38 (3H, s), 2.62 (1H, d, $J=4.6$ Hz), 2.82 (1H, d, $J=4.6$ Hz), 3.71 (1H, d, $J=14.3$ Hz), 4.01 (1H, d, $J=14.3$ Hz), 7.73 (2H, dd, $J=2.9$ Hz, 8.6 Hz), 7.87 (2H, dd, $J=2.9$ Hz, 8.6 Hz)。

【1242】

参考例256

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-ベンゾイミダゾールの製造

10

1-(2-メチル-2-プロペニル)-1H-ベンゾイミダゾールを用い、参考例228と同様にして、1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-ベンゾイミダゾールを製造した。

収率11%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm:

1.32 (3H, s), 2.60 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 2.71 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 4.17 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 4.44 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 7.23-7.41 (2H, m), 7.48 (1H, dd, $J=2.2$ Hz, 7.8 Hz), 7.80 (1H, dd, $J=2.2$ Hz, 7.8 Hz), 7.93 (1H, s)。

20

【1243】

参考例257

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-イミダゾールの製造

1-(2-メチル-2-プロペニル)-1H-イミダゾールを用い、参考例228と同様にして、1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-イミダゾールを製造した。

収率53%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm:

1.26 (3H, s), 2.57 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 2.69 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 3.94 (1H, d, $J=14.7$ Hz), 4.16 (1H, d, $J=14.7$ Hz), 6.97 (1H, s), 7.08 (1H, s), 7.49 (1H, s)。

30

【1244】

参考例258

3-[3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-(4-メチル-4-ペンテニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (3.4 g、15.65ミリモル)を用い、参考例228と同様にして、白色粉末結晶の3-[3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (3.8 g、定量的)を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm:

1.33 (3H, s), 1.56-1.77 (2H, m), 1.80-1.95 (2H, m), 2.59 (1H, d, $J=4.8$ Hz), 2.63 (1H, d, $J=4.8$ Hz), 3.85 (2H, t, $J=7.4$ Hz), 6.99 (1H, d, $J=7.9$ Hz), 7.05-7.23 (3H, m)。

【1245】

参考例259

3-[4-(2-メチル-2-オキシラニル)ブチル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-(5-メチル-5-ヘキセニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.1

50

g、4.8ミリモル)を用い、参考例228と同様にして、無色オイルの3-[4-(2-メチル-2-オキシラニル)ブチル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(1.2g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.30 (3H, s), 1.42-1.67 (4H, m), 1.74-1.88 (2H, m), 2.57 (1H, d, $J=4.9\text{ Hz}$), 2.60 (1H, d, $J=4.9\text{ Hz}$), 3.84 (2H, t, $J=7.2\text{ Hz}$), 6.98 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.02-7.30 (3H, m)。

【1246】

参考例260

10

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)オキサゾリジン-2-オンの製造

3-(2-メチル-2-プロペニル)オキサゾリジン-2-オン(4.28g、30.35ミリモル)を用い、参考例228の方法により、無色オイルの3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)オキサゾリジン-2-オン(2.87g、収率62%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.36 (3H, s), 2.66 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.70 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.15 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 3.57-3.75 (3H, m), 4.25-4.39 (2H, m)。

【1247】

参考例261

20

3, 3-ジフルオロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オンの製造

3, 3-ジフルオロ-1-(2-メチル-2-プロペニル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン(1.08g、4.83ミリモル)を用い、参考例228と同様にして、微黄色粉末の3, 3-ジフルオロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン(1.14g、収率99%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.35 (3H, s), 2.71 (1H, d, $J=4.3\text{ Hz}$), 2.77 (1H, d, $J=4.3\text{ Hz}$), 3.46 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 4.26 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 7.12-7.24 (2H, m), 7.45-7.61 (2H, m)

30

【1248】

対応する出発原料を用い、参考例261と同様にして、参考例262及び参考例263の化合物を製造した。

【1249】

参考例262

3, 3-ジメチル-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.31 (3H, s), 1.39 (6H, s), 2.67 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.74 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.53 (1H, d, $J=14.0\text{ Hz}$), 4.22 (1H, d, $J=14.0\text{ Hz}$), 7.00-7.10 (2H, m), 7.16-7.31 (2H, m)。

40

【1250】

参考例263

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.34 (3H, s), 2.67 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.76 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.49-3.61 (3H, m), 4.22 (1H, d, $J=14.9\text{ Hz}$), 7.00-7.10 (2H, m), 7.18-7.35 (2H, m)。

50

【1251】

参考例264

(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸ベンジルエステルの製造

参考例173で製造したN-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸ベンジルエステル(3.90g、19.0ミリモル)を塩化メチレン(80ml)に溶解し、m-クロロ過安息香酸(5.15g、20.9ミリモル)を加え、室温終夜で攪拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、しばらく攪拌後、分液した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮することにより、無色液体の(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸ベンジルエステル(4.31g、定量的)を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.35 (3H, s), 2.61 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.72 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.28–3.53 (2H, m), 4.90 (1H, br), 5.11 (2H, s), 7.26–7.44 (5H, m)。

【1252】

対応する出発原料を用い、参考例264と同様にして、参考例265～参考例276の化合物を製造した。

【1253】

参考例265

N-メチル-N-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸ベンジルエステル

20

収率42%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.26 (1.5H, s), 1.31 (1.5H, s), 2.57 (1H, s), 2.61 (1H, s), 2.99 (3H, s), 3.24 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 3.62 (0.5H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 3.72 (0.5H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 5.14 (2H, s), 7.27–7.41 (5H, m)。

【1254】

参考例266

(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステル

30

収率98%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 2.71 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 3.27–3.50 (2H, m), 4.88 (1H, br), 5.06 (2H, s), 7.23–7.41 (4H, m)。

【1255】

参考例267

(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

40

1.34 (3H, s), 2.61 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.71 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.32–3.50 (2H, m), 4.86 (1H, br), 5.06 (2H, s), 6.95–7.09 (2H, m), 7.27–7.41 (2H, m)。

【1256】

参考例268

(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸エチルエステル

収率82%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.24 (3H, t, $J=7.1\text{ Hz}$), 1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.74 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.27–3.50 (2H

50

, m), 4.12 (2H, q, $J=7.1$ Hz), 4.78 (1H, br)。

【1257】

参考例269

(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率99%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 2.71 (1H, d, $J=4.4$ Hz), 3.42 (2H, d, $J=5.6$ Hz), 4.90 (1H, br), 5.10 (2H, s), 7.20 (2H, d, $J=8.3$ Hz), 7.38 (2H, d, $J=8.3$ Hz)。

10

【1258】

参考例270

N-メチル-N-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

収率73%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (1.5H, s), 1.30 (1.5H, s), 2.56 (1H, s), 2.61 (1H, s), 2.97 (3H, s), 3.22 (1H, d, $J=14.8$ Hz), 3.61 (0.5H, d, $J=14.8$ Hz), 3.72 (0.5H, d, $J=14.8$ Hz), 5.10 (2H, s), 6.95-7.09 (2H, m), 7.27-7.41 (2H, m)。

20

【1259】

参考例271

オキシラニルメチルカルバミン酸4-クロルベンジルエステル

収率97%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.59 (1H, dd, $J=2.6$ Hz, 4.6 Hz), 2.79 (1H, t, $J=4.3$ Hz), 3.11 (1H, br), 3.20-3.32 (1H, m), 3.50-3.73 (1H, m), 4.93 (1H, br), 5.07 (2H, s), 7.23-7.41 (4H, m)。

30

【1260】

参考例272

オキシラニルメチルカルバミン酸4-フルオロルベンジルエステル

収率89%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.59 (1H, dd, $J=2.6$ Hz, 4.6 Hz), 2.79 (1H, t, $J=4.3$ Hz), 3.11 (1H, br), 3.21-3.32 (1H, m), 3.45-3.73 (1H, m), 4.92 (1H, br), 5.07 (2H, s), 6.95-7.09 (2H, m), 7.27-7.41 (2H, m)。

40

【1261】

参考例273

N-メチル-N-オキシラニルメチルカルバミン酸4-フルオロルベンジルエステル

収率34%、

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.51 (1H, br), 2.76 (1H, br), 3.01 (3H, s), 3.02-3.27 (2H, m), 3.55-3.91 (1H, m), 5.10 (2H, s), 6.95-7.09 (2H, m), 7.27-7.41 (2H, m)。

【1262】

参考例274

50

オキシラニルメチルカルバミン酸 *tert*-ブチルエステル

収率 83%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45 (9H, s), 2.59 (1H, dd, $J=2.6\text{ Hz}$, 4.6 Hz), 2.78 (1H, t, $J=4.4\text{ Hz}$), 3.09 (1H, br), 3.16–3.28 (1H, m), 3.38–3.66 (1H, br), 4.53–4.91 (1H, br)。

【1263】

参考例 275

オキシラニルメチルカルバミン酸ベンジルエステル

収率 72%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

2.67 (1H, t, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.91–3.32 (4H, m), 4.91–5.09 (3H, m), 7.23–7.55 (5H, m)。

【1264】

参考例 276

オキシラニルメチルカルバミン酸フェニルエステル

収率 90%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

2.57 (1H, dd, $J=2.5\text{ Hz}$, 5.0 Hz), 2.73 (1H, t, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.00–3.45 (3H, m), 7.10 (2H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.20 (1H, t, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.38 (2H, t, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.94 (1H, br)。

【1265】

参考例 277

(4-クロロフェニル)カルバミン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステルの製造

(4-クロロフェニル)カルバミン酸2-メチル-2-プロペニルエステル(1.0 g、4.4ミリモル)の塩化メチレン(20 ml)溶液に *m*-クロロ過安息香酸(1.6 g、6.6ミリモル)を氷冷攪拌下に加え、室温で4時間攪拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応混合液を濾過し、炭酸水素ナトリウムと水を加え分液し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して、微黄色固体の(4-クロロフェニル)カルバミン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステル(1.1 g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.42 (3H, s), 2.71 (1H, d, $J=4.6\text{ Hz}$), 2.82 (1H, d, $J=4.6\text{ Hz}$), 4.01 (1H, d, $J=11.9\text{ Hz}$), 4.37 (1H, d, $J=11.9\text{ Hz}$), 6.79 (1H, br), 7.23–7.37 (4H, m)。

【1266】

参考例 278

N-(4-クロロフェニル)-*N*-メチルカルバミン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステルの製造

N-(4-クロロフェニル)-*N*-メチルカルバミン酸2-メチル-2-プロペニルエステル(1.78 g、6.7ミリモル)の塩化メチレン(20 ml)溶液に *m*-クロロ過安息香酸(2.5 g、10.1ミリモル)を氷冷攪拌下に加え、室温で6.5時間攪拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、反応混合液を濾過し、炭酸水素ナトリウム及び水を加え分液し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、微黄色液体の *N*-(4-クロロフェニル)-*N*-メチルカルバミン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステル(1.7 g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.32 (3H, s), 2.62 (1H, d, $J=4.6\text{ Hz}$), 2.69 (1H, d,

10

20

30

40

50

$J = 4.6 \text{ Hz}$), 3.30 (3H , s), 3.99 (1H , d, $J = 11.8 \text{ Hz}$), 4.30 (1H , d, $J = 11.8 \text{ Hz}$), $7.15 - 7.25$ (2H , m), $7.31 - 7.38$ (2H , m)。

【1267】

参考例279

4-オキシラニルメチルピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.2 g , 33.29 mmol)、エピプロモヒドリン (5.4 g , 39.42 mmol) 及び炭酸カリウム (5.5 g , 39.79 mmol) のアセトニトリル (70 ml) 中の混合物を3時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、水を加え、塩化メチレンにより抽出した。飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、無色オイルの4-オキシラニルメチルピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.2 g 、収率 77%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H , s), $2.21 - 2.60$ (6H , m), $2.70 - 2.81$ (2H , m), $3.05 - 3.12$ (1H , m), $3.35 - 3.56$ (4H , m)。

【1268】

参考例280

[4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

トルエン-4-スルホン酸 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステル (9.75 g , 40.3 mmol) 及び参考例36で製造したピペラジン-1-イルカルバミン酸 tert-ブチルエステル (6.75 g , 33.5 mmol) を DMF (70 ml) に溶解した。この溶液に、トリエチルアミン (7 ml , 50.3 mmol) 及びヨウ化カリウム (6.68 g , 33.5 mmol) を加え、室温で終夜攪拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/アセトン = $4/1$) により精製し、白色粉末結晶の [4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸 tert-ブチルエステル (4.66 g 、収率 51%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.35 (3H , s), 1.46 (9H , s), 2.31 (1H , d, $J = 12.9 \text{ Hz}$), $2.49 - 2.84$ (11H , m), 5.37 (1H , br)。

【1269】

参考例281

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オンの製造

参考例49で製造した5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン (3.18 g , 12.92 mmol) 及びトルエン-4-スルホン酸 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステル (4.80 g , 19.38 mmol) の DMF (30 ml) 溶液に、炭酸カリウム (2.14 g , 15.50 mmol) 及びヨウ化ナトリウム (2.90 g , 19.38 mmol) を加え、室温で24時間、更に 60°C で4時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/酢酸エチル = $9/1$) により精製し、白色固体の3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン (2.37 g 、収率 58%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.43 (3H , s), 2.72 (1H , d, $J = 4.4 \text{ Hz}$), 2.86 (1H , d,

10

20

30

40

50

$J = 4.4 \text{ Hz}$), 3.93 (2 H , dd , $J = 14.8 \text{ Hz}$, 22.2 Hz), $7.28 - 7.41$ (2 H , m), $7.83 - 7.98$ (2 H , m)。

【1270】

5-置換-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン及びトルエン-4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステルを用い、参考例281と同様にして、参考例282～参考例289の化合物を製造した。

【1271】

参考例282

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-フェニル-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

10

収率41%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.44 (3 H , s), 2.72 (1 H , d , $J = 4.5 \text{ Hz}$), 2.88 (1 H , d , $J = 4.5 \text{ Hz}$), 3.87 (1 H , d , $J = 14.7 \text{ Hz}$), 3.99 (1 H , d , $J = 14.7 \text{ Hz}$), $7.40 - 7.57$ (3 H , m), $7.79 - 7.87$ (2 H , m)。

【1272】

参考例283

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

20

収率34%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45 (3 H , s), 2.73 (1 H , d , $J = 4.5 \text{ Hz}$), 2.87 (1 H , d , $J = 4.5 \text{ Hz}$), 3.92 (1 H , d , $J = 14.8 \text{ Hz}$), 4.00 (1 H , d , $J = 14.8 \text{ Hz}$), 7.75 (2 H , d , $J = 8.3 \text{ Hz}$), 8.01 (2 H , d , $J = 8.3 \text{ Hz}$)。

【1273】

参考例284

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-ビフェニル)-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

30

収率38%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45 (3 H , s), 2.73 (1 H , d , $J = 4.5 \text{ Hz}$), 2.89 (1 H , d , $J = 4.5 \text{ Hz}$), 3.89 (1 H , d , $J = 14.8 \text{ Hz}$), 4.00 (1 H , d , $J = 14.8 \text{ Hz}$), $7.33 - 7.50$ (3 H , m), $7.57 - 7.75$ (4 H , m), 7.93 (2 H , d , $J = 8.6 \text{ Hz}$)。

【1274】

参考例285

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-クロロフェニル)-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

40

収率52%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.44 (3 H , s), 2.72 (1 H , d , $J = 4.4 \text{ Hz}$), 2.86 (1 H , d , $J = 4.4 \text{ Hz}$), 3.89 (1 H , d , $J = 14.8 \text{ Hz}$), 3.97 (1 H , d , $J = 14.8 \text{ Hz}$), 7.46 (2 H , d , $J = 8.7 \text{ Hz}$), 7.80 (2 H , d , $J = 8.7 \text{ Hz}$)。

【1275】

参考例286

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-フルオロフェニル)-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

50

収率 72 %

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

1. 43 (3H, s), 2. 72 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2. 87 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3. 88 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 3. 96 (1H, d, $J=14.7\text{ Hz}$), 7. 11–7. 21 (2H, m), 7. 74–7. 89 (2H, m)

参考例 287

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-[2-(4-クロロフェニル)エチル]-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

収率 78 %

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

1. 32 (3H, s), 2. 64 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2. 72 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2. 79–2. 90 (2H, m), 2. 93–3. 04 (2H, m), 3. 74 (1H, d, $J=14.8\text{ Hz}$), 3. 79 (1H, d, $J=14.8\text{ Hz}$), 7. 12 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7. 27 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$)

参考例 288

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-[2-(4-クロロフェニル)ビニル]-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

収率 100 %

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

1. 41 (3H, s), 2. 71 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 2. 83 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 3. 88 (2H, s), 6. 60 (1H, d, $J=16.4\text{ Hz}$), 7. 28–7. 47 (5H, m)。

【1276】

参考例 289

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-クロロフェノキシメチル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン

収率 59 %

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

1. 37 (3H, s), 2. 68 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 2. 78 (1H, d, $J=4.4\text{ Hz}$), 3. 86 (2H, s), 4. 90 (2H, s), 6. 91 (2H, d, $J=2.3\text{ Hz}$, 6. 9 Hz), 7. 29 (2H, dd, $J=2.3\text{ Hz}$, 6. 9 Hz)。

【1277】

参考例 290

2-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 1-ジオキソ-1, 2-ジヒドロベンゾ[d]イソチアゾール-3-オンの製造

サッカリン及びトルエン-4-スルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステルから参考例 281と同様にして、2-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 1-ジオキソ-1, 2-ジヒドロベンゾ[d]イソチアゾール-3-オンを製造した。

白色粉末結晶

収率 43 %

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

1. 49 (3H, s), 2. 74 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2. 96 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3. 73 (1H, d, $J=15.5\text{ Hz}$), 4. 04 (1H, d, $J=15.5\text{ Hz}$), 7. 81–8. 00 (3H, m), 8. 09 (1H, dd, $J=2.4\text{ Hz}$, 6. 6 Hz)。

【1278】

参考例 291

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-オンの製造

塩酸4-ピペリドン-水和物を用い、参考例 281と同様にして、1-(2-メチル-

10

20

30

40

50

2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-オンを製造した。

無色オイル、収率50%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.43 (3H, s), 2.35–2.51 (5H, m), 2.58–2.93 (7H, m)。

【1279】

参考例292

4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンの製造

1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンを用い、参考例281と同様にして、4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンを製造した。

10

無色粉末晶、収率63%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.37 (3H, s), 2.34 (1H, d, $J=12.9\text{ Hz}$), 2.53–2.67 (4H, m), 2.77–2.91 (1H, m), 3.14–3.37 (4H, m), 4.62 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 4.69 (1H, d, $J=15.1\text{ Hz}$), 7.38 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 7.60 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$)。

【1280】

参考例293

20

4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(tert-ブチル) ピペラジン-2-オンの製造

1-(tert-ブチル) ピペラジン-2-オンを用い、参考例281と同様にして、4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(tert-ブチル) ピペラジン-2-オンを製造した。

無色粉末晶、収率39%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.38 (3H, s), 1.45 (9H, s), 2.31 (1H, d, $J=12.9\text{ Hz}$), 2.42–2.55 (4H, m), 2.74–2.88 (1H, m), 3.02 (1H, d, $J=16.1\text{ Hz}$), 3.20 (1H, d, $J=16.1\text{ Hz}$), 3.28–3.37 (2H, m)。

30

【1281】

参考例294

(S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジンの製造

(R)-トルエン-4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステル(0.80g、3.30ミリモル)及び1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン(0.91g、3.36ミリモル)のDMF(8ml)溶液に、トリエチルアミン(0.55ml、3.96ミリモル)を加え、更に22時間室温で攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、微黄色液体の(S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン(0.46g、収率44%)を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.40 (3H, s), 2.34 (1H, d, $J=12.9\text{ Hz}$), 2.52–2.77 (7H, m), 3.10–3.27 (4H, m), 6.81–6.94 (2H, m), 7.06–7.17 (2H, m)。

【1282】

参考例295

(S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-カルボン酸エチ

50

ルエステルの製造

(R)－トルエン－４－スルホン酸（２－メチル－２－オキシラニルメチル）エステル（１３．５ｇ、５５．８ミリモル）、ピペリジン４－カルボン酸エチルエステル（８．９ｇ、５０．９ミリモル）及びトリエチルアミン（６．５ｇ、６４．４ミリモル）の混合物をDMF（７０ml）中にて室温で２日間攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n－ヘキサン／酢酸エチル＝３／１）により精製し、無色油状物質の（S）－１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）ピペリジン－４－カルボン酸エチルエステル（５．４ｇ、収率４７％）を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

１．２５（３H, t, $J=7.1\text{ Hz}$ ）, １．３６（３H, s）, １．６７－１．９３（４H, m）, １．９７－２．０８（２H, m）, ２．１９－２．３７（２H, m）, ２．４８（１H, d, $J=11.5\text{ Hz}$ ）, ２．５８（２H, s）, ２．７８－２．９７（２H, m）, ４．１３（２H, q, $J=7.1\text{ Hz}$ ）。

【１２８３】

対応する出発原料を用い、参考例２９５と同様にして、参考例２９６～参考例２９９の化合物を製造した。

【１２８４】

参考例２９６

20

（S）－１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）ピペリジン－４－カルボン酸４－トリフルオロメチルベンジルエステル

無色油状物、収率１８％

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

１．３５（３H, s）, １．６９－２．１０（６H, m）, ２．２５－２．３７（１H, m）, ２．２８（１H, d, $J=12.9\text{ Hz}$ ）, ２．４８（１H, d, $J=12.9\text{ Hz}$ ）, ２．５８（２H, s）, ２．８１－３．００（２H, m）, ５．１１（２H, s）, ７．２０（２H, d, $J=8.0\text{ Hz}$ ）, ７．３８（２H, d, $J=8.0\text{ Hz}$ ）。

【１２８５】

参考例２９７

30

（S）－１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）ピペリジン－４－カルボン酸４－クロルベンジルエステル

無色油状物、収率２６％

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

１．３６（３H, s）, １．７５－２．１６（７H, m）, ２．２７（１H, d, $J=12.9\text{ Hz}$ ）, ２．５０（１H, d, $J=12.9\text{ Hz}$ ）, ２．５８（２H, s）, ２．８７－３．０９（２H, m）, ５．１３（２H, s）, ７．１７－７．２１（２H, m）, ７．２７－７．３１（２H, m）。

【１２８６】

参考例２９８

40

（S）－１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）ピペリジン－４－カルボン酸（４－クロルベンジル）アミド

無色油状物、収率２６％

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

１．３６（３H, s）, １．７５－２．１６（７H, m）, ２．２７（１H, d, $J=12.9\text{ Hz}$ ）, ２．５０（１H, d, $J=12.9\text{ Hz}$ ）, ２．５８（２H, s）, ２．８７－３．０９（２H, m）, ４．４１（２H, d, $J=5.8\text{ Hz}$ ）, ５．７８（１H, br）, ７．１７－７．２１（２H, m）, ７．２７－７．３１（２H, m）。

【１２８７】

参考例２９９

50

(S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-カルボン酸(4-クロロフェニル)アミド

無色油状物、収率33%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.37 (3H, s), 1.82–2.08 (6H, m), 2.13–2.27 (1H, m), 2.30 (1H, d, $J=13.0\text{ Hz}$), 2.53 (1H, d, $J=13.0\text{ Hz}$), 2.60 (2H, s), 2.93–3.12 (2H, m), 7.16 (1H, bs), 7.26–7.31 (2H, m), 7.45–7.49 (2H, m)。

【1288】

参考例300

5-(2-メチル-2-オキシラニルメチルスルファニル)-1-フェニル-1H-テトラゾールの製造

1-フェニル-5-メルカプト-1H-テトラゾール(3.5g、19.64ミリモル)、トルエン-4-スルホン酸(2-メチル-2-オキシラニルメチル)エステル(5g、20.64ミリモル)、炭酸カリウム(3g、21.71ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(4.5g、30.02ミリモル)及びDMF(30ml)の混合物を60℃にて6時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、5%苛性ソーダにより洗浄後、3回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n -ヘキサン/酢酸エチル=2/1)により精製し、無色オイルの5-(2-メチル-2-オキシラニルメチルスルファニル)-1-フェニル-1H-テトラゾール(1.9g、収率39%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (3H, s), 2.73 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 2.91 (1H, d, $J=4.5\text{ Hz}$), 3.61 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 3.77 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 7.50–7.65 (5H, m)。

【1289】

参考例301

3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピオン酸tert-ブチルエステルの製造

水素化ナトリウム(3.71g、92.82ミリモル)のDMSO(50ml)懸濁液に氷冷攪拌下、トリメチルスルホニウムヨード(19.54g、88.78ミリモル)を加え、2.5時間攪拌し、4-オキソペンタン酸tert-ブチルエステル(13.90g、80.71ミリモル)のDMSO(20ml)溶液を加え、室温で15時間攪拌した。氷水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色液体の3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピオン酸tert-ブチルエステル(10.1g、収率67%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.32 (3H, s), 1.44 (9H, s), 1.85–1.94 (2H, m), 2.27–2.33 (2H, m), 2.58 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$), 2.63 (1H, d, $J=4.7\text{ Hz}$)。

【1290】

参考例302

2-イソプロピル-2-メトキシメトキシメチルオキシランの製造

2-メトキシメトキシメチル-3-メチル-1-ブテン(89g、615ミリモル)の塩化メチレン(800ml)溶液にm-クロロ過安息香酸(213g、861ミリモル)を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下18時間攪拌後、10%亜硫酸カリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2-イソプロピル-2-メトキシメトキシメチルオキシラン(98g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.95 (3H, d, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.02 (3H, d, $J=7.0\text{ Hz}$), 1.

10

20

30

40

50

8.4-2.05 (1H, m), 2.66 (1H, d, J=4.9 Hz), 2.75 (1H, d, J=4.9 Hz), 3.37 (3H, s), 3.63 (1H, d, J=11.3 Hz), 3.70 (1H, d, J=11.3 Hz), 4.62 (2H, s)。

【1291】

参考例303

2-エチル-2-メトキシメトキシメチルオキシランの製造

参考例206で製造した2-メトキシメトキシメチル-1-ブテン(98g、757ミリモル)の塩化メチレン(800ml)溶液にm-クロロ過安息香酸(143.7g、833ミリモル)を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下終夜攪拌後、水、10%亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2-エチル-2-メトキシメトキシメチルオキシラン(111g、定量的)を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

0.96 (3H, t, J=7.5 Hz), 1.60-1.73 (1H, m), 1.77-1.93 (1H, m), 2.66 (1H, d, J=4.8 Hz), 2.74 (1H, d, J=4.8 Hz), 3.37 (3H, s), 3.56 (1H, d, J=11.2 Hz), 3.65 (1H, d, J=11.2 Hz), 4.64 (2H, s)。

【1292】

参考例304

2-(2-メトキシメトキシエチル)オキシランの製造

20

4-メトキシメトキシ-1-ブテン(10.46g、90.1ミリモル)の塩化メチレン(250ml)溶液にm-クロロ過安息香酸(20.6g、95.6ミリモル)を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下6時間攪拌後、反応液を濾過して濾液を10%亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2-(2-メトキシメトキシエチル)オキシラン(10.3g、86%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.69-1.96 (2H, m), 2.53 (1H, dd, J=2.7 Hz, 4.9 Hz), 2.79 (1H, t, J=4.9 Hz), 3.02-3.08 (1H, m), 3.38 (3H, s), 3.68 (2H, t, J=5.9 Hz), 4.64 (2H, s)。

30

【1293】

参考例305

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン(0.6g、2.45ミリモル)のトルエン(6ml)懸濁液にトリホスゲン(0.25g、0.86ミリモル)及びピリジン(0.4ml、4.90ミリモル)を加え、2.5時間加熱還流した。酢酸エチルを加え、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、微黄色液体の4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボニルクロリド(0.72g、収率96%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

40

1.79-2.10 (4H, m), 3.50-3.96 (4H, m), 4.58-4.75 (1H, m), 6.97 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.56 (2H, d, J=8.8 Hz)。

【1294】

参考例306

4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン(1.14g、4.67ミリモル)の塩化メチレン(10ml)溶液にトリホスゲン(0.55g、1.87ミリモル)及びトリエチルアミン(0.98ml、7.01ミリモル)を加え、室温で1.5時間攪

50

拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、微黄色液体の4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボニルクロリド(1.43 g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.33-1.65 (2H, m), 2.09-2.24 (2H, m), 3.02-3.22 (1H, m), 3.22-3.41 (1H, m), 3.48-3.70 (1H, m), 4.20-4.35 (2H, m), 6.66 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.43 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【1295】

参考例305又は参考例306に示すように、トリホスゲン及びトリエチルアミン又はピリジン存在下、アミン類、環状アミン類、ベンゼン縮合ヘテロ環化合物を反応させることにより、参考例307～参考例324の化合物を製造した。

【1296】

参考例307

5-クロロ-2,3-ジヒドロインドール-1-カルボニルクロリド

微黄色固体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.19 (2H, t, $J=8.3\text{ Hz}$), 4.28 (2H, t, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.18-7.22 (2H, m), 7.80 (1H, d, $J=9.5\text{ Hz}$)。

【1297】

参考例308

6-クロロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボニルクロリド

微黄色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.83-3.00 (2H, m), 3.83 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 3.90 (1H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 4.71 (1H, s), 4.80 (1H, s), 7.06 (1H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.13-7.28 (2H, m)。

【1298】

参考例309

6-クロロ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボニルクロリド

黄色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.99-2.09 (2H, m), 2.79 (2H, t, $J=6.5\text{ Hz}$), 3.94 (2H, t, $J=6.3\text{ Hz}$), 7.14-7.20 (2H, m), 7.62 (1H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【1299】

参考例310

5-クロロ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-カルボニルクロリド

黄色液体、収率100%、

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.19 (2H, t, $J=8.3\text{ Hz}$), 4.28 (2H, t, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.18-7.22 (2H, m), 7.80 (1H, d, $J=9.5\text{ Hz}$)。

【1300】

参考例311

4-クロロカルボニルピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

微黄色固体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.47 (9H, s), 3.16-3.29 (2H, m), 3.37-3.55 (4H, m), 3.55-3.78 (2H, m)。

【1301】

10

20

30

40

50

参考例 3 1 2

4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

収率 100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.43-3.80 (8H, m), 5.15 (2H, s), 7.15-7.25 (2H, m), 7.33-7.45 (2H, m)。

【1302】

参考例 3 1 3

4- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルオキシカルボニル] ピペラジン-1-カルボニルクロリド

10

収率 100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.54-3.65 (4H, m), 3.65-3.72 (2H, m), 3.72-3.83 (2H, m), 4.80 (2H, dd, $J=1.1\text{ Hz}$, 6.1 Hz), 6.39 (1H, dt, $J=6.1\text{ Hz}$, 15.9 Hz), 6.68 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.49 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.59 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$)。

【1303】

参考例 3 1 4

4- (4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

20

茶色液体、収率 100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.65-2.96 (4H, m), 3.67-4.08 (6H, m), 7.36-7.39 (4H, m)。

【1304】

参考例 3 1 5

4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

茶色液体、収率 100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.97-3.12 (4H, m), 3.91-4.06 (2H, m), 4.06-4.21 (2H, m), 4.15 (2H, s), 7.58-7.73 (4H, m)。

30

【1305】

参考例 3 1 6

4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

茶色液体、収率 100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.58-2.85 (4H, m), 3.58-3.90 (6H, m), 7.17-7.25 (2H, m), 7.35-7.46 (2H, m)。

【1306】

参考例 3 1 7

4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

40

微茶色液体、収率 57%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.54-2.67 (2H, m), 3.85 (1H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.94 (1H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 4.28 (1H, d, $J=2.7\text{ Hz}$), 4.36 (1H, d, $J=2.7\text{ Hz}$), 5.94-6.06 (1H, m), 7.16-7.21 (2H, m), 7.36-7.41 (2H, m)。

【1307】

参考例 3 1 8

50

4-(4-メトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

微茶色液体、収率60%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.54-2.67 (2H, m), 3.51 (1H, t, $J=5.6\text{ Hz}$), 3.81 (3H, s), 3.92-4.02 (1H, m), 4.23-4.31 (1H, m), 4.31-4.37 (1H, m), 5.87-5.96 (1H, m), 6.85-6.90 (2H, m), 7.29-7.35 (2H, m)。

【1308】

参考例319

10

4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

微茶色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.58-2.71 (2H, m), 3.87 (1H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.96 (1H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 4.31 (1H, d, $J=2.8\text{ Hz}$), 4.39 (1H, d, $J=2.8\text{ Hz}$), 6.04-6.15 (1H, m), 7.45-7.63 (4H, m)。

【1309】

参考例320

20

4-(4-ブロモフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

微茶色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.52-2.67 (2H, m), 3.84 (1H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.93 (1H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 4.27 (1H, d, $J=2.6\text{ Hz}$), 4.35 (1H, d, $J=2.6\text{ Hz}$), 5.94-6.06 (1H, m), 7.21-7.24 (2H, m), 7.43-7.49 (2H, m)。

【1310】

参考例321

30

4-(4-フルオロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

微茶色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.54-2.67 (2H, m), 3.84 (1H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.93 (1H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 4.27 (1H, d, $J=2.6\text{ Hz}$), 4.35 (1H, d, $J=2.6\text{ Hz}$), 5.90-6.00 (1H, m), 7.00-7.07 (2H, m), 7.24-7.35 (2H, m)。

【1311】

参考例322

40

N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミルクロリド

微黄色固体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.79-1.06 (1H, m), 1.14 (2H, t, $J=3, 5\text{ Hz}$, 12.5 Hz), 1.23-1.44 (2H, m), 1.50-1.65 (1H, m), 1.67-1.81 (2H, m), 1.87-2.00 (2H, m), 4.78 (1H, m), 7.06-7.10 (2H, m), 7.36-7.41 (2H, m)。

【1312】

参考例323

N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミルクロリド

50

黄色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.09 (3H, s), 4.58 (2H, s), 7.16–7.33 (4H, m)。

【1313】

参考例324

4-[(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジン-1-カルボニルクロリド

茶色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.17–3.39 (4H, m), 3.74–4.02 (4H, m), 7.56 (1H, s), 7.60 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.69 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$)。

10

【1314】

参考例325

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリドの製造
1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン (1.0 g、4.1ミリモル) のトルエン (20 ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、トリホスゲン (0.42 g、1.4ミリモル) 及びピリジン (0.66 ml、8.2ミリモル) を加え、100℃で4.5時間攪拌した。酢酸エチルを加え、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、茶色液体の4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド (1.3 g、定量的) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.08–3.30 (4H, m), 3.67–4.00 (4H, m), 6.79–6.98 (2H, m), 7.08–7.17 (2H, m)。

【1315】

対応する出発原料を用い、参考例325と同様にして、参考例326～参考例332の化合物を定量的に製造した。

【1316】

参考例326

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.26–3.39 (4H, m), 3.76–3.87 (2H, m), 3.87–3.98 (2H, m), 6.87–6.98 (2H, m), 7.48–7.59 (2H, m)。

【1317】

参考例327

4-(4-メトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.04–3.15 (4H, m), 3.52–3.75 (2H, m), 3.75–3.92 (2H, m), 3.78 (3H, s), 6.81–6.98 (4H, m)。

【1318】

40

参考例328

4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.10–3.25 (4H, m), 3.37–3.52 (2H, m), 3.73–3.90 (2H, m), 6.83–6.88 (2H, m), 7.20–7.25 (2H, m)。

【1319】

参考例329

4-(3-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.15–3.29 (4H, m), 3.73–3.94 (4H, m), 6.77–6.8

50

1 (1H, m), 6.88–6.91 (2H, m), 7.20 (1H, t, $J = 8.3$ Hz)。

【1320】

参考例330

4-(3,4-ジクロロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.08–3.27 (4H, m), 3.37–3.48 (2H, m), 3.60–3.73 (1H, m), 3.73–3.90 (1H, m), 6.75 (1H, dd, $J = 2.9$ Hz, 9.0 Hz), 6.96–6.98 (1H, m), 7.30 (1H, dd, $J = 5.1$ Hz, 9.0 Hz)。

10

【1321】

参考例331

4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.04–3.19 (4H, m), 3.40–3.50 (2H, m), 3.62–3.75 (1H, m), 3.75–3.92 (1H, m), 6.86–7.03 (4H, m)。

【1322】

参考例332

4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.21–3.35 (4H, m), 3.42–3.54 (2H, m), 3.77–3.96 (2H, m), 7.02–7.19 (3H, m), 7.31–7.46 (1H, m)。

20

【1323】

参考例333

4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-ピペリジン-4-イルピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.5 g、5.67ミリモル)、4-(トリフルオロメトキシ)ブromベンゼン (3.36 g、13.92ミリモル)、酢酸パラジウム (25 mg、0.11ミリモル)、BINAP (87 mg、0.14ミリモル)、tert-ブトキシナトリウム (1.07 g、11.14ミリモル) 及びトルエン (20 ml) の混合物を窒素雰囲気下、80℃にて8時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル 10 ml 及び飽和食塩水 20 ml を加え、濾過した。濾液を分液し、有機相を硫酸ナトリウムにより乾燥した。有機相を濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 20/1) により精製することにより、黄色粉末の4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.01 g、42%) を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.49 (9H, s), 1.52–1.75 (2H, m), 1.83–1.99 (2H, m), 2.31–2.52 (5H, m), 2.64–2.81 (2H, m), 3.36–3.49 (4H, m), 3.62–3.75 (2H, m), 6.86 (2H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.09 (2H, d, $J = 8.5$ Hz)。

40

【1324】

参考例334

1-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジンの製造

4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1 g、2.33ミリモル) を塩化メチレン (10 ml) に溶解し、氷冷下にてトリフルオロ酢酸 (10 ml) を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を25%苛性ソーダ (40 ml)、飽和食塩水 (10 ml) の順に

50

洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。この反応液を濾過後、濾液を濃縮することにより、黄色アモルファスの1-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン(770mg、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

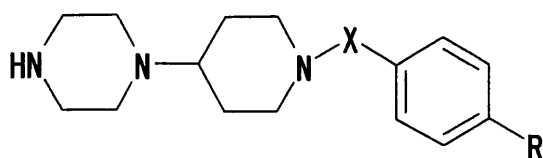
1.52–1.75 (2H, m), 1.83–1.99 (2H, m), 2.25–2.38 (1H, m), 2.48–2.76 (6H, m), 2.79–2.99 (4H, m), 3.56–3.75 (2H, m), 6.89 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.09 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)。

【1325】

参考例334と同様にして、下記表1～表6に示す化合物を製造した。表1及び表2において、Xの欄に「none」とあるのは、Xが直接結合であることを意味する。また、表3以降において、「Ph」とあるのはフェニル基又はフェニレン基を意味する。

【1326】

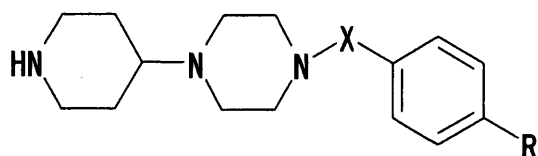
【表1】



参考例	X	R	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm
335	none	OCF_3	1.52–1.75(2H, m), 1.83–1.99(2H, m), 2.25–2.35(1H, m), 2.48–2.76(6H, m), 2.79–2.99(4H, m), 3.56–3.75(2H, m), 6.89(2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.09(2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)
336	C=O	Cl	1.31–1.55(2H, m), 1.69–1.98(2H, m), 2.36–2.60(5H, m), 2.69–3.00(6H, m), 3.69–3.86(1H, m), 4.55–4.79(1H, m), 7.24–7.43(4H, m)
337	C=O	OCF_3	1.31–1.60(2H, m), 1.71–2.00(2H, m), 2.38–2.60(5H, m), 2.67–3.07(6H, m), 3.62–3.86(1H, m), 4.57–4.83(1H, m), 7.25(2H, d, $J=2.3\text{ Hz}$, 8.7Hz), 7.45(2H, d, $J=2.3\text{ Hz}$, 8.7Hz).
338	CH_2	Cl	1.45–1.60(2H, m), 1.67–1.83(2H, m), 1.86–2.00(2H, m), 2.12–2.24(1H, m), 2.45–2.57(4H, m), 2.79–2.93(6H, m), 3.44(2H, s), 7.14–7.31(4H, m)
339	CH_2	OCF_3	1.48–1.81(4H, m), 1.85–2.00(2H, m), 2.12–2.29(1H, m), 2.43–2.57(4H, m), 2.76–2.98(6H, m), 3.46(2H, s), 7.15(2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.33 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$)

【1327】

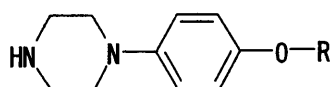
【表 2】



参考例	X	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
340	C=O	Cl	1.29—1.48(2H, m), 1.67—1.86(2H, m), 2.31—2.69(7H, m), 3.07—3.21(2H, m), 3.31—3.50(2H, m), 3.60—3.83(2H, m), 7.26—7.45(4H, m)
341	C=O	OCF ₃	1.31—1.50(2H, m), 1.64—1.83(2H, m), 2.29—2.69(7H, m), 3.07—3.21(2H, m), 3.31—3.50(2H, m), 3.64—3.83(2H, m), 7.25(2H, d, J=8.7Hz), 7.45(2H, d, J=8.7Hz)
342	CH ₂	OCF ₃	1.25—1.48(2H, m), 1.69—1.86(2H, m), 2.19—2.62(11H, m), 3.00—3.17(2H, m), 3.50(2H, s), 7.15(2H, d, J=8.6Hz), 7.34(2H, d, J=8.6Hz)
343	CH ₂	Cl	1.24—1.43(2H, m), 1.74—1.86(2H, m), 2.21—2.60(11H, m), 3.02—3.17(2H, m), 3.46(2H, s), 7.19—7.33(4H, m)
344	none	OCF ₃	1.31—1.51 (2H, m), 1.76—1.93 (2H, m), 2.29—2.45 (1H, m), 2.52—2.79 (6H, m), 3.10—3.26 (6H, m), 6.88 (2H, d, J=8.6Hz), 7.10 (2H, d, J=8.6Hz).
345	none	Cl	1.33—1.52(2H, m), 1.81—1.98(2H, m), 2.26—2.43(1H, m), 2.52—2.74(6H, m), 3.05—3.21(6H, m), 6.84(2H, d, J=6.9Hz), 7.19 (2H, d, J=6.9Hz)

【 1 3 2 8 】

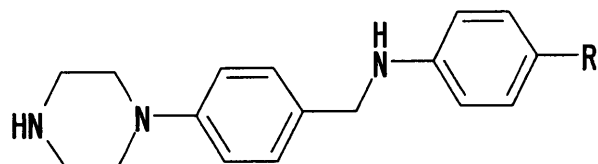
【表 3】



参考例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
346	4-ClPh-	2.98—3.12(8H, m), 6.80—6.94(6H, m), 7.24(2H, d, J=2.3Hz, 6.8Hz)
347	4-CF ₃ PhCH ₂ -	3.04(8H, s), 5.08(2H, s), 6.90(4H, s), 7.54(2H, d, J=8.2Hz), 7.63(2H, d, J=8.2Hz)
348	4-ClPhCH ₂ -	3.03(8H, s), 4.98(2H, s), 6.89(4H, s), 7.35(4H, s).
349	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	3.04(8H, s), 5.01(2H, s), 6.90(4H, s), 7.22(2H, d, J=8.5Hz), 7.45(2H, d, J=8.5Hz)
350	4-CF ₃ OPh-	2.96—3.14(8H, m), 6.82—6.98(6H, m), 7.06—7.16(2H, m)
351	4-CF ₃ Ph-	2.96—3.14(8H, m), 6.84—7.00(6H, m), 7.53(2H, d, J=8.6Hz)

【 1 3 2 9 】

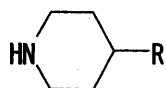
【表 4】



参考例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
352	Cl-	2.96-3.16(8H, m), 3.97(1H, br), 4.20(1H, d, J=5.4Hz), 6.55(1H, d, J=8.8Hz), 6.60(1H, d, J=8.8Hz), 6.90(1H, d, J=8.8Hz), 7.00-7.14(4H, m), 7.18-7.25(1H, m)
353	CF ₃ O-	2.94-3.20(8H, m), 4.00(1H, br), 4.21(1H, d, J=5.3Hz), 6.57(1H, d, J=6.8Hz), 6.64(1H, d, J=8.8Hz), 6.80-7.12(5H, m), 7.16-7.25(1H, m)

【 1 3 3 0 】

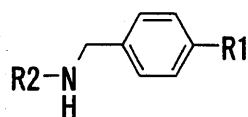
【表 5】



参考 例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
354		1.51—1.73(2H, m), 1.76—1.92(2H, m), 2.51—2.82(3H, m), 3.10—3.27(2H, m), 6.92—7.08(4H, m), 7.12—7.27(2H, m), 7.56(2H, d, J=8.6Hz)
355		1.33—1.60(4H, m), 1.69—2.02(4H, m), 2.29—2.64(5H, m), 2.76—2.88(2H, m), 3.05—3.17(2H, m), 4.14—4.31(1H, m), 6.85(2H, d, J=8.7Hz), 7.12(2H, d, J=8.7Hz)
356		1.52—1.98(4H, m), 2.26—2.43(1H, m), 2.55—2.74(2H, m), 3.10—3.26(2H, m), 7.18(2H, d, J=8.4Hz), 7.55(2H, d, J=8.4Hz)
357		1.60—1.81(4H, m), 2.57—2.74(3H, m), 3.05—3.21(6H, m), 3.60—3.83(4H, m), 6.90(2H, d, J=8.4Hz), 7.13(2H, d, J=8.4Hz)
358		1.56—1.73(2H, m), 1.83—1.89(3H, m), 2.57—2.82(3H, m), 3.18—3.24(2H, m), 6.95—7.05(4H, m), 7.20—7.25(2H, m), 7.53—7.57(2H, m)
359		1.57—1.86(4H, m), 2.52—2.81(4H, m), 3.19—3.25(2H, m), 5.03(2H, s), 6.89—6.94(2H, m), 7.11—7.25(4H, m), 7.44—7.48(2H, m)
360		1.51—1.68(3H, m), 1.78—1.84(2H, m), 2.50—2.64(1H, m), 2.67—2.79(2H, m), 3.15—3.21(2H, m), 5.11(1H, s), 6.87—6.94(2H, m), 7.12—7.18(2H, m), 7.52—7.57(2H, m), 7.62—7.66(2H, m)
361		1.60—2.12(5H, m), 2.52—2.66(1H, m), 2.71—2.83(2H, m), 3.22—3.28(2H, m), 5.01(2H, s), 6.88—6.93(2H, m), 7.11—7.18(2H, m), 7.30—7.41(4H, m)
362		1.86—2.18(3H, m), 2.35—2.52(1H, m), 2.61—2.69(1H, m), 2.93—3.01(5H, m), 3.24—3.59(3H, m), 4.49(2H, s), 6.67—6.70(2H, m), 7.07—7.17(4H, m), 7.23—7.27(2H, m)

【1 3 3 1】

【表 6】



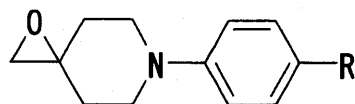
参考例	R1	R2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
363		CH ₃	1.50(9H, s), 2.44(3H, s), 3.00–3.14(4H, m), 3.49–3.57(4H, m), 3.72(2H, s), 6.89(2H, d, J=7.2 Hz), 7.26(2H, d, J=7.2 Hz).
364		C ₂ H ₅	1.15(3H, t, J=7.1Hz), 1.48(9H, s), 2.18(1H, brs), 2.69(2H, q, J=7.1Hz), 3.09–3.12(4H, m), 3.55–3.59(4H, m), 3.73(2H, s), 6.86–6.92(2H, m), 7.23–7.26(2H, m).
365		CH ₃	1.09–1.16(3H, m), 1.78–1.88(2H, m), 2.49(3H, s), 2.73–2.80(2H, m), 3.17–3.31(3H, m), 3.62–3.79(5H, m), 3.92(2H, s), 6.67–6.70(2H, m), 6.91–6.93(2H, m), 7.13–7.19(2H, m), 7.39–7.42(2H, m).

【1 3 3 2】

参考例 2 2 2 と同様にして、下記表 7 に示す化合物を製造した。

【1 3 3 3】

【表 7】



参考例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
366	-Cl	1.51–1.67(2H, m), 1.90–2.04(2H, m), 2.72(2H, s), 3.18–3.43(4H, m), 6.89(2H, d, J=8.4Hz), 7.21(2H, d, J=8.4Hz)
367	-OCF ₃	1.53–1.67(2H, m), 1.86–2.04(2H, m), 2.73(2H, s), 3.22–3.45(4H, m), 6.93(2H, d, J=8.4Hz), 7.11(2H, d, J=8.4Hz).
368		1.53–1.63(2H, m), 1.90–2.06(2H, m), 2.73(2H, s), 3.24(3H, s), 3.27–3.45(4H, m), 6.72(2H, d, J=8.4Hz), 6.90–7.10(6H, m).
369		1.54–1.69(2H, m), 1.92–2.06(2H, m), 2.73(2H, s), 3.20–3.43(4H, m), 6.84–6.96(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.4Hz)
370		1.58–1.69(2H, m), 1.88–2.15(6H, m), 2.71(2H, s), 2.90–3.04(2H, m), 3.17–3.44(6H, m), 4.31–4.46(1H, m), 6.85–6.94(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.4Hz)
371		1.55–1.71(2H, m), 1.92–2.04(2H, m), 2.72(2H, s), 3.12–3.35(12H, m), 6.86–7.00(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.5Hz).

【1 3 3 4】

参考例 1 8 6 と同様にして、参考例 3 7 2 ～参考例 3 9 5 の化合物を製造した。

【1 3 3 5】

参考例 3 7 2

1- (4-ヒドロキシフェニル) - 4-フェニルピペリジン-4-オール
 Ms ; 269 (M⁺) 。

【1336】

参考例373

4- (4-クロロフェニル) - 1- (4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-4-オール
 Ms ; 349 (M⁺-1) 。

【1337】

参考例374

1- (4-ヒドロキシフェニル) - 4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-オール
 Ms : 353 (M⁺) 。

10

【1338】

参考例375

(4-ヒドロキシフェニル) - [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] メタノン
 Ms ; 381 (M⁺) 。

【1339】

参考例376

1- (4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸 tert-ブチルエステル
 20

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ;

1.46 (9H, s), 1.76-2.05 (4H, m), 2.23-2.34 (1H, m), 2.62-2.73 (2H, m), 3.39-3.48 (2H, m), 4.39-4.49 (1H, m), 4.78 (1H, s), 6.72-6.78 (2H, m), 6.82-6.89 (2H, m) 。

【1340】

参考例377

4- (4-フェニルピペリジン-1-イル) フェノール
 Ms : 253 (M⁺) 。

【1341】

参考例378

4- (4, 4-ジエトキシピペリジン-1-イル) フェノール
 Ms : 265 (M⁺) 。

30

【1342】

参考例379

2-ジメチルアミノメチル-4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノール
 Ms : 410 (M⁺) 。

【1343】

参考例380

4- (4- [1, 3] ジオキソラン-2-イルピペリジン-1-イル) フェノール

40

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm ;

1.51-1.70 (2H, m), 1.80-1.92 (2H, m), 2.53-2.66 (2H, m), 3.48-3.57 (2H, m), 3.84-3.92 (2H, m), 3.92-4.02 (2H, m), 4.63 (1H, brs), 4.69 (1H, d, J = 4.9 Hz), 6.70-6.78 (2H, m), 6.83-6.91 (2H, m) 。

【1344】

参考例381

4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノール
 Ms : 337 (M⁺) 。

50

【1345】

参考例382

4-(4-ヒドロキシフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

MS: 293 (M^+)。

【1346】

参考例383

4-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イルオキシ]フェノール

MS: 337 (M^+)。

10

【1347】

参考例384

4-(1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]-デカン-8-イル)フェノール

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;1.87 (4H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.18 (4H, t, $J=5.7\text{ Hz}$), 3.99 (4H, s), 6.74 (2H, d, $J=8.9\text{ Hz}$), 6.88 (2H, d, $J=8.9\text{ Hz}$)。

【1348】

参考例385

4-(4-フェニル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)フェノール

MS: 251 (M^+)。

20

【1349】

参考例386

4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

1.49 (9H, s), 2.95-3.00 (4H, m), 3.55-3.60 (4H, m), 5.77 (1H, s), 6.74-6.86 (4H, m)。

【1350】

参考例387

4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノール

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

3.19-3.24 (4H, m), 3.29-3.34 (4H, m), 4.51 (1H, s), 6.76-6.82 (2H, m), 6.87-6.97 (4H, m), 7.11-7.16 (2H, m)。

【1351】

参考例388

4-{4-[(4-トリフルオロメトキシベンジリデン) アミノ] ピペラジン-1-イル}フェノール

MS: 349 (M^+-1)。

40

【1352】

参考例389

4-[4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノール

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;2.60 (4H, t, $J=4.8\text{ Hz}$), 3.08 (4H, t, $J=4.8\text{ Hz}$), 3.53 (2H, s), 6.71-6.78 (2H, m), 6.81-6.89 (2H, m), 7.27-7.42 (4H, m)。

【1353】

参考例390

3-(4-ヒドロキシフェニル)オキサゾリジン-2-オン

50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

3.94–4.01 (2H, m), 4.35–4.42 (2H, m), 6.73–6.80 (2H, m), 7.29–7.36 (2H, m), 9.34 (1H, s)。

【1354】

参考例391

4-(4-ピリジル)フェノール

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

6.87–6.93 (2H, m), 7.60–7.70 (4H, m), 8.54–8.57 (2H, m), 9.85 (1H, s)。

【1355】

10

参考例392

4-ヒドロキシ-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ベンズアミド

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

6.84–6.87 (2H, m), 7.31–7.34 (2H, m), 7.83–7.87 (4H, m), 10.11 (1H, brs), 10.15 (1H, brs)。

【1356】

参考例393

(4-ヒドロキシフェニル)-(4-トリフルオロメトキシフェニル)メタノン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

6.08 (1H, s), 6.92–6.96 (2H, m), 7.30–7.33 (2H, m), 7.76–7.83 (4H, m)。

20

【1357】

参考例394

(4-ヒドロキシフェニル)-(4-トリフルオロメチルフェニル)メタノン

Ms: 266 (M^+)。

【1358】

参考例395

4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェノール

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

4.67 (1H, brs), 6.81–6.85 (2H, m), 6.90–6.96 (4H, m), 7.13–7.16 (2H, m)。

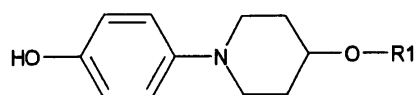
30

【1359】

参考例186と同様にして、下記表8～表12に示す化合物を製造した。

【1360】

【表 8】



参考例	R1	NMR or Ms
396	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.87-2.01(2H, m), 2.04-2.16(2H, m), 2.91-3.02(2H, m), 3.29-3.39(2H, m), 4.34-4.44(1H, m), 4.85(1H, s), 6.71-6.78(2H, m), 6.82-6.92(4H, m), 7.20-7.26(2H, m).
397	4-CF ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.90-2.05(2H, m), 2.08-2.20(2H, m), 2.94-3.05(2H, m), 3.30-3.40(2H, m), 4.46-4.56(1H, m), 4.64(1H, s), 6.72-6.80(2H, m), 6.86-6.93(2H, m), 6.96-7.00(2H, m), 7.52-7.56(2H, m).
398	4-FPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.86-2.00(2H, m), 2.04-2.16(2H, m), 2.90-3.00(2H, m), 3.30-3.40(2H, m), 4.29-4.39(1H, m), 4.72(1H, s), 6.71-6.78(2H, m), 6.83-7.01(6H, m).
399	4-CH ₃ OPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.86-2.00(2H, m), 2.05-2.13(2H, m), 2.88-2.99(2H, m), 3.31-3.41(2H, m), 3.77(3H, s), 4.25-4.35(1H, m), 4.72(1H, s), 6.72-6.77(2H, m), 6.80-6.92(6H, m).
400	4-CH ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.87-2.01(2H, m), 2.04-2.16(2H, m), 2.29(3H, s), 2.90-3.00(2H, m), 3.30-3.40(2H, m), 4.33-4.43(1H, m), 4.85(1H, s), 6.71-6.78(2H, m), 6.80-6.92(4H, m), 7.06-7.10(2H, m).
401	-C ₆ H ₅	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.89-2.03(2H, m), 2.04-2.18(2H, m), 2.92-3.02(2H, m), 3.31-3.41(2H, m), 4.39-4.49(1H, m), 4.92(1H, s), 6.70-6.78(2H, m), 6.84-6.98(5H, m), 7.24-7.33(2H, m).
402	4-CNPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.90-2.04(2H, m), 2.09-2.18(2H, m), 2.94-3.04(2H, m), 3.29-3.39(2H, m), 4.49-4.55(1H, m), 6.75-6.80(2H, m), 6.86-6.90(2H, m), 6.93-7.00(2H, m), 7.55-7.62(2H, m).
403	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	Ms: 289 (M ⁺)
404		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.54-2.07(11H, m), 2.74-2.87(2H, m), 3.31-3.43(2H, m), 3.47-3.57(1H, m), 3.72-3.83(1H, m), 3.88-3.98(1H, m), 4.74-4.78(1H, m), 6.69-6.76(2H, m), 6.83-6.88(2H, m).

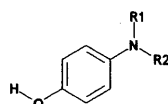
【1361】

10

20

30

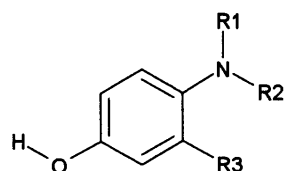
【表 9】



参考例	R1	R2	NMR
405	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.23(3H, s), 4.88(1H, s), 6.66-6.73(2H, m), 6.80-6.87(2H, m), 6.99-7.08(4H, m).
406	-CH ₃	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.22(3H, s), 4.69(1H, brs), 6.66-6.68(2H, m), 6.81-6.84(2H, m), 7.01-7.04(2H, m), 7.10-7.13(2H, m).
407	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.28(3H, s), 4.80(1H, brs), 6.68-6.71(2H, m), 6.85-6.88(2H, m), 7.06-7.09(2H, m), 7.37-7.40(2H, m).
408	-C ₂ H ₅	4-CF ₃ OPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.19(3H, t, J=7.1Hz), 3.66(2H, q, J=7.1Hz), 4.75(1H, brs), 6.62-6.66(2H, m), 6.83-6.87(2H, m), 6.98-7.05(4H, m).
409	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.34(1H, bs), 4.49(4H, brs), 6.61-6.72(4H, m), 7.14-7.16(4H, m), 7.24-7.26(4H, m).
410	-C ₂ H ₅	4-CF ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.21(3H, t, J=7.1Hz), 3.70(2H, q, J=7.1Hz), 4.87(1H, brs), 6.62-6.65(2H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.03-7.09(2H, m), 7.34-7.37(2H, m).
411	-C ₂ H ₅	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.17(3H, t, J=7.1Hz), 3.65(2H, q, J=7.1Hz), 4.73(1H, brs), 6.59-6.63(2H, m), 6.82-6.85(2H, m), 6.98-7.03(2H, m), 7.06-7.10(2H, m).
412	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.90(3H, s), 4.33(1H, brs), 4.40(2H, brs), 6.66-6.70(2H, m), 6.72-6.76(2H, m), 7.13-7.16(2H, m), 7.25-7.27(2H, m).
413	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.88(3H, s), 4.34(1H, brs), 4.36(2H, brs), 6.65-6.69(2H, m), 6.71-6.76(2H, m), 7.15-7.18(2H, m), 7.25-7.28(2H, m).
414	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.92(3H, s), 4.35(1H, brs), 4.46(2H, brs), 6.65-6.68(2H, m), 6.73-6.76(2H, m), 7.34-7.37(2H, m), 7.55-7.58(2H, m).
415	-C ₂ H ₅	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.14(3H, t, J=7.1Hz), 4.12(2H, q, J=7.1Hz), 4.28(1H, brs), 4.39(2H, brs), 6.50-6.80(4H, m), 7.13-7.15(2H, m), 7.26-7.28(2H, m).
416	-C ₂ H ₅	4-CF ₃ PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.16(3H, t, J=7.0Hz), 3.38(2H, brs), 4.29(1H, brs), 4.45(2H, brs), 6.61-6.70(4H, m), 7.35-7.38(2H, m), 7.54-7.56(2H, m).
417	-C ₂ H ₅	4-ClPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.14(3H, t, J=7.0Hz), 3.35(2H, brs), 4.28(1H, brs), 4.36(2H, brs), 6.62-6.70(4H, m), 7.17-7.19(2H, m), 7.25-7.28(2H, m).
418	-COCH ₃	-C ₆ H ₅	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.06(3H, s), 6.27(1H, brs), 6.69-6.80(2H, m), 7.08-7.33(7H, m).
419	-COCH ₃	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.06(3H, s), 6.50(1H, brs), 6.63-6.85(2H, m), 7.05-7.08(2H, m), 7.18-7.38(4H, m).

【1362】

【表 10】



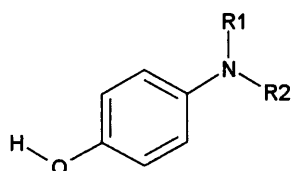
参考例	R1	R2	NMR
420	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.22(3H, s), 5.02(1H, brs), 6.57-6.71(4H, m), 7.01-7.14(3H, m).
421	-CH ₃	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.20(3H, s), 5.02(1H, brs), 6.54-6.70(4H, m), 7.07-7.13(3H, m).
422	-CO ₂ CH ₃	-C ₆ H ₅	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.75(3H, s), 5.86(1H, brs), 6.69-6.72(2H, m), 7.05-7.08(2H, m), 7.18-7.31(5H, m).
423	-CO ₂ CH ₃	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.75(3H, s), 5.52(1H, brs), 6.73-6.76(2H, m), 7.04-7.07(2H, m), 7.16-7.18(2H, m), 7.26-7.29(2H, m).
424	-COCH ₃	4-CF ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.08(3H, s), 6.04(1H, brs), 6.83-6.86(2H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.37-7.40(2H, m), 7.56-7.59(2H, m).
425	-COCH ₃	4-CF ₃ OPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.07(3H, s), 6.60-6.92(3H, m), 6.98-7.30(6H, m).
426	-CH ₃	-C ₆ H ₅	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.24(3H, s), 4.63(1H, brs), 6.76-6.84(5H, m), 7.01-7.05(2H, m), 7.17-7.22(2H, m).
427	-COCH ₃	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.07(3H, brs), 6.46-6.61(2H, m), 6.96-7.36(6H, m).
428	-COCH ₃	4-CF ₃ OPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.07(3H, brs), 6.48-6.62(2H, m), 6.90-7.42(6H, m).

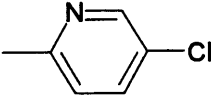
10

20

【 1 3 6 3 】

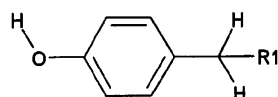
【表 1 1】



参考例	R1	R2	NMR or Ms
429	-C ₆ H ₅	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.72(1H, brs), 4.89(2H, brs), 6.75-6.83(5H, m), 7.05-7.18(6H, m), 7.34-7.37(2H, m).
430	-C ₆ H ₅	4-CF ₃ PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.67(1H, brs), 4.95(2H, brs), 6.74-6.83(5H, m), 7.06-7.18(4H, m), 7.44-7.47(2H, m), 7.54-7.57(2H, m).
431	-C ₆ H ₅	4-ClPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.64(1H, brs), 4.86(2H, brs), 6.74-6.82(5H, m), 7.04-7.08(2H, m), 7.12-7.17(2H, m), 7.26(4H, brs).
432	-COCH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.89(3H, s), 4.83(2H, s), 6.54(1H, brs), 6.82(4H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.20-7.26(2H, m).
433	-CH ₃	4-CF ₃ PhCO-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.46(3H, s), 6.28(1H, brs), 6.68-6.71(2H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.33-7.44(4H, m).
434	-CH ₃	4-ClPhCO-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.44(3H, s), 5.12(1H, brs), 6.67-6.72(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.13-7.16(2H, m), 7.21-7.24(2H, m).
435	-H	4-CF ₃ OPhCO-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 6.71-6.76(2H, m), 7.48-7.52(4H, m), 8.02-8.05(2H, m), 9.25(1H, s), 10.10(1H, brs).
436	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.45(3H, s), 6.13(1H, brs), 6.69-6.72(2H, m), 6.87-6.89(2H, m), 6.99-7.02(2H, m), 7.31-7.34(2H, m).
437	-CH ₃	4-CF ₃ OPhO(CH ₂) ₃ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.97-2.06(2H, m), 2.85(3H, s), 3.42(2H, t, J=6.9Hz), 3.99(2H, t, J=6.0Hz), 4.28(1H, brs), 6.65-6.75(4H, m), 6.86-6.89(2H, m), 7.11-7.14(2H, m).
438	-H		219(M+ - 1)

【 1 3 6 4 】

【表 1 2】



参考例	R1	NMR or Ms
439		Ms: 367 (M ⁺)
440		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.96(3H, s), 4.43(2H, brs), 4.68(1H, s), 6.63–6.66(2H, m), 6.76–6.80(2H, m), 7.05–7.08(2H, m), 7.12–7.15(2H, m).
441		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.90(3H, brs), 4.83(2H, s), 5.88(1H, brs), 6.74–6.76(2H, m), 7.02–7.06(2H, m), 7.10–7.13(2H, m), 7.60–7.63(2H, m).
442		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.06(3H, s), 4.52(2H, s), 4.70(1H, s), 6.71–6.81(4H, m), 7.05–7.07(2H, m), 7.41–7.44(2H, m).
443		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.99(3H, s), 4.44(2H, s), 4.68(1H, s), 6.66–6.70(2H, m), 6.77–6.81(2H, m), 7.04–7.10(4H, m).
444		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.95(1H, brs), 4.21(2H, s), 4.69(1H, brs), 6.53–6.56(2H, m), 6.79–6.82(2H, m), 7.09–7.12(2H, m), 7.20–7.23(2H, m).
445		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.28(3H, brs), 4.71(1H, brs), 6.60–6.63(2H, m), 6.79–6.83(2H, m), 7.21–7.23(2H, m), 7.38–7.40(2H, m).
446		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.16(3H, s), 3.45(2H, s), 3.48(2H, s), 4.82(1H, brs), 6.76–6.79(2H, m), 7.14–7.22(4H, m), 7.35–7.38(2H, m).
447		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.03(1H, brs), 4.22(2H, s), 4.72(1H, brs), 6.56–6.69(2H, m), 6.80–6.83(2H, m), 7.01–7.04(2H, m), 7.21–7.24(2H, m).

【1 3 6 5】

実施例 1

2-クロロ-1-(3-クロロ-2-ヒドロキシプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (2 g、13.56ミリモル) 及びエピクロロヒドリン (1.38 g、14.91ミリモル) のアセトニトリル (60 ml) 溶液に、炭酸水素ナトリウム (1.25 g、14.91ミリモル) を加え、4時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水 (20 ml) を加え、塩化メチレン (15 ml) で2回抽出し、抽出液を硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/n-ヘキサン=1/1) にて精製して、微黄色油状物の2-クロロ-1-(3-クロロ-2-ヒドロキシプロピル)-4-ニトロイミダゾール (2.04 g、収率63%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.51–3.70 (2H, m), 4.02–4.35 (4H, m), 7.92 (1H, s)。

【1366】

実施例 2

2-クロロ-4-ニトロ-1-(2-オキシラニルメチル)イミダゾールの製造

実施例 1 で製造した 2-クロロ-1-(3-クロロ-2-ヒドロキシプロピル)-4-ニトロイミダゾール (2.04 g、8.5 ミリモル) を塩化メチレン (20 ml) に溶解し、1, 8-ジアザビシクロ [5.4.0]-7-ウンデセン (DBU、2.04 ml、13.67 ミリモル) を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を 3 規定塩酸 (20 ml)、飽和食塩水 (20 ml) の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 20/1) にて精製し、無色油状物の 2-クロロ-4-ニトロ-1-(2-オキシラニルメチル)イミダゾール (190 mg、収率 11%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.55–2.69 (1H, m), 2.97 (1H, t, $J = 4.2 \text{ Hz}$), 3.26–3.43 (1H, m), 3.94 (1H, dd, $J = 6.4 \text{ Hz}$, 15.0 Hz), 4.52 (1H, dd, $J = 2.6 \text{ Hz}$, 15.0 Hz), 7.88 (1H, s)。

【1367】

実施例 3

2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (6.78 g、46 ミリモル) 及び 4-ニトロ安息香酸 2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (12 g、51 ミリモル) を酢酸エチル (24 ml) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン (1.3 ml、9.2 ミリモル) を加えて 14 時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に塩化メチレン (40 ml) を加えて結晶化した。得られた結晶を濾取し、メタノール (120 ml) に溶解した。炭酸カリウム (318 mg、2.3 ミリモル) を加え、室温で 1 時間攪拌した。氷冷下、6 規定塩酸 (0.8 ml) 及び硫酸マグネシウム (8 g) をこの順に加え、30 分攪拌した。不溶物をセライト濾過して除き、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (6 ml) 及びトルエン (60 ml) を加えた。得られた結晶を濾取し、50℃ にて乾燥して、白色粉末晶の 2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (7.88 g、収率 72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.02 (3H, s), 3.25 (2H, d, $J = 5.3 \text{ Hz}$), 4.04 (2H, s), 4.98 (1H, s), 5.10 (1H, t, $J = 5.4 \text{ Hz}$), 8.29 (1H, s)。

【1368】

実施例 4

2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例 3 で製造した 2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (5.05 g、21.43 ミリモル) のピリジン (10 ml) 溶液に、氷冷攪拌下、メタンスルホニルクロリド (2.01 ml、25.72 ミリモル) を加え、室温で 1.5 時間攪拌した。6 N 塩酸を加え酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して黄色油状物の 2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (6.72 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.31 (3H, s), 2.10 (1H, s), 3.11 (3H, s), 4.08–4.

2.3 (4H, m), 8.02 (1H, s)。

【1369】

実施例5

2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1g、6.78ミリモル) 及びパラトレンスルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (2.46g、10.15ミリモル)、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド (150mg、0.66ミリモル) 及びアセトニトリル (10ml) の混合物を8時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより希釈し、飽和重曹水により2回洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=6/1) により精製し、微黄色オイルの2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール (1.86g、収率70%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.25 (3H, s), 2.46 (3H, s), 2.80 (1H, s), 3.91 (1H, d, J=10.4Hz), 3.95 (1H, d, J=10.4Hz), 4.04-4.16 (2H, m), 7.38 (2H, d, J=8.0Hz), 7.76 (2H, d, J=8.0Hz), 7.93 (1H, s)。

【1370】

実施例6

2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例4で製造した2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (6.72g、21.43ミリモル) を、実施例2と同様に処理して、白色粉末結晶の2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (5.6g、収率94%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.39 (3H, s), 2.62 (2H, d, J=4.0Hz), 2.78 (1H, d, J=4.0Hz), 4.00 (1H, d, J=14.9Hz), 4.38 (1H, d, J=14.9Hz), 7.87 (1H, s)。

【1371】

実施例7

2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロ-1H-イミダゾールの製造

実施例5で製造した2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール (1.11g、2.84ミリモル) を用い、実施例2と同様の方法により、微黄色粉末結晶の2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (523mg、収率85%) を得た。

【1372】

得られた化合物の物性は、実施例6で得られた化合物の物性と同一であった。

【1373】

実施例8

(R)-2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (10g、67.79ミリモル) 及び (R)-(-)-グリシジルトシレート (17.02g、74.58ミリモル) をアセトニトリル (50ml) に溶解し、この溶液に炭酸水素ナトリウム (6.26g、74.15ミリモル) を加えて3.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、濾過後、濾液を減圧

濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル／*n*-ヘキサン＝1／2）にて精製して、微黄色油状物の（*R*）-2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-3-（4-メチルベンゼンスルホニルオキシ）プロピル]-4-ニトロイミダゾール（16.9 g、収率66%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.47 (3H, s), 3.65 (1H, d, $J=5.8\text{ Hz}$), 3.93–4.33 (5H, m), 7.38 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.70 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.86 (1H, s)。

【1374】

実施例9

（*R*）-2-クロロ-4-ニトロ-1-（2-オキシラニルメチル）イミダゾールの製造
2-クロロ-4-ニトロ-1*H*-イミダゾール（1 g、6.78ミリモル）及び（*R*）-（-）-グリシジルトシレート（1.7 g、7.45ミリモル）をテトラヒドロフラン（THF）（10 ml）に溶解し、この溶液に炭酸水素ナトリウム（600 mg、7.14ミリモル）を加え、11時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル／*n*-ヘキサン＝1／1）にて精製し、微黄色油状物の（*R*）-2-クロロ-4-ニトロ-1-（2-オキシラニルメチル）イミダゾール（1.45 g、収率57%）を得た。

光学純度 79.2% ee

$[\alpha]_D^{27} = 42.55^\circ$ （濃度：1.262, CHCl_3 ）

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.61 (1H, t, $J=2.5\text{ Hz}$, 4.3 Hz), 2.97 (1H, t, $J=4.3\text{ Hz}$), 3.25–3.34 (1H, m), 3.95 (1H, dd, $J=6.4\text{ Hz}$, 15.0 Hz), 4.51 (1H, dd, $J=2.6\text{ Hz}$, 15.0 Hz), 7.88 (1H, s)。

【1375】

実施例10

（*R*）-2-クロロ-1-（2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1*H*-イミダゾール（600 g、4.07モル）及び（*R*）-4-ニトロ安息香酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル（1060 g、4.47モル）を酢酸エチル（2124 ml）に溶解し、この溶液にトリエチルアミン（113.64 ml、0.82モル）を加えて16時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に酢酸エチル（530 ml）、トルエン（5300 ml）を加えて結晶化した。得られた結晶を濾取し、メタノール（10.6 l）に溶解した。この溶液に炭酸カリウム（55.4 g、0.4モル）を加え、室温で1時間攪拌した後、氷冷下、濃塩酸（66 ml）及び硫酸マグネシウム（671 g）をこの順に加え、30分攪拌した。不溶物をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル（530 ml）及びトルエン（5300 ml）を加えた。得られた結晶を濾取し、50℃にて乾燥して、淡茶粉末結晶の（*R*）-2-クロロ-1-（2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル）-4-ニトロイミダゾール（879.1 g、収率92%）を得た。

光学純度 99.0% ee

$[\alpha]_D^{27} = 17.38^\circ$ （濃度：1.03, DMSO）

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.01 (3H, s), 3.25 (2H, d, $J=5.3\text{ Hz}$), 4.05 (2H, s), 5.01 (1H, s), 5.11 (1H, t, $J=5.4\text{ Hz}$), 8.32 (1H, s)。

【1376】

実施例11

(R)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例10で製造した(R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(879g、3.73mol)をピリジン(1778ml)に溶解し、5℃に冷却した。これに塩化メタンスルホニル(432.7ml、5.59mol)を15℃以下にて徐々に滴下した後、同温度で1時間攪拌した。これに6規定塩酸(5500ml)を30℃以下にて加え、氷冷下にて40分攪拌した。析出晶を濾取し、水、トルエンの順に洗浄し、一次晶を得た。また濾液より酢酸エチル(5リットル)にて2回抽出し、抽出液を水洗後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮し、トルエンを加えることにより得られた結晶を濾取し、二次晶を得た。一次晶及び二次晶を合わせ、60℃にて乾燥して、白色粉末結晶の(R)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(942.6g、収率81%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.12 (3H, s), 3.23 (3H, s), 4.09 (2H, s), 4.13 (2H, s), 5.60 (1H, br), 8.34 (1H, s)。

【1377】

実施例12

(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例11で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(942.6g、3mol)を酢酸エチル(9426ml)に懸濁し、これにDBU(494ml、3.3mol)を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水(5リットル)にて洗浄した。水層を酢酸エチル(5リットル)により2回抽出した。抽出液と有機相とを合わせ、飽和食塩水(5リットル)にて洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/ n -ヘキサン=1/2)にて精製し、白色粉末結晶の(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(600.7g、収率92%)を得た。

光学純度98.8% ee

$[\alpha]_D^{26} = 31.11^\circ$ (濃度: 2.02, CHCl₃)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.38 (3H, s), 2.62 (1H, d, $J=4.0\text{ Hz}$), 2.78 (1H, d, $J=4.0\text{ Hz}$), 4.00 (1H, d, $J=14.9\text{ Hz}$), 4.38 (1H, d, $J=14.9\text{ Hz}$), 7.87 (1H, s)。

【1378】

実施例13

(R)-2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(18.4g、125ミリモル)及び(R)-4-メチルベンゼンスルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル(36.2g、149ミリモル)をアセトニトリル(150ml)に懸濁し、これにベンジルトリエチルアンモニウムクロリド(5.7g、25ミリモル)を加え、8時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)により精製し、白色アモルファスの(R)-2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール(20.1g、43%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.24 (3H, s), 2.47 (3H, s), 2.81 (1H, s), 3.90 (1H, d, $J=10.4\text{ Hz}$), 3.95 (1H, d, $J=10.4\text{ Hz}$), 4.04-4.

10

20

30

40

50

1.4 (2H, m), 7.39 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.76 (2H, d, J = 8.0 Hz), 7.91 (1H, s)。

【1379】

実施例14

(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾールの製造 (実施例12の化合物の別途合成法)

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1.51 g, 10.17 mmol) 及び (R)-4-メチルベンゼンスルホン酸 2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (3.70 g, 15.25 mmol) をアセトニトリル (15 ml) に懸濁し、これにベンジルトリエチルアンモニウムクロリド (0.23, 1.02 mmol) を加え、10時間加熱還流した。反応液を室温に戻した後、酢酸エチルを加え、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、酢酸エチル (40 ml) に溶解した。氷冷撹拌下、DBU (1.57 ml, 10.17 mmol) を加え、更に室温で1.5時間撹拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル = 7/3) にて精製し、微黄色油状物の (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (1.50 g, 収率68%) を得た。

【1380】

実施例15

(S)-2-クロロ-4-ニトロ-1-[2-ヒドロキシ-3-(4-ニトロベンゾイルオキシ)-2-メチルプロピル]イミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (3 g, 20.34 mmol) 及び (S)-4-ニトロ安息香酸 2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (5.31 g, 22.37 mmol) を酢酸エチル (10 ml) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン (0.57 ml, 4.07 mmol) を加え60-65℃にて10時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (3 ml) 及びトルエン (30 ml) を加え、得られた結晶を濾取して、黄色粉末結晶の (S)-2-クロロ-4-ニトロ-1-[2-ヒドロキシ-3-(4-ニトロベンゾイルオキシ)-2-メチルプロピル]イミダゾール (6.82 g, 収率87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.23 (3H, s), 4.11-4.33 (4H, m), 5.61 (1H, s), 8.25 (2H, d, J = 8.9 Hz), 8.31-8.45 (3H, m)。

【1381】

実施例16

(S)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例15で製造した (S)-2-クロロ-4-ニトロ-1-[2-ヒドロキシ-3-(4-ニトロベンゾイルオキシ)-2-メチルプロピル]イミダゾール (6.8 g, 17.67 mmol) をメタノール (68 ml) に溶解し、炭酸カリウム (122 mg, 0.88 mmol) を加え、室温にて終夜撹拌した。氷冷し6規定塩酸 (0.3 ml) 及び硫酸マグネシウム (3 g) をこの順に加え30分撹拌した。不溶物をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (3.4 ml) 及びトルエン (34 ml) を加え、得られた結晶を濾取して黄色粉末結晶の (S)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (4.09 g, 収率97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.02 (3H, s), 3.25 (2H, d, J = 5.3 Hz), 4.05 (2H, s), 4.98 (1H, s), 5.11 (1H, t, J = 5.2 Hz), 8.30 (1H, s)。

【1382】

実施例 17

(S)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-2-メチル-3-メタンスルホニルオキシプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例 16 で製造した (S)-2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (4.05 g、16.9 ミリモル) をピリジン (8 ml) に溶解し、4℃まで冷却した。塩化メタンスルホニル (1.6 ml、20.28 ミリモル) を 15℃以下にて徐々に滴下し、更に同温度下にて 1 時間攪拌した。6 規定塩酸 (33 ml) を 30℃以下にて滴下した。反応混合物を塩化メチレン (20 ml) で 3 回抽出し、有機相を合わせ、水 (20 ml) 及び飽和食塩水 (20 ml) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にトルエン (10 ml) を加え、得られた結晶を濾取して、白色粉末結晶の (S)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-2-メチル-3-メタンスルホニルオキシプロピル)-4-ニトロイミダゾール (3.04 g、収率 57%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.12 (3H, s), 3.24 (3H, s), 4.09 (2H, s), 4.13 (2H, s), 5.62 (1H, br), 8.34 (1H, s)。

【1383】

実施例 18

(S)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例 17 で製造した (S)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-2-メチル-3-メタンスルホニルオキシプロピル)-4-ニトロイミダゾール (3.02 g、9.51 ミリモル) を塩化メチレン (30 ml) に溶解し、DBU (1.7 ml、11.41 ミリモル) を加え、室温下にて 1.5 時間攪拌した。反応液を 3 規定塩酸 30 ml、飽和食塩水 20 ml の順に洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) にて精製し、微黄色油状物の (S)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (1.89 g、収率 91%) を得た。

光学純度 93.2% ee

$[\alpha]_D^{27} = -29.15^\circ$ (濃度: 1.18, CHCl₃)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.39 (3H, s), 2.63 (1H, d, $J=4.0$ Hz), 2.79 (1H, d, $J=4.0$ Hz), 4.00 (1H, d, $J=14.9$ Hz), 4.38 (1H, d, $J=14.9$ Hz), 7.88 (1H, s)。

【1384】

実施例 19

2-tert-ブトキシメチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール (10 g、63.3 ミリモル)、2-tert-ブトキシメチルオキシラン (27 ml、189 ミリモル) 及び酢酸ナトリウム (5.19 g、189 ミリモル) をエタノール (100 ml) に懸濁し、この懸濁液を 17 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) にて精製し、白色粉末結晶の 2-tert-ブトキシメチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (3.2 g、収率 21%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.18 (9H, s), 3.63-3.80 (2H, m), 4.22-4.36 (2H, m), 5.27-5.42 (1H, m), 7.53 (1H, s)。

【1385】

2-メチル-2-(2-メトキシメトキシエチル)オキシラン、2-エチル-2-メトキシメトキシメチルオキシラン又は2-イソプロピル-2-メトキシメトキシメチルオキシランを用い、実施例19と同様にして、実施例20～実施例22の化合物を製造した。

【1386】

実施例20

2-(2-メトキシメトキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

白色粉末結晶、収率48%、MS=257。

【1387】

実施例21

2-エチル-2-メトキシメトキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率49%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

0.91 (3H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 1.91 (2H, q, $J=7.5\text{ Hz}$), 3.24 (3H, s), 3.72 (1H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 3.78 (1H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 4.15 (1H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 4.23 (1H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 4.59 (2H, s), 8.10 (1H, s)。

【1388】

実施例22

2-イソプロピル-2-メトキシメトキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率90%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

0.94 (6H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 2.16-2.32 (1H, m), 3.24 (3H, s), 3.76 (1H, d, $J=13.0\text{ Hz}$), 3.82 (1H, d, $J=13.0\text{ Hz}$), 4.18 (1H, d, $J=13.0\text{ Hz}$), 4.25 (1H, d, $J=13.0\text{ Hz}$), 4.59 (2H, s), 8.09 (1H, s)。

【1389】

実施例23

2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシメトキシブチル)-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (5.74 g、38.93ミリモル) のエタノール (60 ml) 溶液に酢酸ナトリウム (3.51 g、42.82ミリモル) 及び2-(2-メトキシメトキシエチル)オキシラン (10.3 g、77.86ミリモル) を加え、13.5時間加熱還流した。エタノールを減圧留去し、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) にて精製した。塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシメトキシブチル)-4-ニトロイミダゾール (8.51 g、収率78%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.67 (2H, m), 3.38 (3H, s), 3.46 (1H, d, $J=2.4\text{ Hz}$), 3.78-3.83 (2H, m), 4.00 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, 14.3 Hz), 4.11-4.21 (2H, m), 4.63 (2H, s), 7.96 (1H, s)。

【1390】

2-メチル-2-メトキシメトキシメチルオキシランを用い、実施例23と同様にして、実施例24の化合物を製造した。

【1391】

実施例 2 4

2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシプロピル)-4-ニトロイミダゾール

無色液体、収率 63%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.20 (3H, s), 3.08 (1H, s), 3.42 (3H, s), 3.53 (2H, q, $J=10.4\text{ Hz}$, 13.8 Hz), 4.67 (2H, s), 8.01 (1H, s)。

【1392】

実施例 2 5

2-(2-メトキシメトキシエチル)-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

実施例 2 3 で製造した 2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシメトキシ)ブチル-4-ニトロイミダゾール (8.45 g、30.21 ミリモル) の 1,4-ジオキサン (100 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (1.33 g、33.23 ミリモル) を加え、40 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷して残渣に水を加えて、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) にて精製し、塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の 2-(2-メトキシメトキシエチル)-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (3.41 g、収率 47%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.11-2.35 (2H, m), 3.36 (3H, s), 3.75 (2H, dd, $J=4.8\text{ Hz}$, 6.8 Hz), 4.08 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, 10.3 Hz), 4.40 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, 10.3 Hz), 4.61 (2H, s), 5.43-5.54 (1H, m), 7.53 (1H, s)。

【1393】

実施例 2 4 で製造した 2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシプロピル)-4-ニトロイミダゾールを用い、実施例 2 5 と同様にして、実施例 2 6 の化合物を製造した。

【1394】

実施例 2 6

2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率 38%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.66 (3H, s), 3.34 (3H, s), 3.63 (1H, d, $J=11.0\text{ Hz}$), 3.84 (1H, d, $J=11.0\text{ Hz}$), 3.93 (1H, d, $J=9.9\text{ Hz}$), 4.37 (1H, d, $J=9.9\text{ Hz}$), 4.62 (2H, s), 7.52 (1H, s)。

【1395】

実施例 2 7

(R)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例 1 0 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (7.4 g、31 ミリモル) を塩化メチレン (120 ml) に懸濁し、これに N-エチルジイソプロピルアミン (13.1 ml、74 ミリモル) 及びクロロメチルメチルエーテル (7.1 ml、74 ミリモル) を加え、室温で 46 時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) にて精製し

10

20

30

40

50

、微黄色液体の(R)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(6.0g、収率69%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.20 (3H, s), 3.08 (1H, s), 3.42 (3H, s), 3.50 (1H, d, $J=10.4\text{ Hz}$), 3.55 (1H, d, $J=10.4\text{ Hz}$), 4.05 (1H, d, $J=14.4\text{ Hz}$), 4.15 (1H, d, $J=14.4\text{ Hz}$), 4.67 (2H, s), 8.01 (1H, s)。

【1396】

実施例28

(R)-2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

10

実施例27で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(6.0g、21ミリモル)のDMF(30ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(1.0g、25ミリモル)を加え、室温で1,5時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄して、黄色固体の(R)-2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(3.1g、収率59%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.66 (3H, s), 3.34 (3H, s), 3.63 (1H, d, $J=11.0\text{ Hz}$), 3.84 (1H, d, $J=11.0\text{ Hz}$), 3.93 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 4.42 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 4.63 (2H, s), 7.52 (1H, s)。

20

【1397】

実施例29

2-クロロ-1-(5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルペンチル)-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(6.8g、43ミリモル)、2-(3-アセトキシプロピル)-2-メチルオキシラン(5.8g、39.3ミリモル)及び酢酸ナトリウム(3.9g、47.6ミリモル)をエタノール(60ml)に懸濁し、この懸濁液を終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンで2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、淡茶油状物の2-クロロ-1-(5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルペンチル)-4-ニトロイミダゾール(9.5g、収率79%)を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.21 (3H, s), 1.50-1.81 (4H, m), 2.05 (3H, s), 3.91-4.12 (4H, m), 8.02 (1H, s)。

【1398】

実施例30

2-(3-アセトキシプロピル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

40

実施例29で製造した2-クロロ-1-(5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルペンチル)-4-ニトロイミダゾール(9.5g、31.1ミリモル)を用い、実施例25と同様の方法により、微橙色粉末の2-(3-アセトキシ)プロピル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(5.2g、収率62%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.67 (3H, s), 1.67-2.00 (4H, m), 2.05 (3H, s), 3.91-4.14 (4H, m), 7.52 (1H, s)。

【1399】

50

実施例 3 1

2-(2-ヒドロキシエチル)-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 2 5 で製造した 2-(2-メトキシメトキシエチル)-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (0.2 g、0.822 ミリモル) の塩化メチレン (10 ml) 溶液にトリフルオロ酢酸 (2 ml) を加え、更に室温で終夜攪拌した。減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 100/1) により精製し、メタノール及びジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の 2-(2-ヒドロキシエチル)-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (0.11 g、収率 65%) を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.92-2.14 (2H, m), 3.52-3.63 (2H, m), 4.05 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, 10.6 Hz), 4.43 (1H, dd, $J=7.6\text{ Hz}$, 10.6 Hz), 4.72 (1H, t, $J=2.7\text{ Hz}$), 5.38-5.53 (1H, m), 8.12 (1H, s)。

【1400】

実施例 3 2

2-ヒドロキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 1 9 で製造した 2-tert-ブトキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (5.82 g、24.1 ミリモル) を用い、実施例 3 1 と同様に反応を行い、白色粉末結晶の 2-ヒドロキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (4.25 g、収率 95%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

3.55-3.67 (1H, m), 3.72-3.88 (1H, m), 4.12 (1H, dd, $J=6.5\text{ Hz}$, 10.5 Hz), 4.36 (1H, t, $J=10.4\text{ Hz}$), 5.25-5.50 (2H, m), 8.11 (1H, s)。

【1401】

実施例 3 3

2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

30

実施例 2 6 で製造した 2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (4.14 g、38 ミリモル) を用い、実施例 3 1 と同様に反応を行い、微黄色粉末結晶の 2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (2.17 g、収率 64%) を得た。

融点 166-168°C

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.51 (3H, s), 3.53 (1H, d, $J=12.1\text{ Hz}$), 3.64 (1H, d, $J=12.1\text{ Hz}$), 4.03 (1H, d, $J=10.6\text{ Hz}$), 4.24 (1H, d, $J=10.6\text{ Hz}$), 5.40 (1H, br), 8.10 (1H, s)。

40

【1402】

実施例 3 4

2-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 2 0 で製造した 2-(2-メトキシメトキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (13.4 g、52.1 ミリモル) を用い、実施例 3 1 と同様に反応を行い、微黄色粉末結晶の 2-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (2.32 g、収率 21%) を得た。

50

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1. 58 (3H, s), 1. 93–2. 17 (2H, m), 3. 59 (2H, t, $J=6.4\text{ Hz}$), 4. 04 (1H, d $J=10.9\text{ Hz}$), 4. 33 (d, 1H, $J=10.9\text{ Hz}$), 8. 11 (1H, s)。

【1403】

実施例 35

2-エチル-2-ヒドロキシメチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 21 で製造した 2-エチル-2-メトキシメトキシメチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (21. 5 g、83. 7 ミリモル) をメ
タノール (430 ml) に懸濁し、これに濃塩酸 (2. 15 ml) を加え、5 時間加熱還
流した。反応液を減圧濃縮し、析出物を濾取して、微黄色粉末結晶の 2-エチル-2-ヒ
ドロキシメチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (7. 14 g、収率 40%) を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

0. 89 (3H, t, $J=7.4\text{ Hz}$), 1. 95 (2H, q, $J=7.4\text{ Hz}$), 3. 53–3. 69 (2H, m), 4. 08 (1H, d, $J=10.8\text{ Hz}$), 4. 21 (1H, d, $J=10.8\text{ Hz}$), 5. 39 (t, 1H, $J=5.6\text{ Hz}$), 8. 09 (1H, s)。

【1404】

20

対応する出発原料を用い、実施例 35 と同様にして、実施例 36 の化合物を製造した。

【1405】

実施例 36

2-ヒドロキシメチル-2-イソプロピル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率 50%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

0. 91 (6H, d, $J=6.9\text{ Hz}$), 2. 12–2. 23 (1H, m), 3. 60–3. 77 (2H, m), 4. 16 (2H, s), 5. 35 (1H, t, $J=5.6\text{ Hz}$), 8. 08 (1H, s)。

30

【1406】

実施例 37

(R)-2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 28 で製造した (R)-2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (3. 1 g、13 ミリモル) の
塩化メチレン (30 ml) 溶液にトリフルオロ酢酸 (15 ml) を加え、更に室温で 25
時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、メタノールを加え、減圧濃縮した。残渣に 2-プロ
パノールを加え、析出物を濾取し、2-プロパノールで洗浄し、微黄色粉末結晶の (R)-
2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-
b] オキサゾール (1. 2 g、収率 46%) を得た。

40

融点 162–163°C

光学純度 97% ee

$[\alpha]_D^{26} = -19.01^\circ$ (濃度: 0. 526, DMSO)。

【1407】

実施例 38

2-メチル-2-(3-ヒドロキシプロピル)-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 30 で製造した 2-(3-アセトキシプロピル)-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (3. 2 g、11. 88 ミリモル)

50

、炭酸カリウム（320mg、2.32ミリモル）及びメタノール（35ml）の混合物を室温で2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝25／1）にて精製し、微黄色粉末の2-メチル-2-（3-ヒドロキシプロピル）-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール（2.1g、78%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.67–1.72 (5H, m), 1.91–2.07 (2H, m), 3.51–3.65 (2H, m), 4.01 (1H, d, $J=10.5\text{ Hz}$), 4.15 (1H, d, $J=10.5\text{ Hz}$), 7.66 (1H, s)。

【1408】

10

実施例39

メタンスルホン酸3-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール-2-イル）プロピルエステルの製造

実施例38で製造した2-メチル-2-（3-ヒドロキシプロピル）-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール（2.1g、9.24ミリモル）、トリエチルアミン（2.8g、20.09ミリモル）、4-ジメチルアミノピリジン（50mg、0.41ミリモル）及び塩化メチレン（80ml）の混合物に氷冷下にて、メタンスルホンクロリド（1.4ml、18.09ミリモル）を塩化メチレン10mlに溶解した溶液を徐々に滴下し、室温で終夜攪拌した。反応液を濃縮し、残渣に10%塩酸を加え、氷冷下にて30分攪拌した。析出晶を濾取し、水洗することにより、白色粉末のメタンスルホン酸3-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール-2-イル）プロピルエステル（2.6g、収率92%）を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.58 (3H, s), 1.65–2.02 (4H, m), 3.17 (3H, s), 4.05–4.26 (4H, m), 8.12 (1H, s)。

【1409】

対応する出発原料を用い、実施例39と同様にして、実施例40～実施例42の化合物を製造した。

【1410】

実施例40

30

メタンスルホン酸6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール-2-イルメチルエステル

微黄色粉末、収率82%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

3.25 (3H, s), 4.11 (1H, dd, $J=6.6\text{ Hz}$, 11.0 Hz), 4.47 (1H, t, $J=9.1\text{ Hz}$), 4.55–4.70 (2H, m), 5.60–5.75 (1H, m), 8.14 (1H, s)。

【1411】

実施例41

メタンスルホン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール-2-イルメチルエステル

40

微黄色粉末、収率87%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.64 (3H, s), 3.24 (3H, s), 4.17 (1H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 4.27 (1H, d, $J=11.2\text{ Hz}$), 4.52 (2H, br), 8.14 (1H, s)。

【1412】

実施例42

メタンスルホン酸2-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール-2-イル）エチルエステル

50

微黄色粉末、収率 87%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.61 (3H, s), 2.38 (2H, t, $J=6.5\text{ Hz}$), 3.19 (3H, s),
4.11 (1H, d, $J=11.0\text{ Hz}$), 4.25 (1H, d, $J=11.0\text{ Hz}$),
4.36 (2H, t, $J=6.5\text{ Hz}$), 8.14 (1H, s)。

【1413】

実施例 43

5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-ヒドロキシ-4-メチル
ペンタン酸 tert-ブチルエステルの製造

3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピオン酸 tert-ブチルエステル (1.00 g、5.39 ミリモル) 及び 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (0.53 g、3.59 ミリモル) のエタノール (5 ml) 懸濁液に酢酸ナトリウム (0.59 g、7.18 ミリモル) を加え、6 時間加熱還流した。不溶物を濾過して除き、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、微黄色油状物の 5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸 tert-ブチルエステル (0.94 g、収率 78%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.17 (3H, s), 1.45 (9H, s), 1.78-1.87 (2H, m), 2.43-2.54 (2H, m), 3.59 (1H, br), 3.99 (2H, s), 8.06 (1H, s)。

【1414】

実施例 44

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 43 で製造した 5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸 tert-ブチルエステル (0.93 g、2.79 ミリモル) の 1, 4-ジオキサン (10 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0.12 g、3.07 ミリモル) を加え、7.5 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、塩化メチレンで抽出して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。ジエチルエーテルで洗浄し、白色固体の 3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸 tert-ブチルエステル (0.35 g、42%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45 (9H, s), 1.65 (3H, s), 2.12-2.25 (2H, m), 2.37-2.46 (2H, m), 3.98 (1H, d, $J=10.3\text{ Hz}$), 4.10 (1H, d, $J=10.3\text{ Hz}$), 7.52 (1H, s)。

【1415】

実施例 45

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸の製造

実施例 44 で製造した 3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸 tert-ブチルエステル (0.72 g、2.42 ミリモル) の塩化メチレン (14 ml) 溶液にトリフルオロ酢酸 (2 ml) を加え、更に 30 分間室温で攪拌した。反応液を減圧濃縮し、エタノールと塩化メチレンで結晶化し、微黄色固体の 3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸 (0.30 g、51%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.32 (3H, s), 1.91-2.09 (1H, m), 2.12-2.26 (1H, m), 2.41-2.74 (2H, m), 3.89 (2H, s), 7.96 (1H, s)

, 12.19 (1H, br)。

【1416】

実施例46

2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾオキサゾールの製造

実施例33で製造した2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(0.32g、1.6ミリモル)のDMF(3ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(77mg、1.9ミリモル)を加え、更に0℃で30分間攪拌した。反応液に氷冷攪拌下、2-クロロベンゾオキサゾール(0.30g、1.9ミリモル)のDMF(3ml)溶液を加え、更に室温で44時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、アセトニトリル及びイソプロパノールで再結晶し、微黄色固体の2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾオキサゾール(0.20g、39%)を得た。

融点 200-203℃。

【1417】

実施例47

(R)-2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾオキサゾールの製造

実施例37で製造した(R)-2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(0.40g、2.0ミリモル)のDMF(4ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(0.1g、2.4ミリモル)を加え、0℃で30分間攪拌した。反応液に氷冷攪拌下、2-クロロベンゾオキサゾール(0.38g、2.4ミリモル)のDMF(4ml)溶液を加え、更に室温で48時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄した。アセトニトリル及びイソプロパノールで再結晶し、微黄色固体の(R)-2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾオキサゾール(0.15g、収率24%)を得た。

融点 232-233℃

光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{26} = +11.20^\circ$ (濃度: 0.518, DMSO)。

【1418】

実施例48

2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルチオ)ベンゾオキサゾールの製造

2-メルカプトベンゾオキサゾール(200mg、1.3ミリモル)及びDMF(3ml)の混合物に水素化ナトリウム(50mg、1.25ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌した。次に、この反応液に、実施例41で製造したメタンスルホン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(330mg、1.2ミリモル)を加え、60-70℃にて5時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、5%苛性ソーダにより洗浄し、3回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)にて精製し、白色粉末の2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルチオ)ベンゾオキサゾール(37mg、収率9%)を得た。

融点 163-166℃。

【1419】

実施例49

2-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチルチオ]ベンゾオキサゾールの製造

実施例42で製造したメタンスルホン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチルエステル(300mg、1ミリモル)を用い、実施例48と同様の方法により、白色粉末結晶の2-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチルチオ]ベンゾオキサゾール(296mg、収率83%)を得た。

融点 174-175℃。

【1420】

実施例50

1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオ)プロパン-2-オール

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(1.2g、8.13ミリモル)、5-(2-メチル-2-オキシラニルメチルチオ)-1-フェニル-1H-テトラゾール(1.9g、7.65ミリモル)、酢酸ナトリウム(700mg、8.53ミリモル)及びエタノール(20ml)の混合物を終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水により2回洗浄後、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、微黄色粉末の1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオ)プロパン-2-オール(2.1g、収率69%)を得た。

¹H-NMR(CDC1₃) δ ppm:

1.38(3H, s), 3.54(1H, d, J=14.8Hz), 3.62(1H, d, J=14.8Hz), 4.19(2H, s), 4.58(1H, s), 7.50-7.67(5H, m), 8.08(1H, s)。

【1421】

実施例51

2-メチル-6-ニトロ-2-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例50で製造した1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオ)プロパン-2-オール(2.1g、5.3ミリモル)及び1,4-ジオキサン(40ml)の混合物に水素化ナトリウム(220mg、5.5ミリモル)を加え、24時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、淡茶粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(500mg、26%)を得た。

融点 140-147℃。

【1422】

実施例52

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)メトキシカルボニルアミノ)酢酸tert-ブチルエステルの製造

トリホスゲン(0.30g、0.76ミリモル)の塩化メチレン(10ml)溶液に氷冷攪拌下、グリシンtert-ブチルエステル塩酸塩(0.52g、2.27ミリモル)の塩化メチレン(5ml)溶液及びN-エチルジイソプロピルアミン(1.05ml、4.53ミリモル)を加え、更に室温で2時間攪拌した。不溶物を濾過して除き、濾液を減圧濃縮した。これを実施例33で製造した2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニト

10

20

30

40

50

ロー 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.30 g、1.51 ミリ
 モル) の DMF (3 ml) 溶液に氷冷攪拌下に加え、更に塩化第一銅 (75 mg、0.76
 ミリモル) を加え、更に室温で 22 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出
 し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムク
 ロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=3/2) により精製し、白色固体の (2-
 メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イ
 ルメトキシカルボニルアミノ) 酢酸 tert-ブチルエステル (40 mg、収率 7%) を
 得た。

融点 104-106 °C。

【1423】

実施例 53

(4-モルホリノフェニル) カルバミン酸 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,
 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

4-モルホリノアニリン (0.40 g、2.24 ミリモル) の THF (4 ml) 溶液に
 氷冷攪拌下、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (0.44 g、2.69 ミリモル) を
 加え、0 °C で 2 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、ジエチルエーテルで洗浄した。濾液
 を実施例 32 で製造した 2-ヒドロキシメチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ
 [2, 1-b] オキサゾール (0.30 g、1.62 ミリモル) の DMF (3 ml) 溶液
 に氷冷攪拌下に加え、更に塩化銅 (75 mg、0.76 ミリモル) を加え、更に室温で 2 時
 間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで
 乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/ア
 セトン=9/1) により精製し、塩化メチレン及び酢酸エチルで洗浄し、白色固体の (4-
 モルホリノフェニル) カルバミン酸 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-
 b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (34 mg、収率 5%) を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2.93-3.09 (4H, m), 3.64-3.80 (4H, m), 4.13 (1H,
 dd, J=6.8 Hz, 10.9 Hz), 4.34-4.55 (3H, m), 5.55-
 5.73 (1H, m), 6.77-6.95 (2H, m), 7.18-7.41 (2H,
 m), 8.15 (1H, s), 9.52 (1H, br)。

【1424】

実施例 54

4-クロロフェニルカルバミン酸 2-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-
 b] オキサゾール-2-イル) エチルエステルの製造

実施例 31 で製造した 2-ヒドロキシエチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ
 [2, 1-b] オキサゾール (0.2 g、1.0 ミリモル) の DMF (5 ml) 溶液に氷
 冷攪拌下、4-クロロフェニルイソシアネート (169 ml、1.1 ミリモル) 及び塩化
 銅 (50 mg、0.5 ミリモル) を加え、室温で 4 時間攪拌した。氷冷し、10% 塩酸を
 加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残
 渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) に
 より精製し、塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルで結晶化し、白色固体の 4-クロ
 ロフェニルカルバミン酸 2-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ
 キサゾール-2-イル) エチルエステル (0.16 g、収率 45%) を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2.16-2.38 (2H, m), 4.08 (1H, dd, J=7.4 Hz, 10.6 Hz),
 4.16-4.36 (2H, m), 4.47 (1H, dd, J=7.4 Hz, 10.
 6 Hz), 5.44-5.55 (1H, m), 7.30-7.36 (2H, m), 7.
 46-7.52 (2H, m), 8.14 (1H, s), 9.83 (1H, br)。

【1425】

フェニルイソシアネートと 2-ヒドロキシエチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-
 ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、2-エチル-2-ヒドロキシメチル-6

10

20

30

40

50

ーニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール又は2-ヒドロキシメチル-2-イソプロピル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールを用い、実施例54と同様にして、実施例55～実施例57の化合物を製造した。また2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールと3-フルオロフェニルイソシアネート又は4-tert-ブトキシカルボニルフェニルイソシアネートを用い、実施例54と同様にして、実施例58及び実施例59の化合物を製造した。

【1426】

実施例55

フェニルカルバミン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルエステル

10

黄色固体、収率17%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.63 (3H, s), 2.30 (2H, t, $J=6.9$ Hz), 4.13 (1H, d, $J=10.9$ Hz), 4.21-4.32 (3H, m), 6.96-7.02 (1H, m), 7.24-7.27 (2H, m), 7.43-7.46 (2H, m), 8.12 (1H, s), 9.60 (1H, br)。

【1427】

実施例56

フェニルカルバミン酸2-エチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル

20

白色固体、収率60%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

0.93 (3H, t, $J=7.4$ Hz), 1.89-2.11 (2H, m), 4.19-4.29 (2H, m), 4.39-4.50 (2H, m), 6.99 (1H, t, $J=7.2$ Hz), 7.23-7.29 (2H, m), 7.34-7.55 (2H, m), 8.14 (1H, s), 9.70 (1H, br)。

【1428】

実施例57

フェニルカルバミン酸2-イソプロピル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル

30

白色固体、収率73%

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

0.97 (6H, dd, $J=2.7$ Hz, 6.9 Hz), 2.25-2.39 (1H, m), 4.20 (1H, d, $J=11.4$ Hz), 4.30 (1H, d, $J=11.4$ Hz), 4.48 (2H, s), 6.99 (1H, t, $J=7.1$ Hz), 7.23-7.29 (2H, m), 7.32-7.52 (2H, m), 8.13 (1H, s), 9.67 (1H, br)。

【1429】

実施例58

3-フルオロフェニルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル

40

白色固体、収率71%

融点 168-169°C。

【1430】

実施例59

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ) 安息香酸tert-ブチルエステル

白色固体、収率32%

融点 177-178°C。

50

【1431】

実施例60

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ)安息香酸の製造

実施例59で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ)安息香酸tert-ブチルエステル(185mg、0.44ミリモル)の塩化メチレン(10ml)懸濁液に氷冷攪拌下、トリフルオロ酢酸(1ml)を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、酢酸エチルに溶かし、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣を酢酸エチルで洗浄し、白色固体の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ)安息香酸を(50mg、収率31%)得た。

融点 248℃(分解)。

【1432】

実施例61

4-クロロフェニルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

4-クロロフェニルカルバミン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル(1.1g、4.4ミリモル)及び2,4-ジニトロ-1H-イミダゾール(0.35g、2.2ミリモル)をエタノール(1ml)に懸濁し、室温で24時間攪拌し、更に酢酸ナトリウム(0.36g、4.4ミリモル)及びエタノール(2ml)を加え、6時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。塩化メチレン及びジエチルエーテルで結晶化させ、微灰色固体の4-クロロフェニルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(0.17g、収率22%)を得た。

融点 179-181℃。

【1433】

実施例62

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル(1.7g、6.6ミリモル)及び2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(0.98g、6.6ミリモル)のエタノール(10ml)に懸濁し、酢酸ナトリウム(0.85g、10ミリモル)を加え、4時間加熱還流した。エタノールを減圧留去し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、微黄色油状物のN-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(2.7g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.15 (3H, br), 3.28 (3H, s), 3.78-4.28 (4H, m), 7.11-7.24 (2H, m), 7.30-7.41 (2H, m), 7.90 (1H, br)。

【1434】

実施例63

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例62で製造したN-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(2.7g、6.6ミリモル)の1,4-ジオキサン(30ml)溶液に氷冷攪拌

下、水素化ナトリウム（0.32 g、7.9ミリモル）を加え、12時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷して水を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）により精製し、塩化メチレンとエタノールで結晶化し、白色固体のN-（4-クロロフェニル）-N-メチルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール-2-イルメチルエステル（0.88 g、収率36%）を得た。

融点 146-148℃。

【1435】

実施例64

(R)-4-クロロフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造 10

実施例10で製造した(R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール（1.5 g、6.5ミリモル）のTHF（30 ml）懸濁液に4-クロロフェニルイソシアネート（1.3 g、8.5ミリモル）のTHF（15 ml）溶液及びトリエチルアミン（0.1 ml）を加え、更に室温で19時間攪拌した。不溶物を濾去し、濾液を減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン/酢酸エチル=9/1）により精製し、白色固体の(R)-4-クロロフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル（2.1 g、収率83%）を得た。

¹H-NMR（DMSO-d₆）δ ppm： 20

1.15（3H, s）, 3.99（2H, s）, 4.07（2H, s）, 7.29-7.39（2H, m）, 7.45-7.58（2H, m）, 8.33（1H, s）, 9.86（1H, br）。

【1436】

種々の対応するフェニルイソシアネート化合物を用い、実施例64と同様にして、実施例65～実施例69の化合物を製造した。またベンジルイソシアネートまたはメチルイソシアネートを用い、実施例64と同様にして、実施例70及び実施例71の化合物を製造した。

【1437】

実施例65

(R)-3-クロロフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル 30
収率41%

¹H-NMR（DMSO-d₆）δ ppm：

1.15（3H, s）, 4.00（2H, s）, 4.13（2H, s）, 5.41（1H, s）, 7.04-7.09（1H, m）, 7.29-7.41（2H, m）, 7.55-7.66（1H, m）, 8.33（1H, s）, 9.93（1H, br）。

【1438】

実施例66

(R)-4-ブロモフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル 40
収率62%

¹H-NMR（DMSO-d₆）δ ppm：

1.15（3H, s）, 3.99（2H, s）, 4.13（2H, s）, 5.40（1H, s）, 7.34-7.53（4H, m）, 8.33（1H, s）, 9.86（1H, br）。

【1439】

実施例67

(R)-4-トリフルオロメチルフェニルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル 50

収率 83%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.16 (3H, s), 4.02 (2H, s), 4.14 (2H, s), 5.42 (1H, s), 7.58–7.74 (4H, m), 8.34 (1H, s), 10.14 (1H, br)。

【1440】

実施例 68

(R)-4-トリフルオロメトキシフェニルカルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率 58%

10

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.15 (3H, s), 3.99 (2H, s), 4.13 (2H, s), 5.41 (1H, s), 7.31 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.58 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 8.33 (1H, s), 9.92 (1H, br)。

【1441】

実施例 69

(R)-4-フルオロフェニルカルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率 95%

20

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.15 (3H, s), 3.98 (2H, s), 4.12 (2H, s), 5.39 (1H, s), 7.10–7.17 (2H, m), 7.45–7.51 (2H, m), 8.33 (1H, s), 9.73 (1H, br)。

【1442】

実施例 70

(R)-ベンジルカルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率 72%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.20 (3H, s), 3.61 (1H, br), 3.97–4.04 (3H, m), 4.23 (1H, d, $J=12.0\text{ Hz}$), 4.70–4.89 (1H, m), 7.13–7.39 (5H, m), 8.01 (1H, s)。

30

【1443】

実施例 71

(R)-メチルカルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率 73%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.21 (3H, s), 2.80 (3H, d, $J=4.8\text{ Hz}$), 3.57 (1H, br), 3.98–4.16 (3H, m), 4.24 (1H, d, $J=12.3\text{ Hz}$), 4.72–4.91 (1H, m), 8.03 (1H, s)。

40

【1444】

実施例 72

(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミルクロリド (2.05 g、7.65 ミリモル) のトルエン (40 ml) 懸濁液に実施例 10 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (2.16 g、9.18 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (2.67

50

ml、15.30ミリモル)及び4-ジメチルアミノピリジン(0.19g、1.53ミリモル)を加え、100℃で3.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、無色油状物の(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(2.74g、収率77%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (3H, s), 2.83 (3H, s), 3.87-4.17 (4H, m), 4.44 (2H, s), 7.18-7.25 (4H, m), 8.05 (1H, s)。

10

【1445】

実施例73

(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例72で製造した(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(2.74g、5.87ミリモル)のDMF(20ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(0.28g、7.04ミリモル)を加え、更に0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄した。イソプロパノールで再結晶し、白色固体の(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(1.40g、収率55%)を得た。

20

融点 123-124℃。

【1446】

実施例74

(R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバモイルクロリド(1.56g、6.05ミリモル)のトルエン(10ml)懸濁液に実施例10で製造した(R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(0.95g、4.03ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン(1.45ml、8.06ミリモル)及び4-ジメチルアミノピリジン(0.10g、0.81ミリモル)を加え、100℃で3時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、白色アモルファスの(R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(0.75g、収率40%)を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.78-1.22 (6H, m), 1.24-1.48 (2H, m), 1.54-1.67 (1H, m), 1.70-1.93 (4H, m), 2.87-3.13 (1H, m), 3.72-3.98 (3H, m), 4.00-4.24 (2H, m), 7.00-7.06 (2H, m), 7.35-7.41 (2H, m), 7.80 (1H, br)。

40

【1447】

実施例75

(R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

50

実施例 74 で製造した (R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.75 g、1.59 ミリモル) の DMF (7 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (76 mg、1.91 ミリモル) を加え、更に 0℃ で 0.5 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をイソプロパノールで再結晶し、白色固体の (R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0.53 g、収率 77%) を得た。

融点 175-177℃。

【1448】

実施例 76

(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

実施例 10 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチル)プロピル-4-ニトロイミダゾール (0.82 g、3.48 ミリモル) のトルエン (10 ml) 懸濁液に N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバモイルクロリド (1.33 g、5.23 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (1.2 ml、6.97 ミリモル) 及び 4-ジメチルアミノピリジン (85 mg、0.70 ミリモル) を加え、100℃ で 5 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1) により精製し、微黄色アモルファスの (R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (1.04 g、収率 65%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.02 (3H, s), 3.26 (3H, s), 3.80-4.00 (4H, m), 5.39 (1H, s), 7.37-7.40 (2H, m), 7.47-7.52 (2H, m), 8.25 (1H, s)。

【1449】

実施例 77

(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例 76 で製造した (R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (4.50 g、9.94 ミリモル) の DMF (13.5 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0.48 g、11.9 ミリモル) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応混合液に水及び酢酸エチルを加えて析出物を濾取した。粗結晶をイソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の (R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (2.95 g、収率 71%) を得た。

融点 144-145℃

光学純度 99.8% ee

$[\alpha]_D^{24} = 7.68^\circ$ (濃度: 0.938, CHCl₃)。

【1450】

対応する出発原料を用い、実施例 77 と同様にして、実施例 78 及び実施例 79 の化合物を製造した。

【1451】

実施例78

(R)－メチルカルバミン酸2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチルエステル
収率26%、融点 175－178℃。

【1452】

実施例79

(R)－ジエチルカルバミン酸2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチルエステル
収率27%、融点 196－197℃。

【1453】

実施例80

(R)－N－(4－クロロフェニル)－N－メチルカルバミン酸2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチルエステルの製造

実施例64で製造した(R)－4－クロロフェニルカルバミン酸3－(2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル)－2－ヒドロキシ－2－メチルプロピルエステル(1.5g、3.8ミリモル)のDMSO(40ml)溶液にヨードメタン(0.71ml、11.4ミリモル)及び水酸化カリウム(0.64g、11.4ミリモル)を加え、室温で4時間攪拌した。氷冷して10%塩酸を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n－ヘキサン／酢酸エチル＝1／1)により精製し、イソプロパノールで再結晶し、白色固体の(R)－N－(4－クロロフェニル)－N－メチルカルバミン酸2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチルエステル(0.67g、収率60%)を得た。

融点 131－133℃

光学純度 99.8% ee

$[\alpha]_D^{26} = 22.86^\circ$ (濃度：1.028, CHCl₃)。

【1454】

実施例81

(R)－ビス(4－クロロフェニル)カルバミン酸2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチルエステルの製造

実施例37で製造した(R)－2－ヒドロキシメチル－2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール(0.30g、1.5ミリモル)の塩化メチレン(15ml)懸濁液に氷冷攪拌下、ピリジン(0.37ml、4.5ミリモル)及びトリホスゲン(0.16g、0.5ミリモル)を加え、更に室温で2.5時間攪拌した。反応液にビス(4－クロロフェニル)アミン(0.39g、1.6ミリモル)を加え、更に室温で20時間攪拌した。反応液を氷冷し、10%塩酸を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン／酢酸エチル＝19／1)により精製し、イソプロパノールで再結晶し、白色固体の(R)－ビス(4－クロロフェニル)カルバミン酸2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチルエステル(82mg、収率12%)を得た。

融点 200－201℃。

【1455】

実施例82

ピペリジン－1－カルボン酸2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチルエステルの製造

実施例33で製造した2－ヒドロキシメチル－2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール(0.3g、1.5ミリモル)の塩化メチレン

(15 ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、ピリジン (0.37 ml、4.5 ミリモル) 及びトリホスゲン (0.18 g、0.6 ミリモル) を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応液を氷冷し、ピペリジン (0.16 ml、1.7 ミリモル) を加え、更に室温で3時間攪拌した。反応液を氷冷し、10%塩酸を加え、不溶物を濾過して除き、塩化メチレンで洗浄した。濾液を分液し、有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=3/2) により精製し、塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルで再結晶し、白色固体のピペリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (65 mg、収率14%) を得た。

融点 152-154 °C。

【1456】

実施例83

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

実施例3で製造した2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (0.30 g、1.3 ミリモル) のトルエン (5 ml) 懸濁液に4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド (0.26 g、0.85 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (0.30 ml、1.7 ミリモル) 及び4-ジメチルアミノピリジン (21 mg、0.17 ミリモル) を加え、100 °Cで2.5時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色油状物の4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.24 g、収率55%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.26 (3H, s), 3.02-3.17 (4H, m), 3.39-3.72 (4H, m), 3.91 (1H, s), 3.99-4.18 (3H, m), 4.34 (1H, d, J=12.3 Hz), 6.85-6.98 (2H, m), 7.09-7.22 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

【1457】

実施例84

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例83で製造した4-(4-トリフルオロメチトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.24 g、0.47 ミリモル) のDMF (2 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (23 mg、0.56 ミリモル) を加え、更に0 °Cで1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、ジイソプロピルエーテルで洗浄し、白色固体の4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0.13 g、収率58%) を得た。

融点 138-140 °C。

【1458】

実施例85

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1

10

20

30

40

50

ーカルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4- (4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド (0. 10 g、0. 38 ミリモル) のトルエン (3 ml) 懸濁液に、実施例 3 で製造した 2-クロロ-1- (2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (0. 13 g、0. 57 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (0. 13 ml、0. 76 ミリモル)、4-ジメチルアミノピリジン (10 mg、0. 08 ミリモル) を加え、2. 5 時間 100 °C で攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、無色油状物の 4- (4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0. 11 g、収率 59 %) を得た。

10

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 26 (3H, s), 2. 43-2. 50 (2H, m), 3. 50-3. 78 (2H, m), 3. 93-4. 24 (5H, m), 7. 46 (1H, d, J=8. 3 Hz), 7. 60 (1H, d, J=8. 3 Hz), 8. 05 (1H, s)。

【1459】

実施例 86

4- (4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

20

実施例 85 で製造した 4- (4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0. 11 g、0. 23 ミリモル) の DMF (1 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (11 mg、0. 28 ミリモル) を加え、更に 0 °C で 1 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=4/1) により精製し、ジイソプロピルエーテルで洗浄し、白色固体の 4- (4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0. 04 g、収率 39 %) を得た。

30

融点 113-115 °C。

【1460】

実施例 87

(R)-4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4-クロロカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3. 34 g、13. 42 ミリモル) のトルエン (70 ml) 懸濁液に実施例 10 で製造した (R)-2-クロロ-1- (2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (4. 43 g、18. 79 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (4. 68 ml、26. 84 ミリモル) 及び 4-ジメチルアミノピリジン (0. 33 g、2. 68 ミリモル) を加え、100 °C で 4. 5 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/塩化メチレン/酢酸エチル=45/45/10) により精製し、無色油状物の (R)-4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルを (4. 12 g、収率 69 %) 得た。

40

50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 23 (3H, s), 1. 47 (9H, s), 3. 33–3. 50 (8H, m), 3. 91 (1H, s), 3. 99–4. 16 (3H, m), 4. 30 (1H, d, $J=12.1\text{ Hz}$), 8. 04 (1H, s)。

【1461】

4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)ピペラジン-1-カルボニルクロライドまたは4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロベニルオキシカルボニル]ピペラジン-1-カルボニルクロライドを用い、実施例87と同様にして、実施例88及び実施例89の化合物を製造した。

【1462】

10

実施例88

(R)-2-クロロ-1-{3-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)ピペラジン-1-イルカルボニルオキシ]-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル}-4-ニトロイミダゾール

収率81%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 24 (3H, s), 3. 28–3. 61 (8H, m), 3. 89 (1H, s), 4. 00–4. 20 (3H, m), 4. 31 (1H, d, $J=12.5\text{ Hz}$), 5. 14 (2H, s), 7. 22 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7. 39 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8. 04 (1H, s)。

20

【1463】

実施例89

(R)-2-クロロ-1-{3-[4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロベニルカルボニル]ピペラジン-1-イルカルボニルオキシ]-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル}-4-ニトロイミダゾール

収率95%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 24 (3H, s), 3. 33–3. 61 (8H, m), 3. 90 (1H, s), 3. 99–4. 17 (3H, m), 4. 31 (1H, d, $J=12.1\text{ Hz}$), 4. 79 (2H, d, $J=6.1\text{ Hz}$), 6. 39 (1H, dt, $J=6.1\text{ Hz}$, 15.9 Hz), 6. 67 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7. 39 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7. 49 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8. 04 (1H, s)。

30

【1464】

実施例90

(R)-4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド(2. 20 g、8. 05ミリモル)のトルエン(30 ml)懸濁液に、実施例10で製造した(R)-2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチル)プロピル-4-ニトロイミダゾール(2. 28 g、9. 66ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン(2. 81 ml、16. 10ミリモル)及び4-ジメチルアミノピリジン(0. 20 g、1. 61ミリモル)を加え、3時間100℃で攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、黄色油状物の(R)-4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(1. 82 g、収率48%)を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 23 (3H, s), 2. 17–2. 50 (4H, m), 2. 55 (1H, s), 3.

50

2.6 – 3.5 (6H, m), 3.98 – 4.20 (3H, m), 4.30 (1H, d, $J = 12.4$ Hz), 7.23 – 7.32 (4H, m), 8.05 (1H, s)。

【1465】

対応する出発原料を用い、実施例90と同様にして、実施例91及び実施例92の化合物を製造した。

【1466】

実施例91

(R) – 2 – クロロ – 1 – {3 – [4 – (4 – トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン – 1 – イルカルボニルオキシ] – 2 – ヒドロキシ – 2 – メチルプロピル} – 4 – ニトロイミダゾール

10

収率31%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.23 (3H, s), 2.24 – 2.54 (4H, m), 3.24 – 3.50 (4H, m), 3.56 (2H, s), 3.97 – 4.20 (3H, m), 4.32 (1H, d, $J = 12.4$ Hz), 7.45 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.58 (2H, d, $J = 8.0$ Hz), 8.05 (1H, s)。

【1467】

実施例92

(R) – 2 – クロロ – 1 – {3 – [4 – (4 – トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン – 1 – イルカルボニルオキシ] – 2 – ヒドロキシ – 2 – メチルプロピル} – 4 – ニトロイミダゾール

20

収率47%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.23 (3H, s), 2.22 – 2.54 (4H, m), 3.30 – 3.54 (4H, m), 3.50 (2H, s), 3.97 – 4.16 (3H, m), 4.32 (1H, d, $J = 12.5$ Hz), 7.15 – 7.18 (2H, m), 7.32 – 7.36 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

【1468】

実施例93

(R) – 4 – (4 – トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン – 1 – カルボン酸 3 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – ヒドロキシ – 2 – メチルプロピルエステルの製造

30

実施例10で製造した(R) – 2 – クロロ – 1 – (2, 3 – ジヒドロキシ – 2 – メチルプロピル) – 4 – ニトロイミダゾール (0.65 g, 2.8ミリモル) のトルエン (13 ml) 懸濁液に4 – (4 – トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン – 1 – カルボニルクロリド (1.25 g, 4.2ミリモル)、N – エチルジイソプロピルアミン (0.96 ml, 5.6ミリモル) 及び4 – ジメチルアミノピリジン (67 mg, 0.56ミリモル) を加え、100℃で8.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 19/1) により精製し、黄色油状物の(R) – 4 – (4 – トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン – 1 – カルボン酸 3 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – ヒドロキシ – 2 – メチルプロピルエステル (1.29 g、収率92%) を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.26 (3H, s), 3.02 – 3.17 (4H, m), 3.39 – 3.72 (4H, m), 3.91 (1H, s), 3.99 – 4.18 (3H, m), 4.34 (1H, d, $J = 12.3$ Hz), 6.85 – 6.98 (2H, m), 7.09 – 7.22 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

【1469】

対応する出発原料を用い、実施例93と同様にして、実施例94～実施例102の化合

50

物を製造した。

【1470】

実施例94

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率48%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.26 (3H, s), 3.13-3.35 (4H, m), 3.48-3.72 (4H, m), 3.94 (1H, s), 4.00-4.18 (3H, m), 4.33 (1H, d, $J=12.3\text{ Hz}$), 6.93 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.50 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

10

【1471】

実施例95

(R)-4-(4-メトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率54%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.24 (3H, s), 2.93-3.09 (4H, m), 3.52-3.63 (4H, m), 3.77 (3H, s), 3.96 (1H, s), 4.00-4.19 (3H, m), 4.32 (1H, d, $J=12.3\text{ Hz}$), 6.82-6.92 (4H, m), 8.05 (1H, s)。

20

【1472】

実施例96

(R)-4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率81%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (3H, s), 3.00-3.13 (4H, m), 3.52-3.65 (4H, m), 3.93 (1H, s), 4.00-4.17 (3H, m), 4.33 (1H, d, $J=12.5\text{ Hz}$), 6.82-6.86 (2H, m), 7.20-7.25 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

30

【1473】

実施例97

(R)-4-(3-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率87%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (3H, s), 3.04-3.22 (4H, m), 3.43-3.70 (4H, m), 3.89 (1H, s), 4.00-4.17 (3H, m), 4.33 (1H, d, $J=12.3\text{ Hz}$), 6.78 (1H, ddd, $J=1.6\text{ Hz}$, 2.4 Hz , 8.4 Hz), 6.85-6.88 (2H, m), 7.19 (1H, t, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

40

【1474】

実施例98

(R)-4-(3,4-ジクロロフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率47%

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

50

1. 12 (3H, s), 3. 15-3. 26 (4H, m), 3. 39-3. 61 (4H, m), 3. 88 (1H, d, $J=11.0$ Hz), 3. 93 (1H, d, $J=11.0$ Hz), 4. 07 (1H, d, $J=14.7$ Hz), 4. 15 (1H, d, $J=14.7$ Hz), 6. 96 (1H, dd, $J=2.9$ Hz, 9. 1 Hz), 7. 16 (1H, d, $J=2.9$ Hz), 7. 42 (1H, d, $J=9.1$ Hz), 8. 34 (1H, s)。

【1475】

実施例99

(R)-4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル
収率100%

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 25 (3H, s), 2. 96-3. 09 (4H, m), 3. 50-3. 67 (4H, m), 3. 98 (1H, s), 4. 05-4. 16 (3H, m), 4. 33 (1H, d, $J=12.3$ Hz), 6. 85-7. 02 (4H, m), 8. 05 (1H, s)。

【1476】

実施例100

(R)-4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率83%

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 25 (3H, s), 3. 11-3. 26 (4H, m), 3. 48-3. 70 (4H, m), 3. 91 (1H, s), 4. 00-4. 24 (3H, m), 4. 33 (1H, d, $J=12.3$ Hz), 7. 02-7. 20 (3H, m), 7. 38 (1H, t, $J=8.0$ Hz), 8. 05 (1H, s)。

【1477】

実施例101

(R)-2-クロロ-1-(3-ジエチルアミノカルボニルオキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール

収率37%

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1. 11 (6H, t, $J=7.1$ Hz), 1. 20 (3H, s), 3. 16 (4H, q, $J=7.1$ Hz), 3. 76 (1H, br), 4. 06-4. 11 (3H, m), 4. 26 (1H, d, $J=11.1$ Hz), 8. 05 (1H, s)。

【1478】

実施例102

2-クロロ-1-(3-モルホリノカルボニルオキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール

収率100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

40

1. 23 (3H, s), 3. 35-3. 52 (4H, m), 3. 61-3. 72 (4H, m), 3. 99-4. 16 (3H, m), 4. 31 (1H, d, $J=12.3$ Hz), 8. 05 (1H, s)。

【1479】

実施例103

(R)-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-カルボニルクロリド (2. 48 g、7. 77ミリモル) のトルエン (40 ml) 懸濁液に実施例10で製

50

造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (2.75 g、11.66 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (2.71 ml、15.54 ミリモル) 及び 4-ジメチルアミノピリジン (0.19 g、1.55 ミリモル) を加え、100℃で2.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、黄色油状物の (R)-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (4.03 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (3H, s), 3.04-3.33 (4H, m), 3.48-3.76 (4H, m), 3.83 (1H, s), 4.00-4.17 (3H, m), 4.33 (1H, d, $J=12.3\text{ Hz}$), 7.55 (1H, s), 7.59 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.69 (2H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 8.04 (1H, s)。

【1480】

実施例 104

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボニルクロリド (0.72 g、2.34 ミリモル) のトルエン (40 ml) 懸濁液に、実施例 10 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (1.16 g、4.68 ミリモル) とトリエチルアミン (1.63 ml、11.70 ミリモル) を加え、100℃で2.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、無色油状物の (R)-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (184 mg、収率 16%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.24 (3H, s), 1.72-1.98 (4H, m), 3.33-3.67 (4H, m), 3.91-4.20 (3H, m), 4.24-4.39 (1H, m), 4.52-4.65 (1H, m), 6.96 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.55 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

【1481】

実施例 105

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボニルクロリド (1.43 g、4.67 ミリモル) のトルエン (30 ml) 懸濁液に実施例 10 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (1.54 g、7.01 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (1.63 ml、9.34 ミリモル)、4-ジメチルアミノピリジン (0.11 g、0.93 ミリモル) を加え、100℃で2.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色油状物の (R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルを (1.44 g、収率 61%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 25 (3H, s), 1. 30–1. 48 (2H, m), 1. 98–2. 13 (2H, m), 2. 83–3. 13 (2H, m), 3. 37–3. 61 (1H, m), 3. 83–3. 96 (2H, m), 3. 96–4. 22 (4H, m), 4. 34 (1H, d, $J=11.8\text{ Hz}$), 7. 40 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7. 60 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 8. 07 (1H, s)。

【1482】

実施例106

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

10

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド (0. 60 g、2. 07ミリモル) のトルエン (36 ml) 懸濁液に、実施例10で製造した (R)-2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチル) プロピル-4-ニトロイミダゾール (0. 74 g、3. 11ミリモル) 及びトリエチルアミン (1. 74 ml、12. 42ミリモル) を加え、100℃で16時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色油状物の (R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0. 32 g、収率31%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 26 (3H, s), 2. 43–2. 50 (2H, m), 3. 50–3. 78 (2H, m), 3. 93–4. 24 (5H, m), 7. 46 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7. 60 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8. 05 (1H, s)。

【1483】

対応する出発原料を用い、実施例106と同様にして、実施例107～112の化合物を製造した。

【1484】

30

実施例107

(R)-4-(4-クロロフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

収率94%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 25 (3H, s), 2. 41–2. 59 (2H, m), 3. 50–3. 78 (2H, m), 3. 93–4. 22 (6H, m), 4. 35 (1H, d, $J=12.3\text{ Hz}$), 5. 87–6. 13 (1H, m), 7. 26–7. 37 (4H, m), 8. 05 (1H, s)。

40

【1485】

実施例108

(R)-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率92%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 26 (3H, s), 2. 46–2. 59 (2H, m), 3. 13–3. 37 (1H, m), 3. 50–3. 74 (2H, m), 4. 00–4. 14 (6H, m), 4. 36 (1H, d, $J=12.4\text{ Hz}$), 7. 19 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7. 37 (2

50

H, d, $J = 8.0 \text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

【1486】

実施例109

(R)-4-(4-メトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率63%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.23 (3H, s), 2.43-2.61 (2H, m), 3.52-3.74 (2H, m), 3.82 (3H, s), 4.01-4.16 (5H, m), 4.34 (1H, d, $J = 12.6 \text{ Hz}$), 5.83-6.00 (1H, m), 6.88 (2H, d, $J = 8.8 \text{ Hz}$), 7.30 (2H, d, $J = 8.8 \text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

10

【1487】

実施例110

(R)-4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率54%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (3H, s), 2.46-2.70 (2H, m), 3.50-3.78 (2H, m), 4.00-4.32 (6H, m), 4.35 (1H, d, $J = 12.6 \text{ Hz}$), 5.98-6.22 (1H, m), 7.39-7.67 (4H, m), 8.06 (1H, s)。

20

【1488】

実施例111

(R)-4-(4-ブロモフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率80%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (3H, s), 2.41-2.63 (2H, m), 3.50-3.76 (2H, m), 3.96-4.20 (6H, m), 4.35 (1H, d, $J = 12.3 \text{ Hz}$), 5.87-6.13 (1H, m), 7.15-7.26 (2H, m), 7.43-7.48 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

30

【1489】

実施例112

(R)-4-(4-フルオロフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率57%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (3H, s), 2.41-2.63 (2H, m), 3.50-3.76 (2H, m), 3.89-4.22 (6H, m), 4.35 (1H, d, $J = 12.6 \text{ Hz}$), 5.83-6.04 (1H, m), 6.99-7.06 (2H, m), 7.29-7.35 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

40

【1490】

5-クロロ-2,3-ジヒドロインドール-1-カルボニルクロリド、5-クロロ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-カルボニルクロリド、6-クロロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボニルクロリド又は6-クロロ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボニルクロリドを用い、実施例106と同様にして、実施例1

50

13～実施例116の化合物を製造した。

【1491】

実施例113

(R)-5-クロロインドリニル-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

微黄色アモルファス、収率50%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.27 (3H, s), 3.14 (2H, t, $J=8.5\text{ Hz}$), 3.42 (1H, br), 3.91-4.28 (5H, m), 4.37 (1H, d, $J=11.8\text{ Hz}$), 7.04-7.24 (2H, m), 7.73 (1H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.04 (1H, s)。

10

【1492】

実施例114

(R)-5-クロロイソインドリニル-2-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

茶色固体、収率19%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.27 (3H, s), 3.93 (1H, d, $J=7.8\text{ Hz}$), 4.04-4.24 (7H, m), 4.32 (1H, d, $J=11.8\text{ Hz}$), 7.16-7.29 (3H, m), 8.07 (1H, s)。

20

【1493】

実施例115

(R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

微黄色油状物、収率63%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.24 (3H, s), 2.83 (2H, t, $J=5.8\text{ Hz}$), 3.46-3.76 (2H, m), 3.90 (1H, d, $J=5.3\text{ Hz}$), 4.01-4.15 (3H, m), 4.34 (1H, d, $J=12.3\text{ Hz}$), 4.43-4.65 (2H, m), 6.93-7.09 (1H, m), 7.09-7.22 (2H, m), 8.04 (1H, s)。

30

【1494】

実施例116

(R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

微黄色油状物、収率70%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.26 (3H, s), 1.87-2.00 (2H, m), 2.76 (2H, t, $J=6.5\text{ Hz}$), 3.27 (1H, br), 3.57-3.83 (2H, m), 3.98-4.17 (3H, m), 4.33 (1H, d, $J=12.0\text{ Hz}$), 7.12-7.16 (2H, m), 7.41-7.61 (1H, br), 7.98 (1H, s)。

40

【1495】

実施例117

(R)-4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例87で製造した(R)-4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(4.12g、9.20ミリモル)のDMF(30ml)溶液

50

に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム（0.44 g、11.04ミリモル）を加え、0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）により精製し、イソプロパノールで洗浄し、白色固体の（R）-4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル（2.24 g、収率59%）を得た。

融点 211-212℃。

【1496】

実施例118

（R）-4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例93で製造した（R）-4-（4-トリフルオロメチトキシフェニル）ピペラジン-1-カルボン酸3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル（1.29 g、2.5ミリモル）のDMF（13 ml）溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム（0.12 g、3ミリモル）を加え、更に0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の（R）-4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルを（0.70 g、収率59%）得た。

光学純度 99.6% ee

$[\alpha]_D^{25} = 0.99^\circ$ （濃度：0.704, CHCl₃）

融点 168-169℃。

【1497】

実施例119

（R）-4-（4-クロロベンジル）ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例90で製造した（R）-4-（4-クロロベンジル）ピペラジン-1-カルボン酸3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル（1.82 g、3.85ミリモル）のDMF（10 ml）溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム（0.31 g、7.70ミリモル）を加え、更に0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、粗結晶をイソプロパノールで洗浄し、微黄色固体の（R）-4-（4-クロロベンジル）ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルを（0.46 g、収率28%）得た。

融点 161-163℃。

【1498】

実施例120

（R）-4-（4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ）ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例103で製造した（R）-4-（4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ）ピペラジン-1-カルボン酸3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル（4.03 g、7.77ミリモル）のDMF（20 ml）溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム（0.37 g、9.32ミリモル）を加え、0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し水で洗浄し、アセトニトリル及びイソプロパノールから再結晶し、白色固体の（R）-4-（4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ）ピペラジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル（2.

10

20

30

40

50

60 g、収率69%)を得た。

融点 176-178℃。

【1499】

実施例121

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例105で製造した(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(1.44g、2.85ミリモル)のDMF(10ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0.14g、3.42ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、アセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(0.42g、収率31%)を得た。

融点 137-140℃。

【1500】

実施例122

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例104で製造した(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(0.18g、0.36ミリモル)のDMF(2ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(19mg、0.47ミリモル)を加え、更に0℃で1.5時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(0.08g、収率47%)を得た。

融点 165-166℃。

【1501】

実施例123

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例106で製造した(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(0.32g、0.65ミリモル)のDMF(3ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(31mg、0.78ミリモル)を加え、更に0℃で1.5時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルを(0.14g、収率49%)得た。

光学純度 98.4% ee

$[\alpha]_D^{26} = +2.50^\circ$ (c 0.560, CHCl₃)。

融点 169–171°C。

【1502】

実施例124

(R)–5–クロロ–2,3–ジヒドロインドール–1–カルボン酸2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチルエステルの製造

実施例113で製造した(R)–5–クロロ–2,3–ジヒドロインドール–1–カルボン酸3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピルエステル(0.60g、1.44ミリモル)のDMF(6ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(70mg、1.73ミリモル)を加え、更に0°Cで1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄した。これをアセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)–5–クロロ–2,3–ジヒドロインドール–1–カルボン酸2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチルエステル(0.30g、収率55%)を得た。

融点 189–191°C。

【1503】

実施例125

(R)–5–クロロ–1,3–ジヒドロイソインドール–2–カルボン酸2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチルエステルの製造

実施例114で製造した(R)–5–クロロ–1,3–ジヒドロイソインドール–2–カルボン酸3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピルエステル(0.13g、0.31ミリモル)のDMF(2ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(15mg、0.37ミリモル)を加え、更に0°Cで1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、微黄色固体の(R)–5–クロロ–1,3–ジヒドロイソインドール–2–カルボン酸2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチルエステル(7mg、収率6%)を得た。

融点 182°C(分解)。

【1504】

実施例126

(R)–6–クロロ–3,4–ジヒドロ–1H–イソキノリン–2–カルボン酸2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチルエステルの製造

実施例115で製造した(R)–6–クロロ–3,4–ジヒドロ–1H–イソキノリン–2–カルボン酸3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピルエステル(0.26g、0.61ミリモル)のDMF(2ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(30mg、0.73ミリモル)を加え、更に0°Cで1時間攪拌した。氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。イソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の(R)–6–クロロ–3,4–ジヒドロ–1H–イソキノリン–2–カルボン酸2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチルエステル(0.12g、49%)を得た。

融点 180–182°C。

【1505】

実施例127

(R)–6–クロロ–3,4–ジヒドロ–2H–キノリン–1–カルボン酸2–メチル–

6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例 116 で製造した (R)-6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (1.84 g、4.29 ミリモル) の DMF (10 ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (0.21 g、5.15 ミリモル) を加え、更に 0℃ で 1 時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、アセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の (R)-6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0.68 g、収率 40%) を得た。

融点 172-174℃。

【1506】

実施例 128

2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

4-トリフルオロメトキシフェノール (198 mg、1.11 ミリモル) を DMF (5 ml) に溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム (48 mg、1.21 ミリモル) を加え、80℃ に昇温しつつ 20 分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例 6 で製造した 2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (220 mg、1.01 ミリモル) を加え、80℃ に昇温しつつ更に 15 分加熱撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。これを飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) で分離精製し、更に塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルによる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末の 2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (170 mg、収率 47%) を得た。

融点 126.8-127.9℃

MS 358 (M-1)⁺

実施例 129

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン]-1-イルフェノール (244 mg、0.69 ミリモル) を DMF (10 ml) に溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム (33 mg、0.83 ミリモル) を加え、80℃ に昇温しつつ 20 分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例 6 で製造した 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (150 mg、0.69 ミリモル) を加え、80℃ に昇温しつつ更に 20 分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) で分離精製し、更に塩化メチレン/酢酸エチルによる結晶化により白色粉末の 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (103 mg、収率 28%) を得た。

融点 165.4-166.3℃。

【1507】

実施例 130

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノール(296mg、0.92ミリモル)をDMF(10ml)に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(44mg、1.1ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(200mg、0.92ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に塩化メチレン/酢酸エチルによる結晶化により白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(178mg、収率38%)を得た。

融点 230.7-233.1℃。

【1508】

実施例131

4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.01g、7.23ミリモル)をDMF(20ml)に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(320mg、8ミリモル)を加え、70℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(1.5g、7.23ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)で分離精製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末の4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.5g、収率45%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.48(9H, s), 1.77(3H, s), 2.99-3.03(4H, m), 3.55-3.59(4H, m), 4.02(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.1Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 6.76-6.81(2H, m), 6.84-6.89(2H, m), 7.55(1H, s)。

融点 212.0-214.5℃

MS 459 (M⁺)。

【1509】

実施例132

4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(4-ヒドロキシフェニル)ペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(364mg、1.31ミリモル)をDMF(10ml)に溶解した。この溶液に室温

10

20

30

40

50

下水素化ナトリウム（58 mg、1.44ミリモル）を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱攪拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-クロロ-1-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）-4-ニトロイミダゾール（300 mg、1.38ミリモル）を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱攪拌した。反応液に氷水を加え、激しく攪拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン/メタノール=200/1）で分離精製し、更に塩化メチレン/ジイソプロピルエーテルによる結晶化により、白色粉末の4-[4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ）フェニル]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（248 mg、収率41%）を得た。

10

融点 207.8-209.1℃。

【1510】

実施例133

4-[4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ）フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸 3,4-ジクロロベンジルエステルの製造

実施例131で製造した4-[4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ）フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（118 mg、0.26ミリモル）を塩化メチレン5 mlに溶解し、トリフルオロ酢酸（5 ml）を加え3時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2 mlずつ加えた。反応液を室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF（15 ml）に溶解した。そこへ3,4-ジクロロベンジルアルコール（136 mg、0.77ミリモル）及び1,1'-カルボニルジイミダゾール（125 mg、0.77ミリモル）をDMF（5 ml）に溶解し3時間室温で攪拌して調製した溶液を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン/メタノール=200/1）により分離精製した。塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末の4-[4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ）フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸 3,4-ジクロロベンジルエステル（101 mg、収率70%）を得た。

20

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.77 (3H, s), 3.01-3.06 (4H, m), 3.62-3.67 (4H, m), 4.02 (1H, d, $J=10.2\text{ Hz}$), 4.04 (1H, d, $J=10.2\text{ Hz}$), 4.18 (1H, d, $J=10.2\text{ Hz}$), 4.49 (1H, d, $J=10.2\text{ Hz}$), 5.09 (2H, s), 6.76-6.81 (2H, m), 6.84-6.89 (2H, m), 7.18-7.22 (1H, m), 7.41-7.47 (2H, m), 7.55 (1H, s)。

40

【1511】

実施例134

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-（4-トリフルオロメチルベンジル）ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例131で製造した4-[4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ）フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（88 mg、0.19ミリモル）をトリフルオロ酢酸（5 ml）に溶解し、5時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2 mlずつ加えた。室温5分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をジク

50

ロロエタンに溶解し、氷冷下 4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド (40 μ l、0.29 ミリモル) 及びトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム (82 mg、0.38 ミリモル) を加え、室温まで昇温した後、終夜撹拌した。これに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加えて撹拌し、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製した。塩化メチレン-酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (53 mg、収率 53%) を得た。

10

融点 171.8-173.1 $^{\circ}$ C。

【1512】

実施例 132 で製造した 4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、実施例 134 と同様にして、実施例 135 の化合物を製造した。

【1513】

実施例 135

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

20

収率 45%、融点 160.6-161.1 $^{\circ}$ C。

【1514】

実施例 136

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

4-トリフルオロメトキシフェノール (1.1 g、6.17 ミリモル) を DMF (20 ml) に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (260 mg、6.45 ミリモル) を加え、80 $^{\circ}$ C に昇温しつつ 15 分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例 12 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (1.22 g、5.61 ミリモル) を加え、80 $^{\circ}$ C に昇温しつつ更に 2 時間加熱撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、激しく撹拌した後、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) で分離精製し、更に塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルによる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末の (R)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (1.03 g、収率 51%) を得た。

30

光学純度 >99% ee

$[\alpha]_D^{28} = 7.67^{\circ}$ (濃度: 1.030, CHCl₃)

40

MS 359 (M⁺)

融点 176.5-178.0 $^{\circ}$ C。

【1515】

対応する出発原料を用い、実施例 136 と同様にして、実施例 137~実施例 139 の化合物を製造した。

【1516】

実施例 137

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(チオモルホリン-4-イル) フェノキシメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 38%、融点 227.5-229.0 $^{\circ}$ C、MS 376 (M⁺)。

50

【1517】

実施例138

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(イミダゾール-1-イル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール
収率44%、融点 172-175℃。

【1518】

実施例139

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール
収率53%、融点 236.0-238.7℃。

10

【1519】

1-(4-ヒドロキシフェニル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステルを用い、実施例136と同様にして、実施例140の化合物を製造した。

【1520】

実施例140

(R)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル
収率30%、融点 208.2-211.5℃。

20

【1521】

実施例141

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノール(17.4g、49.0ミリモル)をDMF(150ml)に溶解した。この反応液に室温下水素化ナトリウム(2.15g、53.8ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(14.9g、68.6ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に塩化メチレン/酢酸エチルによる結晶化により淡黄色粉末の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(14.3g、収率55%)を得た。

30

MS 535 (M+1)⁺

光学純度 99.9% ee

[α]_D²⁸ = -9.94° (濃度: 1.006, CHCl₃)

40

融点 194.5-196℃

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.77 (3H, s), 1.87-2.00 (2H, m), 2.05-2.16 (2H, m), 2.95-3.05 (2H, m), 3.32-3.41 (2H, m), 4.02 (1H, d, J=10.2 Hz), 4.04 (1H, d, J=10.2 Hz), 4.18 (1H, d, J=10.2 Hz), 4.36-4.45 (1H, m), 4.49 (1H, d, J=10.2 Hz), 6.74-6.81 (2H, m), 6.87-6.94 (4H, m), 7.11-7.16 (2H, m), 7.55 (1H, s)。

【1522】

実施例142

50

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] フェノール (1. 7 g、5. 02 ミリモル) を DMF (20 ml) に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (221 m、5. 53 ミリモル) を加え、80 °C に昇温しつつ 20 分加熱攪拌した。これを氷冷し、実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチルオキシラニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール (1. 2 g、5. 53 ミリモル) を加え、80 °C に昇温しつつ更に 20 分加熱攪拌した。反応液に氷水を加え、激しく攪拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン / 酢酸エチル = 10 / 1) で分離精製し、更に酢酸エチルから再結晶を行い、淡黄色粉末の (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (1. 02 g、収率 39 %) を得た。

MS 519 (M⁺)

光学純度 > 99 % ee

[α]_D²⁸ = -18. 02 ° (濃度: 1. 160, CHCl₃)

融点 262. 5 - 265 °C。

【1523】

実施例 143

(R) - 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) フェニル] ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステルの製造

4 - (4 - ヒドロキシフェニル) ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (1. 07 g、3. 86 ミリモル) を DMF 10 ml に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (185 mg、4. 63 ミリモル) を加え、80 °C に昇温しつつ 20 分加熱攪拌した。これを氷冷し、実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチルオキシラニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール 923 mg (4. 24 ミリモル) を加え、80 °C に昇温しつつ更に 20 分加熱攪拌した。反応液に氷水を加え、激しく攪拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン / メタノール = 200 / 1) で分離精製し、更に酢酸エチル / ジソプロピルエーテルによる結晶化により白色粉末の (R) - 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) フェニル] ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (857 mg、収率 48 %) を得た。

MS 458 (M⁺)

光学純度 > 99 % ee

[α]_D²⁸ = -1. 07 ° (濃度: 1. 028, CHCl₃)

融点 227. 5 - 228. 3 °C (分解)。

【1524】

対応する出発原料を用い、実施例 143 と同様にして、実施例 144 の化合物を製造した。

【1525】

実施例 144

(R) - 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) フェニル] - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル

MS 438 (M-18)⁺

融点 183.0-189.0℃ (分解)。

【1526】

実施例145

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾイル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(4-ヒドロキシベンゾイル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(6.6g、21.5ミリモル)をDMF 50mlに溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(991mg、24.8ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール5.16(23.7ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離精製し、更に塩化メチレン/ジイソプロピルエーテルによる結晶化により白色粉末の(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾイル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(7.35g、収率70%)を得た。

MS 488 (M+1)⁺

融点 222.5-224.0℃。

【1527】

実施例146

(R)-4-[2-クロロ-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.7g、8.63ミリモル)をDMF 20mlに溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(397mg、9.92ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(2.1g、9.50ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=200/1)で分離精製し、更に塩化メチレン/酢酸エチルによる結晶化により白色粉末の(R)-4-[2-クロロ-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.34g、収率55%)を得た。

MS 493 (M⁺)

融点 207.0-209.5℃。

【1528】

実施例147

(R)-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(3-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(3.23g、11.6ミリモル)をDMF 40mlに溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム557mg(13.9ミリモル)を加え、70℃に昇温しつつ20分加熱

攪拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール2.78g(12.8ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱攪拌した。反応液に氷水を加え、激しく攪拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離精製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより白色粉末の(R)-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.4g、収率26%)を得た。

10

MS 459 (M⁺)

融点 179.5-182.0℃。

【1529】

実施例148

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(13.5g、48.8ミリモル)をDMF100mlに溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(2.15g、53.7ミリモル)を加え、70℃に昇温しつつ20分加熱攪拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(10.6g、48.8ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱攪拌した。反応液に氷水を加え、激しく攪拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離精製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより白色粉末の(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(9.9g、収率44%)を得た。

20

30

光学純度 >99.5% ee

[α]_D²⁸ = -10.85° (濃度: 1.014, CHCl₃)

MS 459 (M⁺)

融点 230-232℃

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.48 (9H, s), 1.76 (3H, s), 2.99-3.03 (4H, m), 3.54-3.59 (4H, m), 4.02 (1H, d, J=10.2Hz), 4.04 (1H, d, J=10.1Hz), 4.18 (1H, d, J=10.1Hz), 4.49 (1H, d, J=10.2Hz), 6.76-6.81 (2H, m), 6.85-6.89 (2H, m), 7.58 (1H, s)。

40

【1530】

実施例149

(R)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン二塩酸塩の製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.65ミリモル)をトリフルオロ酢酸5mlに溶解し、3時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をメタノールに溶解した。これに飽和塩化水素酢酸エチル溶液を5ml加え、析出物を濾取後、減圧乾燥することにより、淡黄色粉末の(R)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3

50

ージヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン二塩酸塩 (279mg、収率99%) を得た。

MS 359 (M⁺)

融点 212-220℃ (分解)

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1.67 (3H, s), 3.22-3.31 (8H, m), 4.18 (1H, d, J=10.9Hz), 4.23 (2H, s), 4.37 (1H, d, J=10.9Hz), 6.85 (2H, d, J=9.1Hz), 7.00 (2H, d, J=9.1Hz), 8.16 (1H, s), 9.37 (3H, br)。

【1531】

10

実施例150

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(800mg、1.74ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(3ml)の混合物を7時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣を塩化メチレン10mlに溶解し、トリエチルアミン3ml(21.52ミリモル)を加え、室温下にて5分撹拌した後、減圧下にて濃縮した。残渣をメタノール10mlに溶解し、氷冷下4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド(910mg、5.23ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(328mg、5.23ミリモル)及び酢酸0.33ml(5.23ミリモル)を加え、室温まで昇温させ終夜撹拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化メチレンを加え撹拌して塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製することにより、微黄色粉末の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール(667mg、収率74%)を得た。

20

融点 205.5-207℃。

30

【1532】

実施例151

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸エチルエステルの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.65ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン5ml及びトリエチルアミン2mlを加え、続いてクロロギ酸エチル(0.11ml、1.31ミリモル)を加え室温で1時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸エチルエステル(182mg、収率65%)を得た。

40

[α]_D²⁸= -9.86° (濃度: 1.014, CHCl₃)。

MS 431 (M⁺)

50

融点 210.5 – 212.0℃。

【1533】

実施例152

(R) – 4 – [4 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン – 1 – カルボン酸 4 – クロロベンジルエステルの製造

実施例148で製造した(R) – 4 – [4 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン – 1 – カルボン酸 tert – ブチルエステル (300mg、0.65ミリモル) を塩化メチレン 5ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 5ml を加え、3時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2ml ずつ加えた。室温5分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF 15ml に溶解した。そこへ4 – クロロベンジルアルコール (186mg、1.31ミリモル)、1, 1' – カルボニルジイミダゾール (212mg、1.31ミリモル) をDMF 5ml に溶解し3時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 200/1) により分離精製した。塩化メチレン – イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末の(R) – 4 – [4 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン – 1 – カルボン酸 4 – クロロベンジルエステル (313mg、収率91%) を得た。

$[\alpha]_D^{28} = -10.84^\circ$ (濃度: 1.006, CHCl₃)

MS 527 (M⁺)

融点 184.5 – 187.5℃。

【1534】

対応する出発原料を用い、実施例152と同様にして、実施例153の化合物を製造した。

【1535】

実施例153

(R) – 4 – [4 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン – 1 – カルボン酸 5 – クロロベンゾフラン – 2 – イルメチルエステル

収率79%、融点 195 – 197℃。

【1536】

実施例143で製造した(R) – 4 – [4 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン – 1 – カルボン酸 tert – ブチルエステル、実施例144で製造した(R) – 4 – [4 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメトキシ) フェニル] – 1, 2, 3, 6 – テトラヒドロピリジン – 1 – カルボン酸 tert – ブチルエステル、実施例145で製造した(R) – 4 – [4 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメトキシ) ベンゾイル] ピペラジーン – 1 – カルボン酸 tert – ブチルエステル、又は実施例147で製造した(R) – 4 – [3 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン – 1 – カルボン酸 tert – ブチルエステルを用い、実施例152と同様にして、実施例154～実施例158の化合物を製造した。

【1537】

実施例154

(R) – 4 – [4 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b]

] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率 54%、融点 202.5-204°C。

【1538】

実施例 155

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率 67%、融点 174.3-174.8°C。

【1539】

実施例 156

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾイル]ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率 86%、融点 168.5-172°C。

【1540】

実施例 157

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)ベンゾイル]ピペラジン-1-カルボン酸エチルエステル

収率 85%、融点 132-135°C。

【1541】

実施例 158

(R)-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率 50%、融点 136.5-138°C。

【1542】

実施例 159

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 148 で製造した (R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (4.22 g、9.60 ミリモル) を塩化メチレン 10 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 30 ml を加え 5 時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 10 ml ずつ加えた。これを室温で 5 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をジクロロエタンに溶解し、氷冷下に 4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド (1.64 ml、11.5 ミリモル) 及びトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム (3.05 g、14.4 ミリモル) を加え、室温まで昇温した後、終夜攪拌した。これに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加えて攪拌し、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製した。塩化メチレン-酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末の (R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (3.23 g、収率 63%) を得た。

光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{28} = -8.25^\circ$ (濃度: 1.018, CHCl₃)

10

20

30

40

50

MS 533 (M^+)

融点 213.5–217°C。

【1543】

実施例159の化合物は、下記実施例160でも製造した。

【1544】

実施例160

(R)–2–メチル–6–ニトロ–2–{4–[4–(4–トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジーン–1–イル]フェノキシメチル}–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾールの製造

4–[4–(4–トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジーン–1–イル]フェノール 10
3.36g (9.54ミリモル)をDMF 20mlに溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム 420mg (10.5ミリモル)を加え、80°Cに昇温しつつ15分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した(R)–2–クロロ–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル)–4–ニトロイミダゾール 2.18g (10.0ミリモル)を加え、80°Cに昇温しつつ更に15分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌した後、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離精製し、更に塩化メチレン–酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後乾燥することにより淡黄色粉末の(R)–2–メチル–6–ニトロ–2–{4–[4–(4–トリフルオロメトキシ 20
ベンジル)ピペラジーン–1–イル]フェノキシメチル}–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール(2.0g、収率40%)を得た。

【1545】

実施例143で製造した(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメトキシ)フェニル]ピペリジン–1–カルボン酸tert–ブチルエステル、実施例144で製造した(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメトキシ)フェニル]–1,2,3,6–テトラヒドロピリジン–1–カルボン酸tert–ブチルエステル又は実施例145で製造した(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメトキシ) 30
ベンゾイル]ピペラジーン–1–カルボン酸tert–ブチルエステルを用い、実施例159と同様にして、実施例161～実施例163の化合物を製造した。

【1546】

実施例161

(R)–2–メチル–6–ニトロ–2–{4–[1–(4–トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン–4–イル]フェノキシメチル}–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール

収率45%、融点 186–188°C。

【1547】

実施例162

(R)–2–メチル–6–ニトロ–2–{4–[1–(4–トリフルオロメトキシベンジル)–1,2,3,6–テトラヒドロ–2H–ピリジン–4–イル]フェノキシメチル}–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール

収率61%、融点 168–174°C。

【1548】

実施例163

(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメトキシ)ベンゾイル]–1–(4–トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン

収率83%、融点 155–156°C。

10

20

30

40

50

【1549】

実施例164

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルアミドの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(120mg、0.26ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え3時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミン2mlずつを加えた。これを室温5分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF10mlに溶解した。そこへ4-トリフルオロメトキシベンジルアミン(125mg、0.65ミリモル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール(110mg、0.68ミリモル)をDMF5mlに溶解し、3時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルアミド(48mg、収率32%)を得た。

MS 558 (M-18)⁺

融点 166.5-168.5℃。

【1550】

実施例165

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.65ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、これにトリフルオロ酢酸5mlを加え、5時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン10ml及びトリエチルアミン2mlを加え、続いて4-トリフルオロメトキシベンゾイルクロリド(0.15ml、0.98ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水にあげ、塩化メチレンで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により分離精製した。塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(263mg、収率74%)を得た。

MS 547 (M⁺)

融点 201.5-203.2℃。

【1551】

実施例166

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(1-オキソチオモルホリン-4-イル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例137で製造した(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(チオモルホリン-4-イル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾ

ール（85mg、0.23ミリモル）を塩化メチレン5mlに溶解した。これにm-クロロ過安息香酸（59mg、0.24ミリモル）を加え、室温で20分撹拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し、チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に塩化メチレン-イソプロピルエーテルによる結晶化を行い、濾取後乾燥することにより、白色粉末の（R）-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-（1-オキシチオモルホリン-4-イル）フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール（59mg、収率67%）を得た。

MS 392 (M⁺)

融点 198-200℃。

10

【1552】

実施例167

N-メチル-N-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）-2-（4-トリフルオロメトキシフェノキシ）エチルアミンの製造

実施例6で製造した2-クロロ-1-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）-4-ニトロイミダゾール（84mg、0.39ミリモル）、N-メチル-2-（4-トリフルオロメトキシフェノキシ）エチルアミン（100mg、0.43ミリモル）及びDMF（1ml）の混合物を65-70℃にて8時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン/酢酸エチル=20/1）により精製して黄色油状物質を得た。

20

【1553】

この黄色油状物質をDMF1mlに溶解し、水素化ナトリウム（11mg、0.28ミリモル）を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン/酢酸エチル=10/1）により精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末のN-メチル-N-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）-2-（4-トリフルオロメトキシフェノキシ）エチルアミン（34mg、収率21%）を得た。

30

融点 86.4-89.2℃。

【1554】

実施例168

N-メチル-N-〔2-〔N-メチル-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）アミノ〕エチル〕カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール（5.97g、27.43ミリモル）、N-メチル-〔2-〔N-メチル-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）アミノ〕エチル〕カルバミン酸tert-ブチルエステル（10.53g、40.76ミリモル）、トリエチルアミン（0.76ml、5.49ミリモル）及び1-プロパノール（60ml）の混合物を5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、飽和食塩水により洗浄後、硫酸ナトリウムにより乾燥し、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン/メタノール=20/1）により精製して黄色油状物質を得た。

40

【1555】

この黄色油状物質を1,4-ジオキサン200mlに溶解し、水素化ナトリウム（500mg、12.5ミリモル）を加え、終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に氷水を加え、塩化メチレンにより抽出し、飽和食塩水により洗浄後、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカ

50

ゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝２０／１）により精製し、白色粉末結晶のＮ－メチル－Ｎ－〔２－〔Ｎ－メチル－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）アミノ〕エチル〕カルバミン酸ｔｅｒｔ－ブチルエステル（１．９４ｇ、収率１３％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

１．４５（９Ｈ，ｓ），１．５８（３Ｈ，ｓ），２．３８（３Ｈ，ｓ），２．５７－２．６９（３Ｈ，ｍ），２．７９（３Ｈ，ｓ），２．８９（１Ｈ，ｄ， $J=14.9\text{ Hz}$ ），３．１５－３．２５（２Ｈ，ｂｍ），３．８５（１Ｈ，ｄ， $J=14.9\text{ Hz}$ ），４．３３（１Ｈ，ｂｒ），７．５２（１Ｈ，ｓ）。

【１５５６】

10

実施例１６９

（Ｓ）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）－〔２－〔４－〔４－（トリフルオロメチル）フェニル〕ピペラジーン－１－イル〕エチル〕アミンの製造

実施例１２で製造した（Ｒ）－２－クロロ－１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）－４－ニトロイミダゾール（５２３ｍｇ、２．４１ミリモル）及びＮ－メチル－２－〔４－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピペラジーン－１－イル〕エチルアミン（９００ｍｇ、３．１３ミリモル）をDMF 15 mlに加え、70－80℃にて5時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝２０／１）により精製して黄色油状物質を得た。

20

【１５５７】

この黄色油状物質をDMF 15 mlに溶解し、水素化ナトリウム（１１５ｍｇ、２．８９ミリモル）を加え、室温下で１時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝１０／１）により精製し、塩化メチレン－ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の（Ｓ）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）－２－〔４－（４－トリ

30

MS 468 (M^+)

融点 148.0－150.5℃。

【１５５８】

対応する出発原料を用い、実施例１６９と同様にして、実施例１７０～実施例１７７の化合物を製造した。

【１５５９】

実施例１７０

（Ｓ）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）－２－（４－トリフルオロメチルフェノキシ）エチルアミン

40

白色粉末、収率１２％

MS 399 (M-H^+)

融点 123.0－126.0℃。

【１５６０】

実施例１７１

（Ｓ）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）－２－（４－トリフルオロメトキシフェノキシ）エチルアミン

50

白色粉末、収率 45 %

MS 416 (M^+)

融点 112.5 – 115.0 °C。

【1561】

実施例 172

(S)-N, N'-ジメチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-N'-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2-エチレンジアミン

白色粉末、収率 24 %

MS 413 (M^+)

融点 135.5 – 137.5 °C。

【1562】

実施例 173

(S)-4-[2-(N-メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミノ)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率 30 %

MS 425 ($M+H$)⁺

融点 149.5 – 151.8 °C。

【1563】

実施例 174

(S)-N-ベンジル-N-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミン

白色粉末、収率 25 %

融点 96.5 – 97 °C。

【1564】

実施例 175

(S)-N-メチル-N-[3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)プロピル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミン

白色粉末、収率 50 %

融点 92 – 95 °C。

【1565】

実施例 176

(S)-N-メチル-N-[2-(4-クロロフェノキシ)エチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミン

白色粉末、収率 27 %

融点 130.5 – 132 °C。

【1566】

実施例 177

(S)-N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチルアミン

淡茶粉末、収率 26 %

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.58 (3H, s), 1.70–1.85 (2H, m), 1.98 (2H, br), 2.37 (3H, s), 2.25–2.50 (4H, m), 2.50–2.80 (5H, m), 2.90 (1H, d, J=14.9 Hz), 3.85 (1H, d, J=9.5 Hz), 4.37 (1H, m), 4.52 (1H, d, J=14.9 Hz), 7.42 (2H,

10

20

30

40

50

d, $J = 8.7 \text{ Hz}$), 7.52 (1H, s), 7.53 (2H, d, $J = 8.7 \text{ Hz}$)。

【1567】

実施例178

N-(2-エトキシカルボニルフェニル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミンの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (891mg、6.04ミリモル)、1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-ベンゾ[d][1,3]オキサジン-2,4-ジオン (1.41g、6.04ミリモル)、酢酸ナトリウム (545mg、6.64ミリモル) 及びエタノール (10ml) の混合物を10時間、加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を1,4-ジオキサン20mlに溶解し、水素化ナトリウム (219mg、5.48ミリモル) を加え、5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に氷水を加え、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) により精製し、白色粉末結晶のN-(2-エトキシカルボニルフェニル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミン (1.15g、収率55%) を得た。融点 162.5-163.2℃。

【1568】

実施例179

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-ベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (500mg、2.3ミリモル)、N-メチルベンジルアミン (334mg、2.76ミリモル) 及びDMF (2.5ml) の混合物を60℃にて9時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) により精製し、黄色オイルの(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール (712mg、収率91%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.13 (3H, s), 2.37-2.57 (5H, m), 3.51 (1H, d, $J = 12.9 \text{ Hz}$), 3.72 (1H, d, $J = 12.9 \text{ Hz}$), 3.85 (2H, s), 7.16-7.39 (5H, m), 7.87 (1H, s)。

【1569】

対応する出発原料を用い、実施例179と同様にして、実施例180～実施例187の化合物を製造した。

【1570】

実施例180

(S)-1-{2-ヒドロキシ-3-[N-メチル-(3-クロロベンジル)]アミノ-2-メチル}プロピル-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール
収率98%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.15 (3H, s), 2.35-2.57 (5H, m), 3.53 (1H, d, $J = 13.3 \text{ Hz}$), 3.67 (1H, d, $J = 13.3 \text{ Hz}$), 3.92 (2H, s), 7.10-7.31 (4H, m), 7.95 (1H, s)。

【1571】

実施例181

(S)-1-{2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-クロロベンジルアミノ)-2-メチルプロピル}-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

収率 86%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.13 (3H, s), 2.33-2.59 (5H, m), 3.53 (1H, d, $J=13.2$ Hz), 3.68 (1H, d, $J=13.2$ Hz), 3.92 (2H, s), 7.19 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.31 (2H, d, $J=8.4$ Hz), 7.96 (1H, s)。

【1572】

実施例 182

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-トリフルオロメトキシベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

収率 98%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.13 (3H, s), 2.37 (3H, s), 2.47 (1H, d, $J=13.9$ Hz), 2.58 (1H, d, $J=13.9$ Hz), 3.58 (1H, d, $J=13.3$ Hz), 3.72 (1H, d, $J=13.3$ Hz), 3.94 (2H, s), 7.19 (2H, d, $J=8.6$ Hz), 7.31 (2H, d, $J=8.6$ Hz), 7.99 (1H, s)。

【1573】

実施例 183

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-トリフルオロメチルベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

収率 100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.15 (3H, s), 2.38 (3H, s), 2.50 (1H, d, $J=13.9$ Hz), 2.60 (1H, d, $J=13.9$ Hz), 3.65 (1H, d, $J=13.6$ Hz), 3.79 (1H, d, $J=13.6$ Hz), 3.97 (2H, s), 7.41 (2H, d, $J=8.2$ Hz), 7.61 (2H, d, $J=8.2$ Hz), 8.00 (1H, s)。

【1574】

実施例 184

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-メトキシベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

収率 85%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.12 (3H, s), 2.36-2.50 (5H, m), 3.45 (1H, d, $J=12.8$ Hz), 3.64 (1H, d, $J=12.8$ Hz), 3.80 (3H, s), 3.84 (2H, s), 6.84 (2H, dd, $J=1.9$ Hz, 8.6 Hz), 7.13 (2H, dd, $J=1.9$ Hz, 8.6 Hz), 7.89 (1H, s)。

【1575】

実施例 185

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-ジメチルアミノベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

収率 94%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.11 (3H, s), 2.34-2.47 (5H, m), 2.93 (s, 6H), 3.39 (1H, d, $J=12.8$ Hz), 3.60 (1H, d, $J=12.8$ Hz), 3.81 (2H, s), 6.65 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 7.03 (2H, d, $J=8.7$ Hz), 7.87 (1H, s)。

10

20

30

40

50

【1576】

実施例186

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-フェニルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

収率92%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.24 (3H, s), 3.06 (3H, s), 3.40 (2H, s), 4.05 (1H, d, $J=14.2\text{ Hz}$), 4.13 (1H, d, $J=14.2\text{ Hz}$), 6.74-6.89 (3H, m), 7.17-7.34 (2H, m), 8.04 (1H, s)。

【1577】

10

実施例187

(S)-1-{2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-クロロフェニルアミノ)-2-メチルプロピル}-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

収率92%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.24 (3H, s), 3.04 (3H, s), 3.38 (2H, s), 4.08 (2H, s), 6.74 (2H, dd, $J=2.1\text{ Hz}$, 7.2 Hz), 7.19 (2H, dd, $J=2.1\text{ Hz}$, 7.2 Hz), 8.02 (1H, s)。

【1578】

20

実施例188

(S)-2-(N-ベンジル-N-メチル)アミノメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例179で製造した(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-ベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール(710mg、2.1ミリモル)及びDMF(2.1ml)の混合物に、氷冷下にて水素化ナトリウム(101mg、2.51ミリモル)を加え、同温度下にて2時間攪拌した。反応液に酢酸エチル0.7ml、水5mlの順に加え、析出晶を濾取した。これをイソプロピルアルコール10ml中に加熱還流下にて溶解し、活性炭28mgを加え、20分加熱還流を続けた。熱時濾過後、濾液にイソプロピルエーテル3mlを加え、静置し、析出晶を濾取することにより、黄色粉末結晶の(S)-2-(N-ベンジル-N-メチル)アミノメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(248mg、収率39%)を得た。

30

融点 132.5-133℃。

【1579】

対応する出発原料を用い、実施例188と同様にして、実施例189～実施例196の化合物を製造した。

【1580】

実施例189

(S)-2-[N-(4-クロロベンジル)-N-メチルアミノ]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

40

収率44%、融点 129-129.5℃。

【1581】

実施例190

(S)-2-[N-(3-クロロベンジル)-N-メチルアミノ]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率65%、融点 177.5-178.5℃。

【1582】

実施例191

(S)-2-[N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-N-メチルアミノ]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

50

収率 53%、融点 145–146℃。

【1583】

実施例 192

(S)–2–[N–(4–トリフルオロメチルベンジル)–N–メチルアミノ]メチル–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2,1–b] オキサゾール

収率 49%、融点 130–132℃。

【1584】

実施例 193

(S)–2–[N–(4–メトキシベンジル)–N–メチルアミノ]メチル–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2,1–b] オキサゾール

収率 59%、融点 144–147℃。

【1585】

実施例 194

(S)–2–[N–(4–ジメチルアミノベンジル)–N–メチルアミノ]メチル–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2,1–b] オキサゾール

収率 47%、融点 168–169℃。

【1586】

実施例 195

(S)–2–(N–フェニル–N–メチルアミノ)メチル–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2,1–b] オキサゾール

収率 55%、融点 147–148℃。

【1587】

実施例 196

(S)–2–[N–(4–クロロフェニル)–N–メチルアミノ]メチル–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2,1–b] オキサゾール

収率 34%、融点 174–175℃。

【1588】

実施例 197

(S)–4–[2–(N–メチル–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2,1–b] オキサゾール–2–イルメチルアミノ)エチル]ピペラジン–1–カルボン酸 4–トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

実施例 173 で製造した (S)–4–[2–(N–メチル–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2,1–b] オキサゾール–2–イルメチルアミノ)エチル]ピペラジン–1–カルボン酸 *tert*–ブチルエステル (300mg、0.71ミリモル) を塩化メチレン 5ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 5ml を加え、3 時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 2ml ずつ加えた。室温下、5 分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣を DMF 15ml に溶解した。そこへ 4–トリフルオロメチルベンジルアルコール (373mg、2.12ミリモル) 及び 1,1'–カルボニルジイミダゾール (344mg、2.12ミリモル) を DMF 5ml に溶解し 3 時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により分離精製した。塩化メチレン–イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の (S)–4–[2–(N–メチル–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2,1–b] オキサゾール–2–イルメチルアミノ)エチル]ピペラジン–1–カルボン酸 4–トリフルオロメチルベンジルエステル (196mg、収率 53%) を得た。

MS 509 (M–H₂O)⁺

融点 77.2–76.9℃。

【1589】

実施例 198

(S)-N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-イル]エチルアミンの製造

実施例 173 で製造した (S)-4-[2-(N-メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミノ)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (400 mg、0.94 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 5 ml を加え、5 時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 2 ml ずつ加えた。室温下、5 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をメタノール 10 ml に溶解し、4-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒド (0.4 ml、2.83 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (178 mg、2.83 ミリモル) 及び酢酸 0.2 ml を加え、室温で 30 分攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え、攪拌して、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製した。塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の (S)-N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-イル]エチルアミン (307 mg、収率 68%) を得た。

MS 482 (M⁺)

融点 102.0-104.5 °C。

【1590】

実施例 199

(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸エチルエステルの製造

2,4-ジニトロ-1H-イミダゾール (0.678 g、3.92 ミリモル) 及び 2-オキシラニルメチルカルバミン酸フェニルエステル (1.04 g、5.87 ミリモル) をエタノール 20 ml に溶解し、酢酸ナトリウム (0.386 g、4.70 ミリモル) を加え、終夜加熱還流した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) で精製し、ジイソプロピルエーテルを加えた。析出物を濾取後、減圧乾燥することにより、微茶色固体の (6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸エチルエステル (0.116 g、収率 11.6%) を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1.15 (3H, t, J=7.1 Hz), 3.41-3.51 (2H, m), 3.93-4.11 (3H, m), 4.38 (1H, dd, J=8.6 Hz, 10.7 Hz), 5.31-5.47 (1H, m), 7.52 (1H, br), 8.13 (1H, s)。

【1591】

実施例 200

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸ベンジルエステルの製造

2,4-ジニトロ-1H-イミダゾール (3 g、19 ミリモル) 及び (2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸ベンジルエステル (4.31 g、19 ミリモル) をエタノール (20 ml) に溶解し、酢酸ナトリウム (1.56 g、19.0 ミリモル) を加え、70 °C で攪拌終夜した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1、塩化メチレン/メタノール=50/1) で精製し酢酸エチル-塩化メチレンから再結晶することにより、

無色固体の（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）カルバミン酸ベンジルエステル（０．２９８ｇ、収率４．７％）を得た。

融点 １７１．３－１７２．２℃

$^1\text{H-NMR}$ （ $\text{DMSO}-d_6$ ） δ ppm：

１．５５（３Ｈ，ｓ），３．４６（２Ｈ，ｄ， $J=6.3\text{ Hz}$ ），４．０６（１Ｈ，ｄ， $J=11.0\text{ Hz}$ ），４．２５（１Ｈ，ｄ， $J=11.0\text{ Hz}$ ），５．０３（２Ｈ，ｓ），７．１９－７．４１（５Ｈ，ｍ），７．７６（１Ｈ，ｔ， $J=6.3\text{ Hz}$ ），８．１３（１Ｈ，ｓ）。

【１５９２】

10

実施例２０１

２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩の製造

実施例２００で製造した（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）カルバミン酸ベンジルエステル（１９０ｍｇ、０．５７ミリモル）、トリフルオロ酢酸（４ｍｌ）及び塩化メチレン（５ｍｌ）の混合物を室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、微黄色粉末の２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩（１２０ｍｇ、収率６７％）を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ （ $\text{DMSO}-d_6$ ） δ ppm：

１．３５（３Ｈ，ｓ），３．２３（１Ｈ，ｄ， $J=9.6\text{ Hz}$ ），３．４９（１Ｈ，ｄ， $J=9.6\text{ Hz}$ ），３．８２－３．９８（２Ｈ，ｍ），７．９８（１Ｈ，ｓ），１２．２２（１Ｈ，ｓ）。

【１５９３】

対応する出発原料を用い、実施例２００と同様にして、実施例２０２～実施例２０４の化合物を製造した。

【１５９４】

実施例２０２

Ｎ－メチル－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）カルバミン酸ベンジルエステル

30

収率１４％、融点 １５０．３－１５１．６℃。

【１５９５】

実施例２０３

（６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）カルバミン酸ベンジルエステル

収率１１％

$^1\text{H-NMR}$ （ $\text{DMSO}-d_6$ ） δ ppm：

３．４５－３．５９（２Ｈ，ｍ），４．０７（１Ｈ，ｄｄ， $J=6.6\text{ Hz}$ ， 10.8 Hz ），４．３９（１Ｈ，ｄｄ， $J=8.6\text{ Hz}$ ， 10.8 Hz ），５．０４（２Ｈ，ｓ），５．３２－５．５０（１Ｈ，ｍ），７．２３－７．４１（５Ｈ，ｍ），７．７１（１Ｈ，ｂｒ），８．１３（１Ｈ，ｓ）。

40

【１５９６】

実施例２０４

（６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）カルバミン酸tert-ブチルエステル

収率２７％

$^1\text{H-NMR}$ （ CDCl_3 ） δ ppm：

１．４３（９Ｈ，ｓ），３．６５（２Ｈ，ｄｄ， $J=4.3\text{ Hz}$ ， 6.2 Hz ），４．２０（１Ｈ，ｄｄ， 7.0 Hz ， 10.5 Hz ），４．３６（１Ｈ，ｄｄ， $J=8.6\text{ Hz}$

50

, 10.5 Hz), 5.20 (1H, t, J = 6.2 Hz), 5.35–5.48 (1H, m), 7.56 (1H, s)。

【1597】

実施例205

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステルの製造

2,4-ジニトロ-1H-イミダゾール(0.518g、3.28ミリモル)及び(2-メチル-2-オキシラニルメチル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステル(2.097g、8.20ミリモル)を混合し、室温で攪拌終夜した。反応液にエタノール6mlを加え、酢酸ナトリウム(0.538g、6.56ミリモル)を加え1時間加熱還流した。これに水を加え、析出物を濾取した。得られた固体をジエチルエーテル洗浄後、減圧乾燥することにより、無色固体の(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステル(0.197g、収率16%)を得た。

融点 221.0–221.8℃。

【1598】

実施例202で製造したN-メチル-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸ベンジルエステルを用い、実施例201と同様にして、実施例206の化合物を製造した。

【1599】

実施例206

N-メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩

融点 176.2–178.8℃。

【1600】

対応する出発原料を用い、実施例205と同様にして、実施例207～実施例211の化合物を製造した。

【1601】

実施例207

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

収率25%、融点 200.4–202.1℃。

【1602】

実施例208

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸エチルエステル

収率26%、融点 182.5–183.4℃。

【1603】

実施例209

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率17%、融点 182.3–184.4℃。

【1604】

実施例210

(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステル

収率17%、融点 182.6–182.9℃。

【1605】

実施例211

(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル

カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル
収率 17%、融点 164.6–165.1℃。

【1606】

実施例 212

[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-N-メチル-カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (0.953 g、6.46 ミリモル) 及び N-メチル-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル (1.964 g、7.75 ミリモル) をエタノール 20 ml に溶解し、酢酸ナトリウム (0.583 g、7.11 ミリモル) を加え、終夜加熱還流した。エタノールを減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル及び水を加えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) で精製することにより、無色油状物の [3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-N-メチル-カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル (1.683 g、収率 65%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.17 (3H, s), 3.06 (3H, s), 3.25 (1H, d, J=14.7 Hz), 3.51 (1H, d, J=14.7 Hz), 4.00 (2H, s), 5.12 (2H, s), 6.95–7.09 (2H, m), 7.27–7.41 (2H, m), 8.07 (1H, s)。

【1607】

N-メチル-(2-オキシラニルメチル) カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステルを用い、実施例 212 と同様にして、実施例 213 の化合物を製造した。

【1608】

実施例 213

[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]-N-メチル-カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル

収率 51%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

3.04 (3H, s), 3.27–3.55 (2H, m), 3.73–4.23 (4H, m), 5.11 (2H, s), 7.00–7.14 (2H, m), 7.27–7.41 (2H, m), 7.96 (1H, s)。

【1609】

実施例 214

N-メチル-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステルの製造

実施例 212 で製造した [3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-N-メチル-カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル (1.683 g、4.20 ミリモル) を 1,4-ジオキサン 30 ml に溶解し、水素化ナトリウム (0.185 g、4.62 ミリモル) を加え、1 時間室温で攪拌した後、7 時間加熱還流した。溶媒を減圧留去し、残渣に水を加え析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) で精製した。得られた固体を n-ヘキサン及び酢酸エチルの混合溶媒で洗浄し、濾取後、減圧乾燥することにより、無色固体の N-メチル-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル (0.381 g、収率 25%) を得た。

融点 168.9–169.9℃。

【1610】

実施例 213 で製造した [3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-

2-ヒドロキシプロピル]-N-メチル-カルバミン酸4-フルオロベンジルエステルを用い、実施例214と同様にして、実施例215の化合物を製造した。

【1611】

実施例215

N-メチル-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

収率16%、融点 124.5-128.1℃。

【1612】

対応する出発原料を用い、実施例179と同様にして、実施例216~実施例220の化合物を製造した。

10

【1613】

実施例216

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチル-アミノ}-2-ヒドロキシ-2-メチルプロパン

黄色油状物、収率98%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.13 (3H, s), 1.57-1.82 (4H, m), 2.38-2.71 (4H, m), 2.40 (3H, m), 3.65-3.71 (2H, m), 3.82 (1H, s), 3.89-4.01 (2H, m), 6.81-6.86 (2H, m), 7.16-7.22 (2H, m), 8.06 (1H, s)。

20

【1614】

実施例217

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチル-アミノ}-2-ヒドロキシ-2-メチルプロパン

黄色油状物、収率91%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.13 (3H, s), 1.59-1.83 (4H, m), 2.41 (3H, s), 2.43-2.73 (5H, m), 3.66-3.73 (2H, m), 3.84 (1H, s), 3.93 (1H, d, J=14.2 Hz), 4.00 (1H, d, J=14.2 Hz), 6.86-6.91 (2H, m), 7.07-7.12 (2H, m), 8.06 (1H, s)。

30

【1615】

実施例218

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチル-アミノ}-2-ヒドロキシ-2-メチルプロパン

黄色油状物、収率96%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.13 (3H, s), 1.54-1.70 (2H, m), 1.77-1.84 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42-2.60 (3H, m), 2.72-2.82 (2H, m), 3.79 (1H, s), 3.84-3.89 (2H, m), 3.92 (1H, d, J=14.2 Hz), 3.99 (1H, d, J=14.2 Hz), 6.91 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.46 (2H, d, J=8.7 Hz), 8.06 (1H, s)。

40

【1616】

実施例219

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{[1-(4-シアノフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチル-アミノ}-2-ヒドロキシ-2

50

ーメチルプロパン

黄色油状物、収率 89%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 13 (3H, s), 1. 51–1. 65 (2H, m), 1. 77–1. 84 (2H, m), 2. 39 (3H, s), 2. 42–2. 62 (3H, m), 2. 76–2. 88 (2H, m), 3. 75 (1H, s), 3. 88–4. 03 (4H, m), 6. 81–6. 88 (2H, m), 7. 45–7. 53 (2H, m), 8. 05 (1H, s)。

【1617】

実施例 220

(S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–3–{[1–(tert–ブトキシカルボニル) ピペリジン–4–イル]–N–メチル–アミノ}–2–ヒドロキシ–2–メチルプロパン 10

黄色油状物、

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 11 (3H, s), 1. 46 (9H, s), 1. 50–1. 80 (4H, m), 2. 37 (3H, s), 2. 40–2. 75 (5H, m), 3. 90 (1H, d, $J=14.2\text{ Hz}$), 3. 99 (1H, d, $J=14.2\text{ Hz}$), 4. 22 (2H, br), 8. 05 (1H, s)。

【1618】

実施例 216～実施例 220 で製造した化合物から、実施例 188 と同様にして、実施例 221～実施例 225 の化合物を製造した。 20

【1619】

実施例 221

(S)–2–{[1–(4–クロロフェニル) ピペリジン–4–イル]–N–メチル–アミノメチル}–2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール

白色粉末、収率 47%

MS 406 ($M+1$)⁺

融点 179. 2–182. 1℃。

【1620】

実施例 222

(S)–2–{[1–(4–トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン–4–イル]–N–メチル–アミノメチル}–2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール

融点 127. 2–129. 7℃。

【1621】

実施例 223

(S)–2–{[1–(4–トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン–4–イル]–N–メチル–アミノメチル}–2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール 40

融点 131. 5–133. 6℃。

【1622】

実施例 224

(S)–2–{[1–(4–シアノフェニル) ピペリジン–4–イル]–N–メチル–アミノメチル}–2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール

融点 149–152℃。

【1623】

実施例 225

(S)–2–{[1–(tert–ブトキシカルボニル) ピペリジン–4–イル]–N– 50

メチルーアミノメチル} - 2 - メチルー 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール

淡黄色粉末晶、収率 37%

融点 138.5 - 140.3°C。

【1624】

実施例 226

(S) - 2 - { [1 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] - N - メチルーアミノメチル} - 2 - メチルー 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 225 で製造した (S) - 2 - { [1 - (tert - ブトキシカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] - N - メチルーアミノメチル} - 2 - メチルー 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (400mg、1.01ミリモル) を塩化メチレン 1ml に溶解し、これにトリフルオロ酢酸 1ml を加え 5 時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミン 1ml ずつを加えた。これを室温で 5 分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣を DMF 8ml に溶解した。そこへ 4 - (トリフルオロメチル) ベンジルアルコール (267mg、1.51ミリモル) 及び 1, 1' - カルボニルジイミダゾール (246mg、1.51ミリモル) を DMF 2ml に溶解し 4 時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 200/1) により分離精製した。塩化メチレン - イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末の (S) - 2 - { [1 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] - N - メチルーアミノメチル} - 2 - メチルー 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (341mg、収率 68%) を得た。

融点 110.6 - 113.1°C。

【1625】

対応する出発原料を用い、実施例 226 と同様にして、実施例 227 及び実施例 228 の化合物を製造した。

【1626】

実施例 227

(S) - 2 - { [1 - (4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] - N - メチルーアミノメチル} - 2 - メチルー 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール

融点 84.2 - 86.8°C。

【1627】

実施例 228

(S) - 2 - { [1 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) ピペリジン - 4 - イル] - N - メチルーアミノメチル} - 2 - メチルー 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール

融点 116.2 - 116.6°C。

【1628】

実施例 229

2 - メチルー 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 6 で製造した 2 - クロロ - 1 - (2 - メチルー 2 - オキシラニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール (122mg、0.56ミリモル) 及び 4 - [4 - (トリフルオロメチル) ベンジルオキシ] ピペリジン (188mg、4.86モル) を DMF 10ml に溶解し、70 - 75°C にて 5 時間攪拌した。反応液を室温に戻し水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧

下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し黄色油状物質を得た。

【1629】

この黄色油状物質をDMF 10 ml に溶解し、氷冷下水素化ナトリウム（134 mg、3.36ミリモル）を加え、室温まで昇温させ1時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝10／1）により精製し、酢酸エチル－ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の2－メチル－6－ニトロ－2－[4－（4－トリフルオロメチルベンジルオキシ）ピペリジン－1－イルメチル]－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール（41 mg、収率17%）を得た。

MS 440 (M-1)⁺

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.45-1.70 (2H, m), 1.60 (3H, s), 1.75-1.88 (2H, m), 2.26-2.40 (1H, m), 2.45-2.55 (2H, m), 2.72-2.95 (3H, m), 3.38 (1H, m), 3.89 (1H, d, J=9.6 Hz), 4.31 (1H, d, J=9.6 Hz), 4.54 (2H, s), 7.43 (2H, d, J=8.2 Hz), 7.53 (1H, s), 7.79 (2H, d, J=8.2 Hz)。

【1630】

実施例230

1－（2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル）－2－メチル－3－[4－（4－トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン－1－イル]プロパン－2－オール

の製造
実施例5で製造した2－クロロ－1－[2－ヒドロキシ－2－メチル－3－（4－メチルベンゼンスルホニルオキシ）プロピル]－4－ニトロイミダゾール（0.30 g、0.77ミリモル）及び4－（4－トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン（0.21 g、0.85ミリモル）のDMF（6 ml）溶液にヨウ化ナトリウム（0.13 g、0.77ミリモル）及びトリエチルアミン（0.12 ml、0.77ミリモル）を加え、80℃で7時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝9／1）により精製し、黄色油状物の1－（2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル）－2－メチル－3－[4－（4－トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン－1－イル]プロパン－2－オール（0.23 g、収率63%）を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.14 (3H, s), 1.76-2.04 (4H, m), 2.36 (1H, d, J=14.0 Hz), 2.43-2.72 (3H, m), 2.76-3.00 (2H, m), 3.46-3.52 (1H, br), 3.98 (2H, s), 4.37-4.50 (1H, m), 6.91-7.00 (2H, m), 7.48-7.61 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

【1631】

対応する出発原料を用い、実施例230と同様にして、実施例231の化合物を製造した。

【1632】

実施例231

1－（2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル）－2－メチル－3－[4－（4－トリフルオロメトキシフェノキシ）ピペリジン－1－イル]プロパン－2－オール
収率61%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.14 (3H, s), 1.74-2.04 (4H, m), 2.35 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.40 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.43-2.70 (2H, m), 2.74-3.00 (2H, m), 3.98 (2H, s), 4.25-4.41 (

1 H, m), 6.86–6.92 (2 H, m), 7.11–7.15 (2 H, m), 8.05 (1 H, s)。

【1633】

実施例232

1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール
の製造

実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0.3g、1.38ミリモル)及びピペリジン-4-イル-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミン(0.43g、1.66ミリモル)のDMF(8ml)溶液を80℃で2時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、黄色油状物の1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール(0.37g、収率56%)を得た。

10

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.13 (3 H, s), 1.39–1.63 (2 H, m), 1.96–2.09 (2 H, m), 2.47 (1 H, d, J=13.9 Hz), 2.43–2.63 (3 H, m), 2.67–2.83 (1 H, m), 2.87–3.02 (1 H, m), 3.15–3.39 (1 H, m), 3.41–3.72 (2 H, m), 3.97 (2 H, s), 6.46–6.59 (2 H, m), 6.96–7.09 (2 H, m), 8.05 (1 H, s)。

20

【1634】

実施例233

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例230で製造した1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール(225mg、0.49ミリモル)のDMF(2.5ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(23mg、0.59ミリモル)を加え、0℃で1時間攪拌した。これに氷水及び酢酸エチルを加え、析出物を濾取し、水で洗浄し、塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルから再結晶し、n-ヘキサンで洗浄し、微黄色固体の2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(80mg、収率39%)を得た。

30

融点 113–114℃。

【1635】

対応する出発原料を用い、実施例233と同様にして、実施例234の化合物を製造した。

【1636】

40

実施例234

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 117–119℃。

【1637】

実施例235

2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例233で製造した1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2

50

ーメチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール(369mg、0.77ミリモル)を用い、実施例232と同様にして、黄色粉末の2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(25mg、収率7%)を得た。

MS 441 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.11-1.40 (2H, m), 1.61 (3H, s), 1.85-2.01 (2H, m), 2.37 (1H, dt, $J=2.7\text{Hz}$, 11.4Hz), 2.46-2.59 (2H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 2.87 (1H, d, $J=14.9\text{Hz}$), 2.95-3.03 (1H, m), 3.10-3.25 (1H, m), 3.50 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 3.90 (1H, d, $J=9.7\text{Hz}$), 4.29 (1H, d, $J=9.7\text{Hz}$), 6.46-6.52 (2H, m), 6.98-7.01 (2H, m), 7.50 (1H, s)。

【1638】

実施例236

N-メチル-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(1.08g、7.31ミリモル)、N-メチル-[1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(2.08g、7.31ミリモル)、及び酢酸ナトリウム(660mg、8.04ミリモル)を1-プロパノール15ml中にて終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)で精製して塩化メチレン-イソプロピルエーテルにて結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末のN-メチル-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(348mg、収率12%)を得た。

MS 396 ($M+1$)⁺

融点 198.8-201.1℃。

【1639】

実施例237

N-メチル-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸ベンジルエステルの製造

実施例236で製造したN-メチル-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(207mg、0.52ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、5時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に塩化メチレン5ml、トリエチルアミン1ml及びクロロ炭酸ベンジル(0.15ml、1.05ミリモル)を加え、30分室温で攪拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。酢酸エチル-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末のN-メチル-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸ベンジルエステル(184mg、収率82%)を得た。

MS 430 ($M+H$)⁺

融点 138.7-139.2℃。

【1640】

クロロ炭酸4-クロロベンジルを用い、実施例237と同様にして、実施例238の化合物を製造した。また、4-クロロフェニルアセチルクロリドを用い、実施例237と同様にして、実施例239の化合物を製造した。

【1641】

実施例238

N-メチル-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸4-クロロベンジルエステル

融点 147.2-149.2℃。

【1642】

実施例239

2-{4-[N-(4-クロロフェニルアセチル)-N-メチル]アミノピペリジン-1-イル}メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 206.8-208℃。

【1643】

実施例240

2-メチル-2-{4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)]アミノピペリジン-1-イル}メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例235で製造した2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(60mg、0.14ミリモル)のメタノール(2ml)溶液に37%ホルムアルデヒド溶液(51μl、0.70ミリモル)及びシアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(26mg、0.42ミリモル)を加え、更に室温で30分間攪拌した。反応液を氷冷し、酢酸(23μl、0.42ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌した。更にこの反応液を氷冷し、炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=1/1)により精製し、ジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色固体の2-メチル-2-{4-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)]アミノピペリジン-1-イル}メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(40mg、収率65%)を得た。

融点 135-136℃。

【1644】

実施例241

2-[4-(4-クロロベンジル)オキシピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(1.5g、10.17ミリモル)、4-(4-クロロベンジルオキシ)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン(2.5g、8.45ミリモル)、炭酸水素ナトリウム(0.86g、10.24ミリモル)及びエタノール(15ml)の混合物を15時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、白色粉末の2-[4-(4-クロロベンジル)オキシピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(662mg、収率16%)を得た。

融点 129-130℃。

【1645】

実施例 2 4 2

2-〔4-〔N-(4-クロロフェニル)-N-メチル〕アミノピペリジン-1-イル〕メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾールの製造

実施例 6 で製造した 2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (350 mg、1.61 ミリモル)、4-〔N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ〕ピペリジン (373 mg、1.66 ミリモル) 及び DMF (15 ml) の混合物を 70℃ にて 5 時間攪拌した。この反応液に氷冷下にて水素化ナトリウム 77 mg (1.93 ミリモル) を加え、同温度下にて 1 時間攪拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の 2-〔4-〔N-(4-クロロフェニル)-N-メチル〕アミノピペリジン-1-イル〕メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール (307 mg、収率 47%) を得た。

融点 186-187.8℃。

【1646】

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン、4-(4-クロロベンジル)ピペリジン又は 4-(クロロベンゾイル)ピペリジンを用い、実施例 2 4 2 と同様にして、実施例 2 4 3～実施例 2 4 6 の化合物を製造した。

【1647】

実施例 2 4 3

2-メチル-6-ニトロ-2-〔4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-イル〕メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール

融点 143.5-145℃。

【1648】

実施例 2 4 4

2-メチル-6-ニトロ-2-〔4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン-1-イル〕メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール

融点 125-126℃。

【1649】

実施例 2 4 5

2-〔4-(4-クロロベンジル)ピペリジン-1-イル〕メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール

融点 109-110.5℃

実施例 2 4 6

2-〔4-(4-クロロベンゾイル)ピペリジン-1-イル〕メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール

融点 165-167℃。

【1650】

実施例 2 4 7

2-メチル-6-ニトロ-2-〔4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペリジン-1-イル〕メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾールの製造

実施例 6 で製造した 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (80 mg、0.37 ミリモル)、4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペリジン (95 mg、0.37 ミリモル)、酢酸ナトリウム (150 mg、1.83 ミリモル) 及び DMF (2 ml) の混合物を 80℃ にて終夜攪拌した。反応液を水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラ

ムクロマトグラフィー（酢酸エチル／*n*-ヘキサン＝1／1）により精製し、白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペリジン-1-イル]メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール(46mg、収率29%)を得た。

融点 172-174℃。

【1651】

対応する出発原料を用い、実施例247と同様にして、実施例248の化合物を製造した。

【1652】

実施例248

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジン-1-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール

融点 165-167℃。

【1653】

実施例249

(*S*)-2-[4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾールの製造

実施例12で製造した(*R*)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(396mg、1.82ミリモル)及び4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)ピペリジン(614mg、2.36モル)をDMF 15ml中、70-75℃にて4時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し、黄色油状物を得た。

【1654】

この黄色油状物をDMF 15mlに溶解し、氷冷下に水素化ナトリウム87mg(2.18ミリモル)を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝10／1）により精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の(*S*)-2-[4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール(431mg、収率44%)を得た。

MS 441 (*M*⁺)

融点 132.0-136.0℃。

【1655】

実施例250

(*S*)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]-(4-トリフルオロメトキシフェニル)メタノンの製造

実施例12で製造した(*R*)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(1.0g、4.6ミリモル)及び4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジン(1.3g、4.8ミリモル)から、実施例249と同様の方法により、微黄色粉末の(*S*)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]-(4-トリフルオロメトキシフェニル)メタノン(771mg、収率37%)を得た。

融点 113.0-115.0℃。

【1656】

実施例251

10

20

30

40

50

(S)-1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(3.7g、25.1ミリモル)、(S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル(4.8g、21.1ミリモル)及び炭酸水素ナトリウム(2.2g、25.1ミリモル)をエタノール25ml中にて終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1)により分離精製し、ジエチルエーテルで結晶化することで白色粉末の(S)-1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル(1.4g、収率20%)を得た。

融点 101.0-103.0℃。

【1657】

実施例252

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロ-2H-ピリジン(0.985g、4.05ミリモル)及び実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0.839g、3.86ミリモル)をDMF15mlに加え、60℃で8時間攪拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1)により精製した。得られた油状物を、DMF20mlに溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム(94mg、2.35ミリモル)を加え、室温にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製後、減圧乾燥することにより、微黄色固体の(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(0.192g、収率23%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.68 (3H, s), 2.46-3.39 (8H, m), 3.95 (1H, d, J=10.2Hz), 4.49 (1H, br), 5.98 (1H, s), 7.16 (2H, d, J=8.3Hz), 7.35 (2H, d, J=8.3Hz), 7.53 (1H, s)。

【1658】

実施例253

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(500mg、2.30ミリモル)及び4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン(730mg、3.0ミリモル)をDMF10ml中、70-75℃にて5時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、黄色油状物質の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェ

10

20

30

40

50

ノキシ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール (1.06 g、収率99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.14 (3H, s), 1.80–2.04 (4H, m), 2.38 (1H, d, $J=14.0\text{ Hz}$), 2.48–2.68 (2H, m), 2.52 (1H, d, $J=14.0\text{ Hz}$), 2.77–2.95 (2H, m), 3.73 (1H, s), 4.01 (2H, s), 4.39–4.46 (1H, m), 6.93–6.97 (2H, m), 7.49–7.55 (2H, m), 8.08 (1H, s)。

【1659】

実施例254

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(700mg、3.22ミリモル)及び4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン(1.09g、4.86モル)をDMF 10ml中、70–75℃にて4時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、黄色油状物の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール(1.36g、収率87%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

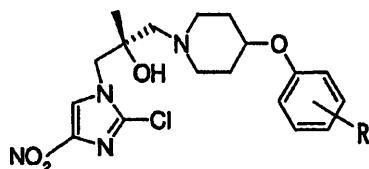
1.12 (3H, s), 1.61–1.78 (2H, m), 1.88–1.96 (2H, m), 2.32 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 2.35–2.56 (2H, m), 2.47 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 2.72–2.81 (1H, m), 2.86–2.95 (1H, m), 3.44–3.51 (1H, m), 3.63 (1H, bs), 3.97 (2H, s), 4.59 (2H, s), 7.43–7.47 (2H, m), 7.58–7.62 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

【1660】

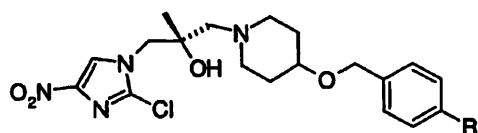
対応する出発原料を用い、実施例254と同様にして、次表に示す実施例255～260の化合物を製造した。

【1661】

【表 1 3】



実施例	R	¹ H NMR (CDCl ₃) δ	収率 (%)
255	4-OCF ₃	1.13(3H, s), 1.77-1.89(2H, m), 1.91-2.01(2H, m), 2.37(1H, d, J=13.9Hz), 2.45-2.67(2H, m), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.75-2.95(2H, m), 3.71(1H, s), 4.00(2H, s), 4.17-4.34(1H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.11-7.15(2H, m), 8.07(1H, s).	99
256	4-Cl	1.13(3H, s), 1.73-1.88(2H, m), 1.91-2.02(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.44-2.63(2H, m), 2.50(1H, d, J=13.9Hz), 2.76-2.95(2H, m), 3.64(1H, s), 3.99(2H, s), 4.26-4.35(1H, m), 6.79-6.86(2H, m), 7.18-7.26(2H, m), 8.06(1H, s).	99
257	4-CN	1.14(3H, s), 1.81-1.92(2H, m), 1.95-2.03(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.47-2.68(2H, m), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.77-2.94(2H, m), 3.53(1H, s), 4.00(2H, s), 4.40-4.47(1H, m), 6.90-6.96(2H, m), 7.53-7.60(2H, m), 8.06(1H, s).	99
258	3-CF ₃	1.14(3H, s), 1.81-1.91(2H, m), 1.94-2.02(2H, m), 2.37(1H, d, J=13.9Hz), 2.47-2.68(2H, m), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.77-2.97(2H, m), 3.61(1H, s), 3.99(2H, s), 4.38-4.44(1H, m), 7.04-7.12(2H, m), 7.18-7.22(1H, m), 7.35-7.42(1H, m), 8.07(1H, s).	99



実施例	R	¹ H NMR (CDCl ₃) δ
259	OCF ₃	1.12(3H, s), 1.66-1.76(2H, m), 1.86-1.95(2H, m), 2.32(1H, d, J=13.9Hz), 2.36-2.55(2H, m), 2.46(1H, d, J=13.9Hz), 2.72-2.82(1H, m), 2.85-2.96(1H, m), 3.42-3.49(1H, m), 3.69(1H, s), 4.00(2H, s), 4.52(2H, s), 7.17-7.21(2H, m), 7.35-7.39(2H, m), 8.06(1H, s).
260	Cl	1.10(3H, s), 1.65-1.74(2H, m), 1.85-1.92(2H, m), 2.31(1H, d, J=13.9Hz), 2.38-2.54(2H, m), 2.46(1H, d, J=13.9Hz), 2.71-2.79(1H, m), 2.84-2.95(1H, m), 3.38-3.48(1H, m), 3.72(1H, s), 3.96(2H, s), 4.48(2H, s), 7.23-7.32(2H, m), 8.05(1H, s).

【1662】

実施例 261

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール

の製造
 実施例 12 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (0.198 g、0.910 ミリモル) 及び 4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ)ピペリジン (0.198 g、0.910 ミリモル) を用い、実施例 254 と同様の方法により、茶色油状物の (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール (0.192 g、収率 49%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 12 (3H, s), 1. 55–1. 98 (4H, m), 2. 28–2. 94 (6H, m), 3. 41–3. 49 (1H, m), 3. 62 (1H, br), 3. 95 (2H, s), 4. 16 (1H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 4. 17 (1H, d, $J=6.0\text{ Hz}$), 6. 28 (1H, ddd, $J=6.0\text{ Hz}$, 6.0 Hz , 15.9 Hz), 6. 60 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7. 21–7. 42 (5H, m), 8. 05 (1H, s)。

【1663】

実施例262

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-イル}-2-メチルプロパン-2-オール

10

製造 実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0. 217g、1. 00ミリモル)及び4-[3-(4-クロロフェニル)アリルオキシ]ピペリジン(0. 250g、0. 995ミリモル)を用い、実施例254と同様の方法により、茶色液体の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-イル}-2-メチルプロパン-2-オール(0. 263g、収率56%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

20

1. 12 (3H, s), 1. 55–2. 01 (4H, m), 2. 28–2. 99 (6H, m), 3. 40–3. 51 (1H, m), 3. 60 (1H, br), 3. 96 (2H, s), 4. 13–4. 16 (2H, m), 6. 20–6. 31 (1H, m), 6. 56 (1H, d, $J=15.7\text{ Hz}$), 7. 19–7. 34 (4H, m), 8. 05 (1H, s)。

【1664】

実施例263

(S)-2-{4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾールの製造

30

製造 実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0. 103g、0. 473ミリモル)及び4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジン(0. 109g、0. 430ミリモル)をDMF 2mlに溶解し、60℃にて4時間攪拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=2/3)により精製した。得られた油状物を、DMF 2mlに溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム(15mg、0. 375ミリモル)を加え、室温にて3時間攪拌した。反応液に水を加え、析出物を濾取した。析出物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=6/1)により精製後、酢酸エチル/n-ヘキサン=1/3(6ml)から再結晶し、白色粉末結晶の(S)-2-{4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール(36mg、収率19%)を得た。

40

融点 88. 8–91. 9℃。

【1665】

実施例264

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-イル}-2-メチルプロパン-2-オール

50

実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール (0.076 g、0.350 ミリモル) 及び 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) エトキシ] ピペリジン (0.080 g、0.334 ミリモル) を用い、実施例 254 と同様の方法により、微黄色油状物の (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 3 - {4 - [2 - (4 - クロロフェニル) エトキシ] ピペリジン - 1 - イル} - 2 - メチル - プロパン - 2 - オール (0.109 g、収率 71%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.10 (3H, s), 1.51 - 1.72 (2H, m), 1.78 - 1.92 (2H, m), 2.24 - 2.50 (4H, m), 2.55 - 2.88 (4H, m), 3.29 - 3.39 (1H, m), 3.58 - 3.66 (3H, m), 3.94 (2H, s), 7.15 (2H, d, $J = 8.5 \text{ Hz}$), 7.24 (2H, d, $J = 8.5 \text{ Hz}$), 8.04 (1H, s)。

【1666】

実施例 265

(S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジン - 1 - イル} プロパン - 2 - オールの製造

トリフェニル - (4 - トリフルオロメチルベンジル) ホスホニウムブロミド (3.00 g、5.98 ミリモル) を DMSO 50 ml に溶解し、氷冷下に水素化ナトリウム (0.239 g、5.98 ミリモル) を加え、室温で 1 時間攪拌した。そこへ 4 - ホルミルオキシピペリジン - 1 - カルボン酸ベンジルエステル (1.497 g、5.69 ミリモル) の DMSO 溶液 10 ml を滴下し、60℃にて 7 時間攪拌した。酢酸エチルで 2 回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n -ヘキサン/酢酸エチル = 4/1) により精製した。更にシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 9/1) により精製し、無色油状物の 4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ビニルオキシ] ピペリジン - 1 - カルボン酸ベンジルエステルを得た。

【1667】

得られた 4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ビニルオキシ] ピペリジン - 1 - カルボン酸ベンジルエステルをエタノール 10 ml に溶解し、10% Pd/C 90 mg を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮することにより、茶色液体の 4 - [2 - (トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジンを得た。

【1668】

得られた 4 - [2 - (トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジン及び実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール 0.184 g (0.844 ミリモル) を用い、実施例 254 と同様に、茶色油状物の (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - {4 - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジン - 1 - イル} プロパン - 2 - オール (0.088 g、収率 3%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.10 (3H, s), 1.49 - 1.92 (4H, m), 2.24 - 2.81 (6H, m), 2.92 (2H, t, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 3.30 - 3.35 (1H, m), 3.65 (2H, t, $J = 6.8 \text{ Hz}$), 3.94 (2H, s), 7.34 (2H, d, $J = 8.2 \text{ Hz}$), 7.54 (2H, d, $J = 8.2 \text{ Hz}$), 8.04 (1H, s)。

【1669】

実施例 266

(S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - [

4-（4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ）ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール

実施例12で製造した（R）-2-クロロ-1-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）-4-ニトロイミダゾール及びN-ピペリジン-4-イル-4-トリフルオロメトキシフェニルアニリンを用い、実施例254と同様にして、黄色油状物の（S）-1-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-メチル-3-[4-（4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ）ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール（1.36g、収率88%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

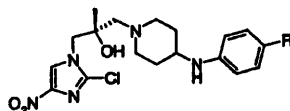
1.13 (3H, s), 1.41-1.57 (2H, m), 2.03-2.08 (2H, m), 2.34 (1H, d, $J=13.9\text{Hz}$), 2.49-2.59 (3H, m), 2.65-2.77 (2H, m), 3.08-3.16 (2H, m), 3.24-3.41 (1H, m), 3.97 (2H, s), 6.47-6.55 (2H, m), 6.98-7.04 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

【1670】

対応する出発原料を用い、実施例266と同様にして、次表に示す実施例267～269の化合物を製造した。

【1671】

【表14】



実施例	R	収率 (%)	$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ
267	Cl	99	1.13(3H, s), 1.40-1.53(2H, m), 2.00-2.06(2H, m), 2.35(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$), 2.45-2.59(3H, m), 2.71-3.01(2H, m), 3.18(1H, br), 3.48-3.58(2H, m), 3.97(2H, s), 6.47-6.54(2H, m), 7.07-7.14(2H, m), 8.05(1H, s).
268	CF_3	99	1.14(3H, s), 1.42-1.59(2H, m), 2.03-2.08(2H, m), 2.35(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$), 2.49-2.60(2H, m), 2.50(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$), 2.74-2.98(2H, m), 3.31-3.39(1H, m), 3.51(1H, s), 3.87(1H, d, $J=9.3\text{Hz}$), 3.97(2H, s), 6.58(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.39(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 8.05(1H, s).
269	CN	99	1.13(3H, s), 1.40-1.53(2H, m), 2.00-2.06(2H, m), 2.35(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$), 2.45-2.59(2H, m), 2.49(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$), 2.71-3.01(2H, m), 3.18(1H, br), 3.48-3.58(2H, m), 3.97(2H, s), 6.51-6.57(2H, m), 7.38-7.44(2H, m), 8.05(1H, s).

【1672】

実施例270

（S）-1-（4-ピペリジノピペリジン-1-イル）-3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-メチル-プロパン-2-オール

実施例12で製造した（R）-2-クロロ-1-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）-4-ニトロイミダゾール（0.500g、2.29ミリモル）と4-ピペリジノピペリジン（0.425g、2.53ミリモル）をDMF 5mlに溶解し、70℃にて5時間攪拌した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルを用いてシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン／酢酸エチル=3／2）により精製し、茶色油状物の（S）-1-（4-ピペリジノピペリジン-1-イル）-3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-メチル-プロパン-2-オール（0.656g、収率74%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

10

20

30

40

50

1. 11 (3H, s), 1. 38-1. 89 (10H, m), 2. 18-2. 55 (9H, m), 2. 70-2. 81 (1H, m), 2. 89-3. 01 (1H, m), 3. 67 (1H, br), 3. 94 (1H, s), 8. 05 (1H, s)。

【1673】

実施例271

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)スルファニル]ピペリジン-1-イル}プロパン-2-オール

の製造
実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール及び4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェニルスルファニル]ピペリジンを用い、実施例270と同様にして、黄色油状物の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)スルファニル]ピペリジン-1-イル}プロパン-2-オール(3.4g、収率99%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 11 (3H, s), 1. 58-1. 73 (2H, m), 1. 91-1. 99 (2H, m), 2. 32 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 41-2. 50 (2H, m), 2. 46 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 75-3. 09 (4H, m), 3. 97 (2H, s), 7. 11-7. 17 (2H, m), 7. 36-7. 53 (2H, m), 8. 04 (1H, s)。

【1674】

実施例272

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オールの製造

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン及び実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾールを用い、実施例270と同様にして、黄色油状物の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール粗製を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

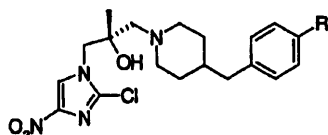
1. 10 (3H, m), 1. 22-1. 71 (5H, m), 2. 26-2. 55 (6H, m), 2. 66-2. 96 (3H, m), 3. 94 (2H, s), 7. 09-7. 18 (4H, m), 8. 06 (1H, s)。

【1675】

対応する出発原料を用い、実施例272と同様にして、次表に示す実施例273及び実施例274の化合物を製造した。

【1676】

【表 15】



実施例	R	収率 (%)	¹ H NMR (CDCl ₃) δ
273	4-CF ₃	56	1.10(3H, s), 1.14-1.38(2H, m), 1.47-1.64(3H, m), 2.29(1H, d, J=13.9Hz), 2.30-2.40(2H, m), 2.43(1H, d, J=13.9Hz), 2.60(2H, d, J=6.5Hz), 2.69(1H, d, J=11.7Hz), 2.90(1H, d, J=11.7Hz), 3.74(1H, br), 3.94(2H, s), 7.22-7.26(2H, m), 7.52-7.54(2H, m), 8.05(1H, s).
274	4-Cl	65	1.10(3H, s), 1.14-1.63(5H, m), 2.26-2.52(7H, m), 2.68(1H, d, J=11.5Hz), 2.90(1H, d, J=11.5Hz), 3.94(2H, s), 7.00-7.08(2H, m), 7.20-7.29(2H, m), 8.05(1H, s).

【1677】

実施例 275

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロパン-2-オール

4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン塩酸塩 (0.495 g、2.53ミリモル) を塩化メチレン及び水酸化ナトリウム水溶液で抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、濃縮液に、実施例 12 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (0.5 g、2.29ミリモル) 及び DMF 5 ml を加え、70℃にて5時間撹拌した。反応液を酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1) により精製し、黄色油状物の (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロパン-2-オール (0.492 g、収率57%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.17 (3H, s), 2.47 (1H, d, J=13.91 Hz), 2.58-2.64 (3H, m), 2.78-3.00 (2H, m), 3.27-3.40 (2H, m), 3.62 (1H, br), 4.01 (2H, s), 6.02-6.05 (1H, m), 7.23-7.41 (5H, m), 8.07 (1H, s)。

【1678】

実施例 276

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)プロパン-2-オール

4-フェニルピペリジン塩酸塩 (0.522 g、2.64ミリモル) を塩化メチレン及び水酸化ナトリウム水溶液で抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、濃縮液に、実施例 12 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (0.5 g、2.29ミリモル) 及び DMF 5 ml を加え、70℃で5時間撹拌した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1) により精製し、黄色油状物の (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)プロパン-2-オール (0.703 g、収率81%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 14 (3H, s), 1. 76–1. 89 (4H, m), 2. 36 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 48–2. 61 (4H, m), 2. 75–2. 89 (1H, m), 2. 98–3. 09 (1H, m), 3. 75 (1H, br), 3. 98 (2H, s), 7. 18–7. 35 (5H, m), 8. 08 (1H, s)。

【1679】

実施例277

(S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチル–3–[4–(4–トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン–1–イル]プロパン–2–オールの製造

実施例12で製造した(R)–2–クロロ–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル)–4–ニトロイミダゾール(0. 329g、1. 51ミリモル)と4–(4–トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン(0. 400g、1. 66ミリモル)をDMF 5mlに溶解し、70℃にて3時間撹拌した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n–ヘキサン/酢酸エチル=2/1)により精製し、茶色油状物の(S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチル–3–[4–(4–トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン–1–イル]プロパン–2–オール(0. 361g、収率54%)を得た。

¹H–NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 13 (3H, s) 1. 71–1. 93 (4H, m), 2. 36 (1H, d, J=14. 0Hz), 2. 48–2. 65 (4H, m), 2. 77–2. 90 (1H, m), 3. 01–3. 14 (1H, m), 3. 64 (1H, br), 3. 99 (2H, s), 7. 32 (2H, d, J=8. 1Hz), 7. 57 (2H, d, J=8. 1Hz), 8. 07 (1H, s)。

【1680】

実施例278

(S)–{1–[3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピル]ピペリジン–4–イル}カルバミン酸tert–ブチルエステルの製造

実施例12で製造した(R)–2–クロロ–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル)–4–ニトロイミダゾール及びピペリジン–4–イル–カルバミン酸tert–ブチルエステルを用い、実施例277と同様にして、黄色油状物の(S)–{1–[3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピル]ピペリジン–4–イル}カルバミン酸tert–ブチルエステル(収率92%)を得た。

¹H–NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 11 (3H, s), 1. 32–1. 51 (2H, m), 1. 44 (9H, m), 1. 90–1. 96 (2H, m), 2. 32 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 39–2. 55 (2H, m), 2. 46 (1H, d, J=13. 9Hz), 2. 67–2. 96 (3H, m), 3. 44 (1H, br), 3. 59 (1H, s), 3. 96 (2H, s), 8. 05 (1H, s)。

【1681】

実施例279

(S)–{1–[3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチル–プロピル]ピペリジン–4–イル}–N–[2–(4–トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸tert–ブチルエステルの製造

実施例12で製造した(R)–2–クロロ–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル)–4–ニトロイミダゾール(0. 332g、0. 891ミリモル)及びピペリジン–4–イル–N–[2–(4–トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸tert–ブチルエステル(0. 194g、0. 891ミリモル)を用い、実施例277と同様

10

20

30

40

50

の方法により、微黄色油状物の (S) - {1 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチル - プロピル] ピペリジン - 4 - イル} - N - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 *tert* - ブチル エステル (0.370 g、収率 70%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.12 (3H, s), 1.49 (9H, s), 1.55 - 1.80 (4H, m), 2.17 - 2.57 (4H, m), 2.70 - 2.98 (4H, m), 3.21 - 3.30 (2H, m), 3.50 (1H, s), 3.95 (2H, s), 7.31 (2H, d, $J = 8.2 \text{ Hz}$), 7.57 (2H, d, $J = 8.2 \text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

【1682】

実施例 280

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 253 で製造した (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] プロパン - 2 - オール (1.06 g、2.3 ミリモル) を DMF 15 ml に溶解した。この溶液に氷冷下水素化ナトリウム (110 mg、2.76 ミリモル) を加え、室温にて終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 5/1) により精製し、塩化メチレン - ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (431 mg、収率 44%) を得た。

MS 427 ($M+1$)⁺

光学純度 97.8% ee

$[\alpha]_D^{27} = -2.07^\circ$ (濃度: 1.064, CHCl_3)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.61 (3H, s), 1.67 - 1.92 (4H, m), 2.41 - 2.51 (1H, m), 2.57 (1H, d, $J = 14.9 \text{ Hz}$), 2.58 - 2.67 (1H, m), 2.88 (1H, d, $J = 14.9 \text{ Hz}$), 2.74 - 2.98 (2H, m), 3.91 (1H, d, $J = 9.7 \text{ Hz}$), 4.31 (1H, d, $J = 9.7 \text{ Hz}$), 4.28 - 4.36 (1H, m), 6.91 (2H, d, $J = 8.7 \text{ Hz}$), 7.51 (2H, d, $J = 8.7 \text{ Hz}$), 7.54 (1H, s)。

【1683】

実施例 281

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 254 で製造した (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン - 1 - イル] プロパン - 2 - オール (1.36 g、2.8 ミリモル) を DMF 15 ml に溶解した。この溶液に氷冷下、水素化ナトリウム (134 mg、3.36 ミリモル) を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 10/1) により精製し、塩化メチレン - ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (431 mg、

10

20

30

40

50

収率 44%) を得た。

MS 440 ($M-1$)⁺

融点 91-92 °C

光学純度 99.6% ee

$[\alpha]_D^{27} = -8.63^\circ$ (濃度: 1.066, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.44-1.66 (2H, m), 1.60 (3H, s), 1.71-1.85 (2H, m), 2.28-2.38 (1H, m), 2.44-2.56 (1H, m), 2.52 (1H, d, $J=14.9$ Hz), 2.72-2.81 (1H, m), 2.84 (1H, d, $J=14.9$ Hz), 2.87-2.94 (1H, m), 3.33-3.41 (1H, m), 3.88 (1H, d, $J=9.6$ Hz), 4.31 (1H, d, $J=9.6$ Hz), 4.54 (2H, s), 7.41-7.44 (2H, m), 7.52 (1H, s), 7.56-7.60 (2H, m)。

10

【1684】

実施例 282

(S)-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 266 で製造した (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オールを用い、実施例 281 と同様にして、白色粉末の (S)-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (収率 73%) を得た。

20

融点 107.5-109.0 °C

MS 441 (M^+)

光学純度 99.8% ee

$[\alpha]_D^{27} = 19.19^\circ$ (濃度: 1.006, CHCl₃)。

【1685】

実施例 283

(S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 278 で製造した (S)-{1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペリジン-4-イル}カルバミン酸 tert-ブチルエステルを用い、実施例 281 と同様の方法により、白色粉末の (S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸 tert-ブチルエステル (収率 49%) を得た。

30

MS 381 (M^+)

融点 158.5-160.7 °C。

40

【1686】

実施例 284

(S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 279 で製造した (S)-{1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペリジン-4-イル}-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸 tert-ブチルエステル (0.37 g、0.627 ミリモル) を用い、実施例 281 と同様の方法により、微

50

黄色粉末結晶の (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - N - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 *tert* - ブチルエステル (0.211 g、収率 63%) を得た。

融点 206.8 - 208.6 °C。

【1687】

実施例 285

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン - 1 - イルメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 271 で製造した (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - { [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン - 1 - イル} プロパン - 2 - オールを用い、実施例 281 と同様にして、白色粉末の (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン - 1 - イルメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (収率 62%) を得た。

MS 458 (M⁺)

融点 133.0 - 137.4 °C。

【1688】

実施例 286

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン - 1 - イル] メチル - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 272 で製造した (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン - 1 - イル] プロパン - 2 - オールを用い、実施例 281 と同様にして、白色粉末の (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン - 1 - イル] メチル - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (収率 55%) を得た。

融点 111.0 - 112.5 °C

MS: 440 (M⁺)

光学純度 99.0% ee

[α]_D²⁷ = 5.38° (濃度: 1.004, CHCl₃)。

【1689】

実施例 287

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (4 - フェニル - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 275 で製造した (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - (4 - フェニル - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - イル) プロパン - 2 - オール (0.492 g、1.31 ミリモル) を DMF 8 ml に溶解し、4 °C まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム (63 mg、1.57 ミリモル) を加え、室温にて 3 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン / アセトン = 4 / 1) により精製後、塩化メチレン及び酢酸エチルから再結晶し、微黄色固体の (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (4 - フェニル - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (0.059 g、収率 13%) を得た。

融点 200.1 - 201 °C。

【1690】

実施例288

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-フェニルピペリジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例276で製造した(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)プロパン-2-オール(0.703g、1.86ミリモル)をDMF 12mlに溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム(89mg、2.23ミリモル)を加え、室温にて3時間攪拌した。反応液に水を加え、析出物を濾取した。析出物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/アセトン=3/1)により精製後、酢酸エチルから再結晶し、白色粉末結晶の(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-フェニルピペリジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(0.230g、収率36%)を得た。

融点 158.8-163.9℃。

【1691】

対応する出発原料を用い、実施例288と同様にして、実施例289～実施例294の化合物を製造した。

【1692】

実施例289

(S)-1'-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-[1,4']ビピペリジニル

融点 163.4-164.9℃。

【1693】

実施例290

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 138.7-139.9℃。

【1694】

実施例291

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 91.3-92.7℃。

【1695】

実施例292

(S)-2-{4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 140.6-142.8℃。

【1696】

実施例293

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 84.6-86.8℃。

【1697】

実施例294

(S)-2-{4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 92.5-94℃。

【1698】

10

20

30

40

50

実施例 295

(S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - N - メチル - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) アミンの製造

実施例 282 で製造した (S) - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) アミノピペリジン - 1 - イル] メチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (400 mg、0.90 ミリモル) をメタノール 10 ml に溶解し、37% ホルムアルデヒド溶液 (0.13 ml、4.52 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (170 mg、2.71 ミリモル) 及び酢酸 (0.17 ml、2.71 ミリモル) を加え、30 分室温で攪拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 100/1) により精製し、塩化メチレン - ジイソプロピルエーテルから再結晶して、淡黄色針状結晶の (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - N - メチル - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) アミン (309 mg、収率 78%) を得た。

光学純度 99.9% ee

$[\alpha]_D^{17} = 7.77^\circ$ (濃度: 1.042, CHCl₃)

MS 455 (M⁺)

融点 133.2 - 134.4 °C。

【1699】

実施例 296

(S) - N - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - N - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) アセトアミドの製造

実施例 282 で製造した (S) - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) アミノピペリジン - 1 - イル] メチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (153 mg、0.35 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリエチルアミン 76 μl 及びアセチルクロリド 30 μl を加え、1.5 時間室温で攪拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 100/1) により精製し、塩化メチレン - ジイソプロピルエーテルで結晶化して、白色粉末の (S) - N - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - N - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) アセトアミド (82 mg、収率 49%) を得た。

MS 484 (M + 1)⁺

融点 137.0 - 138.7 °C。

【1700】

実施例 297

(S) - 2 - {4 - N - [(4 - トリフルオロメチルフェニル) アセチル] アミノピペリジン - 1 - イル} メチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 283 で製造した (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 tert - ブチルエステル (0.1 g、0.262 ミリモル) をエタノール 4 ml に溶解し、6 規定の塩酸 3 ml を加え、室温で 5 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、濃縮液に塩化メチレン 4 ml 及びトリエチルアミン 4 ml を加え、室温で 5 分攪拌後、濃縮した。トルエン 10 ml を加え、濃縮することにより、水を共沸した。濃縮液に 4 - トリ

10

20

30

40

50

フルオロメチルフェニル酢酸 (0.064 g、0.315 ミリモル)、塩化メチレン 4 ml、トリエチルアミン (0.06 ml、0.393 ミリモル) 及び 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 (WSCD) (0.065 g、0.341 ミリモル) を加えて室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで 2 回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=3/2 により精製した。酢酸エチル 3 ml から再結晶し、白色粉末結晶の (S)-2-{4-N-[(4-トリフルオロメチルフェニル) アセチル] アミノピペリジン-1-イル} メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (32 mg、収率 26%) を得た。

10

融点 152.7-154.3 °C。

【1701】

実施例 298

(S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

実施例 283 で製造した (S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (0.300 g、0.787 ミリモル) を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 2 ml を加え、2 時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 4 ml ずつ加えた。この混合物を室温で 5 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣を DMF 6 ml に溶解した。この溶液に、4-(トリフルオロメチル) ベンジルアルコール (0.166 g、0.944 ミリモル) を DMF 4 ml に溶解し、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (0.153 g、0.944 ミリモル) を加えて 4 時間室温で攪拌した混合物を加えた。この混合物を室温で終夜攪拌後、65 °C にて 8 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) により精製した。酢酸エチルより再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の (S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステル (0.107 g、収率 28%) を得た。

20

30

融点 141.2-144 °C。

【1702】

対応する出発原料を用い、実施例 298 と同様にして、実施例 299 及び実施例 300 の化合物を製造した。

【1703】

実施例 299

(S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イルエステル

40

融点 134.4-136.9 °C。

【1704】

実施例 300

(S)-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

融点 156.2-158.5 °C。

【1705】

実施例 301

50

(S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - (4 - トリフルオロメチルベンジル) アミンの製造

実施例 283 で製造した (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 tert - ブチルエステル (0.300 g、0.787 ミリモル) を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 2 ml を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 4 ml ずつを加えた。この混合物を室温で 20 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をメタノール 4 ml に溶解し、そこへ 4 - トリフルオロメチルベンズアルデヒド (0.164 g、0.945 ミリモル)、シアノトリ
10
ヒドロホウ酸ナトリウム (0.099 g、1.57 ミリモル) 及び酢酸 (0.09 ml、1.57 ミリモル) を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 20/1) により精製した。イソプロピルアルコールから再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - (4 - トリフルオロメチルベンジル) アミン (0.078 g、収率 22%) を得た。

融点 148.6 - 152.9 °C。

20

【1706】

実施例 302

(S) - 1 - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - 3 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ウレアの製造

実施例 283 で製造した (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 tert - ブチルエステル (0.300 g、0.787 ミリモル) を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 2 ml を加え、2 時間室温で攪拌した。減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 4 ml ずつ加え、室温で 5 分攪拌した後、減圧下
30
濃縮した。これを「残渣 1」とする。

【1707】

一方、4 - (トリフルオロメチル) アニリン (0.139 g、0.865 ミリモル) を THF 4 ml に溶解し、ピリジン (0.07 ml、0.865 ミリモル) を加え、氷冷下、クロロギ酸フェニル (0.108 ml、0.865 ミリモル) を加え、室温で 1 時間反応した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水、10% 塩酸及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。

【1708】

得られた残渣をジメチルスルホキシド 6 ml に溶解した。これを先ほどの「残渣 1」に加え、室温で終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出後、有機相を
40
合わせ、水、飽和重曹水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン/アセトン = 2/1) により精製した。イソプロピルアルコール/n - ヘキサン (1/1) 6 ml から再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の (S) - 1 - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - 3 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ウレア (0.064 g、収率 17%) を得た。

融点 136.8 - 139.9 °C。

【1709】

実施例 303

50

(S) - 2 - [4 - N - (4 - トリフルオロメチルベンゾイル) アミノピペリジン - 1 - イル] メチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 283 で製造した (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 tert - ブチルエステル (360 mg、0.92 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 5 ml を加え、5 時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン 10 ml 及びトリエチルアミン 2 ml を加え、続いて 4 - トリフルオロメチルベンゾイルクロリド (0.3 ml、1.85 ミリモル) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 20/1) により分離精製した。酢酸エチル - ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の (S) - 2 - [4 - N - (4 - トリフルオロメチルベンゾイル) アミノピペリジン - 1 - イル] メチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (232 mg、収率 55%) を得た。

MS 454 (M+H)⁺

融点 170.5 - 171.7 °C。

【1710】

実施例 304

(S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エチル] アミンの製造

実施例 284 で製造した (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - N - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert - ブチルエステル (0.196 g、0.354 ミリモル) を塩化メチレン 2 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 1 ml を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え、塩化メチレンで 2 回抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 10/1) で精製し、イソプロピルエーテルを加え固化させ、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - [2 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) エチル] アミン (0.020 g、収率 12%) を得た。

融点 80.7 - 84.2 °C。

【1711】

実施例 305

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (トリフルオロメトキシ) ベンゼンスルフィニル] ピペリジン - 1 - イルメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 285 で製造した (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン - 1 - イルメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (300 mg、0.65 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解した。この溶液に m - クロロ過安息香酸 (169 mg、0.69 ミリモル) を加え、室温で 30 分攪拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し、チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 50/1) により精製し、酢酸エチル - イソプロピルエーテルから結晶化させた。結晶を濾取し、乾燥することにより、白色粉末の (S) -

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼンスルフィニル]ピペリジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(219mg、収率71%)を得た。

MS 475 (M+H)⁺

融点 107-109℃。

【1712】

実施例306

2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(3.19g、21.6ミリモル)と4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(5.53g、21.6ミリモル)及び酢酸ナトリウム(1.95g、23.8ミリモル)を1-プロパノール50mlに溶解させ、48時間加熱還流した。反応液を塩化メチレンで希釈後、水及び飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製後、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルを加え結晶化した。濾取後減圧乾燥することにより白色粉末結晶の2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(1.85g、収率23%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.43 (9H, s), 1.62 (3H, s), 2.45-2.68 (5H, m), 2.87 (1H, d, J=14.9Hz), 3.30 (4H, br), 3.93 (1H, d, J=9.7Hz), 4.30 (1H, d, J=9.7Hz), 7.54 (1H, s)。

【1713】

対応する出発原料を用い、実施例306と同様にして、実施例307の化合物を製造した。

【1714】

実施例307

2-[4-(4-シアノフェニル)ピペラジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率18%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.67 (3H, s), 2.60-2.80 (3H, m), 2.80-3.00 (3H, m), 3.22 (4H, br), 3.97 (1H, d, J=9.8Hz), 4.35-4.50 (1H, m), 6.78-6.85 (2H, m), 7.46-7.51 (2H, m), 7.55 (1H, s)。

【1715】

実施例308

2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(1.59g、10.8ミリモル)及び1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン(3.23g、10.8ミリモル)の1-プロパノール(20ml)溶液に炭酸水素ナトリウム(1.95g、23.8ミリモル)を加え終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)で分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルにて結晶化させて、淡黄色粉末の2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

ル (1.34 g、収率 29%) を得た。

MS 411 (M^+)

融点 159–160 °C。

【1716】

また上記シリカゲルカラムクロマトグラフィーによる分離精製により、中間体である 2-クロロ-1-〔3-〔4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル〕-2-ヒドロキシ-2-メチル〕プロピル-4-ニトロイミダゾールを黄色油状物として得た (697 mg、収率 15%)。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.17 (3H, s), 2.32–2.91 (6H, s), 3.26–3.31 (4H, m), 4.03 (2H, s), 6.71 (1H, s), 6.89–6.93 (2H, m), 7.45–7.51 (2H, m), 8.06 (1H, s)。

10

【1717】

対応する出発原料を用い、実施例 308 と同様にして、実施例 309～実施例 311 の化合物を製造した。

【1718】

実施例 309

2-〔4-(4-ビフェニル)ピペラジン-1-イル〕メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール

収率 32%、融点 223–227.8 °C。

20

【1719】

実施例 310

2-〔4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-イル〕メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール

収率 14%、融点 196.6–197.3 °C。

【1720】

実施例 311

2-〔4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル〕メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール

収率 18%

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.61 (3H, s), 2.61 (1H, d, $J=14.8$ Hz), 2.65–2.73 (2H, m), 2.82–2.95 (2H, m), 2.93 (1H, d, $J=14.8$ Hz), 2.99–3.09 (4H, m), 3.94 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 4.34 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 6.78–6.86 (2H, m), 7.06–7.11 (2H, m), 7.53 (1H, s)。

【1721】

実施例 312

1-〔3-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチル〕プロピル-2-クロロ-4-ニトロイミダゾールの製造

40

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (863 mg、5.85 ミリモル) 及び 4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.5 g、5.85 ミリモル) を 1-プロパノール (10 ml) に溶解し、6 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、白色粉末結晶の 1-〔3-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチル〕プロピル-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール (705 mg、収率 29.8%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.15 (3H, s), 1.45 (9H, s), 2.35 (1H, d, $J=13.9$ Hz)

50

), 2.45-2.65 (5H, m), 3.25 (1H, s), 3.42 (4H, t, J = 4.3 Hz), 4.00 (2H, s), 8.05 (1H, s)。

【1722】

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール及び4-(2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル、4-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル又は4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステルを用い、実施例312と同様にして、実施例313～実施例315の化合物を製造した。

【1723】

実施例313

4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

微黄色粉末結晶、収率43%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.46 (9H, s), 2.16-2.50 (4H, m), 2.55-2.70 (2H, m), 3.40-3.51 (4H, m), 3.64 (1H, s), 3.91-4.09 (2H, m), 4.17 (1H, dd, J = 2.0 Hz, 13.5 Hz), 8.00 (1H, s)。

【1724】

実施例314

4-[4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-ヒドロキシ-3-メチルブチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

白色粉末、収率17%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.23 (3H, s), 1.40-1.74 (11H, m), 2.23-2.58 (5H, m), 2.81-2.95 (1H, m), 3.26-3.51 (4H, m), 3.91 (1H, d, J = 14.0 Hz), 3.99 (1H, d, J = 14.0 Hz), 6.94 (1H, s), 8.07 (1H, s)。

【1725】

実施例315

4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル

微黄色油状物、収率81%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.14 (3H, s), 2.35-2.76 (6H, m), 3.43-3.61 (4H, m), 4.01 (2H, s), 5.13 (2H, s), 7.28-7.43 (5H, m), 8.04 (1H, s)。

【1726】

実施例316

4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸イソブチルエステルの製造

実施例312で製造した1-[3-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチル]プロピル-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール (150mg, 0.37ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (5ml) の混合物を5時間室温で攪拌した。反応液を減圧濃縮した。残渣を塩化メチレン (5ml) に溶解し、トリエチルアミン (0.23ml, 1.63ミリモル) 及びクロロギ酸イソブチル (112mg, 0.82ミリモル) をこの順に加え、30分室温で攪拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮して、4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸イソブチルエステルを得た。これ

10

20

30

40

50

を精製せずにそのまま次の工程へと進めた。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.93 (6H, d, $J=6.7\text{ Hz}$), 1.14 (3H, s), 1.82–2.00 (1H, m), 2.39 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 2.47–2.73 (5H, m), 3.11 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 3.17 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 3.41–3.55 (4H, m), 3.87 (2H, s), 4.04 (1H, s), 8.10 (1H, s)。

【1727】

実施例317

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

10

実施例315で製造した4- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル (55.22 g、126.11ミリモル) 及び1, 4-ジオキサン (550 ml) の混合物に水素化ナトリウム (6.05 g、151.25ミリモル) を加え、14時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより2回抽出し、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、白色粉末結晶の4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル (26.54 g、収率52%) を得た。

20

融点130.5–132.1℃

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.61 (3H, s), 2.38–2.69 (5H, m), 2.86 (1H, d, $J=14.8\text{ Hz}$), 3.10–3.50 (4H, m), 3.92 (1H, d, $J=9.9\text{ Hz}$), 4.33 (1H, d, $J=9.9\text{ Hz}$), 5.11 (2H, s), 7.23–7.38 (5H, m), 7.53 (1H, s)。

【1728】

対応する出発原料を用い、実施例317と同様にして、実施例318～実施例320の化合物を製造した。

30

【1729】

実施例318

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸イソブチルエステル

微黄色粉末結晶、収率39%、融点176.5–177.3℃。

【1730】

実施例319

4- (6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

白色粉末結晶、収率45%、融点185–188℃ (分解)

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45 (9H, s), 2.48–2.58 (4H, m), 2.85 (2H, d, $J=5.1\text{ Hz}$), 3.31–3.45 (4H, m), 4.20 (1H, dd, $J=6.9\text{ Hz}$, 10.3 Hz), 4.34 (1H, dd, $J=8.4\text{ Hz}$, 10.3 Hz), 5.35–5.48 (1H, m), 7.55 (1H, s)。

【1731】

実施例320

4- [2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチル] ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

微黄色粉末、収率70%、融点 190–191℃ (分解)。

50

【1732】

実施例321

4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例39で製造したメタンスルホン酸3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピルエステル(2g、6.6ミリモル)、ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(1.4g、7.5ミリモル)、トリエチルアミン(1.3g、12.85ミリモル)、ヨウ化カリウム(1.8g、10.8ミリモル)及びDMF(15ml)の混合物を60℃にて終夜撹拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより3回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(1.9g、収率73%)を得た。

融点 166-167℃。

【1733】

実施例322

2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩の製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(1,19g、3.24ミリモル)をトリフルオロ酢酸(30ml)に溶解し、3時間室温で撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をメタノール(30ml)に溶解し、氷冷撹拌した。塩化水素の酢酸エチル溶液を少しずつ加え、同温度で30分撹拌した。析出した結晶を濾取して黄色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(1.06g、収率96%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.68 (3H, s), 3.00-3.59 (6H, m), 4.14 (1H, d, $J=11.1\text{ Hz}$), 4.36 (1H, d, $J=11.1\text{ Hz}$), 4.50-6.12 (4H, br), 8.17 (1H, s), 9.62 (2H, br)。

【1734】

実施例323

2-[4-(4-ビフェニルメチル)ピペラジン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例319で製造した4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(400mg、1.13ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(10ml)の混合物を4時間室温で撹拌した。反応液を濃縮し、残渣を塩化メチレン(10ml)に溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加え、中和した。得られる液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール(10ml)に溶解し、次いでこれに4-フェニルベンズアルデヒド(515mg、2.83ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(214mg、3.41ミリモル)、酢酸(0.21ml、3.67ミリモル)の順に加え、終夜室温で撹拌した。反応液を濃縮し、残渣に水を加え、塩化メチレンで2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の2-[4-(4-ビフェニルメチル)ピペラジン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2

10

20

30

40

50

， 1-b] オキサゾール (188 mg、収率 40%) を得た。

融点 183-185 °C (分解)。

【1735】

対応する出発原料を用い、実施例 323 と同様にして、実施例 324 ~ 実施例 329 の化合物を製造した。

【1736】

実施例 324

2- {2- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] エチル} -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
白色粉末、収率 36%、融点 148-149 °C。

10

【1737】

実施例 325

2-メチル-6-ニトロ-2- {3- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] プロピル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
白色粉末、収率 57%、融点 154-156 °C。

【1738】

実施例 326

2- {2- [4- (4-ビフェニルメチル) ピペラジン-1-イル] エチル} -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
白色粉末、収率 53%、融点 181-182 °C。

20

【1739】

実施例 327

2- {3- [4- (4-ビフェニルメチル) ピペラジン-1-イル] プロピル} -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
白色粉末、収率 65%、融点 176-178 °C。

【1740】

実施例 328

4- (N, N-ジメチルアミノ) -4'- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イルメチル] ビフェニル

30

白色粉末、収率 68%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.58 (3H, s), 2.36 (4H, br), 2.50-2.60 (2H, m), 2.54 (1H, d, J=14.8 Hz), 2.67-2.76 (2H, m), 2.84 (1H, d, J=14.8 Hz), 2.99 (6H, s), 3.41 (1H, d, J=12.9 Hz), 3.48 (1H, d, J=12.9 Hz), 3.87 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.30 (1H, d, J=9.7 Hz), 6.76-6.82 (2H, m), 7.25-7.29 (2H, m), 7.46-7.51 (4H, m), 7.53 (1H, s)。

【1741】

40

実施例 329

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (2-フェニル-1H-イミダゾール-4-イルメチル) ピペラジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

白色粉末、収率 93%

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1.52 (3H, s), 2.10-2.64 (6H, m), 2.67 (1H, d, J=15.4 Hz), 2.74 (1H, d, J=15.4 Hz), 3.10-3.70 (4H, br), 4.04 (1H, d, J=10.7 Hz), 4.21 (1H, d, J=10.7 Hz), 6.97 (1H, br), 7.27-7.34 (1H, m), 7.38-7.4

50

5 (2H, m), 7.88–7.93 (2H, m), 8.12 (1H, s)。

【1742】

実施例330

2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノンの製造

3,4-(ジクロロフェニル)酢酸(418mg、2.04ミリモル)及び塩化チオニル(3ml)の混合物を6時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、対応する酸クロリドを得た。

【1743】

一方、実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(300mg、0.816ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(6ml)の混合物を室温下にて6時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン10mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。この溶液に、氷冷下にて上記で得られた酸クロリドを塩化メチレン5mlに溶解した溶液を徐々に加え、室温下にて30分攪拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、白色粉末結晶の2-(3,4-ジクロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニ

融点 189–191℃。

【1744】

対応する出発原料を用い、実施例330と同様にして、実施例331及び実施例332の化合物を得た。

【1745】

実施例331

1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エタノン

融点 168–171.4℃。

【1746】

実施例332

2-(3,4-ジクロロフェノキシ)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノン

融点 209–211℃。

【1747】

実施例333

2-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセトアミドの製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(500mg、1.36ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(15ml)の混合物を室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン(10ml)に溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加え、中和した。この液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF(10ml)に溶解し、これに2-ブロモ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセトアミド(423mg、1.5ミリモル)、炭酸カ

リウム (207 mg、1.5 ミリモル) 及びヨウ化ナトリウム (204 mg、1.36 ミリモル) を加え、5 時間室温で攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、白色粉末の 2- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -N- (4-トリフルオロメチルフェニル) アセトアミド (389 mg、収率 61%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.62 (3H, s), 2.53-2.84 (9H, m), 2.88 (1H, d, $J=14.8$ Hz), 3.06 (1H, d, $J=16.7$ Hz), 3.14 (1H, d, $J=16.7$ Hz), 3.93 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 4.30 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 7.55 (1H, s), 7.55-7.59 (2H, m), 7.65-7.71 (2H, m), 9.20 (1H, s)。 10

【1748】

対応する出発原料を用い、実施例 333 と同様にして、実施例 334 ~ 実施例 336 の化合物を製造した。

【1749】

実施例 334

[4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] 酢酸エチルエステル 20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.25 (3H, t, $J=7.1$ Hz), 1.60 (3H, s), 2.45-2.64 (6H, m), 2.55 (1H, d, $J=14.8$ Hz), 2.72-2.81 (2H, m), 2.87 (1H, d, $J=14.8$ Hz), 3.14 (2H, s), 3.90 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 4.16 (2H, q, $J=7.1$ Hz), 4.31 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 7.57 (1H, s)。

【1750】

実施例 335

3- {3- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] プロピル} -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン 30

融点 123-126 °C。

【1751】

実施例 336

1- (4-クロロフェニル) -2- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] エタノン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.60 (3H, s), 2.47 (4H, br), 2.53 (1H, d, $J=14.9$ Hz), 2.57-2.65 (2H, m), 2.74-2.84 (2H, m), 2.87 (1H, d, $J=14.9$ Hz), 3.64 (1H, d, $J=16.7$ Hz), 3.75 (1H, d, $J=16.7$ Hz), 3.90 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 4.30 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 7.42 (2H, d, $J=8.6$ Hz), 7.54 (1H, s), 7.92 (2H, d, $J=8.6$ Hz)。 40

【1752】

実施例 337

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸塩の製造

実施例 306 で製造した 2- (4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イ 50

ル) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (130 mg、0.35ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (3 ml) 及び塩化メチレン (5 ml) の混合物を室温下にて1時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン (5 ml) に溶解し、トリエチルアミン (107.5 mg、1.06ミリモル) を加えた。この液に氷冷下にてクロロギ酸ベンジル (120 mg、0.71ミリモル) を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、黄色オイルを得た。このオイルを酢酸エチル (5 ml) に溶解した。そこへ飽和塩酸酢酸エチル溶液を加え、析出品を濾取することにより、白色粉末結晶の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸塩 (46.8 mg、収率30%) を得た。

融点 130.5-132.1℃。

【1753】

対応する出発原料を用い、実施例337と同様にして、実施例338~340の化合物を製造した。

【1754】

実施例338

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸フェニルエステル

融点 81-85℃。

【1755】

実施例339

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸イソプロピルエステル

融点 158.3-159.8℃。

【1756】

実施例340

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸n-オクチルエステル

融点 138-139.4℃。

【1757】

実施例341

4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

実施例319で製造した4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (400 mg、1.13ミリモル) を塩化メチレン (2 ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (1 ml) を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF (1 ml) に溶解し、トリエチルアミン (1 ml) を加えて中和し、中和液とした。

【1758】

一方、4-トリフルオロメチルベンジルアルコール (297 mg、1.69ミリモル) をDMF (1 ml) に溶解し、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (274 mg、1.69ミリモル) を加え、室温下にて1時間攪拌し、活性エステルを調製した。

【1759】

この活性エステルの溶液を上記の中和液に加え、室温下にて3時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により

10

20

30

40

50

精製し、微黄色粉末結晶の4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル(322mg、収率63%)を得た。

融点 120-122℃。

【1760】

対応する出発原料を用い、実施例341と同様にして、実施例342及び実施例343の化合物を製造した。

【1761】

実施例342

4-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

微黄色粉末、収率68%、融点 139-140℃。

【1762】

実施例343

4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

微黄色粉末、収率57%、融点 130-133℃。

【1763】

実施例344

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロピニルエステル・マレイン酸塩の製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(220mg、0.6ミリモル)、トリフルオロ酢酸(1ml)及び塩化メチレン(2ml)の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン2mlに溶解し、トリエチルアミン(1ml、7.17ミリモル)を加え中和した。得られる中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF(2ml)に溶解した。

【1764】

一方、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロピン-1-オール(110m、0.55ミリモル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール(90mg、0.55ミリモル)及びDMF(2ml)の混合物を室温下にて2時間攪拌し、活性エステルを調製した。

【1765】

この活性エステルを先のDMF溶液に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=5/1)により精製した。

【1766】

得られたフリー体をエタノール5mlに溶解し、これにマレイン酸(96mg、0.83ミリモル)をエタノール(5ml)に溶解した溶液を加えた。析出晶を濾取することにより、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロピニルエステル・マレイン酸塩(227mg、収率68%)を得た。

融点 166℃(分解)。

【1767】

10

20

30

40

50

実施例 345

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステルの製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(900mg、2.4ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(20ml)の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン20mlに溶解し、トリエチルアミン(6ml、43.05ミリモル)を加え中和した。減圧下にて濃縮した。残渣をDMF(5ml)に溶解した。

10

【1768】

一方、4-メチルスルファニルベンジルアルコール(470mg、3ミリモル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール(500mg、3.1ミリモル)及びDMF(10ml)の混合物を室温下にて3時間攪拌し、活性エステルを調製した。

【1769】

この活性エステルを先のDMF溶液に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステル(860mg、収率79%)を得た。

20

融点 118-120℃。

【1770】

実施例 346

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-メタンスルフィニルベンジルエステルの製造

実施例345で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステル(300mg、0.67ミリモル)及び塩化メチレン(10ml)の混合物に、氷冷下にてm-クロロ過安息香酸(210mg、0.85ミリモル)を加え、同温度下にて2時間攪拌した。反応液を飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をイソプロピルアルコール/エーテルから再結晶し、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-メタンスルフィニルベンジルエステル(203mg、収率65%)を得た。

30

融点 117-121℃。

【1771】

実施例 347

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-ヒドロキシベンジルエステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-(tert-ブチルジメチルシリロキシ)ベンジルエステル(400mg、0.75ミリモル)及びTHF(10ml)の混合物に、氷冷下にてテトラブチルアンモニウムフロリド(1M)THF溶液(0.8ml、0.8ミリモル)を加え、同温度下にて20分攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、飽和塩化アンモニウム水溶液、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え

40

50

、析出晶を濾取することにより、微黄色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-ヒドロキシベンジルエステル(95mg、収率30%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.59 (3H, s), 2.30-2.70 (4H, m), 2.56 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 2.86 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 3.10-3.55 (4H, m), 3.91 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 4.28 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 5.03 (2H, s), 5.30 (1H, br s), 6.84 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.24 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.53 (1H, s)。

【1772】

10

実施例348

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-アセチルベンジルエステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-(1,1-ジメトキシエチル)ベンジルエステル(600mg、1.23ミリモル)、1規定塩酸10ml(10ミリモル)及びTHF(15ml)の混合物を室温下にて2時間攪拌した。飽和重曹水を加えて中和し、酢酸エチルにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-アセチルベンジルエステル(558mg、収率99%)を得た。

20

融点 101-102℃。

【1773】

実施例349

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-ベンゾイルベンジルエステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-(ジメトキシフェニルメチル)ベンジルエステル(800mg、1.45ミリモル)を用い、実施例348の方法により、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-ベンゾイルベンジルエステル(630mg、収率86%)を得た。

30

融点 105-107℃。

【1774】

実施例350

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-アミノベンジルエステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジルエステル(340mg、0.66ミリモル)、トリフルオロ酢酸2ml及び塩化メチレン(10ml)の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて中和し、分液後、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、微黄色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-アミノベンジルエステル(100mg、収率37%)を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.61 (3H, s), 2.35-2.70 (4H, m), 2.56 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 2.85 (1H, d, $J=15.0\text{ Hz}$), 3.05-3.55 (4H, m), 3.91 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 4.28 (1H, d, $J=10.0\text{ Hz}$), 5.03 (2H, s), 5.30 (1H, br s), 6.84 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.24 (2H, d, $J=8.0\text{ Hz}$), 7.53 (1H, s)。

50

m), 3.69 (2H, brs), 3.91 (1H, d, $J=10.0$ Hz), 4.28 (1H, d, $J=10.0$ Hz), 4.98 (2H, s), 6.55 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.14 (2H, d, $J=8.0$ Hz), 7.53 (1H, s)。

【1775】

実施例351

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸フェニルアミド塩酸塩の製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(130mg、0.35ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(3ml)の混合物を室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン3mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。この液にフェニルイソシアネート(63mg、0.53ミリモル)を加え、室温下にて30分攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、アモルファスを得た。

【1776】

このアモルファスを酢酸エチルに溶解し、飽和塩酸/酢酸エチル溶液を加えることにより得られる結晶を濾取し、微黄色粉末結晶の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸フェニルアミド塩酸塩(124mg、収率55%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.55 (3H, s), 2.50-2.56 (4H, m), 2.75 (2H, s), 3.21-3.40 (4H, m), 4.05 (1H, d, $J=10.7$ Hz), 4.24 (1H, d, $J=10.7$ Hz), 6.92-6.99 (1H, m), 7.21-7.28 (2H, m), 7.44-7.48 (2H, m), 8.13 (1H, s), 8.59 (1H, s)。

【1777】

実施例352

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸イソプロピルアミドの製造

実施例306で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(140mg、0.38ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(3ml)の混合物を室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン3mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。この液にイソプロピルイソシアネート(75 μ l、0.76ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸イソプロピルアミド(90mg、収率67%)を得た。

融点 175-176.3 $^{\circ}$ C。

【1778】

対応する出発原料を用い、実施例352と同様にして、実施例353及び実施例354の化合物を製造した。

【1779】

実施例353

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(3-クロロフェニル)アミド

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1. 56 (3H, s), 2. 50–2. 56 (4H, m), 2. 77 (2H, s), 3. 21–3. 40 (4H, m), 4. 08 (1H, d, $J=10.7\text{ Hz}$), 4. 26 (1H, d, $J=10.7\text{ Hz}$), 6. 95 (1H, bd, $J=8.0\text{ Hz}$), 7. 23 (1H, t, $J=8.0\text{ Hz}$), 7. 36 (1H, bd, $J=8.0\text{ Hz}$), 7. 61 (1H, t, $J=2.0\text{ Hz}$), 8. 13 (1H, s), 8. 61 (1H, s)。

【1780】

実施例354

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボン酸シクロヘキシルアミド

10

融点 216. 5–218. 5℃。

【1781】

実施例355

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボチオ酸(4-クロロフェニル)アミドの製造

実施例322で製造した2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジーン-1-イルメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール・二塩酸塩(196mg、0. 73ミリモル)を塩化メチレン10mlに懸濁し、トリエチルアミン(0. 27ml、1. 94ミリモル)を加え、均一化させた。これに4-クロロフェニルイソチオシアネート(140mg、0. 83ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を水洗後、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、淡茶粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボチオ酸(4-クロロフェニル)アミド(128mg、収率40%)を得た。

20

融点 204–206℃(分解)。

【1782】

対応する出発原料を用い、実施例355と同様にして、実施例356及び実施例357の化合物を製造した。

【1783】

30

実施例356

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボチオ酸フェニルアミド

融点 164–165℃(分解)。

【1784】

実施例357

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボチオ酸(4-メトキシフェニル)アミド

融点 189–191℃(分解)。

【1785】

40

実施例358

2-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-イル]ベンゾオキサゾールの製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジーン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール(500mg、1. 36ミリモル)をトリフルオロ酢酸(10ml)に溶解し、3時間室温で攪拌した。反応液を減圧下に濃縮し、塩化メチレン、トリエチルアミンを1mlずつ加えた。次いでこれを室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、2-クロロベンゾオキサゾール(0. 19ml 1. 63ミリモル)及びトリエチルアミン(0. 23ml、1. 63ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌した。

50

反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝１００／１）で精製し、塩化メチレン－ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の２－〔４－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）ピペラジン－１－イル〕ベンゾオキサゾール（３２５ｍｇ、収率６２％）を得た。

MS ３８４（ M^+ ）

融点 ２２８．０－２２９．５℃。

【１７８６】

対応する出発原料を用い、実施例３５８と同様にして、実施例３５９～実施例３６１の化合物を製造した。

【１７８７】

実施例３５９

２－〔４－（６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）ピペラジン－１－イル〕ベンゾオキサゾール

白色粉末、収率７４％

MS ３７０（ M^+ ）

融点 ２０６－２０９℃（分解）。

【１７８８】

実施例３６０

２－〔４－〔２－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イル）エチル〕ピペラジン－１－イル〕ベンゾオキサゾール

白色粉末、収率７３％

MS ３９８（ M^+ ）

融点 １８７．６－１８９．６℃。

【１７８９】

実施例３６１

２－〔４－〔３－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イル）プロピル〕ピペラジン－１－イル〕ベンゾオキサゾール

白色粉末、収率９０％

MS ４１２（ M^+ ）

融点 １７２．０－１７４．４℃。

【１７９０】

実施例３６２

（Ｓ）－４－〔３－（２－クロロ－４－ニトロイミダゾール－１－イル）－２－ヒドロキシプロピル〕ピペラジン－１－カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

実施例８で製造した（Ｒ）－２－クロロ－１－〔２－ヒドロキシ－３－（４－メチルベンゼンスルホニルオキシ）プロピル〕－４－ニトロイミダゾール（１６．８６ｇ、４４．８６ミリモル）及びピペラジン－１－カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（８．３６ｇ、４４．８９ミリモル）をアセトニトリル（１００ｍｌ）に溶解し、これにトリエチルアミン（６．３ｍｌ、４５．２ミリモル）を加え、６時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水（１００ｍｌ）を加え、酢酸エチル（１００ｍｌ）で２回抽出した。有機相を合わせ、水（１００ｍｌ）、飽和食塩水（１００ｍｌ）の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝４０／１）にて精製した。酢酸エチル／*n*-ヘキサンから再結晶し、微黄色粉末結晶の（Ｓ）－４－〔３－（２－クロロ－４－ニトロイミダゾール－１－イル）－２－ヒドロキシプロピル〕ピペラジン－１－カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（１１．６１ｇ、収率６６％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ （ CDCl_3 ） δ ppm：

１．４６（９Ｈ，*s*），２．２１－２．５０（４Ｈ，*m*），２．５４－２．７０（２Ｈ，

10

20

30

40

50

m), 3.39–3.48 (4H, m), 3.65 (1H, s), 3.89–4.10 (2H, m), 4.20 (1H, dd, J=1.9 Hz, 13.5 Hz), 8.00 (1H, s)。

【1791】

実施例363

(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造 (実施例362の化合物の別途合成法)

実施例9で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(1g、4.91ミリモル)、ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(1.01g、5.40ミリモル)及びDMF(3ml)の混合物を70℃にて6時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水7mlを加え、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=40/1)にて精製し、微黄色粉末結晶の(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(967mg、51%)を得た。

【1792】

実施例364

(R)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(6.1g、41.35ミリモル)、(S)-(+)-グリシジルトシレート(12.27g、53.75ミリモル)及び炭酸水素ナトリウム(7.3g、86.89ミリモル)のエタノール(30ml)中の混合物を9時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンで2回抽出した。抽出溶液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を濃縮して得られたフォームをDMF(60ml)に溶解した。この溶液に、ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(8.47g、45.48ミリモル)、トリエチルアミン(6.92ml、49.64ミリモル)及びヨウ化ナトリウム(6.82g、45.5ミリモル)を加え、室温で24時間攪拌した。反応液を水中に注ぎ、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)で精製して、微黄色オイルの(R)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(6.43g、収率40%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.48 (9H, s), 2.16–2.50 (4H, m), 2.55–2.69 (2H, m), 3.37–3.50 (4H, m), 3.65 (1H, s), 3.90–4.25 (3H, m), 8.00 (1H, s)。

【1793】

実施例365

(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(7.00g、32.2ミリモル)及びピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(6.29g、33.8ミリモル)のDMF(70ml)中の混合物を70℃にて8時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、得られる結晶を濾取した。室温下にて減圧乾燥することにより微黄色粉末結晶の(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロ

ピル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (10.25 g、収率 79%) を得た。

光学純度 > 98.4% ee

$[\alpha]_D^{27} = 25.488$ (濃度: 1.024, CHCl_3)

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.14 (3H, s), 1.46 (9H, s), 2.34 (1H, d, $J = 13.9$ Hz), 2.47–2.67 (5H, m), 3.26 (1H, s), 3.44 (4H, t, $J = 4.4$ Hz), 3.99 (2H, s), 8.04 (1H, s)。

【1794】

実施例 366

(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造 (実施例 365 の化合物の別途合成法)

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (89.4、606 ミリモル) 及び (S)-4-(2-メチルオキシラニルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (119 g、466 ミリモル) をエタノール (475 ml) に溶解し、炭酸水素ナトリウム (58.7 g、699 ミリモル) を加えて 6 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、酢酸エチルで抽出した。抽出溶液を硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮することによって得られた結晶を酢酸エチルで分散洗浄後、濾取して一次晶を得た。母液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン = 3/1) にて精製し、二次晶を得た。一次晶と二次晶とをあわせ減圧乾燥し、白色粉末結晶の (S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (84.7 g、収率 45%) を得た。

【1795】

実施例 367

(R)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 18 で製造した (S)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (440 mg、2.02 ミリモル)、ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (414 mg、2.22 ミリモル) 及び DMF (4 ml) の混合物を 55–60 °C にて 9 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水 (24 ml) を加え、酢酸エチル (10 ml) で 2 回抽出した。有機相を合わせ、水 (20 ml) で 3 回洗浄後、飽和食塩水 (10 ml) で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をジエチルエーテル処理して得られる結晶を濾取し、微黄色粉末結晶の (R)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (662 mg、収率 81%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.15 (3H, s), 1.45 (9H, s), 2.34 (1H, d, $J = 13.9$ Hz), 2.48–2.67 (5H, m), 3.27 (1H, s), 3.44 (4H, t, $J = 4.4$ Hz), 3.99 (2H, s), 8.04 (1H, s)。

【1796】

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール及び (R)-4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、実施例 366 と同様にして、実施例 368 の化合物を製造した。

【1797】

実施例 368

(R)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (実施

10

20

30

40

50

例 367 の化合物の別途合成法)

白色粉末結晶、収率 20%。

【1798】

実施例 369

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール

の製造
(S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン (0.43 g、1.37 ミリモル) 及び 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (0.22 g、1.51 ミリモル) のアセトニトリル (4 ml) 懸濁液に炭酸水素ナトリウム (0.17 g、2.06 ミリモル) を加え、9 時間加熱還流した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1) により精製し、微黄色油状物の (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール (0.20 g、収率 31%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.18 (3H, s), 2.41 (1H, d, J=13.8 Hz), 2.56 (1H, d, J=13.8 Hz), 2.67-2.80 (2H, m), 2.85-2.96 (2H, m), 3.13-3.25 (4H, m), 4.03 (2H, s), 6.83-6.93 (2H, m), 7.07-7.17 (2H, m), 8.07 (1H, s)。

【1799】

実施例 370

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール

の製造
実施例 12 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (20 g、91.9 ミリモル) 及び 1-(4-クロロフェニル)ピペラジン (20.8 g、0.11 モル) を DMF (200 ml) に加え、70-75 °C にて 5 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) により精製し、黄色アモルファスの (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール (33.0 g、収率 87%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

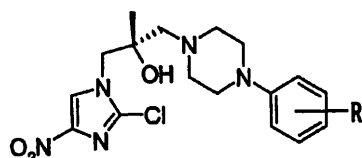
1.53 (3H, s), 2.42 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.55 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.67-2.76 (2H, m), 2.81-2.90 (2H, m), 3.13-3.17 (4H, m), 3.43 (1H, s), 4.03 (2H, s), 6.78-6.85 (2H, m), 7.16-7.23 (2H, m), 8.06 (1H, s)。

【1800】

対応する出発原料を用い、実施例 370 と同様にして、次表に示す実施例 371 ~ 実施例 384 の化合物を製造した。

【1801】

【表 16】



実施例	R	収率 (%)	¹ H NMR (CDCl ₃) δ
371	4-CF ₃	82	1.18(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.79(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.26-3.31(5H, m), 4.03(2H, s), 6.91(2H, d, J=8.7Hz), 7.49(2H, d, J=8.7Hz), 8.06(1H, s).
372	4-H	92	1.17(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.78(2H, m), 2.83-2.91(2H, m), 3.18-3.22(4H, m), 3.42(1H, s), 4.01(2H, s), 6.85-6.93(3H, m), 7.24-7.31(2H, m), 8.06(1H, s).
373	4-F	43	1.16(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.77(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.10-3.14(4H, m), 3.41(1H, s), 4.01(2H, s), 6.83-7.00(4H, m), 8.06(1H, s).
374	4-OMe	99	1.15(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.78(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.07-3.11(4H, m), 3.77(3H, s), 4.02(2H, s), 6.81-6.91(4H, m), 8.07(1H, s).
375	4-COOEt	100	1.17(3H, s), 1.37(3H, t, J=7.1Hz), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.76(2H, m), 2.81-2.89(2H, m), 3.31-3.35(4H, m), 3.40(1H, s), 4.04(2H, s), 4.33(2H, q, J=7.1Hz), 6.83-6.87(2H, m), 7.90-7.95(2H, m), 8.06(1H, s).
376	4-Me	86	1.15(3H, s), 2.27(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.77(2H, m), 2.82-2.90(2H, m), 3.12-3.16(4H, m), 3.47(1H, s), 4.01(2H, s), 6.81-6.85(2H, m), 7.06-7.09(2H, m), 8.06(1H, s).
377	4-CN	99	1.18(3H, s), 2.43(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.66-2.75(2H, m), 2.81-2.90(2H, m), 3.31-3.35(4H, m), 3.51(1H, s), 4.03(1H, d, J=14.3Hz), 4.09(1H, d, J=14.3Hz), 6.82-6.88(2H, m), 7.46-7.52(2H, m), 8.07(1H, s).
378	3,4-di-Cl	99	1.17(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.76(2H, m), 2.80-2.89(2H, m), 3.15-3.19(4H, m), 3.40(1H, s), 4.03(2H, s), 6.72(1H, dd, J=8.9, 2.9Hz), 6.94(1H, d, J=2.9Hz), 7.28(1H, d, J=8.9Hz), 8.05(1H, s).
379	3-CF ₃	99	1.17(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.78(2H, m), 2.83-2.93(2H, m), 3.22-3.27(4H, m), 3.36(1H, s), 4.03(2H, s), 7.03-7.11(3H, m), 7.32-7.39(1H, m), 8.06(1H, s).

【表 17】

380	2-CF ₃	99	1.16(3H, s), 2.44(1H, d, J=14.0Hz), 2.57(1H, d, J=14.0Hz), 2.67-2.78(2H, m), 2.81-2.91(2H, m), 2.93-2.96(4H, m), 3.81(1H, s), 4.05(2H, s), 7.21-7.27(1H, m), 7.35-7.39(1H, m), 7.50-7.57(1H, m), 7.60-7.64(1H, m), 8.11(1H, s).
381	4-Cl-3-CF ₃	99	1.18(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.77(2H, m), 2.83-2.92(2H, m), 3.19-3.24(4H, m), 3.40(1H, s), 4.04(2H, s), 6.95(1H, dd, J=8.9, 2.9Hz), 7.16(1H, d, J=2.9Hz), 7.34(1H, d, J=8.9Hz), 8.06(1H, s).
382	4-COO ^t Bu	99	1.17(3H, s), 1.57(9H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.67-2.76(2H, m), 2.81-2.90(2H, m), 3.29-3.33(4H, m), 3.51(1H, s), 4.04(2H, s), 6.84(2H, d, J=9.0Hz), 7.87(2H, d, J=9.0Hz), 8.07(1H, s).
383	2-F	99	1.16(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.57(1H, d, J=13.9Hz), 2.71-2.80(2H, m), 2.85-2.96(2H, m), 3.10-3.14(4H, m), 3.56(1H, s), 4.02(2H, s), 6.91-7.10(4H, m), 8.07(1H, s).
384	4-NMe ₂	82	1.14(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.54(1H, d, J=13.9Hz), 2.70-2.77(2H, m), 2.81-2.91(8H, m), 3.05-3.09(4H, m), 3.66(1H, s), 4.01(2H, s), 6.72-6.76(2H, m), 6.86-6.91(2H, m), 8.07(1H, s).

【1803】

対応する出発原料を用い、実施例370と同様にして、実施例385及び実施例386の化合物を製造した。

【1804】

実施例385

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-ピリジル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール

収率100%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.18(3H, s), 2.44(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.63-2.73(2H, m), 2.77-2.91(2H, m), 3.31-3.35(4H, m), 3.54(1H, s), 4.03-4.12(2H, m), 6.63-6.66(2H, m), 8.09(1H, s), 8.23-8.27(2H, m)。

【1805】

実施例386

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(3-ピリジル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール

収率81%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.17(3H, s), 2.44(1H, d, J=13.9Hz), 2.57(1H, d, J=13.9Hz), 2.67-2.79(2H, m), 2.84-2.93(2H, m), 3.20-3.25(4H, m), 3.85(1H, bs), 4.06(2H, s), 7.16-7.19(2H, m), 8.07-8.11(2H, m), 8.26-8.28(1H, m)。

【1806】

実施例9で製造した(R)-2-クロロ-4-ニトロ-1-(2-オキシラニルメチル)イミダゾールを用い、実施例370と同様にして、実施例387～実施例389の化合物を製造した。

【1807】

実施例 387

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール

収率 86%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.27-2.36 (1H, m), 2.49-2.63 (3H, m), 2.78-2.88 (2H, m), 2.97-3.18 (4H, m), 3.74 (1H, br), 3.96-4.08 (2H, m), 4.18-4.24 (1H, m), 6.84-7.01 (4H, m), 8.02 (1H, s)。

【1808】

10

実施例 388

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール

収率 49%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.27-2.36 (1H, m), 2.49-2.63 (3H, m), 2.78-2.87 (2H, m), 3.28-3.31 (4H, m), 3.62 (1H, br), 3.95-4.11 (2H, m), 4.19-4.25 (1H, m), 6.92 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.49 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 8.02 (1H, s)。

【1809】

20

実施例 389

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-[4-(4-シアノフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール

収率 100%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.28-2.37 (1H, m), 2.49-2.63 (3H, m), 2.76-2.85 (2H, m), 3.28-3.36 (4H, m), 3.58 (1H, br), 3.96-4.12 (2H, m), 4.19-4.25 (1H, m), 6.87 (2H, d, $J=8.9\text{ Hz}$), 7.51 (2H, d, $J=8.9\text{ Hz}$), 8.01 (1H, s)。

【1810】

30

実施例 390

(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造

実施例 12 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (15 g、68.93 ミリモル) 及びピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル (25.17 g、82.72 ミリモル) とを DMF 75 ml 中、65-70℃ にて 20 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル 150 ml 及び水 475 ml 中に注ぎ、分液した。更に水層より酢酸エチル 150 ml により抽出した。有機相を合わせ、水 400 ml により 3 回洗浄後、飽和食塩水 100 ml により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/ n -ヘキサン = 1/2) により精製し、黄色オイルの (S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル (29.98 g、収率 83%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.15 (3H, s), 2.36 (1H, d, $J=14.0\text{ Hz}$), 2.42-2.75 (5H, m), 3.18 (1H, s), 3.42-3.58 (4H, m), 4.00 (2H, s), 5.12 (2H, s), 7.21 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 7.38 (2H, d, $J=8.6\text{ Hz}$), 8.03 (1H, s)。

40

50

【1811】

実施例391

(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステルの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(4.24g、19.48ミリモル)及びピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル(6.73g、21.41ミリモル)をDMF 21ml中、50-55℃にて24時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル60ml及び水90ml中に注ぎ、分液した。更に水層より酢酸エチル60mlにより抽出した。有機相を合わせ、水90mlにより3回洗浄後、飽和食塩水60mlにより洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/n-ヘキサン=1/1)により精製し、黄色オイルの(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル(9.29g、収率90%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.16 (3H, s), 2.36 (1H, d, $J=14.0\text{ Hz}$), 2.43-2.76 (5H, m), 3.17 (1H, s), 3.48-3.67 (4H, m), 4.00 (2H, s), 4.78 (2H, dd, $J=1.0\text{ Hz}$, 6.1 Hz), 6.33-6.48 (1H, m), 6.66 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.48 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 7.58 (2H, d, $J=8.3\text{ Hz}$), 8.04 (1H, s)。

【1812】

対応する出発原料を用い、実施例391と同様にして、実施例392の化合物を製造した。

【1813】

実施例392

(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルエステル

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.15 (3H, s), 2.36 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 2.51 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 2.48-2.63 (2H, m), 2.63-2.78 (2H, m), 3.17 (1H, s), 3.39-3.63 (4H, m), 4.00 (2H, s), 4.75 (2H, dd, $J=1.1\text{ Hz}$, 6.3 Hz), 6.28 (1H, dt, $J=6.3\text{ Hz}$, 15.9 Hz), 6.62 (1H, d, $J=15.9\text{ Hz}$), 7.15-7.18 (2H, m), 7.38-7.42 (2H, m), 8.03 (1H, s)。

【1814】

実施例393

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

実施例365で製造した(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(10.25g、25.4ミリモル)をDMF (30ml)に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(1.12g、27.9ミリモル)を加え、同温度下にて2時間攪拌した。反応液に酢酸エチル(10ml)及び水(70ml)を加え、析出する結晶を濾取し、水洗した。この粗結晶を酢酸エチル(70ml)から再結晶して、微黄色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1

ー b] オキサゾールー 2-イルメチル) ピペラジンー 1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.62 g、収率 71%) を得た。

光学純度 > 99.5% ee

$[\alpha]_D^{27} = -20.953^\circ$ (濃度: 0.492, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.44 (9H, s), 1.62 (3H, s), 2.45–2.66 (5H, m), 2.87 (1H, d, J = 14.9 Hz), 3.29 (4H, br), 3.92 (1H, d, J = 9.7 Hz), 4.30 (1H, d, J = 9.7 Hz), 7.53 (1H, s)。

【1815】

実施例 394

(S)-4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー 2-イルメチル) ピペラジンー 1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 363 で製造した (S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾールー 1-イル)-2-ヒドロキシプロピル] ピペラジンー 1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (11 g、28.22 ミリモル) を用い、実施例 393 と同様の方法により、微黄色粉末結晶の (S)-4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー 2-イルメチル) ピペラジンー 1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (7.5 g、収率 75%) を得た。

光学純度 96.6% ee

$[\alpha]_D^{22} = -11.91^\circ$ (濃度: 1.016, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.45 (9H, s), 2.49–2.59 (4H, m), 2.85 (2H, d, J = 5.2 Hz), 3.33–3.44 (4H, m), 4.19 (1H, dd, J = 6.9 Hz, 10.2 Hz), 4.35 (1H, dd, J = 6.9 Hz, 10.2 Hz), 5.36–5.49 (1H, m), 7.55 (1H, s)。

【1816】

実施例 395

(R)-4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー 2-イルメチル) ピペラジンー 1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 364 で製造した (R)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾールー 1-イル)-2-ヒドロキシプロピル] ピペラジンー 1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.43 g、16.49 ミリモル) を 1,4-ジオキサン 35 ml に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム (730 mg、18.25 ミリモル) を加え、室温下にて終夜攪拌後、24 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を徐々に加え、塩化メチレンにより 2 回抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、白色粉末の (R)-4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー 2-イルメチル) ピペラジンー 1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.23 g、収率 21%) を得た。

光学純度 > 99% ee

$[\alpha]_D^{27} = 11.635^\circ$ (濃度: 1.004, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.45 (9H, s), 2.50–2.61 (4H, m), 2.85 (2H, d, J = 5.3 Hz), 3.31–3.50 (4H, m), 4.18 (1H, dd, J = 6.9 Hz, 10.2 Hz), 4.35 (1H, dd, J = 8.4 Hz, 10.2 Hz), 5.35–5.50 (1H, m), 7.55 (1H, s)。

【1817】

実施例 396

(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールー 2-イルメチル) ピペラジンー 1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製

10

20

30

40

50

造

実施例 368 で製造した (R) - 4 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] ピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (376 mg、0.93 ミリモル) を 1, 4 - ジオキサン (10 ml) に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム (45 mg、1.12 ミリモル) を加え、室温下にて 30 分攪拌後、24 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を徐々に加え、酢酸エチルにより 2 回抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン / アセトン = 3 / 1) により精製し、無色粉末結晶の (R) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (239 mg、収率 70 %) を得た。

10

光学純度 99.2 % ee

$[\alpha]_D^{27} = 21.073^\circ$ (濃度: 0.522, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.45 (9H, s), 1.61 (3H, s), 2.45 - 2.64 (5H, m), 2.87 (1H, d, J = 14.9 Hz), 3.29 (4H, br), 3.92 (1H, d, J = 9.7 Hz), 4.33 (1H, d, J = 9.7 Hz), 7.52 (1H, s)。

【1818】

実施例 397

20

(S) - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 369 で製造した (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロパン - 2 - オール (5.85 g, 12.61 ミリモル) の THF (150 ml) 溶液に氷冷下、水素化ナトリウム (0.66 g, 18.92 ミリモル) を加え、6 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷し、水及び酢酸エチルを加え、析出物を濾取し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン / 酢酸エチル = 1 / 1) により精製し、イソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の (S) - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イル] メチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (2.58 g、収率 48 %) を得た。

30

光学純度 99.8 % ee

$[\alpha]_D^{26} = 8.80^\circ$ (濃度: 1.000, CHCl₃)

融点 129 - 130 °C。

【1819】

実施例 398

(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 370 で製造した (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - [4 - (4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イル] プロパン - 2 - オール (33.0 g、79.7 ミリモル) を DMF (300 ml) に溶解した。この溶液に氷冷下水素化ナトリウム (3.7 g、91.6 ミリモル) を加え、室温で終夜攪拌した。反応液に氷水及び酢酸エチルを加え、激しく攪拌した。析出物を濾取して水及び酢酸エチルで洗浄し、減圧乾燥し、淡黄色粉末の粗製体を 23.2 g 得た。これを同様にもう 1 回合成した粗製体 (50 g) と合わせ、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン / 酢酸エチル = 50 / 1) により精製し、塩化メチレン - 酢酸エチルより結晶化を行い、白色粉末の (S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (45 g、収率 90 %) を得た。

40

50

光学純度 99.6% ee

$[\alpha]_D^{22} = -10.20^\circ$ (濃度: 0.5, CHCl₃)

融点 218–219.6°C。

【1820】

対応する出発原料を用い、実施例398と同様にして、実施例399～実施例403の化合物を製造した。

【1821】

実施例399

(S)-2-[4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

10

収率42%、 $[\alpha]_D^{28} = 2.10^\circ$ (濃度: 0.5, CHCl₃)

融点178.5–179.5°C。

【1822】

実施例400

(S)-2-[4-(3-ピリジル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率42%、融点 145–147.7°C。

【1823】

実施例401

(S)-2-[4-(4-ピリジル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

20

収率3%

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.65 (3H, s), 2.62 (1H, d, J=14.8 Hz), 2.64–2.71 (2H, m), 2.79–2.89 (2H, m), 2.92 (1H, d, J=14.8 Hz), 3.15–3.30 (4H, m), 3.95 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7 Hz), 6.60 (2H, d, J=6.2 Hz), 7.53 (1H, s), 8.26 (2H, d, J=6.2 Hz)。

【1824】

実施例402

(S)-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

30

融点 175.8–176.6°C。

【1825】

実施例403

(S)-2-[4-(4-シアノフェニル)ピペラジン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 211–211.5°C。

【1826】

実施例404

(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

40

1-(4-クロロフェニル)ピペラジン・二塩酸塩 (1.31 g、4.86ミリモル) を苛性ソーダ水溶液に投入し、塩化メチレンにより抽出した。抽出液を硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、1-(4-クロロフェニル)ピペラジンを得た。

【1827】

次に上記で得られた1-(4-クロロフェニル)ピペラジンと実施例9で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (763 mg、3.75ミリモル) とをDMF (5 ml) 中、70°Cにて6時間攪拌した。反応液を

50

氷冷し、水素化ナトリウム（219mg、5.48ミリモル）を加え、室温下にて2時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出晶を濾取した。これをアセトン／水から再結晶することにより、微黄色粉末結晶の（S）-2-[4-（4-クロロフェニル）ピペラジン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール（250mg、収率18%）を得た。

融点 183-183.5℃。

【1828】

実施例405

（S）-4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造

10

実施例390で製造した（S）-4-[3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル（4.3g、8.24ミリモル）をDMF（13ml）に溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム（430mg、10.7ミリモル）を加え、同温度下にて2時間攪拌した。反応液に酢酸エチル（4.3ml）、水（30ml）の順に加え、30分攪拌した。析出晶を濾取し、水洗した。これを酢酸エチル／イソプロピルエーテルから再結晶し、更にイソプロピルアルコールから再結晶することにより、白色粉末結晶の（S）-4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル（3.15g、収率79%）を得た。

20

融点 139.5-140.5℃

光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{27} = 18.04^\circ$ （濃度：1.020, CHCl₃）

¹H-NMR（CDCl₃）δ ppm：

1.60（3H, s）, 2.39-2.75（5H, m）, 2.87（1H, d, J=14.9Hz）, 3.14-3.56（4H, m）, 3.93（1H, d, 9.7Hz）, 4.29（1H, d, J=9.7Hz）, 5.10（2H, s）, 7.19（2H, d, J=8.6Hz）, 7.36（2H, d, J=8.6Hz）, 7.54（1H, s）。

【1829】

30

実施例406

（S）-4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジン-1-カルボン酸3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニルエステルの製造

実施例391で製造した（S）-4-[3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニルエステル（13.2g、24.81ミリモル）をDMF（40ml）に溶解し、4℃まで冷却した。水素化ナトリウム（1.19g、29.78ミリモル）を加え、同温度下にて1.5時間攪拌した。反応液に酢酸エチル（13ml）、水（92ml）の順に加え、30分攪拌した。析出晶を濾取し、水洗した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）により精製し、微黄色粉末結晶の（S）-4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジン-1-カルボン酸3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニルエステル（10.17g、収率83%）を得た。

40

融点 132-133℃

光学純度 99.0% ee

$[\alpha]_D^{27} = -21.73^\circ$ （濃度：0.866, CHCl₃）

¹H-NMR（CDCl₃）δ ppm：

1.62（3H, s）, 2.48-2.75（5H, m）, 2.88（1H, d, J=1

50

4. 9 Hz), 3. 15–3. 57 (4H, m), 3. 94 (1H, d, J=9. 7 Hz), 4. 29 (1H, d, J=9. 7 Hz), 4. 75 (2H, d, J=1. 15 Hz, 6. 0 Hz), 6. 29–6. 42 (1H, m), 6. 64 (1H, d, J=15. 9 Hz), 7. 47 (2H, d, J=8. 4 Hz), 7. 52–7. 62 (3H, m)。

【1830】

対応する出発原料を用い、実施例406と同様にして、実施例407の化合物を製造した。

【1831】

実施例407

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルエステル

10

融点91–93℃

$[\alpha]_D^{27} = -21.88^\circ$ (濃度: 0. 786, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1. 54 (3H, s), 2. 38–2. 71 (5H, m), 2. 84 (1H, d, J=14. 9 Hz), 3. 13–3. 54 (4H, m), 3. 92 (1H, d, J=9. 7 Hz), 4. 29 (1H, d, J=9. 7 Hz), 4. 73 (2H, dd, J=1. 2 Hz, 6. 2 Hz), 6. 15–6. 33 (1H, m), 6. 60 (1H, d, J=16. 0 Hz), 7. 16 (2H, d, J=8. 7 Hz), 7. 40 (2H, d, J=8. 7 Hz), 7. 53 (1H, s)。

20

【1832】

実施例408

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール・二塩酸塩の製造

実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1. 46g、3. 98ミリモル)をトリフルオロ酢酸30mlに溶解し、室温下3時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をメタノール30mlに溶解し、氷冷下、飽和塩化水素の酢酸エチル溶液を徐々に加え、同温度下30分攪拌した。析出晶を濾取し、黄色粉末の(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール・二塩酸塩(994mg、収率73%)を得た。

30

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1. 63 (3H, s), 2. 80–3. 36 (6H, m), 4. 11 (1H, d, J=11. 0 Hz), 4. 25–4. 98 (5H, m), 8. 15 (1H, s), 9. 31 (2H, br)。

【1833】

実施例409

(S)-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾールの製造

40

実施例394で製造した(S)-4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(100mg、0. 27ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(2ml)の混合物を室温下にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン5mlに溶解し、トリエチルアミン(1ml、7. 17ミリモル)を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール5mlに溶解し、4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド(148mg、0. 85ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(53mg、0. 85ミリモル)、酢酸(49μl、0. 85ミリモル)の順に加え、室温下にて18時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンに

50

より2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝1／1）により精製し、微黄色粉末結晶の（S）－6－ニトロ－2－[4－（4－トリフルオロメチルベンジル）ピペラジーン－1－イルメチル]－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール（53mg、収率46%）を得た。

融点 149－150℃。

【1834】

実施例410

（S）－2－[4－（4－ビフェニルメチル）ピペラジーン－1－イルメチル]－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾールの製造 10

実施例394で製造した（S）－4－（6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジーン－1－カルボン酸tert－ブチルエステル（7.2g、20.26ミリモル）、トリフルオロ酢酸24ml及び塩化メチレン（72ml）の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン100mlに溶解し、トリエチルアミン（20ml、143.49ミリモル）を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール72mlに溶解し、4－フェニルベンズアルデヒド（7.38g、40.52ミリモル）、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム（3.82g、60.78ミリモル）、酢酸（3.48ml、60.78ミリモル）の順に加え、室温下にて24時間攪拌した。析出晶を濾取し、メタノールにより洗浄した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝10／1）により精製し、黄色粉末結晶の（S）－2－[4－（4－ビフェニルメチル）ピペラジーン－1－イルメチル]－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール（5.52g、収率65%）を得た。 20

光学純度 >99.0% ee

$[\alpha]_D^{28} = -28.261^\circ$ （濃度：0.046，DMSO）

融点 207－208℃。

【1835】

実施例411

（R）－2－[4－（4－ビフェニルメチル）ピペラジーン－1－イルメチル]－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾールの製造 30

実施例395で製造した（R）－4－（6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジーン－1－カルボン酸tert－ブチルエステル（101.5mg、0.29ミリモル）及びトリフルオロ酢酸（2ml）の混合物を室温下にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン5mlに溶解し、トリエチルアミン（2ml、14.35ミリモル）を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール5mlに溶解し、4－フェニルベンズアルデヒド（156mg、0.86ミリモル）、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム（53mg、0.84ミリモル）、酢酸（0.05ml、0.87ミリモル）の順に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）により精製し、白色粉末結晶の（R）－2－[4－（4－ビフェニルメチル）ピペラジーン－1－イルメチル]－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール（56mg、収率46%）を得た。 40

$[\alpha]_D^{28} = 28.261^\circ$ （濃度：0.046，DMSO）。

融点 224－225℃

対応する出発原料を用い、実施例411と同様にして、実施例412の化合物を製造した。

【1836】

実施例 4 1 2

(R) - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール
収率 4 8 % 、融点 1 4 1 - 1 4 3 °C。

【 1 8 3 7 】

実施例 4 1 3

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 ' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 3 9 3 で製造した (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (1 . 7 g 、 4 . 6 ミリモル) 、トリフルオロ酢酸 (1 0 m l) 及び塩化メチレン (3 0 m l) の混合物を室温下にて 3 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール 3 0 m l に溶解し、4 ' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - カルボアルデヒド (2 . 3 g 、 9 . 1 9 ミリモル) 、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (5 8 0 m g 、 9 . 2 3 ミリモル) 、酢酸 (0 . 5 5 m l 、 9 . 6 2 ミリモル) の順に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン / メタノール = 5 0 / 1) により精製し、白色粉末結晶の (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 ' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール (1 . 4 7 g 、収率 6 3 %) を得た。

[α] _D²⁸ = 1 . 8 3 1 ° (濃度 : 0 . 7 1 , C H C l ₃)

¹H - NMR (C D C l ₃) δ p p m :

1 . 6 0 (3 H , s) , 2 . 2 0 - 2 . 4 5 (4 H , m) , 2 . 4 5 - 2 . 6 5 (4 H , m) , 2 . 5 0 (1 H , d , J = 1 5 . 0 H z) , 2 . 8 6 (1 H , d , J = 1 5 . 0 H z) , 3 . 4 8 (2 H , s) , 3 . 8 9 (1 H , d , J = 1 0 . 0 H z) , 4 . 3 1 (1 H , d , J = 1 0 . 0 H z) , 7 . 3 7 (2 H , d , J = 8 . 0 H z) , 7 . 5 0 - 7 . 5 6 (3 H , m) , 7 . 6 8 (4 H , s) 。

【 1 8 3 8 】

対応する出発原料を用い、実施例 4 1 3 と同様にして、実施例 4 1 4 ~ 実施例 4 1 7 の化合物を製造した。

【 1 8 3 9 】

実施例 4 1 4

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール
融点 1 1 0 - 1 1 2 °C。

【 1 8 4 0 】

実施例 4 1 5

(S) - 2 - [4 - (4 - ビフェニルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール
融点 1 8 2 - 1 8 4 °C。

【 1 8 4 1 】

実施例 4 1 6

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール
融点 1 3 7 - 1 3 8 °C。

【 1 8 4 2 】

実施例 4 1 7

10

20

30

40

50

(S) - 2 - { 4 - [2 - (4 - クロロフェニル) - 4 - メチルチアゾール - 5 - イルメチル] ピペラジーン - 1 - イルメチル } - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール

融点 174.3 - 175.5 °C。

【1843】

実施例 418

(R) - 2 - [4 - (4 - ビフェニルメチル) ピペラジーン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 396 で製造した (R) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチルエステル (100mg、0.27ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (2ml) の混合物を室温下にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 5ml に溶解し、トリエチルアミン (1ml、7.17ミリモル) を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール 5ml に溶解し、4 - フェニルベンズアルデヒド (149mg、0.82ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (51mg、0.82ミリモル)、酢酸 (48μl、0.82ミリモル) の順に加え、室温下にて15時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加えることによって得られる結晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、微黄色粉末結晶の (R) - 2 - (4 - ビフェニル - 4 - イルメチルピペラジーン - 1 - イルメチル) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール (67mg、収率57%) を得た。

融点 112 - 114 °C。

【1844】

対応する出発原料を用い、実施例 418 と同様にして、実施例 419 の化合物を製造した。

【1845】

実施例 419

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) ピペラジーン - 1 - イルメチル] - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール

融点 93 - 95 °C。

【1846】

実施例 420

(S) - 2 - クロロ - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イル] エタノンの製造

実施例 393 で製造した (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチルエステル (1.5g、4.1ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 20ml の混合物を室温化にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン 20ml に溶解し、トリエチルアミン 3ml、4 - ジメチルアミノピリジン (100mg、0.82ミリモル) の順に加えた。氷冷下にてクロロアセチルクロリド (0.49ml、6.2ミリモル) を塩化メチレン 2ml に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて終夜攪拌した。反応液を2回水洗後、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 100/1) により精製し、淡茶粉末の (S) - 2 - クロロ - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イル] エタノン (600mg、収率43%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.64 (3H, s), 2.50 - 2.70 (3H, m), 2.61 (1H, d, J = 15.0 Hz), 2.70 - 2.90 (1H, m), 2.89 (1H, d, J = 15.0 Hz)

z), 3.15–3.55 (3H, m), 3.60–3.75 (1H, m), 3.97 (1H, d, J=10.0 Hz), 4.03 (2H, s), 4.30 (1H, d, J=10.0 Hz), 7.55 (1H, s)。

【1847】

実施例421

(S)-2-(4-クロロフェノキシ)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノンの製造

実施例420で製造した(S)-2-クロロ-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノン(300mg、0.87ミリモル)、4-クロロフェノール(170mg、1.32ミリモル)、炭酸カリウム(180mg、1.3ミリモル)及びDMF(5ml)の混合物を60℃にて3時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、苛性ソーダ水溶液、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノールから再結晶し、淡茶粉末の(S)-2-(4-クロロフェノキシ)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノン(260mg、収率68%)を得た。

融点 179–180℃。

【1848】

実施例422

(S)-2-(4-クロロフェニルスルファニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノンの製造

実施例420で製造した(S)-2-クロロ-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノン(300mg、0.87ミリモル)及び4-クロロチオフェノール(190mg、1.32ミリモル)を用い、実施例421と同様の方法により、白色粉末の(S)-2-(4-クロロフェニルスルファニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノン(80mg、収率20%)を得た。

融点 142–145℃。

【1849】

実施例423

(S)-(4-クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]メタノンの製造

実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.82ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(6ml)の混合物を室温下にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン15mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。氷冷下にて4-クロロ塩化ベンゾイル(150.7mg、0.86ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテル及び酢酸エチルにより処理し、黄色粉末結晶の(S)-(4-クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]メタノン(282mg、収率85%)を得た。

融点 173–174℃。

【1850】

対応する出発原料を用い、実施例423と同様にして、実施例424の化合物を製造した。

【1851】

実施例424

(4-ビフェニル) - [4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]メタノン
融点 116-118℃。

【1852】

実施例425

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-フェニルメタノンの製造

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(142mg、0.39ミリモル)、トリフルオロ酢酸(1ml)及び塩化メチレン(1ml)の混合物を室温下にて1時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン2mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。氷冷下にて塩化ベンゾイル(54μl、0.46ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を塩化メチレンにより希釈し、飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテルにより処理し、黄色粉末結晶の[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-フェニルメタノン(72mg、収率50%)を得た。

融点 145-148.7℃。

【1853】

対応する出発原料を用い、実施例425と同様にして、実施例426～実施例433の化合物を製造した。

【1854】

実施例426

(4-クロロフェニル) - [4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]メタノン
融点 150.0-155.2℃。

【1855】

実施例427

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(ピリジン-4-イル)メタノン

¹H-NMR(CDC1₃) δ ppm:

1.62(3H, s), 2.25-2.75(4H, m), 2.61(1H, d, J=14.9Hz), 2.88(1H, d, J=14.9Hz), 3.00-3.93(4H, br), 3.95(1H, d, J=9.8Hz), 4.30(1H, d, J=9.8Hz), 7.26-7.55(2H, m), 7.59(1H, s), 8.67-8.72(2H, m)。

【1856】

実施例428

1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-2-フェニルエタノン

融点 175.2-175.9℃。

【1857】

実施例429

1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサ

10

20

30

40

50

ゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] - 3-フェニルプロパン-1-オン
融点 166.8-169.1℃。

【1858】

実施例430

1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサ
ゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-2-フェノキシエタノン
融点 158-160.6℃。

【1859】

実施例431

2-(4-クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロ
イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノ
ン
融点 184-187℃。

【1860】

実施例432

(4-ピフェニリル)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサ
ゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]メタノン

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.63 (3H, s), 2.45-2.80 (4H, m), 2.62 (1H, d, J=14.9 Hz), 2.90 (1H, d, J=14.9 Hz), 3.28-3.81 (4H, br), 3.95 (1H, d, J=9.8 Hz), 4.31 (1H, d, J=9.8 Hz), 7.34-7.50 (5H, m), 7.55 (1H, s), 7.56-7.63 (4H, m)。

【1861】

実施例433

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサ
ゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-トリフルオロメチルフェニル)
メタノン

融点 161-162℃。

【1862】

実施例434

(S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オ
キサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-トリフルオロメチルフェ
ニル)メタノンの製造

実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イ
ルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(2,3
6mg、0.882ミリモル)を塩化メチレン10mlに懸濁し、トリエチルアミン(1
ml、7.17ミリモル)を加え、均一溶液とした。この溶液に、氷冷下にて4-(トリ
フルオロメチル)塩化ベンゾイル(193mg、0.926ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-トリフルオロメチルフェニル)メタノン(264mg、収率68%)を得た。

融点 183-184℃。

【1863】

対応する出発原料を用い、実施例434と同様にして、実施例435～実施例438の化合物を製造した。実施例435～437の化合物は、実施例322で製造した2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2

10

20

30

40

50

, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩から製造した。

【1864】

実施例435

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-メトキシフェニル)メタノン
融点 135-137℃。

【1865】

実施例436

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-メチルフェニル)メタノン
融点 121-122℃。

10

【1866】

実施例437

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(3-トリフルオロメチルフェニル)メタノン
融点 122-124℃。

【1867】

実施例438

(S)-2-(4クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノン
融点 189-190℃。

20

【1868】

実施例439

(S)-2-(3,4-ジクロロフェノキシ)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノンの製造

3,4-(ジクロロフェノキシ)酢酸(234mg、1.06ミリモル)及び塩化チオニル(5ml)の混合物を30分加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、対応する酸クロリドを得た。

30

【1869】

一方、実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(236mg、0.88ミリモル)を塩化メチレン10mlに懸濁し、トリエチルアミン(1ml、7.17ミリモル)を加え、溶液とした。そこへ氷冷下にて、上記の酸クロリドを塩化メチレン5mlに溶解した溶液を徐々に加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-2-(3,4-ジクロロフェノキシ)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]エタノン(183mg、収率44%)を得た。

40

融点 164-166℃。

【1870】

対応する出発原料を用い、実施例439と同様にして、実施例440の化合物を製造した。

【1871】

実施例440

(S)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]

50

] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ブタン-1-オン

融点 145-146℃。

【1872】

実施例441

(S)-3-(4-クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]プロペノンの製造

4-クロロ桂皮酸(300mg、1.64ミリモル)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール(HOBT)(240mg、1.77ミリモル)、WSCD(350mg、1.83ミリモル)及び塩化メチレン(10ml)の混合物を室温下にて30分攪拌し、対応する活性エステルを調整した。

10

【1873】

一方、実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(434mg、1.64ミリモル)を塩化メチレン10mlに懸濁し、トリエチルアミン(3.3ml、2.37ミリモル)を加え、溶解させた。そこへ氷冷下にて、上記の活性エステルの反応液を加え、室温下にて3時間攪拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、白色粉末結晶の(S)-3-(4-クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]プロペノン(180mg、収率26%)を得た。

20

融点 220-222℃。

【1874】

対応する出発原料を用い、実施例441と同様にして、実施例442~445の化合物を製造した。

【1875】

実施例442

(S)-3-(クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]プロパン-1-オン

30

融点 177-178℃。

【1876】

実施例443

(S)-4-(4-クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ブタン-1-オン

融点 146-147℃。

【1877】

実施例444

(S)-3-(3,4-ジクロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]プロペノン

40

融点 213-215℃。

【1878】

実施例445

(S)-5-(4-クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ペンタン-1-オン

50

融点 108-111℃。

【1879】

実施例446

1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-2-(4-トリル)エタノンの製造

実施例322で製造した2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(240mg、0.79ミリモル)をDMF 5mlに溶解し、トリエチルアミン(0.22ml、1.58ミリモル)を加え、中和した。続いてこの中和液にp-トリル酢酸(140mg、0.93ミリモル)、WSCD(180mg、0.93ミリモル)の順に加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を酢酸エチルにより希釈し、2回水洗し、続いて飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエーテルにより処理し、白色粉末の1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-2-(4-トリル)エタノン(172mg、収率64%)を得た。

融点 213-214℃。

【1880】

対応する出発原料を用い、実施例446と同様にして、実施例447の化合物を製造した。

【1881】

実施例447

(4-ジメチルアミノフェニル)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]メタノン

融点 204-207℃。

【1882】

実施例448

(S)-2-{4-[3-(4-クロロフェニル)プロパン-1-スルホニル]ピペラジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.82ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(10ml)の混合物を室温下にて1時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン10mlに溶解した。この溶液にトリエチルアミン(3ml、21.52ミリモル)を加え、室温下にて10分攪拌後、3-(4-クロロフェニル)プロパン-1-スルホニルクロリド(300mg、1.19ミリモル)を加え、室温下にて3日間攪拌した。反応液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末の(S)-2-{4-[3-(4-クロロフェニル)プロパン-1-スルホニル]ピペラジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(330mg、収率84%)を得た。

融点 150-151℃。

【1883】

実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イルメチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールを用い、実施例448と同様にして、実施例449及び実施例450の化合物を製造した。

【1884】

10

20

30

40

50

実施例 4 4 9

2-〔4-(4-クロロベンゼンスルホニル)ピペラジン-1-イルメチル〕-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール

融点 202-204℃。

【1885】

実施例 4 5 0

2-〔4-(4-クロロフェニルメタンルホニル)ピペラジン-1-イルメチル〕-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール

融点 215-217℃。

【1886】

実施例 4 5 1

(S)-2-〔4-[2-(4-クロロフェニル)エタンスルホニル]ピペラジン-1-イルメチル〕-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾールの製造

実施例 4 0 8 で製造した (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール・二塩酸塩 (236 mg、0.88 ミリモル) を DMF 3 ml に溶解し、炭酸カリウム (500 mg、3.62 ミリモル)、2-(4-クロロフェニル)エタンスルホニルクロリド (240 mg、1 ミリモル) の順に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により精製し、白色粉末結晶の (S)-2-〔4-[2-(4-クロロフェニル)エタンスルホニル]ピペラジン-1-イルメチル〕-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール (100 mg、収率 26%) を得た。

融点 192-193℃。

【1887】

実施例 4 0 8 で製造した (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例 4 5 1 と同様にして、実施例 4 5 2 ~ 実施例 4 5 4 の化合物を製造した。また実施例 3 2 2 で製造した 2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例 4 5 1 と同様にして、実施例 4 5 5 の化合物を製造した。

【1888】

実施例 4 5 2

(S)-2-〔4-(4-クロロベンゼンスルホニル)ピペラジン-1-イルメチル〕-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール

融点 216-218℃。

【1889】

実施例 4 5 3

(S)-2-〔4-(4-クロロフェニルメタンルホニル)ピペラジン-1-イルメチル〕-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール

融点 204-206℃。

【1890】

実施例 4 5 4

(S)-2-〔4-[4-(4-クロロフェニル)ブタン-1-スルホニル]ピペラジン-1-イルメチル〕-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ〔2,1-b〕オキサゾール

融点 176-177℃。

【1891】

実施例 4 5 5

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) エタンスルホニル] ピペラジーン-1-イルメチル} -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール
融点 182-184℃。

【1892】

実施例 4 5 6

(S)-4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

実施例 3 9 4 で製造した (S)-4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチル
エステル (300mg、0.84ミリモル) を塩化メチレン 2ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 1ml を加え、室温下にて 1 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を D
MF 1ml に溶解し、トリエチルアミン 1ml を加えて中和した。

【1893】

一方、4-(トリフルオロメチル) ベンジルアルコール (297mg、1.69ミリモル) を DMF 1ml に溶解し、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (274mg、1.69ミリモル) を加え、室温下にて 1 時間攪拌し、活性エステルを調製した。

【1894】

この活性エステルの溶液を、先の中和液に加え、室温下にて 3 時間攪拌した。反応液に
水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩水で
洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣
をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により
精製し、白色粉末結晶の (S)-4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメ
チルベンジルエステル (273mg、収率 71%) を得た。

$[\alpha]_D^{28} = -14.851^\circ$ (濃度: 0.404、CHCl₃)

融点 125-125.5℃。

【1895】

実施例 4 5 7

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジ
ルエステルの製造

実施例 3 9 3 で製造した (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイ
ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.87g、5.09ミリモル) を塩化メチレン (20ml) に
溶解し、トリフルオロ酢酸 (20ml) を加え、5 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣
を DMF (20ml) に溶解した。4-(トリフルオロメチル) ベンジルアルコール (1.92g、10.9ミリモル) の DMF (20ml) 溶液に 1, 1'-カルボニルジイミ
ダゾール (1.76g、10.9ミリモル) を加え室温で 3 時間攪拌した混合物を加え、
室温で終夜攪拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し
た。硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシ
リカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=3/1) により精製した。
。イソプロピルアルコールより再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結
晶の (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベ
ンジルエステル (1.48g、収率 53%) を得た。

融点 140.4-141.6℃

光学純度 99.9% ee

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

10

20

30

40

50

1. 62 (3H, s), 2. 52-2. 69 (5H, m), 2. 88 (1H, d, J=14.9 Hz), 3. 43 (4H, br), 3. 93 (1H, d, J=9.7 Hz), 4. 28 (1H, d, J=9.7 Hz), 5. 16 (2H, s), 7. 44 (2H, d, J=8.1 Hz), 7. 53 (1H, s), 7. 61 (2H, d, J=8.1 Hz)。

【1896】

実施例458

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸1, 3, 3-トリメチル-2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イルメチルエステルの製造

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3, 3-ジメチル-2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イルメチルエステル (300mg、0.62ミリモル) 及びDMF (3ml) の混合物に、氷冷下にて水素化ナトリウム (27mg、0.68ミリモル) を加え、同温度下にて30分撹拌した。続いてこの混合物にヨウ化メチル (97mg、0.68ミリモル) を加え、室温下にて2時間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、微黄色粉末の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸1, 3, 3-トリメチル-2-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール-5-イルメチルエステル (140mg、45%) を得た。

融点 80-100℃ (分解)。

【1897】

対応する出発原料を用い、実施例458と同様にして、実施例459の化合物を製造した。

【1898】

実施例459

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-6-イルメチルエステル

融点 189-190℃。

【1899】

実施例460

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3, 5-ジクロロベンジルエステルの製造

実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール二塩酸塩 (300mg、0.88ミリモル) 及びDMF (3ml) の混合物にトリエチルアミン (270mg、2.67ミリモル) を加え中和した。3, 5-ジクロロベンジルアルコール (180mg、1.02ミリモル) をDMF (3ml) に溶解し、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (180mg、1.11ミリモル) を加え室温下にて2時間撹拌して調製した活性エステルの溶液を、上記中和液に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、白色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3, 5-ジクロロベンジルエステル (220mg、収率53%) を得た。

融点 129-130℃。

【1900】

実施例461

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩の製造

実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.09g、2.97ミリモル)を用い、実施例344の方法により、白色粉末の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩(945mg、63%)を得た。

10

融点 136-138℃。

【1901】

対応する出発原料を用い、実施例461と同様にして、実施例462～実施例465の化合物を製造した。

【1902】

実施例462

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸[(E)-3-メチル-3-(3-トリフルオロメチルフェニル)]-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

20

融点 142-143℃。

【1903】

実施例463

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 150-151℃。

【1904】

実施例464

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 158-159℃。

30

【1905】

実施例465

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸[(Z)-3-メチル-3-(3-トリフルオロメチルフェニル)]-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

40

融点 124-125℃。

【1906】

実施例466

(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-フルオロベンジルエステルの製造

実施例396で製造した(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(106mg、0.29ミリモル)を用い、実施例457の方法により、白色粉末の(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[

50

2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 4-フルオロベンジルエステル (79 mg、収率 66%) を得た。

$[\alpha]_D^{28} = 19.70^\circ$ (濃度: 1.066, CHCl₃)

融点 167-169°C。

【1907】

実施例 467

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 [3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル] アミドの製造

3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルアミン (761 mg、3.78 ミリモル)、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (613 mg、3.78 ミリモル) 及び DMF (3 ml) の混合物を室温下にて終夜攪拌し、反応液とした。

【1908】

一方、実施例 393 で製造した (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (926 mg、2.52 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (10 ml) 及び塩化メチレン (3 ml) の混合物を室温下にて 5 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を DMF 3 ml に溶解し、トリエチルアミン (2 ml、14.35 ミリモル) を加えた。これに上記の反応液を加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 20/1) により精製し、微黄色粉末の (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 [3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル] アミド (1.2 g、収率 96%) を得た。

融点 105-107°C。

【1909】

実施例 306 で製造した 2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールを用い、実施例 467 と同様にして、実施例 468 ~ 470 の化合物を製造した。

【1910】

実施例 468

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 (4-トリフルオロメチルベンジル) アミド

融点 201-202.5°C。

【1911】

実施例 469

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 (4-トリフルオロメチルフェニル) アミド

融点 216-217°C。

【1912】

実施例 470

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 (4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェニル) アミド

融点 222-224°C。

【1913】

実施例 471

10

20

30

40

50

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸シクロヘキシルアミドの製造

実施例 408 で製造した (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (ピペラジン - 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール・二塩酸塩 (236 mg、0.88 ミリモル) を塩化メチレン 15 ml に懸濁し、トリエチルアミン (2 ml、14.35 ミリモル) を加えて均一化させた。これにシクロヘキシルイソシアネート (120 mg、0.96 ミリモル) を加え、室温下にて 1 時間攪拌した。反応液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 20/1) により精製し、微黄色粉末の (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸シクロヘキシルアミド (164 mg、47%) を得た。

融点 98 - 101 °C。

【1914】

実施例 322 で製造した 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (ピペラジン - 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例 471 と同様にして、実施例 472 ~ 476 の化合物を製造した。

【1915】

実施例 472

4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 (4 - メトキシフェニル) アミド

融点 167 - 168 °C。

【1916】

実施例 473

4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 (4 - クロロフェニル) アミド

融点 185 - 188 °C (分解)。

【1917】

実施例 474

4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 (3 - トリフルオロメチルフェニル) アミド

融点 183 - 184 °C。

【1918】

実施例 475

4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 (3, 4 - ジクロロフェニル) アミド

融点 212 - 214 °C (分解)。

【1919】

実施例 476

4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 (4 - メチルフェニル) アミド

融点 202 - 203 °C (分解)。

【1920】

実施例 477

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 (4 - トリフルオロメチルフェニル) アミドの製造

4 - アミノベンゾトリフルオリド (142 mg、0.882 ミリモル)、1, 1' - カルボニルジイミダゾール (143 mg、0.882 ミリモル) 及び DMF (6 ml) の混

10

20

30

40

50

合物を室温下にて終夜攪拌し、反応液とした。

【1921】

一方、実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール二塩酸塩(236mg、0.88ミリモル)を塩化メチレン5mlに懸濁し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えて均一化させた。これに上記のDMFの反応液を加え、室温下にて6時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルフェニル)アミド(90mg、収率23%)を得た。

10

融点 150-152.5℃。

【1922】

対応する出発原料を用い、実施例477と同様にして、実施例478～実施例481の化合物を製造した。

【1923】

実施例478

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-メトキシフェニル)アミド

20

融点 185.5-187.5℃。

【1924】

実施例479

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルベンジル)アミド

融点 101-103.6℃。

【1925】

実施例480

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-クロロフェニル)アミド

融点 156-159℃(分解)。

30

【1926】

実施例481

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-メチルフェニル)アミド

融点 207-210℃(分解)。

【1927】

実施例482

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミドの製造

40

実施例477で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルフェニル)アミド(200mg、0.44ミリモル)をDMF4mlに溶解し、水素化ナトリウム(26mg、0.66ミリモル)を加え、室温下にて1.5時間攪拌後、ヨウ化メチル(0.5ml、0.76ミリモル)を加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水によ

50

り洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し、白色粉末結晶の（S）－4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－カルボン酸N－メチル－N－（4－トリフルオロメチルフェニル）アミド（35mg、収率17%）を得た。

融点 100.4－102.4℃。

【1928】

実施例483

（S）－〔4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－イル〕－〔4－（4－トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン－1－イル〕メタノンの製造

実施例393で製造した（S）－4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－カルボン酸tert－ブチルエステル（1.17g、3.32ミリモル）、トリフルオロ酢酸（5ml）及び塩化メチレン（10ml）の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン10mlに溶解し、トリエチルアミン（5ml、35.87ミリモル）を加え、室温下にて10分攪拌した。減圧下にて濃縮し、残渣をDMF15mlに溶解し、炭酸カリウム（920mg、6.64ミリモル）を加え、氷冷下にて4－（4－トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン－1－カルボニルクロリド（1.07g、3.65ミリモル）をDMF10mlに溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝30／1）により精製し、白色粉末結晶の（S）－〔4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－イル〕－〔4－（4－トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン－1－イル〕メタノン（575mg、収率33%）を得た。

融点 179.1－181.9℃。

【1929】

実施例484

（S）－〔4－（4－クロロフェニル）－1，2，3，6－テトラヒドロピリジン－1－イル〕－〔4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－イル〕メタノンの製造

実施例408で製造した（S）－2－メチル－6－ニトロ－2－（ピペラジン－1－イルメチル）－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール二塩酸塩（401mg、1.5ミリモル）をDMF8mlに溶解し、炭酸カリウム（750mg、5.4ミリモル）を加え、室温下にて10分攪拌後、氷冷下にて4－（4－クロロフェニル）－1，2，3，6－テトラヒドロピリジン－1－カルボニルクロリド（400mg、1.56ミリモル）をDMF3mlに溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノールから再結晶し、微黄色粉末結晶の（S）－〔4－（4－クロロフェニル）－1，2，3，6－テトラヒドロピリジン－1－イル〕－〔4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－イル〕メタノン（380mg、収率53%）を得た。

融点 161－162℃。

【1930】

実施例408で製造した（S）－2－メチル－6－ニトロ－2－（ピペラジン－1－イルメチル）－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール・二塩酸塩を用い、

10

20

30

40

50

実施例 484 と同様にして、実施例 485 及び実施例 486 の化合物を製造した。また実施例 322 で製造した 2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例 484 と同様にして、実施例 487 の化合物を製造した。

【1931】

実施例 485

(S)-[4-(4-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]メタノン

融点 156-159℃。

10

【1932】

実施例 486

(S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル]メタノン

融点 168.4-171.7℃。

【1933】

実施例 487

[4-(4-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]メタノン

融点 186-187℃。

20

【1934】

実施例 488

(S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]安息香酸の製造

(S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]安息香酸 tert-ブチルエステル (300mg、0.68ミリモル) をトリフルオロ酢酸 10ml 中室温にて 5 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、トリエチルアミンで中和した。これを減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、メタノール-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の (S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]安息香酸 (186mg、収率 71%) を得た。

30

MS 387 (M⁺)

融点 248-252℃。

【1935】

実施例 489

(S)-2-[4-(2,6-ジフェニルピリミジン-4-イル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

40

実施例 393 で製造した (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (500mg、1.36ミリモル) を塩化メチレン 2ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 10ml を加え、室温で 3 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 4ml ずつ加えた。反応液を室温で 5 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣を DMF 5ml に溶解し、4-クロロ-2,6-ジフェニルピリミジン (400mg、1.50ミリモル)、DBU (0.2ml、1.36ミリモル) を加え、100℃で 5 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し

50

た。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝100／1）により精製し、塩化メチレン－ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の（S）－2－[4－（2，6－ジフェニルピリミジン－4－イル）ピペラジン－1－イルメチル]－2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール（113mg、収率17%）を得た。

MS 498 (M+H)⁺

融点 202.5－205.4℃。

【1936】

対応する出発原料を用い、実施例489と同様にして、実施例490の化合物を製造した。

【1937】

実施例490

（S）－2－[4－（4，6－ジフェニルピリミジン－2－イル）ピペラジン－1－イルメチル]－2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール

収率7%、融点 201.2－205.4℃。

【1938】

実施例491

{4－[3－（2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル）－2－ヒドロキシ－2－メチルプロピル]ピペラジン－1－イル}カルバミン酸tert－ブチルエステルの製造

2－クロロ－4－ニトロ－1H－イミダゾール（2.05g、13.9ミリモル）、4－（2－メチル－2－オキシラニルメチル）ピペラジン－1－イルカルバミン酸tert－ブチルエステル（3.14g、11.6ミリモル）及び炭酸水素ナトリウム（1.46g、17.4ミリモル）を1－プロパノール13ml中、6時間加熱攪拌した。反応液を酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n－ヘキサン／アセトン＝2／1）により精製し、白色粉末結晶の{4－[3－（2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル）－2－ヒドロキシ－2－メチルプロピル]ピペラジン－1－イル}カルバミン酸tert－ブチルエステル（1.55g、収率32%）を得た。

¹H－NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.12 (3H, s), 1.46 (9H, s), 2.36 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.50 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.64－2.84 (8H, m), 3.32 (1H, s), 3.96 (2H, s), 5.46 (1H, br), 8.03 (1H, s)。

【1939】

実施例492

{4－[3－（2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル）－2－ヒドロキシ－2－メチルプロピル]ピペラジン－1－イル}カルバミン酸tert－ブチルエステルの製造（実施例491の化合物の別途合成法）

実施例6で製造した2－クロロ－1－（2－メチル－2－オキシラニルメチル）－4－ニトロイミダゾール（4.36g、20.0ミリモル）及びピペラジン－1－イルカルバミン酸tert－ブチルエステル（4.44g、22.0ミリモル）を用い、実施例365と同様の方法により、白色粉末結晶の{4－[3－（2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル）－2－ヒドロキシ－2－メチルプロピル]ピペラジン－1－イル}カルバミン酸tert－ブチルエステルを（6.08g、収率72%）を得た。

【1940】

実施例493

10

20

30

40

50

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

実施例492で製造した{4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-イル}カルバミン酸tert-ブチルエステル(6.87g、16.4ミリモル)を用い、実施例393と同様の方法により、白色粉末結晶の[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(2.71g、収率43%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.43 (9H, s), 1.60 (3H, s), 2.36 (1H, d, $J=14.0\text{ Hz}$), 2.52-2.90 (9H, m), 3.90 (1H, d, $J=9.7\text{ Hz}$), 4.27 (1H, d, $J=9.7\text{ Hz}$), 5.35 (1H, br), 7.53 (1H, s)。

【1941】

実施例494

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸ベンジルエステルの製造

実施例493で製造した[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(150mg、0.39ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(4ml)の混合物を室温下にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン4mlに溶解し、トリエチルアミン(4ml、28.7ミリモル)を加え、中和した。次いでこれに、氷冷下にてクロロギ酸ベンジル(100mg、0.59ミリモル)を加え、室温下にて2時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/アセトン=1/1)により精製し、微黄色粉末結晶の[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸ベンジルエステル(6.5mg、収率4%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.60 (3H, s), 2.53-2.90 (10H, m), 3.89 (1H, d, $J=9.6\text{ Hz}$), 4.27 (1H, d, $J=9.6\text{ Hz}$), 5.11 (2H, s), 5.88 (1H, br), 7.25-7.34 (5H, m), 7.52 (1H, s)。

【1942】

実施例495

N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)アミンの製造

実施例493で製造した[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(40mg、0.11ミリモル)、4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド(24mg、0.13ミリモル)、トリフルオロ酢酸0.08ml及び塩化メチレン(1ml)の混合物を室温下にて3時間攪拌した。飽和重曹水を加えて中和し、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=3/1)により精製し、白色粉末結晶のN-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)アミン(19mg、収率40%)を得た。

融点 189.2-190.9℃。

10

20

30

40

50

【1943】

実施例496

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{4-[(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジン-1-イル}プロパン-2-オール

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(218mg、1ミリモル)、N-(ピペラジン-1-イル)-N-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミン(283mg、1.1ミリモル)及びDMF(2ml)の混合物を70-80℃にて7時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/アセトン=1/1)により精製し、微黄色粉末結晶の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{4-[(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジン-1-イル}プロパン-2-オール(402mg、収率85%)を得た。

$[\alpha]_D^{27} = 19.01^\circ$ (濃度: 1.010, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.18 (3H, s), 2.42 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.57 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.71-2.95 (4H, m), 3.10-3.33 (5H, m), 4.02 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.58 (2H, d, J=8.4 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.4 Hz), 8.05 (1H, s)。

【1944】

実施例497

(S)-{4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-イル}カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(29.8g、137ミリモル)とピペラジン-1-イル-カルバミン酸tert-ブチルエステル(28.9g、144ミリモル)を用い、実施例496と同様の方法により、白色粉末結晶の(S)-{4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-イル}カルバミン酸tert-ブチルエステル(36.68g、収率64%)を得た。

$[\alpha]_D^{27} = 17.793^\circ$ (濃度: 1.006, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.12 (3H, s), 1.45 (9H, s), 2.36 (1H, d, J=14.0 Hz), 2.50 (1H, d, J=14.0 Hz), 2.64-2.84 (8H, m), 3.32 (1H, s), 3.97 (2H, s), 5.47 (1H, br), 8.04 (1H, s)。

【1945】

対応する出発原料を用い、実施例497と同様にして、実施例498～実施例500の化合物を製造した。

【1946】

実施例498

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{4-[(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジン-1-イル}プロパン-2-オール

$[\alpha]_D^{27} = 12.326^\circ$ (濃度: 1.006, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.17 (3H, s), 2.41 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.56 (1H, d

, $J = 13.9 \text{ Hz}$), 2.71–2.95 (4H, m), 3.14–3.29 (5H, m), 4.01 (2H, s), 7.19 (2H, d, $J = 8.0 \text{ Hz}$), 7.50 (1H, s), 7.62 (2H, d, $J = 8.0 \text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

【1947】

実施例499

(S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチル–3–{4–[(5–トリフルオロメチルベンゾフラン–2–イルメチレン)アミノ]ピペラジン–1–イル}プロパン–2–オール

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.18 (3H, s), 2.43 (1H, d, $J = 14.0 \text{ Hz}$), 2.58 (1H, d, $J = 14.0 \text{ Hz}$), 2.73–2.82 (2H, m), 2.86–2.95 (2H, m), 3.17 (1H, s), 3.31 (4H, s), 4.03 (2H, s), 6.82 (1H, s), 7.46 (1H, s), 7.52 (1H, d, $J = 8.7 \text{ Hz}$), 7.59 (1H, d, $J = 8.7 \text{ Hz}$), 7.83 (1H, s), 8.05 (1H, s)。

10

【1948】

実施例500

(S)–1–{4–[(5–クロロベンゾフラン–2–イルメチレン)アミノ]ピペラジン–1–イル}–3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチルプロパン–2–オール

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.18 (3H, s), 2.42 (1H, d, $J = 14.0 \text{ Hz}$), 2.57 (1H, d, $J = 14.0 \text{ Hz}$), 2.71–3.00 (4H, m), 3.17 (1H, s), 3.23–3.38 (4H, m), 4.02 (2H, s), 6.71 (1H, s), 7.22 (1H, dd, $J = 2.1 \text{ Hz}$, 8.7 Hz), 7.33–7.43 (2H, m), 7.50 (1H, d, $J = 2.1 \text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

20

【1949】

実施例501

(S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチル–3–[4–(4–トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペラジン–1–イル]プロパン–2–オールの製造

30

実施例12で製造した(R)–2–クロロ–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル)–4–ニトロイミダゾール(0.610g、2.82ミリモル)及びピペラジン–1–イル–(4–トリフルオロメチルフェニル)アミン(0.760g、3.09ミリモル)を用い、実施例496と同様の方法により、無色固体の(S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチル–3–[4–(4–トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペラジン–1–イル]プロパン–2–オール(1.125g、収率86%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.15 (3H, s), 2.39 (1H, d, $J = 14.0 \text{ Hz}$), 2.54 (1H, d, $J = 14.0 \text{ Hz}$), 2.60–2.95 (8H, m), 3.25 (1H, s), 3.99 (2H, s), 4.67 (1H, s), 6.90 (2H, d, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 7.43 (2H, d, $J = 8.6 \text{ Hz}$), 8.04 (1H, s)。

40

【1950】

実施例502

(S)–N–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール–2–イルメチル)ピペラジン–1–イル]–(4–トリフルオロメチルフェニル)アミンの製造

実施例501で製造した(S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチル–3–[4–(4–トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペラジン–1–イル]プロパン–2–オール(1.125g、2.43ミリモル)を用い、実施例4

50

93と同様の方法により、白色固体の(S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミン(0.715g、収率69%)を得た。

融点 192.1-195.3℃。

【1951】

実施例503

(S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

実施例497で製造した(S)-{4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-イル}カルバミン酸tert-ブチルエステル(36.68g)を用い、実施例493と同様の方法により、白色粉末結晶の(S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(19.51g、収率58%)を得た。

光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{27} = 9.84^\circ$ (濃度: 1.016, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.43 (9H, s), 1.60 (3H, s), 2.35 (1H, d, J=14.0 Hz), 2.52-2.92 (9H, m), 3.89 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.27 (1H, d, J=9.7 Hz), 5.35 (1H, s), 7.53 (1H, s)。

【1952】

実施例504

(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミンの製造

実施例496で製造した(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{4-[(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジン-1-イル}プロパン-2-オール(847mg、0.85ミリモル)及びDMF(4ml)の混合物に氷冷下にて水素化ナトリウム(69mg、1.73ミリモル)を加え、同温度下にて2.5時間攪拌した。反応液に水を加え、析出する結晶を濾取した。これをメタノールにより洗浄後、アセトン/水から再結晶することにより、微黄色粉末結晶の(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミン(248mg、収率69%)を得た。

融点 201-202.3℃ (分解)

光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{27} = -64.64^\circ$ (濃度: 1.018, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.64 (3H, s), 2.55-2.79 (3H, m), 2.80-3.20 (7H, m), 3.94 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7 Hz), 7.44 (1H, s), 7.48-7.67 (5H, m)。

【1953】

対応する出発原料を用い、実施例504と同様の方法により、実施例505~実施例507の化合物を製造した。

【1954】

実施例505

(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメ

10

20

30

40

50

トキシベンジリデン) アミン

融点 188.4–191.2 °C

光学純度 >99.0 % ee

$[\alpha]_D^{27} = -58.30^\circ$ (濃度: 1.024, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.64 (3H, s), 2.55–2.77 (3H, m), 2.82–3.18 (7H, m), 3.94 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7 Hz), 7.16 (2H, d, J=8.2 Hz), 7.43 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.58 (2H, d, J=8.2 Hz)。

【1955】

10

実施例 506

(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレン)アミン

融点 190.2–191.8 °C

光学純度 99.8 % ee

$[\alpha]_D^{27} = -81.05^\circ$ (c=0.992, CHCl₃)

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.64 (3H, s), 2.59–2.77 (3H, m), 2.86–3.00 (3H, m), 3.05–3.26 (4H, m), 3.96 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7 Hz), 6.79 (1H, s), 7.39 (1H, s), 7.41–7.57 (3H, m), 7.82 (1H, s)。

20

【1956】

実施例 507

(S)-N-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]アミン

光学純度 >99.0 % ee

$[\alpha]_D^{27} = -84.48^\circ$ (濃度: 1.018, CHCl₃)

融点 213.8–215.7 °C

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.63 (3H, s), 2.57–2.76 (3H, m), 2.81–2.95 (3H, m), 3.00–3.24 (4H, m), 3.94 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.32 (1H, d, J=9.7 Hz), 6.67 (1H, s), 7.17–7.23 (1H, m), 7.30–7.43 (2H, m), 7.48 (1H, d, J=2.1 Hz), 7.53 (s, 1H)。

30

【1957】

実施例 508

(S)-N-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]アミンの製造 (実施例 507 の化合物の別途合成法)

40

実施例 503 で製造した (S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸 tert-ブチルエステル (0.20 g、0.523 ミリモル) 及び 5-クロロベンゾフラン-2-カルボアルデヒド (0.113 g、0.628 ミリモル) を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 0.4 ml を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=4/1) により精製した。微黄色粉末結晶の (S)-N-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメ

50

チレン) -N- [4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン (0.137 g、収率 59%) 得た。

【1958】

実施例 509

(S)-N-[1-(4-クロロフェニル) エチリデン] -N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミンの製造

実施例 503 で製造した (S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (200 mg、0.52 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 2 ml 及び塩化メチレン (4 ml) の混合物を室温下にて 30 分攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリエチルアミン (4 ml、28.7 ミリモル) を加え、中和した。中和液に 4-クロロアセトフェノン (97 mg、0.63 ミリモル) をエタノール 4 ml に溶解した溶液を加え、4 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン = 3/1) により精製した。微黄色粉末結晶の (S)-N-[1-(4-クロロフェニル) エチリデン] -N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン (39 mg、収率 18%) を得た。

融点 164.6-166.5 °C。

【1959】

対応する出発原料を用い、実施例 509 と同様にして、実施例 510 ~ 実施例 513 の化合物を製造した。

【1960】

実施例 510

(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -N-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチリデン] アミン

融点 167.9-169.4 °C。

【1961】

実施例 511

(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -N-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチリデン] アミン

融点 177.8-180.1 °C。

【1962】

実施例 512

(S)-N-シクロヘキシリデン-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン

融点 178.6-179.3 °C。

【1963】

実施例 513

N-(2-ベンジリデンヘブチリデン)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン

融点 166.6-169.6 °C。

【1964】

実施例 514

10

20

30

40

50

(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミンの製造

実施例504で製造した(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミン(100mg、0.23ミリモル)及びTHF(4ml)の混合物に、氷冷下にて水素化ホウ素ナトリウム(13mg、0.34ミリモル)を加え、室温下にて30分攪拌した。反応液にメタノール1mlを加え、減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1)により精製し、微黄色粉末結晶の(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジル)アミン(32mg、収率31%)を得た。

融点 131.3-135.5℃。

【1965】

実施例515

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イルアミン・二塩酸塩の製造

実施例503で製造した(S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.78ミリモル)、濃塩酸2ml及びメタノール(4ml)の混合物を50℃にて30分攪拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣をメタノール/エーテルから再結晶し、黄色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イルアミン二塩酸塩(265mg、収率91%)を得た。

融点 176℃(分解)。

【1966】

実施例516

3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(2.21g、14.98ミリモル)と3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(2.37g、7.49ミリモル)のエタノール(25ml)懸濁液に炭酸水素ナトリウム(1.32g、15.73ミリモル)を加え、8時間加熱還流した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、微黄色アモルファスの3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(3.27g、収率94%)を得た。

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

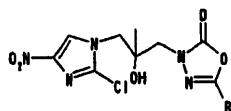
1.53(3H, s), 3.67(1H, d, J=8.8Hz), 3.81(1H, d, J=8.8Hz), 4.49(2H, s), 7.42-7.66(2H, m), 7.86-8.09(2H, m), 8.54(1H, s), 10.98(1H, br)。

【1967】

対応する出発原料を用い、実施例516と同様にして、次表に示す実施例517~実施例523の化合物を製造した。

【1968】

【表 18】



実施例	R	¹ H NMR δ		収率 (%)
517		CDCl ₃	1.59(3H, s), 3.78(1H, d, J=8.5Hz), 3.86(1H, d, J=8.5Hz), 4.29(1H, d, J=15.1Hz), 4.57(1H, d, J=15.1Hz), 7.61(2H, d, J=8.1Hz), 7.79(2H, d, J=8.1Hz), 8.06(1H, s), 9.17(1H, br).	70
518		CDCl ₃	1.61(3H, s), 3.79 (1H, d, J=8.5Hz), 3.85(1H, d, J=8.5Hz), 4.27(1H, d, J=15.0Hz), 4.56(1H, d, J=15.0Hz), 7.33-7.63 (7H, m), 7.78(2H, d, J=8.4Hz), 8.06(1H, s), 9.02(1H, br).	82
519		CDCl ₃	1.62(3H, s), 3.75(1H, d, J=8.5Hz), 3.83(1H, d, J=8.5Hz), 4.27(1H, d, J=15.0Hz), 4.54(1H, d, J=15.0Hz), 7.34(2H, dd, J=1.8Hz, 8.6Hz), 7.63(2H, dd, J=1.8Hz, 8.6Hz), 8.03(1H, s), 9.05(1H, br).	57
520		DMSO-d ₆	1.51(3H, s), 3.66(1H, d, J=8.8Hz), 3.79(1H, d, J=8.8Hz), 4.48(2H, s), 7.24-7.41(2H, m), 7.84-7.96(2H, m), 8.52(1H, s).	64
521		CDCl ₃	1.56(3H, s), 2.41-2.53(2H, m), 2.81-3.00(2H, m), 3.56(1H, d, J=8.5Hz), 3.63(1H, d, J=8.5Hz), 4.22(1H, d, J=15.0Hz), 4.42(1H, d, J=15.0Hz), 7.12(2H, d, J=8.4Hz), 7.26(2H, d, J=8.4Hz), 7.55(1H, br), 7.97(1H, s).	92
522		DMSO-d ₆	1.53(3H, s), 3.63(1H, d, J=8.8Hz), 3.77(1H, d, J=8.8Hz), 4.43(1H, d, J=15.0Hz), 4.51(1H, d, J=15.0Hz), 6.58(1H, d, J=15.9Hz), 7.43-7.55(3H, m), 7.64(2H, d, J=8.5Hz), 7.51(1H, s).	89
523		CDCl ₃	1.56(3H, s), 3.72(2H, s), 4.25(1H, d, J=15.1Hz), 4.44(1H, d, J=15.1Hz), 4.59(2H, s), 6.85(2H, dd, J=2.3Hz, 6.8Hz), 7.29(2H, dd, J=2.3Hz, 6.8Hz), 7.98(1H, s), 8.49 (1H, br).	98

【1969】

実施例 524

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

実施例 516 で製造した 3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン (3.27 g、7.05 ミリモル) の 1,4-ジオキサン (70 ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (0.37 g、9.17 ミリモル) を加え、3 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=4/1) により精製し、アセトニトリル及びエタノールで再結晶し、白色固体の 3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン (1.43 g、収率 48%) を得た。

融点 190-191℃。

【1970】

対応する出発原料を用い、実施例 524 と同様にして、実施例 525～実施例 531 の化合物を製造した。

【1971】

実施例525

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 230-231℃。

【1972】

実施例526

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(ビフェニル-4-イル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 248-249℃。

【1973】

実施例527

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-クロロフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 221-222℃。

【1974】

実施例528

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-フルオロフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 188-191℃。

【1975】

実施例529

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-[2-(4-クロロフェニル)ビニル]-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 249-252℃。

【1976】

実施例530

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-[2-(4-クロロフェニル)エチル]-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 139-140℃。

【1977】

実施例531

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-クロロフェノキシメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 64-66℃。

【1978】

実施例532

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-フェニル-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(170mg、1.15ミリモル)、3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-フェニル-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(310mg、0.9ミリモル)、炭酸水素ナトリウム(120

10

20

30

40

50

mg、1.43ミリモル)及びエタノール(2ml)の混合物を2.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を1,4-ジオキサン(10ml)に溶解し、水素化ナトリウム(55mg、1.38ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌後、1.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノールから再結晶し、淡茶粉末の3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-フェニル-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(127mg、収率32%)を得た。

融点 225-227℃。

10

【1979】

実施例533

5-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

4-メチルベンゼンスルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル(3.9g、18.9ミリモル)、5-(4-クロロベンジル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(5.5g、26.11ミリモル)、炭酸カリウム(3.4g、24.6ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(3.4g、22.68ミリモル)、DMF(40ml)の混合物を室温下にて21時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルを5.47g得た。

20

【1980】

この黄色オイルのうちの2.3g(11.02ミリモル)、2,4-ジニトロ-1H-イミダゾール(2.26g、14.3ミリモル)、酢酸ナトリウム(1.81g、22.07ミリモル)及びエタノール(22ml)の混合物を8時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより抽出し、飽和重曹水により洗浄後、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=3/1)により精製し、白色固体の5-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(240mg、9%)を得た。

30

融点 151-153℃。

【1981】

実施例534

5-(4-ブロモフェニル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

実施例41で製造したメタンスルホン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(1.02g、3.67ミリモル)、5-(4-ブロモフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(680mg、2.82ミリモル)、炭酸カリウム(580mg、4.2ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(890mg、5.94ミリモル)及びDMF(15ml)の混合物を100℃にて3時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、水で3回洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、微黄色粉末の5-(4-ブロモフェニル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(17.4mg、収率2%)を得た。

40

50

融点 231-233℃。

【1982】

実施例535

5-(4-ブロモフェニル)-3-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

実施例40で製造したメタンスルホン酸6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(3.28g、12.46ミリモル)及び5-(4-ブロモフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(1.5g、6.22ミリモル)を用い、実施例534の方法により、淡茶粉末の5-(4-
10
ブロモフェニル)-3-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(312mg、収率12%)を得た。

融点 264℃(分解)。

【1983】

対応する出発原料を用い、実施例535と同様にして、実施例536の化合物を製造した。

【1984】

実施例536

3-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン
20

融点 204-207℃。

【1985】

実施例537

3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-5-(ピリジン-4-イル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

5-(ピリジン-4-イル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(150mg、0.92ミリモル)、水素化ナトリウム(41mg、1.03ミリモル)及びDMF(1.5ml)の混合物を室温下にて1時間攪拌した。反応液に、実施例42で製造したメタンスルホン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチルエステル(200mg、0.69ミリモル)、ヨウ化ナトリウム(140mg、0.93ミリモル)の順に加え、50-60℃にて6時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、水で3回洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=25/1)により精製し、白色粉末の3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-5-(ピリジン-4-イル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(137mg、収率56%)を得た。
30
40

融点 147-149℃。

【1986】

対応する出発原料を用い、実施例537と同様にして、実施例538の化合物を製造した。

【1987】

実施例538

3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-5-(ピラジン-2-イル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 209-212℃。

10

20

30

40

50

【1988】

実施例539

(R)-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オンの製造

5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン(0.68g、2.76ミリモル)及び実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0.50g、2.30ミリモル)のDMF(5ml)溶液に炭酸カリウム(0.38g、2.76ミリモル)を加え、室温で16時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=4/1)により精製し、白色アモルファスの(R)-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン(1.06g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.53 (3H, s), 3.67 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 3.81 (1H, d, $J=8.8\text{ Hz}$), 4.49 (2H, s), 7.42-7.66 (2H, m), 7.86-8.09 (2H, m), 8.54 (1H, s), 10.98 (1H, br)。

【1989】

実施例540

(R)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オンの製造

実施例539で製造した(R)-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン(0.87g、1.88ミリモル)の1,4-ジオキサン(18ml)溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム(98mg、2.44ミリモル)を加え、5時間加熱還流した。減圧濃縮し、氷冷し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、アセトニトリル/イソプロパノールから再結晶し、白色粉末結晶の(R)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン(0.32g、収率40%)を得た。

光学純度 98.2% ee

$[\alpha]_D^{26} = -12.43^\circ$ (濃度: 0.668, CHCl₃)

融点 146-148°C。

【1990】

実施例541

3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(503mg、3.41ミリモル)、3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(700mg、3.41ミリモル)のエタノール(7ml)懸濁液に酢酸ナトリウム(336mg、4.1ミリモル)を加え、8時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、微黄色粉末の3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3H-ベンゾオキサゾール

－2－オン（616mg、収率51%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

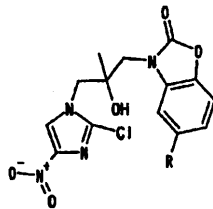
1.31 (3H, s), 3.04 (1H, s), 3.87 (1H, d, $J=14.7\text{Hz}$), 3.98 (1H, d, $J=14.7\text{Hz}$), 4.13 (1H, d, $J=12.5\text{Hz}$), 4.24 (1H, d, $J=14.5\text{Hz}$), 7.08–7.31 (4H, m), 8.04 (1H, s)。

【1991】

対応する出発原料を用い、実施例541と同様にして、次表に示す実施例542及び実施例543の化合物を製造した。

【1992】

【表19】



実施例	R	$^1\text{H NMR } \delta$		収率 (%)
542	Cl	CDCl_3	1.32(3H, s), 3.14(1H, s), 3.87(1H, d, $J=14.7\text{Hz}$), 3.95(1H, d, $J=14.7\text{Hz}$), 4.11(1H, d, $J=14.4\text{Hz}$), 4.25(1H, d, $J=14.4\text{Hz}$), 7.10-7.23(3H, m), 8.03(1H, s).	35
543	F	CDCl_3	1.11(3H, s), 2.66(1H, s), 3.86(1H, d, $J=14.5\text{Hz}$), 3.94(1H, d, $J=14.5\text{Hz}$), 4.16(1H, d, $J=14.3\text{Hz}$), 4.24(1H, d, $J=14.3\text{Hz}$), 6.89-7.00(1H, m), 7.29 (1H, dd, $J=2.7\text{Hz}$, 8.8Hz), 7.37(1H, dd, $J=4.4\text{Hz}$, 8.8Hz), 8.01(1H, s).	33

【1993】

実施例544

3-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

実施例541で製造した3-[3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（615mg、1.74ミリモル）、水素化ナトリウム（76.6mg、1.91ミリモル）、1,4-ジオキサン（15ml）の混合物を1時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン/メタノール=30/1）により精製し、白色粉末の3-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（209mg、収率38%）を得た。

融点 222.7–224.3℃。

【1994】

対応する出発原料を用い、実施例544と同様にして、実施例545及び実施例546の化合物を製造した。

【1995】

実施例545

5-クロロ-3-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

融点 207.6–207.9℃。

【1996】

実施例546

10

20

30

40

50

5-フルオロ-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

融点 246.2-246.8℃。

【1997】

実施例547

5-ブロモ-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(3.22g、21.8ミリモル)、5-ブロモ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(6.2g、21.8ミリモル)、酢酸ナトリウム(1.97g、24ミリモル)、エタノール(50ml)の混合物を8時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣を1,4-ジオキサン60mlに溶解し、水素化ナトリウム(528mg、13.21ミリモル)を加え、70-80℃にて17時間攪拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=30/1)により精製し、白色粉末の5-ブロモ-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(1.82g、収率37%)を得た。

融点 243-245.5℃。

【1998】

実施例548

5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-3-(4-ヒドロキシビフェニル-3-イル)-5-メチルオキサゾリジン-2-オンの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(1.3g、8.78ミリモル)、5-フェニル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(2.47g、8.78ミリモル)、酢酸ナトリウム(792mg、9.66ミリモル)及びエタノール(30ml)の混合物を10時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、白色粉末の5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-3-(4-ヒドロキシ-3-ビフェニル)-5-メチルオキサゾリジン-2-オン(1.82g、収率61%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.55 (3H, s), 3.85 (1H, d, $J=9.5\text{ Hz}$), 3.98 (1H, d, $J=9.5\text{ Hz}$), 4.46 (1H, d, $J=14.9\text{ Hz}$), 4.56 (1H, d, $J=14.9\text{ Hz}$), 6.99 (1H, d, $J=8.4\text{ Hz}$), 7.27 (1H, t, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.36-7.57 (6H, m), 8.52 (1H, s), 10.06 (1H, s)。

【1999】

実施例549

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-フェニル-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

実施例548で製造した5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-3-(4-ヒドロキシ-3-ビフェニル)-5-メチルオキサゾリジン-2-オン(1.23g、2.88ミリモル)、水素化ナトリウム(127mg、3.16ミリモル)及びDMF(100ml)の混合物を100℃にて4時間攪拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出した。有機相を水洗後

、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥し、次いで濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）により精製し、黄茶色粉末結晶の3-〔2-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール-2-イルメチル）-5-フェニル-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（172mg、収率15%）を得た。

融点 254-254.6℃。

【2000】

実施例550

3-〔2-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール-2-イル）エチル〕-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

10

2-ベンゾオキサゾリノン（240mg、1.8ミリモル）、水素化ナトリウム（67mg、1.95ミリモル）及びDMF（10ml）の混合物を室温下にて30分攪拌した。反応液に実施例42で製造したメタンスルホン酸2-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール-2-イル）エチルエステル（500mg、1.7ミリモル）を加え、50-60℃にて4時間攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水中に注いだ。析出物を濾取し、エタノールから再結晶することにより、淡茶粉末の3-〔2-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ〔2, 1-b〕オキサゾール-2-イル）エチル〕-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（320mg、収率56%）を得た。

融点 193-195℃。

20

【2001】

実施例551

3-〔5-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-4-ヒドロキシ-4-メチルペンチル〕-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-〔3-（2-メチル-2-オキシラニル）プロピル〕-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（3.8g、16.3ミリモル）を用い、実施例541の方法により、白色粉末の3-〔5-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-4-ヒドロキシ-4-メチルペンチル〕-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（3.5g、68%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

30

1.20 (3H, s), 1.49-1.70 (2H, m), 1.88-2.07 (2H, m), 2.68 (1H, s), 3.81-3.93 (2H, m), 4.00 (2H, s), 6.98 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 7.09-7.26 (3H, m), 8.00 (1H, s)。

【2002】

実施例552

3-〔6-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-5-ヒドロキシ-5-メチルヘキシル〕-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-〔4-（2-メチル-2-オキシラニル）ブチル〕-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（1.2g、4.86ミリモル）を用い、実施例541の方法により、白色粉末の3-〔6-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-5-ヒドロキシ-5-メチルヘキシル〕-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（1.2g、62%）を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.16 (3H, s), 1.38-1.58 (4H, m), 1.67-1.86 (2H, m), 2.15 (1H, s), 3.87 (2H, t, $J=6.6\text{Hz}$), 3.98 (2H, s), 6.98 (1H, d, $J=7.8\text{Hz}$), 7.08-7.26 (3H, m), 8.01 (1H, s)。

【2003】

実施例553

50

3-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾール-1-イル)プロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

実施例551で製造した3-[5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-ヒドロキシ-4-メチルペンチル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(3.5g、9.2ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末の3-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾール-1-イル)プロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(2.4g、収率76%)を得た。

融点 180-181℃。

【2004】

10

実施例554

3-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾール-1-イル)ブチル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

実施例552で製造した3-[6-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-5-ヒドロキシ-5-メチルヘキシル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(1.2g、3ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末の3-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾール-1-イル)ブチル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン(780mg、収率72%)を得た。

融点 155-158℃。

20

【2005】

実施例555

1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3-メチル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(1.41g、6.46ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末結晶の1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3-メチル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(1.23g、収率63%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

30

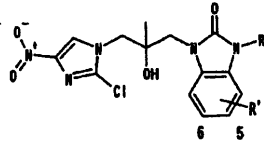
1.23 (3H, s), 3.47 (3H, s), 3.94 (1H, d, $J=12.4\text{ Hz}$), 4.03 (1H, d, $J=12.4\text{ Hz}$), 4.06 (1H, d, $J=11.9\text{ Hz}$), 4.17 (1H, d, $J=11.9\text{ Hz}$), 4.79 (1H, s), 7.00-7.21 (4H, m), 8.09 (1H, s)。

【2006】

対応する出発原料を用い、実施例555と同様にして、次表に示す実施例556～実施例565の化合物を製造した。

【2007】

【表 20】



実施例	R	R'	¹ H NMR δ	収率 (%)
556		H	1.23(3H, s), 1.51(9H, s), 1.75-1.89(2H, m), 2.17(2H, s), 2.20-2.41(2H, m), 2.75-2.91(2H, m), 3.90(1H, d, J=14.2Hz), 4.16(1H, d, J=14.2Hz), 4.25-4.50(3H, m), 7.00-7.23(4H, m), 8.09(1H, s).	78
557	Me	6-Cl	1.24(3H, s), 3.45(3H, s), 3.94(2H, s), 4.06(1H, d, J=14.4Hz), 4.18(1H, d, J=14.4Hz), 6.96(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.9Hz), 7.16(1H, dd, J=1.9 Hz, 8.4 Hz), 8.08(1H, s)	69
558	Me	6-CF ₃	1.26(3H, s), 3.51(3H, s), 3.95(1H, d, J=8.5Hz), 4.03 (1H, d, J=8.5Hz), 4.14(1H, d, J=14.3Hz), 4.21(1H, d, J=14.3Hz), 7.13(1H, d, J=8.3Hz), 7.31(1H, s), 7.48 (1H, d, J=8.3Hz), 8.07(1H, s).	61
559	Me	5-Cl	1.23(3H, s), 3.47(3H, s), 3.91(1H, d, J=14.8Hz), 3.99 (1H, d, J=14.8Hz), 4.05(1H, d, J=14.0Hz), 4.17(1H, d, J=14.0Hz), 6.97(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.9Hz), 7.14(1H, dd, J=1.9Hz, 8.4Hz), 8.07(1H, s).	56
560	Me	6-F	1.24(3H, s), 3.46(3H, s), 3.90(1H, d, J=14.8Hz), 3.97 (1H, d, J=14.8Hz), 4.06(1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 6.79-7.00(3H, m), 8.08(1H, s).	63
561	Et	6-Cl	1.21(3H, s), 1.36(3H, t, J=7.2Hz), 3.84-4.20(6H, m), 6.98(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.8Hz), 7.15 (1H, dd, J=1.8Hz, 8.4Hz), 8.08(1H, s).	77
562	isopropyl	6-Cl	1.24(3H, s), 1.55(6H, d, J=7.0Hz), 3.93(2H, s), 4.06 (1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 4.55-4.75 (1H, m), 7.05(1H, s), 7.18(2H, s), 8.09(1H, s).	69
563	Me	6-NMe ₂	1.23(3H, s), 2.96(6H, s), 3.42(3H, s), 3.89(1H, d, J=14.8Hz), 3.99(1H, d, J=14.8 Hz), 4.05(1H, d, J=14.3 Hz), 4.16(1H, d, J=14.3Hz), 6.39(1H, d, J=2.2Hz), 6.60(1H, dd, J=2.2Hz, 8.6Hz), 6.92(1H, d, J=8.6Hz), 8.10(1H, s).	粗製
564	n-hexyl	6-Cl	0.87(3H, t, J=6.9Hz), 1.16-1.39(9H, m), 1.64 - 1.82 (2H, m), 3.80-3.93(4H, m), 4.05(1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 6.97(1H, d, J=8.4Hz), 7.06 (1H, d, J=1.8Hz), 7.14(1H, dd, J=1.8Hz, 8.4Hz), 8.08 (1H, s).	55
565	Me	6-CO ₂ Et	1.25 (3H, s), 1.42 (3H, t, J=7.1Hz), 3.50 (3H, s), 3.93-4.11 (3H, m), 4.20 (1H, d, J=14.3Hz), 4.40 (2H, q, J=7.1Hz), 7.07 (1H, d, J=8.3Hz), 7.75 (1H, d, J=1.5Hz), 7.94 (1H, dd, J=1.5Hz, 8.3Hz), 8.07 (1H, s).	48

【2008】

実施例 566

1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

実施例 555 で製造した 1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3-メチル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (1.23 g、3.37 ミリモル) を用い、実施例 544 の方法により、白色粉末結晶の 1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミ

10

20

30

40

50

ダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (563mg、収率51%)を得た。

融点 203.2-204.4℃。

【2009】

対応する出発原料を用い、実施例566と同様にして、実施例567～実施例576の化合物を製造した。

【2010】

実施例567

1-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

10

融点 218-219.1℃。

【2011】

実施例568

5-クロロ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 261.9-265.4℃ (分解)。

【2012】

実施例569

1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-5-トリフルオロメチル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

20

融点 232.4-234.7℃。

【2013】

実施例570

6-クロロ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 261.3-263.3℃。

30

【2014】

実施例571

5-フルオロ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 244.2-249.8℃ (分解)。

【2015】

実施例572

5-クロロ-1-エチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

40

融点 240.9-245.6℃。

【2016】

実施例573

5-クロロ-1-イソプロピル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 240.5-244.8℃。

【2017】

実施例574

50

5-ジメチルアミノ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 264.6-268.3℃(分解)。

【2018】

実施例575

5-クロロ-1-(n-ヘキシル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 168.1-169.3℃。

【2019】

実施例576

5-エトキシカルボニル-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 265.8-266.7℃。

【2020】

実施例577

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(758mg、2.7ミリモル)を用い、実施例200の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(70mg、収率13%)を得た。

融点 234.5-234.7℃。

【2021】

対応する出発原料を用い、実施例577と同様にして、実施例578の化合物を製造した。

【2022】

実施例578

1-(4-フルオロフェニル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 254.1-254.7℃。

【2023】

実施例579

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-(3-ピペリジン-4-イル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

実施例567で製造した1-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(371mg、0.74ミリモル)、トリフルオロ酢酸1ml及び塩化メチレン(10ml)の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に飽和重曹水を加え、塩基性とし、析出晶を濾取した。析出晶を繰り返し水洗することにより、微黄色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-(ピペリジン-4-イル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(255mg、収率86%)を得た。

融点 192.3-198.8℃ (分解)。

【2024】

実施例580

4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-1-イル]ピペリジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

実施例579で製造した1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-(ピペリジン-4-イル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(90mg、0.23ミリモル)及び塩化メチレン(5ml)の混合物に、氷冷下にてトリエチルアミン(75mg、0.74ミリモル)、クロロギ酸ベンジル(126mg、0.74ミリモル)の順に加え、室温下にて3時間攪拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/アセトン=1/1)により精製し、白色粉末結晶の4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-1-イル]ピペリジン-1-カルボン酸ベンジルエステル(25mg、収率21%)を得た。

10

融点 181.7-184.6℃。

【2025】

実施例581

1-ベンジル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]イミダゾリジン-2-オンの製造

1-ベンジル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オン(680mg、2.76ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末結晶の1-ベンジル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]イミダゾリジン-2-オン(580mg、収率59%)を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.18 (3H, s), 3.17-3.54 (6H, m), 4.07 (2H, s), 4.37 (2H, s), 7.17-7.40 (5H, m), 8.13 (1H, s)。

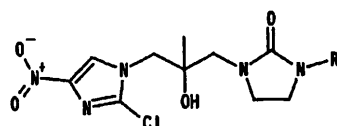
30

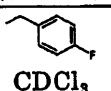
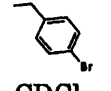
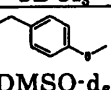
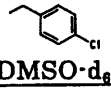
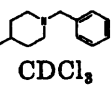
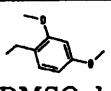
【2026】

対応する出発原料を用い、実施例581と同様にして、次表に示す実施例582～実施例587の化合物を製造した。

【2027】

【表 2 1】



実施例	R (solvent)	¹ H NMR δ	収率 (%)
582	 CDCl ₃	1.19(3H, s), 3.16-3.52(6H, m), 4.06(2H, s), 4.33(2H, s), 6.93-7.09(2H, m), 7.18-7.30(2H, m), 8.13(1H, s).	43
583	 CDCl ₃	1.19(3H, s), 3.16-3.55(6H, m), 4.05(2H, s), 4.31(2H, s), 7.14 (2H, dd, J=2.0Hz, 8.6Hz), 7.46(2H, dd, J=2.0Hz, 8.6 Hz), 8.13 (1H, s).	64
584	 DMSO-d ₆	1.03(3H, s), 3.02-3.27(4H, m), 3.39-3.55(2H, m), 3.73(3H, s), 4.03(2H, s), 4.29(2H, s), 6.90(2H, d, J=8.6Hz), 7.17(2H, d, J=8.6Hz), 8.48(1H, s).	69
585	 DMSO-d ₆	1.04(3H, s), 3.05-3.25(4H, m), 3.36-3.48(2H, m), 4.03(2H, s), 4.22(2H, s), 7.28(2H, d, J=8.3Hz), 7.41(2H, d, J=8.3Hz), 8.48(1H, s).	60
586	 CDCl ₃	1.16(3H, s), 1.59-1.84(4H, m), 2.00-2.18(2H, m), 2.89-3.02 (2H, m), 3.09-3.50(8H, m), 3.61-3.80(1H, m), 4.00(1H, d, J =14.3Hz), 4.09(1H, d, J=14.3Hz), 7.18-7.36(5H, m), 8.12 (1H, s).	粗製
587	 DMSO-d ₆	1.03(3H, s), 3.05-3.23(4H, m), 3.30-3.50(2H, m), 3.75(3H, s), 3.77(3H, s), 4.02(2H, s), 4.20(2H, s), 6.47(1H, dd, J=2.2Hz, 8.3Hz), 6.56(1H, d, J=2.2Hz), 7.06(1H, d, J=8.3Hz), 8.48 (1H, s).	58

【2028】

実施例 588

1-ベンジル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オンの製造

実施例 581 で製造した 1-ベンジル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]イミダゾリジン-2-オン (580mg、1.47ミリモル) を用い、実施例 544 の方法により、白色粉末結晶の 1-ベンジル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン (395mg、収率 75%) を得た。

融点 180.2-180.9℃。

【2029】

対応する出発原料を用い、実施例 588 と同様にして、実施例 589～実施例 594 の化合物を製造した。

【2030】

実施例 589

1-(4-フルオロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン

融点 182.5-183.3℃。

【2031】

実施例 590

1-(4-ブロモベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン

融点 205.7-208.1℃。

【2032】

実施例 591

1-(4-メトキシベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン
融点 158.6-160.5℃。

【2033】

実施例 592

1-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン
融点 208.7-209.8℃。

【2034】

実施例 593

1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.41-1.72 (7H, m), 1.97-2.10 (2H, m), 2.88-2.95 (2H, m), 3.08-3.30 (4H, m), 3.43-3.70 (4H, m), 3.81 (1H, d, J=15.0 Hz), 3.91 (1H, d, J=10.3 Hz), 4.51 (1H, d, J=10.3 Hz), 7.13-7.31 (5H, m), 7.47 (1H, s)。

【2035】

実施例 594

1-(2,4-ジメトキシベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン
融点 175-175.4℃。

【2036】

実施例 595

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オンの製造

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オン (300mg、1.29ミリモル)を用い、実施例200の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オン (59mg、収率26%)を得た。

融点 194.8-197.4℃。

【2037】

実施例 596

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オンの製造

実施例594で製造した1-(2,4-ジメトキシベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン (100mg、0.24ミリモル)、トリフルオロ酢酸2ml及び塩化メチレン (2ml)の混合物を室温下にて1時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え中和し、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をジエチルエーテル処理することにより得られる結晶を濾取し、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オン (50mg、収率78%)を得た。

融点 224.8-229.1℃ (分解)。

【2038】

実施例 597

3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)オキサゾリジン-2-オンの製造

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)オキサゾリジン-2-オン(2.87g、18.23ミリモル)、2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(2.7g、18.23ミリモル)、酢酸ナトリウム(1.64g、20.05ミリモル)及びエタノール(30ml)の混合物を10時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に塩化メチレンを加え、水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を1, 4-ジオキサン50mlに溶解し、水素化ナトリウム(610mg、15.25ミリモル)を加え、終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)オキサゾリジン-2-オン(1.54g、収率40%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

1.59 (3H, s), 3.46-3.71 (4H, m), 4.11-4.30 (4H, m), 8.15 (1H, s)。

【2039】

実施例 598

5-アジドメチル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]オキサゾリジン-2-オンの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(350mg、2.37ミリモル)、5-アジドメチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)オキサゾリジン-2-オン(500mg、2.37ミリモル)、酢酸ナトリウム(214mg、2.61ミリモル)及びエタノール(5ml)の混合物を70℃にて8時間攪拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/2)により精製し、微黄色オイルの5-アジドメチル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]オキサゾリジン-2-オン(640mg、収率75%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.23 (3H, s), 3.17-3.35 (2H, m), 3.43-3.61 (2H, m), 3.67-3.84 (2H, m), 4.01-4.16 (2H, m), 4.68-4.81 (1H, m), 8.04 (1H, s)。

【2040】

実施例 599

5-アジドメチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)オキサゾリジン-2-オンの製造

実施例 598 で製造した5-アジドメチル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]オキサゾリジン-2-オン(1g、2.78ミリモル)を1, 4-ジオキサン10mlに溶解し、水素化ナトリウム(130mg、3.25ミリモル)を加え、80℃にて4時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)により精製し、淡茶色粉末結晶の5-アジドメチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)オキサゾリジン-2-オン(46

mg、収率5%)を得た。

MS 323 (M⁺)

実施例600

1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オンの製造

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン(5.13g、23.04ミリモル)を用い、実施例541の方法により、微黄色油状物の1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン(1.54g、収率36%)を得た。

10

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.23 (3H, s), 3.96 (1H, br), 4.04-4.20 (4H, m), 5.28 (2H, s), 7.00-7.07 (1H, m), 7.11-7.24 (2H, m), 7.30-7.43 (1H, m), 8.07 (1H, s)。

【2041】

実施例601

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オンの製造

20

実施例600で製造した1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン(1.54g、4.20ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微褐色固体の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン(0.58g、収率42%)を得た。

融点 230-231°C。

【2042】

実施例602

1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3,3-ジフルオロ-1,3-ジヒドロインドール-2-オンの製造
3,3-ジフルオロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロインドール-2-オン(1.14g、4.76ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末の1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3,3-ジフルオロ-1,3-ジヒドロインドール-2-オン

30

(968mg、収率53%)を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1.09 (3H, s), 3.73 (1H, d, J=14.5Hz), 3.87 (1H, d, J=14.5Hz), 4.13 (1H, d, J=14.4Hz), 4.21 (1H, d, J=14.4Hz), 5.39 (1H, s), 7.20-7.26 (1H, m), 7.33-7.37 (1H, m), 7.57-7.64 (1H, m), 7.67-7.71 (1H, m)。

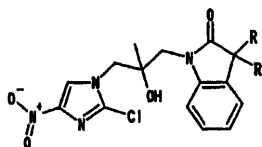
40

【2043】

対応する出発原料を用い、実施例602と同様にして、次表に示す実施例603~実施例604の化合物を製造した。

【2044】

【表 2 2】



実施例	R	¹ H NMR (CDCl ₃) δ
603	Me	1.21(3H, s), 1.38(6H, s), 3.77(1H, d, J=14.8Hz), 3.87(1H, d, J=14.8Hz), 4.05 (1H, d, J=14.3Hz), 4.15(1H, d, J=14.3Hz), 6.91(1H, d, J=7.7Hz), 7.02-7.31 (3H, m), 8.07(1H, s).
604	H	1.24(3H, s), 3.64(2H, s), 3.79(1H, d, J=14.8Hz), 3.89(1H, d, J=14.8Hz), 4.09 (1H, d, J=14.3Hz), 4.19(1H, d, J=14.3Hz), 6.93(1H, d, J=7.7Hz), 7.12(1H, d, J=7.5Hz), 7.25-7.35(2H, m), 8.07(1H, s).

10

【2045】

実施例605

3, 3-ジフルオロ-1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オンの製造

実施例602で製造した1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3, 3-ジフルオロ-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン(903mg、2.34ミリモル)を用い、実施例544の方法により、白色粉末の3, 3-ジフルオロ-1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン(77mg、収率9%)を得た。

20

融点 202-206℃。

【2046】

対応する出発原料を用い、実施例605と同様にして、実施例606の化合物を製造した。

【2047】

実施例606

3, 3-ジメチル-1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1.25 (3H, s), 1.37 (3H, s), 1.78 (3H, s), 3.96 (1H, d, J=15.1Hz), 4.00 (1H, d, J=10.7Hz), 4.22 (1H, d, J=15.1Hz), 4.57 (1H, d, J=10.7Hz), 7.04-7.17 (3H, m), 7.24-7.31 (1H, m), 7.44 (1H, s)。

30

【2048】

実施例607

1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)-2-メチルブタン-2-オール

40

1-エチル-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]-1H-テトラゾール(1.04g、5.59ミリモル)を用い、実施例541の方法により、微黄色油状物の1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)-2-メチルブタン-2-オール(1.15g、収率69%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.29 (3H, s), 1.56 (3H, t, J=7.3Hz), 2.04-2.22 (2H, m), 2.91-3.11 (2H, m), 4.10 (2H, s), 4.24 (1H, br), 4.34 (2H, q, J=7.3Hz), 8.09 (1H, s)。

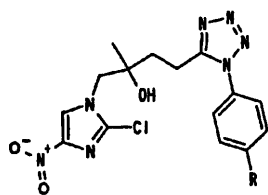
50

【2049】

対応する出発原料を用い、実施例607と同様にして、次表に示す実施例608及び実施例609の化合物を製造した。

【2050】

【表23】



実施例	R	¹ HNMR (CDCl ₃) δ	収率(%)
608	H	1.26(3H, s), 2.02-2.08(2H, m), 2.96-3.17(2H, m), 3.80(1H, s), 4.04(2H, s), 7.42-7.46(2H, m), 7.60-7.62(3H, m), 8.03(1H, s).	60
609	Cl	1.26(3H, s), 2.08-2.12(2H, m), 2.96-3.15(2H, m), 3.85(1H, s), 4.07(s, 2H), 7.40-7.44(2H, m), 7.56-7.61(2H, m), 8.04(1H, s).	66

【2051】

実施例610

2-[2-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)エチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例607で製造した1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)-2-メチルブタン-2-オール(1.15g、3.49ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末結晶の2-[2-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)エチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(68mg、収率7%)を得た。

融点 135-137℃。

【2052】

対応する出発原料を用い、実施例610と同様にして、実施例611及び実施例612の化合物を製造した。

【2053】

実施例611

2-メチル-6-ニトロ-2-[2-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イル)エチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 158-159℃。

【2054】

実施例612

2-{2-[1-(4-クロロフェニル)-1H-テトラゾール-5-イル]エチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 198-200℃。

【2055】

実施例613

3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)チアゾリジン-2,4-ジオンの製造

実施例42で製造したメタンスルホン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチルエステル(280mg、0.96ミリモル)及び5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)チアゾリジン-2,4-ジオン(320mg、1.17ミリモル)を用い、実施例537の方法により、微黄色粉末の3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]

10

20

30

40

50

〕オキサゾール-2-イル)エチル] - 5 - (4-トリフルオロメチルベンジリデン)チアゾリジン-2, 4-ジオン (260 mg、収率58%)を得た。融点 257-258.5℃。

【2056】

実施例614

1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピロリジン-2, 5-ジオンの製造

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピロリジン-2, 5-ジオン (1.96 g、11ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末結晶の1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピロリジン-2, 5-ジオン (589 mg、収率16%)を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

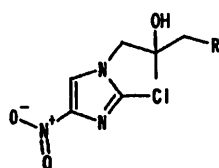
0.96 (3H, s), 2.68 (4H, s), 3.48 (2H, s), 4.02 (2H, s), 5.19 (1H, s), 8.34 (1H, s)。

【2057】

対応する出発原料を用い、実施例614と同様にして、次表に示す実施例615及び実施例616の化合物を製造した。

【2058】

【表24】



実施例	R	¹ H NMR δ (CDCl ₃)	収率 (%)
615		1.21(3H, s), 3.48(1H, s), 3.79(1H, d, J=14.6Hz), 3.90(1H, d, J=14.6Hz), 4.01(1H, d, J=14.9Hz), 4.16(1H, d, J=14.9Hz), 7.75-7.93(4H, m), 8.06(1H, s).	71
616		1.21(3H, s), 4.09(1H, d, J=14.4Hz), 4.18(1H, d, J=14.4Hz), 4.05(1H, d, J=14.3Hz), 4.15(1H, d, J=14.3Hz), 4.42(1H, d, J=14.0Hz), 4.49(1H, d, J=14.0Hz), 7.60-7.74(2H, m), 7.81-8.12(2H, m).	55

【2059】

実施例617

1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピロリジン-2, 5-ジオンの製造

実施例614で製造した1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピロリジン-2, 5-ジオン (589 mg、1.86ミリモル)を用い、実施例544の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピロリジン-2, 5-ジオン (232 mg、収率34%)を得た。

融点 202.5-203.4℃。

【2060】

対応する出発原料を用い、実施例617と同様にして、実施例618及び実施例619の化合物を製造した。

【2061】

実施例618

2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

ー 2-イルメチル) イソインドール-1, 3-ジオン

融点 264-268. 3℃。

【2062】

実施例 619

2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 1-ジオキソ-1, 2-ジヒドロ [d] ベンゾイソチアゾール-3-オン

融点 243-245℃ (分解)。

【2063】

実施例 620

1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-(ピリジン-3-イル)-プロパン-2-オール

の製造
3-(2-メチル-2-オキシラニル) ピリジン (7.4 g、54.75ミリモル) を用い、実施例 541 の方法により、白色粉末の 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-(ピリジン-3-イル)-プロパン-2-オール (3.3 g、収率 24%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.65 (3H, s), 4.19 (1H, d, $J=14.2\text{ Hz}$), 4.27 (1H, d, $J=14.2\text{ Hz}$), 5.82 (1H, s), 7.24-7.30 (1H, m), 7.68-7.72 (1H, m), 8.50-8.53 (1H, m), 8.68 (1H, d, $J=2.3\text{ Hz}$)。

【2064】

実施例 621

2-メチル-6-ニトロ-2-(ピリジン-3-イル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 620 で製造した 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-(ピリジン-3-イル)-プロパン-2-オール (3.3 g、11.7ミリモル) を用い、実施例 544 の方法により、淡茶色粉末結晶の 2-メチル-6-ニトロ-2-(ピリジン-3-イル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (1.8 g、収率 63%) を得た。

融点 212-214℃。

【2065】

実施例 622

2-メチル-6-ニトロ-2-(1-オキシピリジン-3-イル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 621 で製造した 2-メチル-6-ニトロ-2-(ピリジン-3-イル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (800mg、3.3ミリモル) 及び塩化メチレン (25ml) の混合物に、氷冷下にて m-クロロ過安息香酸 (1g、4.06ミリモル) を加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液を濾過し、濾液を 20% 亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮することにより、白色粉末の 2-メチル-6-ニトロ-2-(1-オキシピリジン-3-イル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (330mg、39%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.92 (3H, s), 4.51 (2H, s), 7.42-7.53 (2H, m), 8.14 (1H, s), 8.20-8.24 (1H, m), 8.42 (1H, s)。

【2066】

実施例 623

1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-オンの製造

1-(2-メチルオキシラニルメチル)ピペリジン-4-オン(2.2g、13ミリモル)を用い、実施例597の方法により、微黄色粉末の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-オン(50mg、収率1%)を得た。

融点 124-126℃。

【2067】

実施例624

4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オンの製造

4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オン(1.6g、4.9ミリモル)を用い、実施例541の方法により、微黄色粉末の4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オン(1g、収率43%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.18 (3H, s), 2.45 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 2.57 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 2.72-2.98 (2H, m), 3.19-3.44 (3H, m), 3.55 (1H, d, $J=16.5\text{ Hz}$), 4.00 (1H, d, $J=14.3\text{ Hz}$), 4.10 (1H, d, $J=14.3\text{ Hz}$), 4.64 (2H, s), 7.37 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 7.61 (2H, d, $J=8.2\text{ Hz}$), 8.02 (1H, s)。

【2068】

対応する出発原料を用い、実施例624と同様にして、実施例625の化合物を製造した。

【2069】

実施例625

1-tert-ブチル-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-2-オン

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ ppm:

1.16 (3H, s), 1.44 (9H, s), 2.41 (1H, d, $J=13.8\text{ Hz}$), 2.51 (1H, d, $J=13.8\text{ Hz}$), 2.65-2.88 (3H, m), 2.93-3.09 (1H, m), 3.12-3.28 (2H, m), 3.99 (1H, d, $J=14.3\text{ Hz}$), 4.08 (1H, d, $J=14.3\text{ Hz}$), 8.05 (1H, s)。

【2070】

実施例626

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オンの製造

実施例624で製造した4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オン(1g、2.1ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-2-オン(206mg、収率22%)を得た。

融点 88-93℃。

【2071】

対応する出発原料を用い、実施例626と同様にして、実施例627の化合物を製造した。

【2072】

実施例627

1-tert-ブチル-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-2-オン
融点 193-194℃。

【2073】

実施例628

1-tert-ブチル-4-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]ピペラジン-2-オンの製造

実施例42で製造したメタンスルホン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチルエステル(290mg、1ミリモル)、塩酸1-tert-ブチルピペラジン-2-オン(200mg、1.28ミリモル)、トリエチルアミン(242mg、2.39ミリモル)、ヨウ化カリウム(250mg、1.5ミリモル)及びDMF(3ml)の混合物を70℃にて4時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の1-tert-ブチル-4-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]ピペラジン-2-オン(27mg、収率8%)を得た。

融点 153-154℃。

【2074】

対応する出発原料を用い、実施例628と同様にして、実施例629の化合物を製造した。

【2075】

実施例629

4-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-1-フェニルピペラジン-2-オン

融点 199-202(分解)。

【2076】

実施例630

1-tert-ブチル-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジン-2-オンの製造

実施例39で製造したメタンスルホン酸3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピルエステル(300mg、0.98ミリモル)を用い、実施例628の方法により、白色粉末の1-tert-ブチル-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジン-2-オン(150mg、収率42%)を得た。

融点 147-149℃(分解)。

【2077】

実施例631

1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-ベンズイミダゾール(350mg、1.86ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末結晶の1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール(135mg、収率22%)を得た。

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

0.99(3H, s), 4.06(1H, d, J=14.2Hz), 4.23-4.45

10

20

30

40

50

(3H, m), 5.44 (1H, s), 7.14–7.32 (2H, m), 7.57–7.77 (2H, m), 8.15 (1H, s), 8.36 (1H, s)。

【2078】

対応する出発原料を用い、実施例631と同様にして、実施例632の化合物を製造した。

【2079】

実施例632

1-(イミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.19 (3H, s), 3.86–4.05 (3H, m), 4.13 (1H, d, J=14.2 Hz), 6.87 (1H, s), 6.89 (1H, s), 7.47 (1H, s), 8.08 (1H, s)。

【2080】

実施例633

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1H-ベンズイミダゾールの製造

実施例631で製造した1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール (135mg、0.4ミリモル)を用い、実施例544の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1H-ベンズイミダゾール (72mg、収率60%)を得た。

融点 250.3–251.9℃ (分解)。

【2081】

対応する出発原料を用い、実施例633と同様にして、実施例634の化合物を製造した。

【2082】

実施例634

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾール

融点 245.5–247.8℃。

【2083】

実施例635

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (100mg、0.46ミリモル)、1,2,3,4-テトラヒドロキノリン (122mg、0.92ミリモル)及びDMF (1ml)の混合物を80℃にて8時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、橙色オイルの(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール (134mg、収率83%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.24 (3H, s), 1.94–2.04 (2H, m), 2.39 (1H, m), 2.79–2.85 (2H, m), 3.27–3.42 (4H, m), 6.66–6.72 (2H, m), 6.97–7.08 (2H, m), 8.04 (1H, s)。

【2084】

対応する出発原料を用い、実施例635と同様にして、次表に示す実施例636～実施

10

20

30

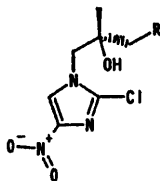
40

50

例 638 の化合物を製造した。

【2085】

【表 25】



実施例	R	¹ H NMR δ (CDCl ₃)	収率 (%)
636		1.18(3H, s), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.66(1H, d, J=13.9Hz), 2.82-2.98(4H, m), 3.76(1H, d, J=14.9Hz), 3.88(1H, d, J=14.9Hz), 4.03(2H, s), 7.00(1H, dd, J=2.3Hz, 7.7Hz), 7.06-7.20(3H, m), 8.01(1H, s).	87
637		1.20(3H, s), 2.55(1H, d, J=13.8Hz), 2.71(1H, d, J=13.8Hz), 3.81(1H, d, J=14.8Hz), 3.91(1H, d, J=14.8Hz), 4.05(4H, s), 7.10-7.23(4H, m), 8.00(1H, s).	93
638		1.11(3H, s), 1.67-1.78(4H, m), 2.37(1H, d, J=14.0Hz), 2.51(1H, d, J=14.0Hz), 2.57-2.82(4H, m), 3.69(1H, s), 3.95(4H, s), 3.99(2H, s), 8.06(1H, s).	100

【2086】

実施例 639

(S)-1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロキノリンの製造

実施例 635 で製造した (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-(3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール (134 mg, 0.38 ミリモル) を用い、実施例 393 の方法により、白色粉末の (S)-1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン (64 mg, 54%) を得た。

融点 168-172 °C。

【2087】

対応する出発原料を用い、実施例 639 と同様にして、実施例 640～実施例 642 の化合物を製造した。

【2088】

実施例 640

S)-2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン

融点 153-155.3 °C。

【2089】

実施例 641

(S)-2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.68(3H, s), 3.01(1H, d, J=14.5 Hz), 3.24(1H, d, J=14.5 Hz), 3.92(1H, d, J=9.6 Hz), 4.08(4H, s), 4.50(1H, d, J=9.6 Hz), 7.13-7.21(4H, m), 7.50(1H, s)。

【2090】

実施例 642

(S)－8－(2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチル)－1, 4－ジオキサ－8－アザスピロ [4, 5] デカン
融点 166.5－168.2℃。

【2091】

実施例643

(2S)－メチル－6－ニトロ－2－[(2S)－(4－トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン－1－イルメチル]－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾールの製造

実施例12で製造した(R)－2－クロロ－1－(2－メチル－2－オキシラニルメチル)－4－ニトロイミダゾール(645mg、2.97ミリモル)、(S)－2－(4－トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン(930mg、3.56ミリモル)及びDMF(15ml)の混合物を80℃にて8時間攪拌した。この反応液に氷冷下にて水素化ナトリウム(154mg、3.86ミリモル)を加え、同温度下にて1時間攪拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン)により精製し、塩化メチレン/イソプロピルエーテルから再結晶し、白色粉末の(2S)－メチル－6－ニトロ－2－[(2S)－(4－トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン－1－イルメチル]－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール(505mg、収率41%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.42－1.52 (1H, m), 1.59 (3H, s), 1.61－1.79 (2H, m), 1.87－1.99 (1H, m), 2.50－2.61 (1H, m), 3.03－3.17 (2H, m), 3.06 (1H, d, J=14.7Hz), 3.20 (1H, d, J=14.7Hz), 3.72－3.79 (2H, m), 3.92 (1H, dd, J=9.2Hz, 3.7Hz), 4.58 (1H, d, J=9.5Hz), 6.80－6.88 (2H, m), 7.15－7.19 (1H, m), 7.42 (1H, s)。

【2092】

実施例644

4－[3－(2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル)－2－ヒドロキシ－2－メチルプロピル] ホモピペラジン－1－カルボン酸tert－ブチルエステルの製造

2－クロロ－4－ニトロ－1H－イミダゾール(8.39g、56.88ミリモル)、4－(2－メチル－2－オキシラニルメチル)ホモピペラジン－1－カルボン酸tert－ブチルエステル(15.38g、56.88ミリモル)及び酢酸ナトリウム(5.13g、62.57ミリモル)の1－プロパノール(100ml)中の混合物を10時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、水洗後、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=5/1)により精製し、赤黄色オイルの4－[3－(2－クロロ－4－ニトロイミダゾール－1－イル)－2－ヒドロキシ－2－メチルプロピル] ホモピペラジン－1－カルボン酸tert－ブチルエステル(6.25g、収率27%)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.14 (3H, s), 1.48 (9H, s), 1.69－1.90 (2H, m), 2.40－2.55 (1H, m), 2.66 (1H, d, J=14.1Hz), 2.75－2.98 (5H, m), 3.30－3.59 (4H, m), 3.96 (2H, s), 8.06 (1H, s)。

【2093】

実施例645

4－(2－メチル－6－ニトロ－2, 3－ジヒドロイミダゾ [2, 1－b] オキサゾール－2－イルメチル) ホモピペラジン－1－カルボン酸tert－ブチルエステルの製造

実施例 644 で製造した 4- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ホモピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.25 g、14.96 ミリモル) を用い、実施例 544 の方法により、白色粉末の 4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ホモピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.07 g、収率 54%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.47 (9H, s), 1.59 (3H, s), 1.68-1.79 (2H, m), 2.63-2.90 (5H, m), 3.06 (1H, d, $J=15.1$ Hz), 3.25-3.50 (4H, m), 3.91 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 4.33 (1H, d, $J=9.7$ Hz), 7.54 (1H, s)。

10

【2094】

実施例 646

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ホモピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸塩の製造

実施例 645 で製造した 4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ホモピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (250 mg、0.655 ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (10 ml) の混合物を室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 10 ml に溶解し、トリエチルアミン (0.27 ml, 1.96 ミリモル) を加え、更にクロロギ酸ベンジル (0.19 ml, 1.31 ミリモル) を加え、室温下にて 3 時間攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=1/1) により精製し、微黄色オイルを得た。得られたオイルを酢酸エチルに溶解し、飽和塩酸/酢酸エチル溶液を加えることにより得られる結晶を濾取し、白色粉末結晶の 4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ホモピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸塩 (246 mg、収率 83%) を得た。

20

融点 115-117 °C。

【2095】

30

実施例 647

2- [4- (4-ビフェニルメチル) ホモピペラジン-1-イルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 645 で製造した 4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ホモピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (346 mg、0.91 ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (10 ml) の混合物を室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 10 ml に溶解し、トリエチルアミン (0.27 ml, 1.96 ミリモル) を加えた。減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール 10 ml に溶解した。この溶液に、4-フェニルベンズアルデヒド (496 mg、2.72 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (171 mg、2.72 ミリモル)、酢酸 (0.17 ml, 2.72 ミリモル) の順に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=5/1) により精製し、無色粉末の 2- [4- (4-ビフェニルメチル) ホモピペラジン-1-イルメチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (251 mg、収率 62%) を得た。

40

融点 138-142.2 °C。

【2096】

実施例 648

50

1'-tert-ブトキシカルボニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール (1.0 g、6.3ミリモル)、1-オキサ-6-アザスピロ [2, 5] オクタン-6-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.0 g、9.5ミリモル) 及び酢酸ナトリウム (612 mg、7.5ミリモル) をエタノール (7 ml) 中にて10時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化メチレンを加え激しく攪拌した。反応液を塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレンジイソプロピルエーテルで結晶化して白色粉末の1'-tert-ブトキシカルボニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (586 mg、収率29%) を得た。

融点 230-232℃。

【2097】

実施例649

4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (3.1 g、21.0ミリモル)、1-オキサ-6-アザスピロ [2, 5] オクタン-6-カルボン酸 tert-ブチルエステル (4.4 g、21.0ミリモル) 及び炭酸水素ナトリウム (1.94 g、23.1ミリモル) をエタノール (20 ml) 中にて6時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、塩化メチレンで抽出後、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製して黄色油状物質の4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (5.4 g、収率72%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.45-1.71 (5H, m), 1.46 (9H, s), 3.03-3.14 (2H, m), 3.90-4.03 (2H, m), 4.02 (2H, s), 7.91 (1H, s)

。

【2098】

実施例650

4-{2-[4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル]-2-オキソエチル} ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1.29 g、8.76ミリモル)、4-{2-(1-オキサ-6-アザスピロ [2, 5] オクタン-6-イル)-2-オキソエチル} ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.97 g、8.76ミリモル) 及び炭酸水素ナトリウム (809 mg、9.64ミリモル) をエタノール (10 ml) 中にて5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出後、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製して黄色油状物質の4-{2-[4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル]-2-オキソエチル} ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.58 g、収率61%) を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.45 (9H, s), 1.53-1.71 (4H, m), 2.44 (4H, br), 2.96-3.04 (1H, m), 3.10-3.27 (2H, m), 3.35-3.48 (4H, m), 3.90-3.96 (2H, m), 4.05 (2H, s), 4.32-4.37 (2H, m), 8.04 (1H, s)。

【2099】

6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-オキサ-6-アザスピロ[2,5]オクタンを用い、実施例650と同様にして、実施例651の化合物を製造した。

【2100】

実施例651

4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-オール

淡桃色粉末、収率54%

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.60-1.66 (2H, m), 1.82-1.93 (3H, m), 3.10-3.22 (2H, m), 3.62-3.67 (2H, m), 4.07 (2H, s), 6.95 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.50 (2H, d, $J=8.7\text{ Hz}$), 7.99 (1H, s)。

10

【2101】

実施例652

1'-tert-ブトキシカルボニル-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]の製造(実施例648の化合物の別途合成法)

実施例649で製造した4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(26.7g、74.0ミリモル)を1,4-ジオキサン(200ml)に溶解した。この溶液に氷冷下、水素化ナトリウム(3.6g、88.8ミリモル)を加え、8時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に氷水、塩化メチレンを加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、メタノールで洗浄後、減圧乾燥して一次晶として16.4gを得た。更に先の濾液を塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過して得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣にメタノールを加え結晶化を行なって二次晶として2.7gを得た。一次晶及び二次晶を合わせて、白色粉末の1'-tert-ブトキシカルボニル-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン](19.1g、収率79%)を得た。

20

融点 230-232℃。

30

【2102】

実施例653

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

実施例650で製造した4-{2-[4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル]-2-オキソエチル}ピペラジンカルボン酸tert-ブチルエステル(2.58g、5.3ミリモル)をジオキサン(30ml)に溶解した。この溶液に氷冷下水素化ナトリウム(254mg、6.36ミリモル)を加え、終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に氷水、酢酸エチルを加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、酢酸エチルで洗浄後、減圧乾燥し、白色粉末の4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(996mg、収率42%)を得た。

40

融点 211.0-213.0℃。

【2103】

対応する出発原料を用い、実施例653と同様にして、実施例654の化合物を製造した。

【2104】

実施例654

50

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロ-1'-(4-トリフルオロメチルフェニル)-スピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]

白色粉末、収率79%

MS; 368 (M⁺)

融点 249.2-250.1℃。

【2105】

実施例655

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]・トリフルオロ酢酸塩の製造

実施例652で製造した1'-tert-ブトキシカルボニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (42g、0.13モル)を塩化メチレン (100ml) に懸濁し、氷冷下トリフルオロ酢酸 (60ml) を滴下して加え、室温で終夜攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、メタノールを加え、結晶化した。これを濾取してメタノール、酢酸エチルで洗浄して減圧乾燥し、淡茶色粉末の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]・トリフルオロ酢酸塩 (43.6g、収率99%) を得た。

MS 224 (M⁺)

融点 196-198℃ (分解)

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

2.06-2.32 (4H, m), 3.12-3.35 (4H, m), 4.24 (2H, s), 8.21 (1H, s), 8.88 (2H, bs)。

【2106】

実施例656

1'-アセチル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (85.5mg、0.25ミリモル)を塩化メチレン (5ml) に懸濁し、トリエチルアミン (74μl) 及びアセチルクロリド (20μl) を加え、1時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣にメタノール、水を加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、イソプロピルエーテルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-アセチル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (37.8mg、収率56%) を得た。

MS: 266 (M⁺)

融点 232.0-234.0℃。

【2107】

実施例657

1'-(4-トリフルオロメチルフェニルアセチル)-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (300mg、0.89ミリモル)を塩化メチレン (5ml) に懸濁し、トリエチルアミン (0.4ml、2.66ミリモル) 及び (α, α, α-トリフルオロ-p-トリル) 酢酸クロリド (2.7ml、1.33ミリモル) を加え、1時間室温で攪拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-(4-トリフルオロメチルフェニルアセチル)-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (143mg、収率39%) を得た。

MS: 410 (M^+)

融点 185.0–187.0°C。

【2108】

実施例658

1'- (3, 4-ジクロロフェノキシアセチル)-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (300mg、0.89ミリモル)、(3, 4-ジクロロフェニル) 酢酸 (294mg、1.24ミリモル) 及びWSCD (255mg、1.24ミリモル) をDMF (5ml) 中室温にて1.5時間 10
攪拌した。反応液に水、ジエチルエーテルを加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、ジエチルエーテルで洗浄後、減圧乾燥し、白色粉末の1'- (3, 4-ジクロロフェノキシアセチル)-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (96mg、収率25%) を得た。

融点 218.0–220.0°C。

【2109】

実施例659

2, 3-ジヒドロ-1'-メチル-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩をフリー化して得られる 20
2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (250mg、1.12ミリモル) をメタノール (5ml) に懸濁した。この懸濁液に、37%ホルムアルデヒド溶液 (0.25ml、3.35ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (210mg、3.35ミリモル) 及び酢酸 (0.19ml、3.35ミリモル) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルで結晶し、白色粉末の2, 3-ジヒドロ-1'-メチル-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (160mg、収率60%) を得 30
た。

MS: 238 (M^+)

融点 237.0–239.0°C (分解)。

【2110】

実施例660

1'-ベンゼンスルホニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (197mg、0.88 40
ミリモル) を塩化メチレン (5ml) に懸濁し、トリエチルアミン (0.36ml、2.64ミリモル) 及びベンゼンスルホニルクロリド (0.28ml、2.10ミリモル) を加え、室温で30分攪拌した。反応液にジイソプロピルエーテル、水を加え激しく攪拌した。析出物を濾取し、水、ジイソプロピルエーテルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-ベンゼンスルホニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (210mg、収率66%) を得た。

MS: 364 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1.99–2.18 (4H, m), 2.49–2.63 (2H, m), 3.40–3.54 (2H, m), 4.10 (2H, s), 7.65–7.81 (5H, m), 8.21 (50

1 H, s)。

【2111】

対応する出発原料を用い、実施例660と同様にして、実施例661の化合物を製造した。

【2112】

実施例661

1'-メタンスルホニル-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm:

1.98-2.22 (4H, m), 2.94 (3H, s), 3.04-3.13 (2H, m), 3.43-3.51 (2H, m), 4.16 (2H, s), 8.17 (1H, s)

10

【2113】

実施例662

1'-ベンジルオキシカルボニル-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]の製造

実施例655で製造した2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(250mg、0.74ミリモル)を塩化メチレン(5ml)に懸濁し、トリエチルアミン(0.40ml、2.96ミリモル)及びクロロギ酸ベンジル(0.32ml、2.22ミリモル)を加え、室温で30分攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-ベンジルオキシカルボニル-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン](224mg、収率84%)を得た。

20

融点 175.0-177.0℃。

【2114】

実施例663

1'-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]の製造

30

実施例655で製造した2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(33g、97.6ミリモル)をDMF(200ml)に懸濁し、トリエチルアミン(20ml、0.15モル)を加えて攪拌した。そこへ4-トリフルオロメチルベンジルアルコール(25.8g、0.15モル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール(23.7g、0.15モル)をDMF(100ml)に溶解し、3時間室温で攪拌した混合物を加え、70℃で2時間攪拌した。反応液を減圧留去して、残渣に水を加え、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により分離精製し、酢酸エチル-イソプロピルエーテルから再結晶を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン](37.2g、収率90%)を得た。

40

融点 189-190℃。

【2115】

対応する出発原料を用い、実施例663と同様にして、実施例664及び実施例665の化合物を製造した。

【2116】

実施例664

1'-[(4-トリフルオロメトキシ)ベンジルオキシカルボニル]-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]

50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 80–1. 93 (2H, m), 2. 13–2. 19 (2H, m), 3. 32–3. 42 (2H, m), 4. 00–4. 20 (2H, m), 4. 03 (2H, s), 5. 14 (2H, s), 7. 20–7. 23 (2H, m), 7. 38–7. 46 (2H, m), 7. 54 (1H, s)。

【2117】

実施例665

1'-(4-ホルミルアミノベンジルオキシカルボニル)-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

1. 85–2. 10 (4H, m), 3. 15–3. 40 (2H, m), 3. 65–3. 85 (2H, m), 4. 16 (2H, s), 5. 03 (2H, s), 7. 33 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7. 58 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 8. 15 (1H, s), 8. 27 (1H, s)。

【2118】

実施例667

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸フェニルアミドの製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(100mg、0.30ミリモル)をDMF 5mlに懸濁し、トリエチルアミン(43 μ l、0.31ミリモル)及びフェニルイソシアネート(34 μ l、0.31ミリモル)を加え、室温で30分撹拌した。反応液に水を加え撹拌して、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製し、酢酸エチルより再結晶を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸フェニルアミド(90mg、収率88%)を得た。

MS; 343 (M^+)

融点 229–232 $^{\circ}\text{C}$ (分解)。

【2119】

4-イソシアン酸ピリジン又はイソシアン酸ベンジルを用い、実施例667と同様にし、実施例668及び実施例669の化合物を製造した。

【2120】

実施例668

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸4-ピリジンアミド

融点 217–219 $^{\circ}\text{C}$ 。

【2121】

実施例669

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸ベンジルアミド

融点 244–247 $^{\circ}\text{C}$ (分解)。

【2122】

実施例670

4-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-イルカルボニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

トリホスゲン(227mg、0.77ミリモル)をトルエン10mlに溶解し氷冷した。この溶液に、ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(425mg、2.28ミリモル)及びジイソプロピルエチルアミン(0.4ml、2.28ミリモル)を

10

20

30

40

50

加え、1時間攪拌した後、続いて実施例655で製造した2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(700mg、2.07ミリモル)を加え、室温で1時間攪拌し、更に1時間加熱還流した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/アセトン=10/1)により精製した後、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルで結晶化して、白色粉末の4-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イルカルボニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(342mg、収率38%)を得た。

10

融点 260.0-265.0℃(分解)

¹H-NMR(CDC1₃) δ ppm:

1.47(9H, s), 1.90-2.02(2H, m), 2.10-2.16(2H, m), 3.23-3.47(10H, m), 3.60-3.66(2H, m), 3.96(2H, s), 7.54(1H, s)。

【2123】

ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル又は1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジンをを用い、実施例670と同様にして、実施例671~実施例672の化合物を製造した。

20

【2124】

実施例671

4-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イルカルボニル)ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

融点 221-223℃。

【2125】

実施例672

1-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イルカルボニル)-4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン

30

融点 226-230℃(分解)。

【2126】

実施例673

2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸4-(ジメチルアミノ)フェニルアミドの製造

実施例655で製造した2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(200mg、0.59ミリモル)をDMF(5ml)に懸濁し、トリエチルアミン(0.1ml、0.72ミリモル)を加え攪拌した。そこへN,N-ジメチル-p-フェニレンジアミン(132mg、0.98ミリモル)及び1,1'-カルボニルジイミダゾール(82.7mg、1.02ミリモル)をDMF(5ml)に溶解し3時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で30分攪拌した。反応液に水を加え、攪拌して、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製し、酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の2,3-ジヒドロ-6-ニトロースピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸4-(ジメチルアミノ)フェニルアミド(181mg、収率79%)を得た。

40

MS 386(M⁺)

融点 244-247℃(分解)。

【2127】

50

4-トリフルオロメチルベンジルアミンまたは4-トリフルオロメトキシベンジルアミンを用い、実施例673と同様にして、実施例674及び実施例675の化合物を製造した。

【2128】

実施例674

2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルアミド

融点 215-217℃。

【2129】

実施例675

2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルアミド

融点 223-225℃。

【2130】

実施例676

2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-カルボチオ酸4-クロロフェニルアミドの製造

実施例655で製造した2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(200mg、0.59ミリモル)をDMF(5ml)に懸濁し、トリエチルアミン(0.24ml、1.77ミリモル)及びイソチオシアン酸4-クロロフェニル(200mg、1.18ミリモル)を加え、室温で30分撹拌した。反応液に水を加え撹拌して、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルで結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-チオカルボン酸4-クロロフェニルアミド(222mg、収率87%)を得た。

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

2.02-2.19(4H, m), 3.59-3.69(2H, m), 4.19(2H, s), 4.40-4.54(2H, m), 7.30-7.37(4H, m), 8.18(1H, s), 9.48(1H, s)。

【2131】

実施例677

4-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルカルボニル]アミノ安息香酸の製造

4-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルカルボニル]アミノ安息香酸tert-ブチルエステル(150mg、0.68ミリモル)を塩化メチレン(1ml)に溶解し、トリフルオロ酢酸(5ml)を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣にメタノール-酢酸エチルを加えて結晶化を行い、白色粉末の4-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルカルボニル]アミノ安息香酸(59mg、収率45%)を得た。

融点 >300℃

¹H-NMR(DMSO-d₆) δ ppm:

1.92-2.12(4H, m), 3.32-3.39(2H, m), 3.86-3.95(2H, m), 4.17(2H, s), 7.45(2H, d, J=8.8Hz), 7.82(2H, d, J=8.8Hz), 8.17(1H, s), 8.97(1H, s), 12.54(1H, s)。

【2132】

実施例678

10

20

30

40

50

2-[(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル] ベンゾチアゾールの製造

実施例 655 で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (84 mg、0.25 ミリモル) を DMF (3 ml) に懸濁し、トリエチルアミン (76 μ l、0.55 ミリモル) 及び 2-クロロベンゾチアゾール (40 μ l、0.30 ミリモル) を加え、80 °C で 1 時間攪拌した。反応液を減圧留去して、残渣に水を加え、析出物を濾取した。これを塩化メチレン-メタノールで結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の 2-[(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル] ベンゾチアゾール (55 mg、収率 62%) を得た。

10

MS ; 357 (M^+)

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm :

2.05-2.23 (4H, m), 3.52-3.63 (2H, m), 3.89-3.97 (2H, m), 4.18 (2H, s), 7.05-7.12 (1H, m), 7.26-7.32 (1H, m), 7.46-7.49 (1H, m), 7.76-7.80 (1H, m), 8.18 (1H, s)。

【2133】

5-クロロ-1-フェニル-1H-テトラゾールを用い、実施例 678 と同様にして、実施例 679 の化合物を製造した。

20

【2134】

実施例 679

5-[(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル] -1-フェニル-1H-テトラゾール

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm :

2.05-2.09 (4H, m), 3.24-3.40 (4H, m), 4.14 (2H, s), 7.59-7.72 (5H, m), 8.15 (1H, s)。

【2135】

実施例 680

4-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イルアセチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

30

実施例 655 で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (700 mg、2.07 ミリモル) を DMF 20 ml に懸濁し、4-(クロロアセチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (599 mg、2.28 ミリモル)、ジイソプロピルエチルアミン (0.8 ml、4.57 ミリモル) 及びヨウ化ナトリウム (310 mg、2.07 ミリモル) を加え、100 °C で 3 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル、水を加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、酢酸エチルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の 4-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イルアセチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (688 mg、収率 74%) を得た。

40

融点 > 300 °C

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm :

1.41 (9H, s), 1.95-2.01 (4H, m), 2.43-2.64 (4H, m), 3.21 (2H, s), 3.26-3.42 (6H, m), 3.50-3.52 (2H, m), 4.12 (2H, s), 8.14 (1H, s)。

【2136】

2-クロロ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル) アセタミド又は 3-(3-クロロプロピル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンを用い、実施例 680 と同様にして

50

、実施例 681 及び実施例 682 の化合物を製造した。

【2137】

実施例 681

(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル酢酸(4-トリフルオロメチルフェニル)アミド
融点 273-275℃ (分解)。

【2138】

実施例 682

3-[3-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル]プロピル-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン
融点 190-192℃。

【2139】

実施例 683

4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イルエチル]ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 655 で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]トリフルオロ酢酸塩(200mg、0.59ミリモル)を DMF 5ml に懸濁し、4-(2-クロロエチル)ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(150mg、0.60ミリモル)、トリエチルアミン(0.25ml、1.79ミリモル)及びヨウ化ナトリウム(108mg、0.72ミリモル)を加え、50℃で5時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル、水を加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、酢酸エチルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の 4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イルエチル]ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(80mg、収率31%)を得た。

融点 214-215℃。

【2140】

実施例 684

4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジーン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

実施例 653 で製造した 4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(300mg、0.67ミリモル)を塩化メチレン 5ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 5ml を加え、室温で6時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 1ml ずつ加えた。反応液を室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣を DMF 15ml に溶解した。そこへ 4-トリフルオロメチルベンジルアルコール(293mg、1.67ミリモル)及び 1, 1'-カルボニルジイミダゾール(270mg、1.67ミリモル)を DMF 5ml に溶解し3時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、微桃色粉末の 4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジーン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステル(324mg、収率88%)を得た。

。

10

20

30

40

50

MS 553 (M+H)⁺

融点 139.0-141.0℃。

【2141】

対応する出発原料を用い、実施例684と同様にして、実施例685の化合物を製造した。

【2142】

実施例685

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

融点 137-139℃。

【2143】

実施例683で製造した4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルを用い、実施例684と同様にして、実施例686~実施例689の化合物を製造した。

【2144】

実施例686

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルエチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-クロロベンジルエステル

融点 178-179℃。

【2145】

実施例687

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルエチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

融点 174-175℃。

【2146】

実施例688

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルエチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

融点 176-177℃。

【2147】

実施例689

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルエチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-ビフェニルメチルエステル

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.90-2.05 (2H, m), 2.15-2.20 (2H, m), 2.40-2.80 (12H, m), 3.45-3.60 (4H, m), 3.99 (2H, s), 5.17 (2H, s), 7.31-7.62 (10H, m)。

【2148】

実施例680で製造した4-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イルアセチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルを用い、実施例684と同様にして、実施例690の化合物を製造した。

【2149】

実施例690

10

20

30

40

50

4- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イルアセチル) ピペラジン-1-カルボン酸 4- (トリフルオロメチル) ベンジルエステル

融点 137-139℃。

【2150】

実施例 691

1- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) -2- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] エタノンの製造

実施例 653 で製造した 4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) -2-オキソエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (300mg、0.67ミリモル) を塩化メチレン 5ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 10ml を加え、室温で 6 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 1ml ずつ加えた。室温で 5 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をメタノール 10ml に溶解し、氷冷下 4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド (0.23ml、1.67ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (105mg、1.67ミリモル) 及び酢酸 0.1ml を加え、室温まで昇温し、終夜攪拌した。次いでこれに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え攪拌した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により分離精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の 1- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) -2- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] エタノン (226mg、収率 67%) を得た。

MS: 508 (M⁺)

融点 145-147℃。

【2151】

対応する出発原料を用い、実施例 691 と同様にして、実施例 692 の化合物を製造した。

【2152】

実施例 692

1- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) -2- [(4-フェニルベンジル) ピペラジン-1-イル] エタノン

融点 187-188℃。

【2153】

実施例 680 で製造した 4- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イルアセチル) ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルを用い、実施例 691 と同様にして、実施例 693 及び実施例 694 の化合物を製造した。

【2154】

実施例 693

1- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イルアセチル) -4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン

融点 195-197℃ (分解)。

【2155】

実施例 694

1- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-

10

20

30

40

50

2, 4'-ピペリジン]-1'-イルアセチル)-4-(4-フェニルベンジル)ピペラジン

融点 226-227℃(分解)。

【2156】

実施例695

4-[(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルフェニル)アミドの製造

実施例653で製造した4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.67ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸10mlを加え、室温で4時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを1mlずつ加えた。室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF10mlに溶解した。そこへ4-アミノベンゾトリフルオリド(0.17ml、1.33ミリモル)及び1, 1'-カルボニルジイミダゾール(220mg、1.33ミリモル)をDMF5mlに溶解し3時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で2時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の4-[(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルフェニル)アミド(213mg、収率59%)を得た。

融点 153.0-155.0℃。

【2157】

実施例696

2-{4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-イル}-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセトアミドの製造

実施例653で製造した4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.67ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸10mlを加え、室温で6時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に塩化メチレン及びトリエチルアミンを1mlずつ加えた。室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をDMF10mlに溶解し、2-ブロモ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アセタミド(207mg、0.73ミリモル)及びトリエチルアミン(0.28ml、2.0ミリモル)を加え、100℃で2時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により分離精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の2-{4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-イル}-N-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]アセトアミド(275mg、収率75%)を得た。

MS 552 (M+1)⁺

融点 133.0-135.0℃。

【2158】

実施例697

10

20

30

40

50

2-[4-(ベンゾオキサゾール-2-イル)ピペラジン-1-イル]-1-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)エタノンの製造

実施例653で製造した4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(227mg、0.50ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、室温で4時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に塩化メチレン及びトリエチルアミンを1mlずつ加えた。室温にて5分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をDMF 5mlに溶解し、トリエチルアミン(0.21ml、1.52ミリモル)及び2-クロロベンゾオキサゾール(86μl、0.76ミリモル)を加え、80℃で2時間攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン-酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、淡黄色粉末の2-[4-(ベンゾオキサゾール-2-イル)ピペラジン-1-イル]-1-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)エタノン(99mg、42%)を得た。

MS 467 (M⁺)

融点 260.0-263.0℃(分解)。

【2159】

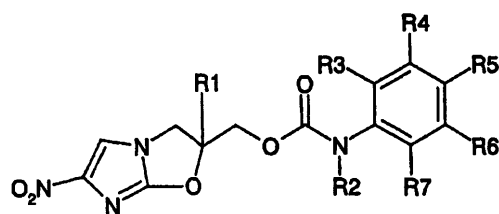
適当な出発原料を用い、上記実施例1-697と同様の方法により製造した化合物を下記表26-77に示す。

【2160】

10

20

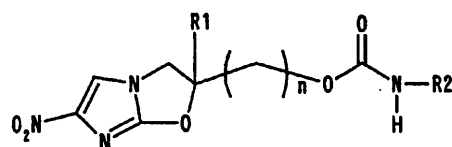
【表 2 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	mp(°C)
698	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	193-195
699	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	195-197.5
700	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	189-190
701	-H	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	182-183
702	-H	-H	-H	-H	-H	-H	-H	185-186
703	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	177.5 - 179
704	-CH ₃	-H	-H	-H	-F	-H	-H	194-196
705	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	145-147
706	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	-H	190.5-192
707	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-Cl	163-164
708	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	177-180
709	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	182-183.5
710	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	179-182
711	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-F	142 - 144
712	-CH ₃	-H	-H	-H	-Br	-H	-H	197 - 199
713	-CH ₃	-H	-H	-H	-CONH ₂	-H	-H	234 - 235 dec
714	-CH ₃	-H	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	151 - 152
715	-CH ₃	-H	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	196 - 199
716	-CH ₃	-H	-H	-H	-SO ₂ NH ₂	-H	-H	218 - 220 dec
717	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	112 - 114
718	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	132 - 134
719	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-Br	-H	-H	132 - 133
720	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	198.5 - 200
721	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	163.5 - 164.8
722	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	129 - 130
723	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	138 - 140
724	-CH ₃	-H	-H	-H	Morpholino-	-H	-H	223-225
725	-CH ₃	-H	-H	-H	Morpholino-	-H	-H	134-135
726	-CH ₃	-H	-H	-H	C ₆ H ₁₃ NHCO-	-H	-H	197-198

【 2 1 6 1 】

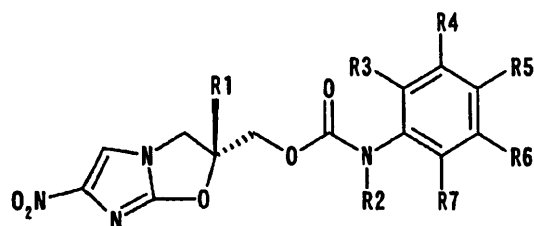
【表 2 7】



実施例	n	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR
727	1	-H	-CH ₂ Ph	143.5-145
728	1	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	187-188.5
729	1	-CH ₃	-CH ₂ Ph	141 - 142
730	1	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ Ph	124 - 127
731	1	-CH ₃	-cyclo-C ₆ H ₁₁	176 - 178
732	1	-CH ₃	-4-PYRIDYL	151 - 153 (dec)
733	1	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	163 - 165
734	1	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	142 - 143
735	1	-CH ₃	-C ₆ H ₁₃	129 - 130
736	1	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	94 - 96
737	1	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Cl	DMSO-d ₆ , 1.59(3H, s), 3.22-3.33(2H, m), 3.57(2H, t, J=6.0Hz), 4.07(2H, dd, J=11.1Hz, 27.6Hz), 4.27(2H, dd, J=7.6Hz, 9.9Hz), 6.47-6.59(1H, m), 8.13(1H, s)
	1	-H	-C ₈ H ₁₇	DMSO-d ₆ , 0.85(3H, t, J=6.9Hz), 1.00-1.45(12H, m), 2.90-2.98(2H, m), 4.06(1H, dd, J=6.8Hz, 10.8Hz), 4.25-4.46(3H, m), 5.48-5.66(1H, m), 7.28(1H, t, J=5.6Hz), 8.13(1H, s)
738				
739	2	-H	C ₈ H ₁₇ -	86-88
740	2	-CH ₃	Ph-	131-133
741	2	-CH ₃	PhCH ₂ -	127-127.5
742	2	-CH ₃	PhCH ₂ CH ₂ -	124-125

【 2 1 6 2 】

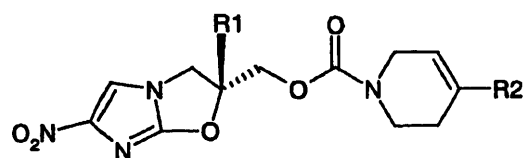
【表 2 8】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	mp(°C)
743	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	103 - 104
744	-CH ₃	-CH ₂ Ph	-H	-H	-Cl	-H	-H	168 - 169
745	-CH ₃	-C ₆ H ₁₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	98 - 100
746	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-Br	-H	-H	147 - 150
747	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	140 - 141
748	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	111 - 113
749	-CH ₃	-C ₄ H ₉	-H	-H	-Cl	-H	-H	114 - 116
750	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-H	-H	-Cl	-H	-H	87 - 89
751	-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-Cl	-H	-H	161 - 165
752	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	-H	-H	-Cl	-H	-H	175 - 178

【 2 1 6 3 】

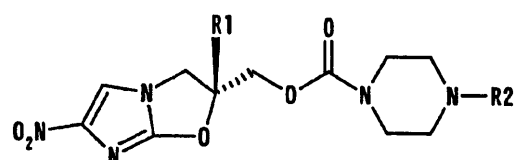
【表 29】



実施例	R1	R2	mp(°C)
753	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	165 - 166
754	-CH ₃	4-CH ₃ OPh-	155 - 157
755	-CH ₃	4-ClPh-	157 - 158
756	-CH ₃	3-CF ₃ Ph-	100 - 101
757	-CH ₃	4-BrPh-	168 - 170
758	-CH ₃	4-FPh-	151 - 154

【2164】

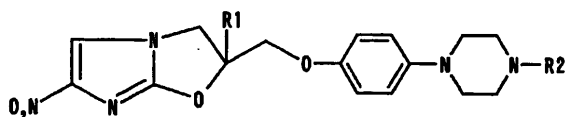
【表 30】



実施例	R1	R2	mp(°C)
759	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	151 - 153
760	-CH ₃	4-ClPh-	143 - 144
761	-CH ₃	3-ClPh-	136 - 138
762	-CH ₃	3,4-Cl ₂ Ph-	142 - 143
763	-CH ₃	4-CH ₃ OPh-	163 - 164
764	-CH ₃	3-CF ₃ Ph-	105 - 107
765	-CH ₃	4-FPh-	139 - 140
766	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	166 - 167
767	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ OCO-	186 - 188
768	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	205 - 206
769	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	133 - 134

【2165】

【表 31】



実施例	R1	R2	mp(°C) or 1H NMR
770	-CH ₃	4-ClPh-	228.8 - 232.2
771	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	236.2 - 237.4
772	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	CDCl ₃ : 1.76(3H, s), 3.03(4H, br), 3.62-3.67(4H, m), 4.01(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 5.15(2H, s), 6.76-6.80(2H, m), 6.85-6.89(2H, m), 7.19-7.23(2H, m), 7.38-7.42(2H, m), 7.54(1H, s)
773	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	174.2 - 175
774	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	155.5 - 156.5
775	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ OCO-	155 - 159.8

【2166】

10

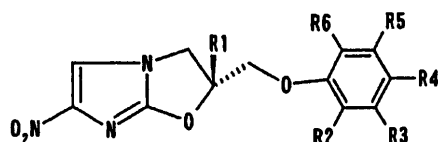
20

30

40

50

【表 3 2】

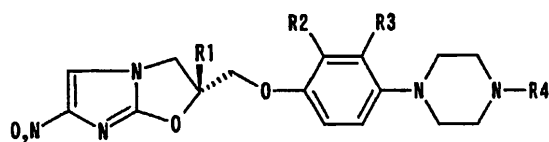


実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
776	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	151 - 153.5
777	-CH ₃	-H	-H	-I	-H	-H	220 - 221
778	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	185 - 186.5
779	-CH ₃	-H	-H	Morpholino-	-H	-H	233 - 240 dec
780	-CH ₃	-H	-H	Piperidino-	-H	-H	217 - 218.5 dec

10

【 2 1 6 7 】

【表 3 3】



実施例	R1	R2	R3	R4	mp(°C) or ¹ H NMR
781	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	230 - 231.5 dec
782	-CH ₃	-H	-Cl	-CH ₃	201 - 204.5 dec
783	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ Ph-	258 - 259 dec
784	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhCH ₂ -	207 - 208.4
785	-CH ₃	-H	-H	4-ClPh-	251 - 257 dec
786	-CH ₃	-H	-H	CH ₃ CO-	206 - 207.5
787	-CH ₃	-H	-Cl	C ₂ H ₅ OCO-	168.5 - 171
788	-CH ₃	-Cl	-H	t-BuOCO-	192 - 194.5
789	-CH ₃	-Cl	-H	C ₂ H ₅ OCO-	178.5 - 180.5
790	-CH ₃	-Cl	-Cl	t-BuOCO-	233 - 233.5 dec
791	-CH ₃	-Cl	-Cl	C ₂ H ₅ OCO-	224.2 - 225.7
792	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₂ CF ₃	213 - 216
793	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₄ H ₉	197.5 - 199
794	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ (CH ₂) ₇ CH ₃	198 - 201
795	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ (CH ₂) ₂ OCH ₃	176 - 179
796	-CH ₃	-H	-Cl	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	153 - 155
797	-CH ₃	-Cl	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	176 - 176.8
798	-CH ₃	-Cl	-Cl	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	196.5 - 197.5
799	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	187 - 189
800	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ OCO-	180.5 - 182.5
801	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ OCO-	185 - 187
802	-CH ₃	-H	-H	3,4-Cl ₂ PhCH ₂ OCO-	171 - 171.5
803	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhNHCO-	228 - 232 dec
804	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ (CH ₂) ₂ N(CH ₃) ₂	CDCl ₃ : 1.76(3H, s), 2.30(6H, s), 2.61(2H, t, J=5.8Hz), 2.99-3.04(4H, m), 3.60-3.64(4H, m), 4.03(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.1Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.22(2H, t, J=5.8Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 6.76-6.81(2H, m), 6.83-6.89(2H, m), 7.55(1H, s)

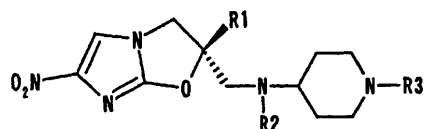
20

30

40

【 2 1 6 8 】

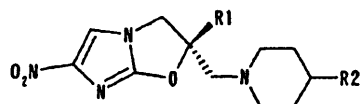
【表 3 4】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
805	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	127.2 - 129.7
806	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	131.5 - 133.6
807	-CH ₃	-CH ₃	4-NCPH-	149 - 152
808	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	84.2 - 86.8
809	-CH ₃	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ OCO-	116.2 - 116.6

【2 1 6 9】

【表 3 5】



実施例	R1	R2	mp(°C) or 1H NMR
810	-CH ₃	-OPh	153.2 - 154.8 CDCl ₃ ; 1.16-1.42(2H,m), 1.61(3H,s), 1.87-2.01(2H,m), 2.31-2.60(3H,m), 2.78-3.02(4H,m), 3.24-3.30(1H,m), 3.82(1H,d,J=8.1Hz), 3.91(1H,d,J=9.7Hz), 4.29(1H,d,J=9.7Hz), 6.54(2H,d,J=8.6Hz), 6.98-7.36(2H,d,J=8.6Hz), 7.54(1H,s)
811	-CH ₃	4-CF ₃ PhNH-	130 - 131.8
812	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	117.5 - 118.5
813	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	146.5-147.5
814	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	177 - 179
815	-CH ₃	4-ClPhCO-	98 - 100
816	-CH ₃	4-CF ₃ PhCO-	119.4 - 120.7
817	-CH ₃	4-CF ₃ OPhO-	141 - 144
818	-CH ₃	4-ClPhO-	89 - 91.7
819	-CH ₃	3-CF ₃ PhO-	171 - 174.7
820	-CH ₃	4-NCPHO-	124 - 128
821	-CH ₃	4-FPhO-	113 - 115
822	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ O-	138 - 140
823	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ O-	115 - 116.5
824	-CH ₃	4-PhPhCH ₂ O-	79 - 81
825	-CH ₃	PhCH ₂ CH ₂ O-	80.8 - 83.9
826	-CH ₃	4-PyridylCH ₂ O-	77 - 79
827	-CH ₃	3-PyridylCH ₂ O-	101 - 102
828	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	153 - 155
829	-CH ₃	4-ClPhNHCO-	161 - 164
830	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ NHCO-	159 - 161
831	-CH ₃	4-ClPhNH-	148.5 - 150
832	-CH ₃	4-NCPHNH-	180.2 - 181.1 dec
833	-CH ₃	4-ClPhN(CH ₃)-	188.5 - 191
834	-CH ₃	4-NCPHN(CH ₃)-	161 - 164
835	-CH ₃	4-CF ₃ PhN(CH ₃)-	178.5 - 180
836	-CH ₃	(4-ClPh) ₂ N-	

【2 1 7 0】

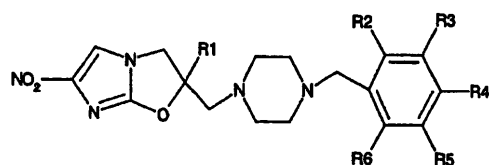
10

20

30

40

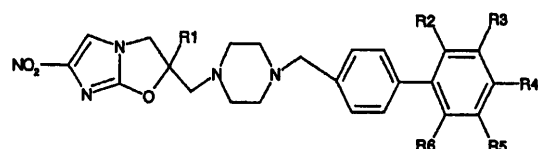
【表 3 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or ¹ H NMR
837	-CH ₃	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	158.5 - 160
838	-CH ₃	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	115 - 117.9
839	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	126 - 129.2
840	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	164 - 166
841	-CH ₃	-H	-H	-OPh	-H	-H	157 - 158.2
842	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	147 - 151.9
843	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	151 - 152.5
844	-CH ₃	-H	-H	-3-PYRIDYL	-H	-H	140 - 143.8
845	-CH ₃	-H	-Ph	-H	-H	-H	94.6 - 96.5
846	-CH ₃	-H	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	-H	162 - 163.9
847	-CH ₃	-Ph	-H	-H	-H	-H	146.8 - 149
848	-CH ₃	-H	-H	-CH=CHPh	-H	-H	178.5 - 181.8
849	-CH ₃	-H	-CF ₃	-H	-CF ₃	-H	154 - 156.2
							CDCl ₃ , 1.59(3H, s), 2.34(4H, bs), 2.50-2.59(2H, m), 2.53(1H, d, J=14.8Hz), 2.67-2.76(2H, m), 2.85(1H, d, J=14.8Hz), 3.41(1H, d, J=12.9Hz), 3.47(1H, d, J=12.9Hz), 3.87(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 7.23-7.33(5H, m), 7.53(1H, s)
850	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	CDCl ₃ , 1.58(3H, s), 2.30(4H, br), 2.49-2.57(2H, m), 2.52(1H, d, J=14.9Hz), 2.65-2.73(2H, m), 2.84(1H, d, J=14.9Hz), 2.93(6H, s), 3.34(2H, d, J=3.50Hz), 3.86(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 6.67(2H, d, J=8.7Hz), 7.11(2H, d, J=8.7Hz), 7.52(1H, s)
851	-CH ₃	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	CDCl ₃ , 1.59(3H, s), 2.31(4H, br), 2.50-2.58(2H, m), 2.53(1H, d, J=14.8Hz), 2.65-2.74(2H, m), 2.84(1H, d, J=14.8Hz), 3.35(1H, d, J=13.0Hz), 3.41(1H, d, J=13.0Hz), 3.79(3H, s), 3.88(1H, d, J=9.7Hz), 4.30(1H, d, J=9.7Hz), 6.83(2H, d, J=8.6Hz), 7.17(2H, d, J=8.6Hz), 7.52(1H, s)
852	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	CDCl ₃ , 1.61(3H, s), 2.30-2.73(9H, m), 2.84(1H, d, J=14.8Hz), 3.49(2H, s), 3.87(1H, d, J=9.7Hz), 3.95(2H, s), 4.30(1H, d, J=9.7Hz), 7.09-7.33(9H, m), 7.52(1H, s)
853	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ Ph	-H	-H	

【 2 1 7 1 】

【表 3 7】



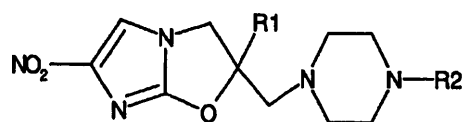
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or ¹ H NMR
854	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	176.8 - 181.3
855	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	111.8 - 114.8
856	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	183.3 - 186.6
857	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	123.5 - 125.3
858	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	CDCl ₃ ; 1.59(3H, s), 2.37(4H, bs), 2.51-2.61(2H, m), 2.54(1H, d, J=14.8Hz), 2.69-2.76(2H, m), 2.86(1H, d, J=14.8Hz), 3.44(1H, d, J=13.1Hz), 3.51(1H, d, J=13.1Hz), 3.88(1H, d, J=9.6Hz), 4.31(1H, d, J=9.6Hz), 7.29-7.36(3H, m), 7.39-7.47(2H, m), 7.51-7.60(4Hm), 7.53(1H, s)
859	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	CDCl ₃ ; 1.60(3H, s), 2.37-2.75(9H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.49(2H, s), 3.88(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 7.37(1H, d, J=8.0Hz), 7.53(1H, s), 7.54(1H, d, J=8.0Hz), 7.68(4H, s)
860	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	CDCl ₃ ; 1.60(3H, s), 2.38(4H, br), 2.55(1H, d, J=14.9Hz), 2.60(2H, br), 2.71-2.76(2H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.50(2H, s), 3.89(1H, d, J=9.7Hz), 4.30(1H, d, J=9.7Hz), 7.27(2H, d, J=6.6Hz), 7.36(2H, d, J=8.1), 7.47-7.52(2H, m), 7.53(1H, s), 7.55-7.61(2H, m)

10

20

【 2 1 7 2 】

【表 3 8】



実施例	R1	R2	mp(°C)
861	-CH ₃		134 - 138.8
862	-CH ₃		188.6 - 190.7
863	-CH ₃		127 - 131.5
864	-CH ₃		156 - 158.6
865	-CH ₃		102.8-104.9
866	-CH ₃		129 - 133
867	-CH ₃		164.0-168.5
868	-CH ₃		221.5 - 222.3
869	-CH ₃		158 - 159.4
870	-CH ₃		105 - 107
871	-CH ₃		142 - 145.4

【 2 1 7 3 】

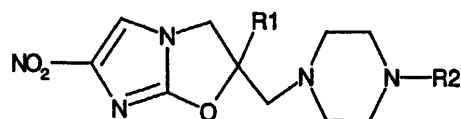
10

20

30

40

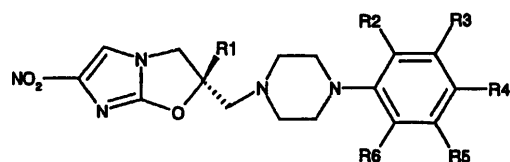
【表 3 9】



実施例	R1	R2	mp(°C)
872	-CH ₃		196 - 199.4
873	-CH ₃		102 - 104
874	-CH ₃		215.5 - 217
875	-CH ₃		195 - 197.8

【 2 1 7 4 】

【表 4 0】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or ¹ H NMR
876	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	175.8 - 176.6
877	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	180.6 - 184.2
878	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	175 - 179.5
879	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	172 - 172.5
880	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	175 - 179.2
881	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	185 - 185.5
882	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	177 - 177.3
883	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	171.6 - 173.6
884	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	179.5 - 180.3
885	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-CF ₃	-H	170.5 - 171.2
886	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	248 - 252
887	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-F	191 - 192.2
888	-CH ₃	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	206 - 207
889	-H	-H	-H	-F	-H	-H	178.5 - 179.5
890	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	211 - 211.5
891	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	183 - 183.5
892	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	CDCl ₃ ; 1.64(3H, s), 2.59-2.75(2H, m), 2.62(1H, d, J=15Hz), 2.80-2.95(2H, m), 2.93(1H, d, J=15Hz), 3.00-3.25(4H, m), 3.94(1H, d, J=10Hz), 4.35(1H, d, J=10Hz), 6.86(2H, d, J=8Hz), 7.46(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s)
893	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-H	198.5 - 200.5

【 2 1 7 5 】

10

20

30

40

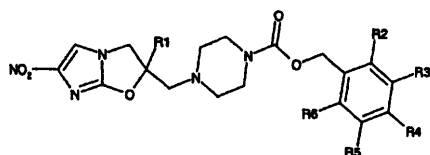
实例例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
894	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	144.2 - 145.6
895	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	153 - 156.9
896	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	114.5 - 116.6
897	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	132.4 - 136.3
898	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	143.5 - 145
899	-CH ₃	-H	-H	-Br	-H	-H	151 - 152
900	-CH ₃	-H	-H	-Ph	-H	-H	134 - 135.2
901	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	127 - 130.5
902	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	128 - 130
903	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ Ph	-H	-H	128 - 131
904	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	142 - 145.5
905	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	132 - 135.3
906	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	117 - 118
907	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	117 - 118
908	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	106 - 108
909	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	143 - 145
910	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	127 - 130
911	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	144 - 145
912	-CH ₃	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	126 - 127
913	-CH ₃	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	156 - 158
914	-CH ₃	-H	-CF ₃	-H	-CF ₃	-H	159 - 160
915	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	-H	125 - 129
916	-CH ₃	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	147 - 149
917	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	125 - 127
918	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	135 - 138
919	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	149 - 151
920	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-F	131 - 133
921	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	144 - 146
922	-CH ₃	-H	-H	-SO ₂ CH ₃	-H	-H	112 - 115
923	-CH ₃	-H	-H	-CON(CH ₃) ₂	-H	-H	108 - 111
924	-CH ₃	-H	-H	-CONHC ₃ H ₇	-H	-H	124 - 126
925	-CH ₃	-H	-H	-OCH(CH ₃) ₂	-H	-H	122 - 123
926	-CH ₃	-H	-H	-OSO ₂ CH ₃	-H	-H	100 - 104
927	-CH ₃	-H	-H	-I	-H	-H	132 - 134
928	-CH ₃	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	105 - 109
929	-CH ₃	-H	-H	-CONH ₂	-H	-H	159 - 161
930	-CH ₃	-H	-H	-F	-Cl	-H	148 - 149

【 2 1 7 6 】

20

30

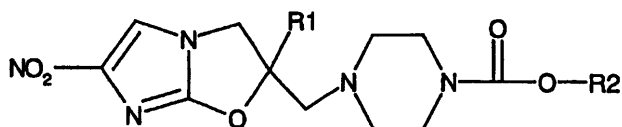
【表 4 2】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or 1H NMR
931	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.38-2.70(4H, bm), 2.56(1H, d, J=14.9Hz), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.41(4H, bs), 3.92(1H, d, J=9.7Hz), 4.28(1H, d, J=9.7Hz), 5.06(2H, s), 6.99-7.07(2H, m), 7.28-7.34(2H, m), 7.53(1H, s)
932	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.45-2.75(4H, bm), 2.58(1H, d, J=14.9Hz), 2.86(1H, d, J=14.9Hz), 3.20-3.60(4H, br), 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 4.29(1H, d, J=9.8Hz), 5.15(2H, s), 7.44(1H, d, J=8.0Hz), 7.54(1H, s), 7.61(1H, d, J=8.0Hz)
933	-CH ₃	-H	-H	-OH	-H	-H	CDCl ₃ 1.59(3H, s), 2.30-2.70(4H, m), 2.56(1H, d, J=15Hz), 2.86(1H, d, J=15Hz), 3.10-3.55(4H, m), 3.91(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 5.03(2H, s), 5.30(1H, brs), 6.84(2H, d, J=8Hz), 7.24(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s)
934	-CH ₃	-H	-H	-NH ₂	-H	-H	CDCl ₃ 1.61(3H, s), 2.35-2.70(4H, m), 2.56(1H, d, J=15Hz), 2.85(1H, d, J=15Hz), 3.05-3.55(4H, m), 3.69(2H, brs), 3.91(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 4.98(2H, s), 6.55(2H, d, J=8Hz), 7.14(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s)
935	-CH ₃	-H	-H	(CH ₃) ₃ C(CH ₂) ₄ Si-	-H	-H	114 - 115
936	-CH ₃	-H	-H	(CH ₃) ₃ COCONH-	-H	-H	124 - 127

【 2 1 7 7 】

【表 4 3】



実施例	R1	R2	mp(°C)
937	-CH ₃	-(CH ₂) ₄ Ph	143.5 - 144.6
938	-CH ₃	4-ClPh(CH ₂) ₂ -	118 - 119
939	-CH ₃	4-ClPhCH=CHCH ₂ -	121 - 123.3
940	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	121 - 122
941	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	127 - 128

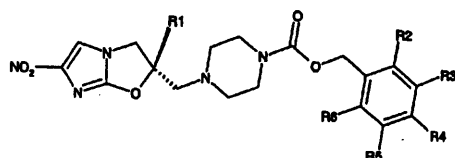
【 2 1 7 8 】

10

20

30

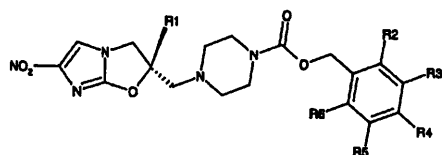
【表 4 4】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or ¹ H NMR
942	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	83 - 85
943	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	174 - 175
944	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	187 - 188.5
945	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	163.5 - 165.5
946	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	172.5 - 174
947	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	128 - 129
948	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	97 - 98
949	-CH ₃	-H	-H	-F	-F	-H	115 - 116
950	-CH ₃	-H	-H	-H	-F	-F	101 - 103
951	-CH ₃	-H	-F	-H	-F	-H	85 - 87
952	-CH ₃	-F	-F	-F	-F	-F	143 - 144
953	-CH ₃	-F	-H	-F	-H	-F	92 - 95
954	-CH ₃	-H	-F	-H	-H	-F	144 - 146
955	-CH ₃	-F	-H	-H	-H	-F	169 - 170
956	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-F	178 - 182
957	-CH ₃	-H	-H	-H	-F	-H	112 - 115
958	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	78 - 80
959	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-F	175 - 176
960	-CH ₃	-H	-H	-Br	-H	-H	166 - 167
961	-H	-H	-H	-F	-H	-H	121.5 - 122
962	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	112.9 - 116.7
963	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	105.5 - 106
964	-H	-H	-H	-H	-Cl	-H	97.5 - 98
965	-H	-H	-H	-H	-F	-H	93 - 94
966	-CH ₃	-H	-H	-OCHF ₂	-H	-H	134 - 135
967	-CH ₃	-H	-H	-F	-OCH ₃	-F	71 - 74
968	-CH ₃	-H	-H	-F	-OCHF ₂	-F	84 - 86
969	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-OCHF ₂	-H	85 - 87
970	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	180 - 181
971	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	185 - 187
972	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	172 - 173
973	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ CF ₃	-H	-H	76 - 80
974	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-OCH ₂ CF ₃	-H	139 - 140

【 2 1 7 9 】

【表 4 5】



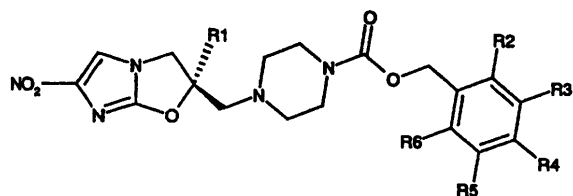
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or ¹ H NMR
975	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ CF ₃	-Cl	-H	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.40-2.75(4H, m), 2.57(1H, d, J=15Hz), 2.87(1H, d, J=15Hz), 3.05-3.50(4H, m), 3.92(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 4.40(2H, q, J=8Hz), 5.02(2H, s), 6.40(2H, d, J=8Hz), 7.21(2H, dd, J=8,2Hz), 7.39(1H, d, J=2Hz), 7.53(1H, s)
976	-CH ₃	-H	-H	-OCHF ₂	-Cl	-H	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.40-2.70(4H, m), 2.59(1H, d, J=15Hz), 2.87(1H, d, J=15Hz), 3.10-3.55(4H, m), 3.96(1H, d, J=10Hz), 4.30(1H, d, J=10Hz), 5.13(2H, s), 6.53(1H, t, J=73Hz), 7.10-7.30(2H, m), 7.42(1H, s), 7.55(1H, s)
977	-CH ₃	-H	-H	-Br	-OCHF ₂	-F	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.40-2.65(4H, m), 2.59(1H, d, J=15Hz), 2.86(1H, d, J=15Hz), 3.00-3.50(4H, m), 3.96(1H, d, J=10Hz), 4.29(1H, d, J=10Hz), 5.14(2H, s), 6.59(1H, t, J=73Hz), 7.17(1H, m), 7.39(1H, m), 7.55(1H, s)

10

【2180】

20

【表 4 6】

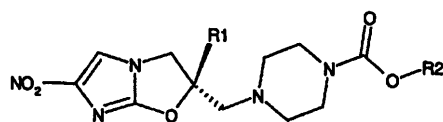


実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
978	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	139.8 - 141.7
979	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	108 - 111
980	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	185 - 186
981	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-CF ₃	-H	115 - 115.5
982	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-CH ₃	-H	91 - 91.5
983	-CH ₃	-H	-H	-SCF ₃	-H	-H	136.5 - 137
984	-CH ₃	-H	-H	-F	-Cl	-H	72.5 - 73
985	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₃	178.5 - 179

30

【2181】

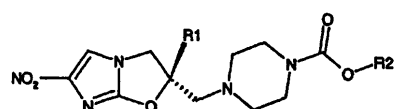
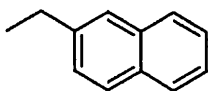
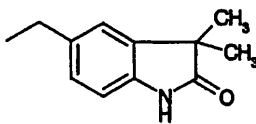
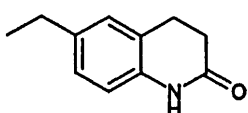
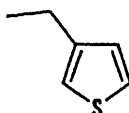
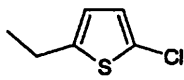
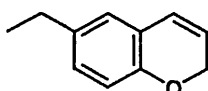
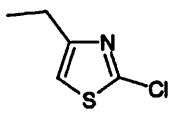
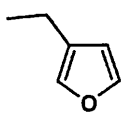
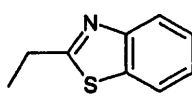
【表 4 7】



実施例	R1	R2	mp(°C)
986	-CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	101 - 103
987	-CH ₃	-cyclo-C ₆ H ₁₁	189.6 - 191.6
988	-CH ₃	-CH ₂ CF ₃	123.5 - 124
989	-CH ₃	-CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	138 - 138.5
990	-CH ₃	(E)-3,4-Cl ₂ PhCH=CHCH ₂ -	145 - 148
991	-CH ₃	(E)-4-ClPhCH=CHCH ₂ -	124 - 125
992	-CH ₃	(E)-4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	60 - 61
993	-H	(E)-4-ClPhCH=CHCH ₂ -	113 - 114
994	-H	(E)-4-ClPhC(CH ₃)=CHCH ₂ -	109 - 110
995	-H	(Z)-4-ClPhC(CH ₃)=CHCH ₂ -	95 - 96
996	-CH ₃	(E)-4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	132 - 133
997	-CH ₃	(Z)-4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	138 - 140
998	-CH ₃	(E)-3-CF ₃ -4-ClPhCH=CHCH ₂ -	147 - 149
999	-CH ₃	(E)-4-FPhCH=CHCH ₂ -	155 - 156
1000	-CH ₃	(E)-4-CF ₃ PhCH=C(CH ₃)CH ₂ -	122 - 123
1001	-CH ₃	(4-CF ₃ Ph) ₂ C=CHCH ₂ -	145 - 146
1002	-CH ₃	4-ClPh(CH ₂) ₂ -	150 - 151
1003	-CH ₃	4-ClPh(CH ₂) ₃ -	96 - 97
1004	-CH ₃	4-ClPh(CH ₂) ₄ -	78 - 82
1005	-CH ₃	4-ClPhO(CH ₂) ₂ -	138 - 139
1006	-CH ₃	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₃ -	46 - 48
1007	-CH ₃	4-CF ₃ Ph(CH ₂) ₃ -	118 - 120
1008	-CH ₃	4-CF ₃ PhO(CH ₂) ₂ -	104 - 108
1009	-CH ₃	4-CF ₃ OPhN(CH ₂) ₂ (CH ₂) ₂ -	102 - 104
1010	-CH ₃	(E)-4-ClPhC(CH ₃)=CHCH ₂ -	CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.02-2.10(3H, m), 2.57(1H, d, J=14.9Hz), 2.40-2.73(4H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.06-3.62(4H, m), 3.93(1H, d, J=9.7Hz), 4.29(1H, d, J=9.7Hz), 4.76(2H, m), 5.87(1H, dt, J=1.3Hz, 6.7Hz), 7.23-7.37(4H, m), 7.54(1H, s) CDCl ₃ 1.62(3H, s), 2.02-2.10(3H, m), 2.58(1H, d, J=14.9Hz), 2.35-2.72(4H, m), 2.86(1H, d, J=14.9Hz), 3.04-3.56(4H, m), 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 4.30(1H, d, J=9.8Hz), 4.46(2H, m), 5.66(1H, dt, J=1.4Hz, 7.0Hz), 7.04-7.12(2H, m), 7.23-7.35(2H, m), 7.53(1H, s)
1011	-CH ₃	(Z)-4-ClPhC(CH ₃)=CHCH ₂ -	

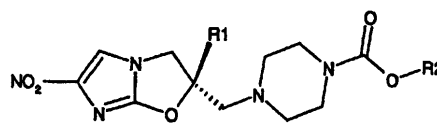
【 2 1 8 2 】

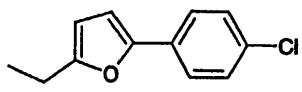
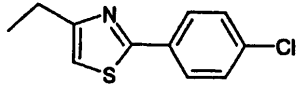
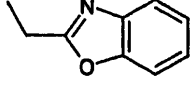
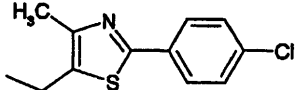
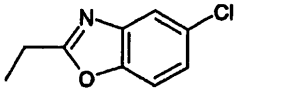
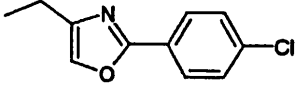
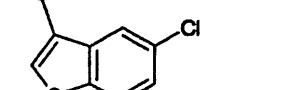
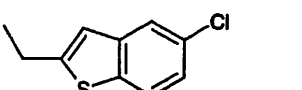
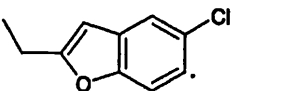
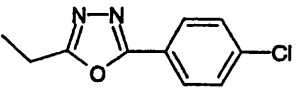
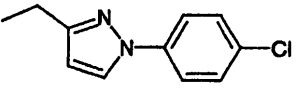
【表 4 8】

			
実施例	R1	R2	mp(°C)
1012	-CH ₃		80 - 85
1013	-CH ₃		120 - 140
1014	-CH ₃		189 - 190
1015	-CH ₃		196.1 - 199.1
1016	-CH ₃		137.4 - 139.2
1017	-CH ₃		71 - 76.4
1018	-CH ₃		121.1 - 122.1
1019	-CH ₃		177.1 - 178.9
1020	-CH ₃		158.5 - 160.4

【 2 1 8 3 】

【表 4 9】



実施例	R1	R2	mp(°C)
1021	-CH ₃		193.4 - 195.9
1022	-CH ₃		203.6 - 204.9
1023	-CH ₃		89.7 - 91.8
1024	-CH ₃		185.2 - 187.5
1025	-CH ₃		93.6 - 96.5
1026	-CH ₃		215.3 - 216.4
1027	-CH ₃		180.7 - 182.3
1028	-CH ₃		170.2 - 170.6
1029	-CH ₃		134.3 - 135.7
1030	-CH ₃		83.6 - 86.3
1031	-CH ₃		191.8 - 192.9

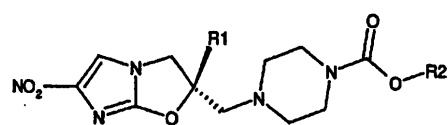
【 2 1 8 4 】

10

20

30

【表 50】



実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR
1032	-CH ₃		174.3 - 179.2
1033	-CH ₃		108.9 - 113.1
1034	-CH ₃		193.5 - 194.7
1035	-H		152 - 153.5
1036	-H		190.3 - 191.2
1037	-H		177.5 - 180.9
1038	-CH ₃		127.5 - 128.1
1039	-CH ₃		140 - 141.5
1040	-CH ₃		114 - 117
1041	-CH ₃		CDCl ₃ , 1.40-1.62(5H, m), 1.80-1.93(2H, br), 2.46-2.64(13H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.37(4H, br), 3.92(1H, d, J=9.7Hz), 4.20(2H, t, J=6.1), 7.53(1H, s)

【 2 1 8 5 】

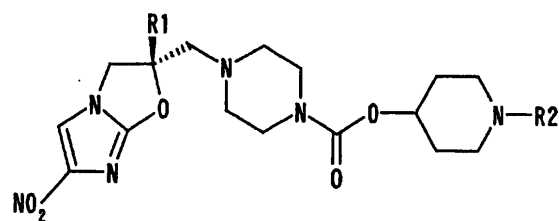
10

20

30

40

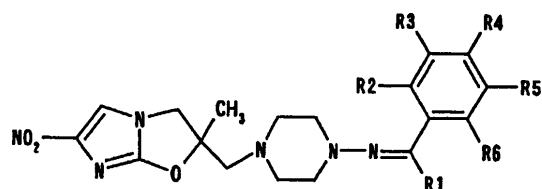
【表 5 1】



実施例	R1	R2	mp(°C)
1042	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	160.5 - 161.4
1043	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	158.6 - 160.6
1044	-CH ₃	4-CH ₃ OPh-	138.5 - 139.5
1045	-CH ₃	Ph-	163 - 163.5
1046	-CH ₃	4-FPh-	159 - 160
1047	-CH ₃	PhCH ₂ -	141.5 - 142
1048	-CH ₃	4-ClPh-	177 - 178
1049	-CH ₃	4-NPh-	158 - 159
1050	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	144 - 145
1051	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	95.5 - 97
1052	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	143 - 143.5
1053	-CH ₃	4-CF ₃ PhCO-	160.5 - 162.4
1054	-CH ₃	4-ClPhCO-	218 - 220.3
1055	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	169.8 - 172.7

【 2 1 8 6 】

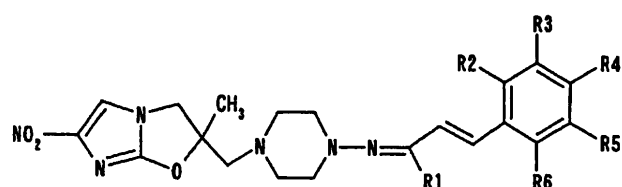
【表 5 2】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Mp(°C)
1056	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	215.3 - 217.8
1057	-H	-H	-H	-Br	-H	-H	219.2 - 221.3
1058	-H	-F	-H	-Br	-H	-H	198.8 - 200.5
1059	-H	-H	-F	-Cl	-H	-H	199 - 199.5
1060	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	180.2 - 184.1
1061	-H	-F	-F	-F	-H	-H	188.5 - 189.2
1062	-H	-H	-F	-F	-F	-H	191.7 - 192.6
1063	-H	-F	-H	-Cl	-H	-H	202.8 - 203.3

【 2 1 8 7 】

【表 5 3】

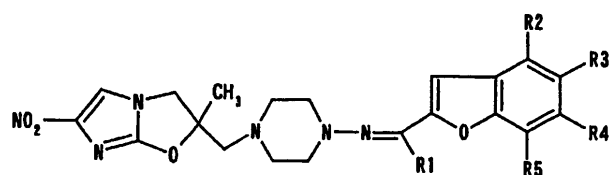


実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
1064	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	214.2 - 214.8
1065	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	204.1 - 205.7
1066	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	127.8 - 131.8
1067	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	204.2 - 205.3
1068	-H	-H	-H	-F	-H	-H	199.2 - 200.2

10

【 2 1 8 8 】

【表 5 4】

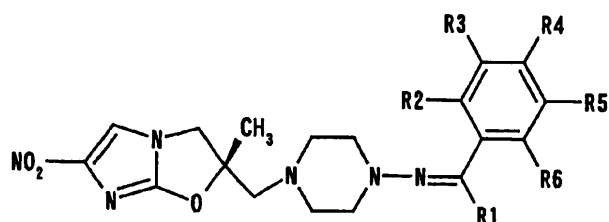


実施例	R1	R2	R3	R4	R5	mp(°C)
1069	-H	-H	-Cl	-H	-H	164.6 - 165.9
1070	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	194.9 - 196
1071	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	211.7 - 212.1
1072	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	182.9 - 185.9

20

【 2 1 8 9 】

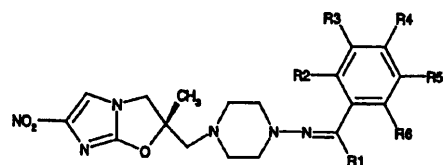
【表 5 5】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
1073	-H	-H	-H	-F	-H	-H	202.5 - 203.1
1074	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	205.4 - 206.4
1075	-H	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	162.7 - 164
1076	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	233.7 - 236.2
1077	-H	-H	-H	-1-PYRRYL	-H	-H	249.1 - 249.7
1078	-H	-H	-H	-Ph	-H	-H	211.6 - 212
1079	-H	-H	-H	-OCH ₂ Ph	-H	-H	202.2 - 203.9
1080	-H	-H	-H	-Br	-H	-H	224.4 - 226.2
1081	-H	-H	-H	-OC ₈ H ₁₇	-H	-H	156.8 - 158.3
1082	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	197.8 - 198.7
1083	-H	-H	-H	-OPh	-H	-H	198.1 - 200.1
1084	-H	-H	-F	-F	-F	-H	193.8 - 196
1085	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	177.9 - 178.3
1086	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	175.7 - 178.2
1087	-H	-H	-CF ₃	-H	-CF ₃	-H	200.2 - 202.3
1088	-H	-H	-H	-Cl	-F	-H	197.2 - 199.2
1089	-H	-H	-H	-Br	-H	-F	206.1 - 207.4
1090	-H	-H	-H	-F	-F	-F	174 - 174.7
1091	-H	-H	-H	-Cl	-H	-F	202.8 - 203.7
1092	-H	-H	-H	-C ₄ H ₉	-H	-H	162.2 - 165.1
1093	-H	-H	-H	-N(Ph) ₂	-H	-H	182.6 - 186.4
1094	-H	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	223.5 - 224.5
1095	-H	-H	-H	-I	-H	-H	217 - 221.1
1096	-H	-H	-H	-1-(1,2,4-triazolyl)	-H	-H	200.6 - 202.3

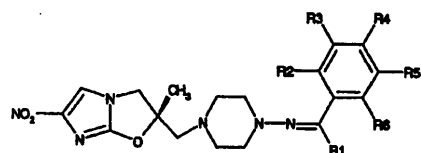
【2190】

【表 5 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
1097	-H	-H	-H	-H	-H	-H	370
1098	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	404
1099	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	404
1100	-H	-F	-H	-H	-H	-H	388
1101	-H	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	412
1102	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	415
1103	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	438
1104	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	438
1105	-H	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	426
1106	-H	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	414
1107	-H	-Cl	-Cl	-H	-Cl	-H	472
1108	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	-Cl	472
1109	-H	-H	-H	-H	-OPh	-H	462
1110	-H	-H	-F	-H	-H	-F	406
1111	-H	-F	-H	-F	-H	-H	406
1112	-H	-H	-H	-F	-F	-H	406
1113	-H	-H	-F	-H	-F	-H	406
1114	-H	-H	-H	-F	-F	-F	424
1115	-H	-H	-F	-H	-F	-F	424
1116	-H	-F	-H	-H	-F	-F	424
1117	-H	-H	-F	-F	-H	-F	424
1118	-H	-F	-H	-F	-H	-F	424
1119	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	454
1120	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	398
1121	-H	-H	-H	-H	-Br	-H	448
1122	-H	-Br	-H	-H	-H	-H	448
1123	-H	-H	-H	-H	-F	-F	406
1124	-H	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	438
1125	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	414
1126	-H	-H	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	442
1127	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH ₂ Ph	476
1128	-H	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	415
1129	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	454
1130	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	438
1131	-H	-Cl	-H	-H	-Cl	-H	438
1132	-H	-H	-H	-H	-OCOCH ₃	-H	428
1133	-H	-NO ₂	-H	-H	-H	-H	415
1134	-H	-H	-H	-H	-F	-H	388
1135	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	438
1136	-H	-H	-H	-H	-CN	-H	395
1137	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	400
1138	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	430
1139	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	430
1140	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	430

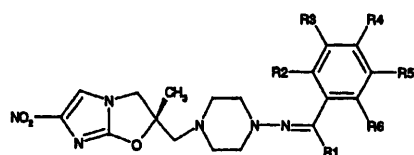
【表 57】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
1141	-H	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	430
1142	-H	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	460
1143	-H	-H	-Cl	-H	-H	-NO ₂	449
1144	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-NO ₂	445
1145	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-NO ₂	445
1146	-H	-H	-H	-H	-Ph	-H	446
1147	-H	-NH ₂ SO ₂ CH ₃	-H	-H	-H	-H	463
1148	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	384
1149	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	398
1150	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	398
1151	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	384
1152	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	398
1153	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	384
1154	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	398
1155	-H	-H	-H	-OCOCH ₃	-H	-H	428
1156	-H	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	428
1157	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	427
1158	-H	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	398
1159	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	-CH ₃	412
1160	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	428
1161	-H	-H	-H	-CH=CHPh(trans)	-H	-H	472
1162	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	413
1163	-H	-H	-Br	-H	-H	-OCH ₃	478
1164	-H	-H	-H	-F	-H	-Cl	422
1165	-H	-H	-Br	-H	-H	-F	466
1166	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-F	418
1167	-H	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	426
1168	-H	-Br	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	508
1169	-H	-F	-F	-F	-F	-F	460
1170	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-OCH ₃	443
1171	-H	-H	-OCH ₂ Ph	-H	-OCH ₂ Ph	-H	582
1172	-H	-H	-H	-OCH ₂ Ph	-OCH ₂ Ph	-H	582
1173	-H	-H	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	414
1174	-H	-H	-H	-H	-OCH ₂ Ph	-H	476
1175	-H	-H	-H	-OCH ₂ Ph	-OCH ₃	-H	506
1176	-H	-H	-H	-SC ₂ H ₅	-H	-H	430
1177	-H	-H	-H	-OCHF ₂	-H	-H	436
1178	-H	-H	-H	-OCH(CH ₃) ₂	-H	-H	428
1179	-H	-H	-H	-OCH ₃	-Br	-H	478
1180	-H	-H	-H	-N(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	441
1181	-H	-H	-H	-OCH ₃	-F	-H	418
1182	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	414
1183	-H	-OCH ₃	-H	-H	-F	-H	418
1184	-H	-Cl	-H	-H	-NO ₂	-H	449

【2192】

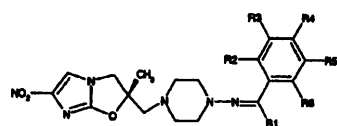
【表 5 8】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
1185	-H	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-OC ₂ H ₅	-H	458
1186	-H	-H	-H	-OCOCH ₃	-OCH ₃	-H	458
1187	-H	-NO ₂	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	475
1188	-H	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	416
1189	-H	-H	-H	-Cl	-NO ₂	-H	449
1190	-H	-H	-H	-SO ₂ CH ₃	-H	-H	448
1191	-H	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₂ Ph	-H	506
1192	-H	-H	-H	-Cl	-CF ₃	-H	472
1193	-H	-I	-H	-H	-H	-H	496
1194	-H	-H	-H	-H	-SCF ₃	-H	470
1195	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	460
1196	-H	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	430
1197	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-H	-H	428
1198	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	430
1199	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	460
1200	-H	-OCHF ₂	-H	-H	-H	-H	436
1201	-H	-H	-Br	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	508
1202	-H	-H	-CH ₃	-OCH ₃	-H	-CH ₃	428
1203	-H	-H	-H	-OH	-H	-H	386
1204	-H	-H	-OCH ₃	-OH	-OCH ₃	-H	446
1205	-H	-H	-H	-OH	-H	-OH	402
1206	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	400
1207	-H	-F	-H	-H	-H	-F	406
1208	-H	-H	-H	-3-PYRIDYL	-H	-H	447
1209	-H	-H	-H	-OCH ₂ Ph	-Cl	-H	510
1210	-H	-H	-H	-2-THIENYL	-H	-H	452
1211	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	460
1212	-H	-H	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	-H	452
1213	-H	-H	-H	CH ₂ =CHCH ₂ O-	-H	-H	426
1214	-H	-H	-H	Pyrrolidinyl-	-H	-H	439
1215	-H	EtOCOCH ₂ O-	-H	-H	-H	-H	472
1216	-H	-H	-H	-OCH ₃	cyclo-C ₅ H ₉ O-	-H	484
1217	-H	-H	CF ₃ CF ₂ O-	-H	-H	-H	504
1218	-H	-H	-H	Imidazolyl-	-H	-H	436
1219	-H	-H	-H	Piperidino-	-H	-H	453
1220	-H	-H	-H	4-CF ₃ Ph-	-H	-H	514
1221	-H	-H	-H	4-CH ₃ OPh-	-H	-H	476
1222	-H	-H	-H	(CH ₃) ₂ N(CH ₂) ₃ O-	-H	-H	471
1223	-H	-H	-H	Morpholino-	-NO ₂	-H	500
1224	-H	-H	-H	Piperidino-	-NO ₂	-H	498
1225	-H	-H	-H	4-FPh-	-H	-H	464
1226	-H	-H	-H	4-CH ₃ (CH ₂) ₈ Ph-	-H	-H	572
1227	-H	-H	-H	3,4-F ₂ Ph-	-H	-H	482
1228	-H	-H	-H	4-CH ₃ (CH ₂) ₃ Ph-	-H	-H	502
1229	-H	-H	-H	3-Cl-4-FPh-	-H	-H	498

【 2 1 9 3 】

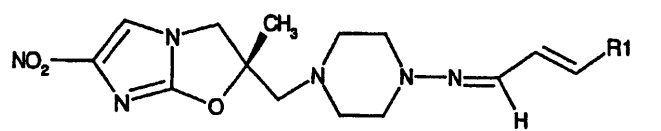
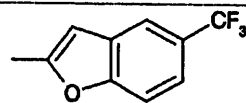
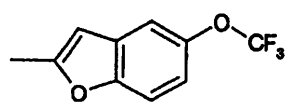
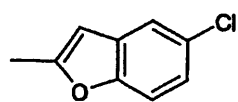
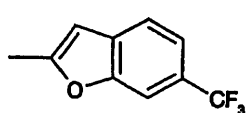
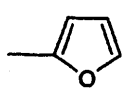
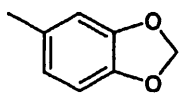
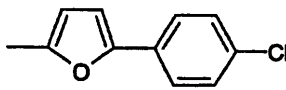
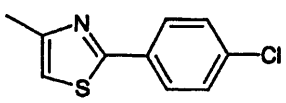
【表 5 9】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
1230	-H	-H	-H	4-CF ₃ OPh-	-H	-H	530
1231	-H	-H	-H	4-CH ₃ Ph-	-H	-H	460
1232	-H	-H	-H	4-NCPH-	-H	-H	471
1233	-H	-H	-H	3,4-(CH ₃ O) ₂ Ph-	-H	-H	506
1234	-H		-OCH ₂ O-	-H	-H	-H	414
1235	-H	-H			-H	-Cl	448
1236	-H	-H			-H	-H	414
1237	-H	-H			-OCH ₃	-H	444
1238	-H	-NO ₂	-H	-OCH ₂ O-		-H	459
1239	-H	-H	-H		-F	-H	486
1240	-H	-H		-H	-H	-NO ₂	617
1241	-H	-H		-H	-H	-NO ₂	589
1242	-H	-H		-H	-H	-OCH ₃	587
1243	-H	-H	-H		-H	-H	437
1244	-H	-H	-H		-H	-H	626
1245	-H	-H	-H		-H	-H	513
1246	-H	-H	-H		-H	-H	486

【 2 1 9 4 】

【表 6 0】

		
実施例	R1	mp(°C) or MS
1247		174.1 - 175.8
1248		201.9 - 203
1249		218.8 - 220.1
1250		156 - 159.3
1251		386
1252		496
1253		513
1254		440

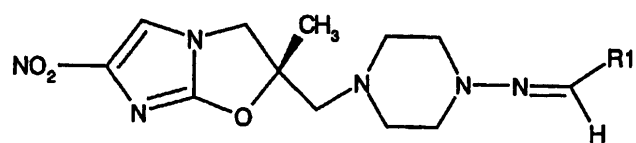
【 2 1 9 5 】

10

20

30

【表 6 1】



実施例	R1	mp(°C)
1255		211.5 - 213.6
1256		190.2 - 191.8
1257		182 - 185.7
1258		192.3 - 195.5
1259		218.4 - 218.9
1260		196 - 197.8
1261		212.5 - 212.9
1262		219.2 - 220
1263		209.4 - 210.4

【 2 1 9 6 】

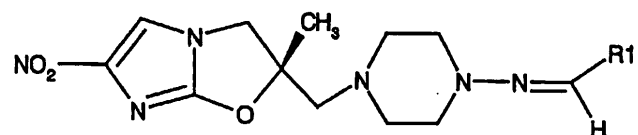
10

20

30

40

【表 6 2】



実施例	R1	mp(°C) or MS
1264		205.4 - 206.6
1265		214.7 - 215.2
1266		420
1267		498
1268		420
1269		463
1270		450

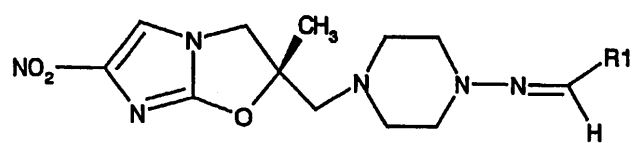
10

20

30

【 2 1 9 7 】

【表 6 3】



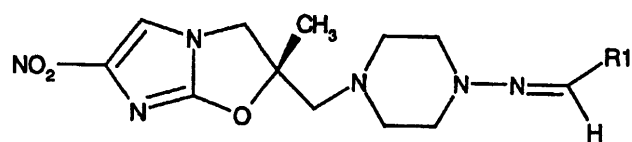
実施例	R1	mp(°C) or MS
1271		227.6 - 228.3
1272		428
1273		494
1274		376
1275		374

【 2 1 9 8 】

10

20

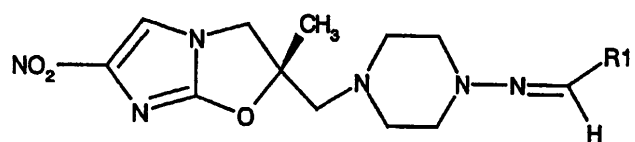
【表 6 4】

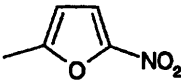
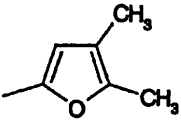
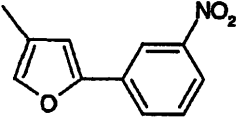


実施例 R1	mp(°C) or MS
1276	360
1277	374
1278	388
1279	230.6 - 232.6
1280	470
1281	481
1282	470
1283	504
1284	538
1285	481

【 2 1 9 9 】

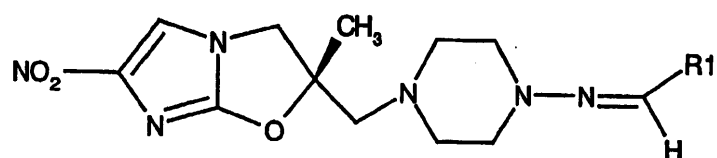
【表 6 5】



実施例 R1	mp(°C) or MS
1286 	405
1287 	388
1288 	481

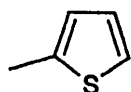
【 2 2 0 0 】

【表 6 6】



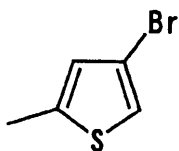
実施例	R1	mp(°C) or MS
1289		376
1290		217.8 - 218.5
1291		213.2 - 215.6
1292		536
1293		421
1294		390
1295		410
1296		404
1297		524
1298		524
1299		468

1289



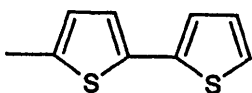
376

1290



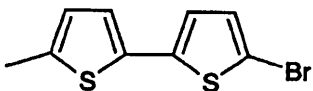
217.8 - 218.5

1291



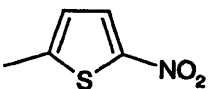
213.2 - 215.6

1292



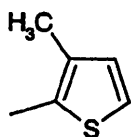
536

1293



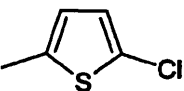
421

1294



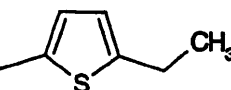
390

1295



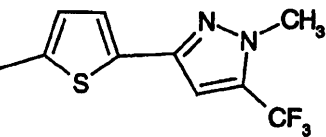
410

1296



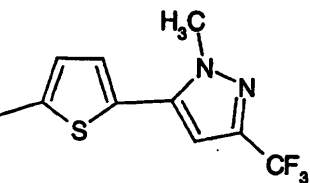
404

1297



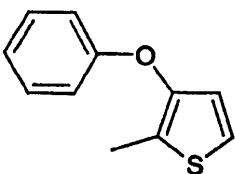
524

1298



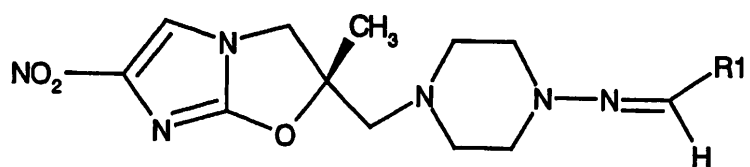
524

1299



468

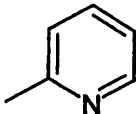
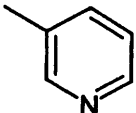
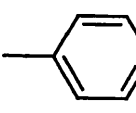
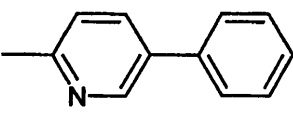
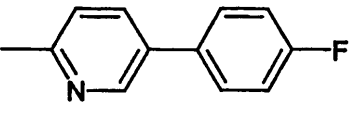
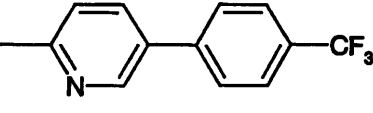
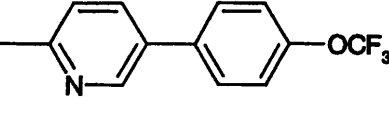
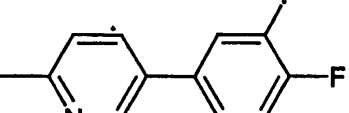
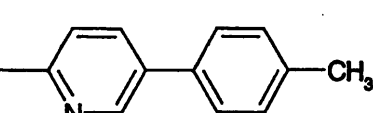
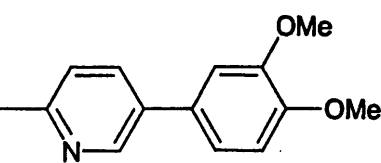
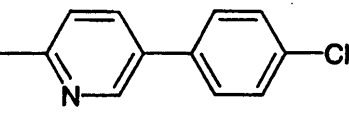
【表 6 7】



実施例	R1	mp(°C) or MS
1300		376
1301		421

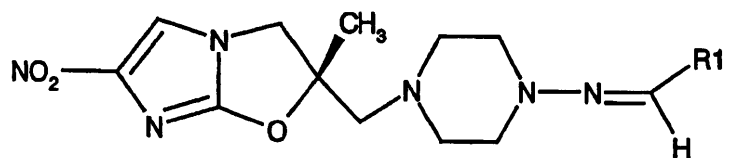
【 2 2 0 2 】

C[C@H]1CN2C(=N1)C(=O)N2C1CCN(C1)N=N/C=C\R1

实施例	R1	mp(°C) or MS
1302		371
1303		371
1304		371
1305		447
1306		465
1307		515
1308		531
1309		483
1310		461
1311		507
1312		481

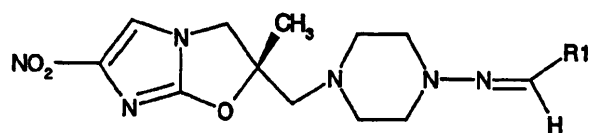
【 2 2 0 3 】

【表 6 9】



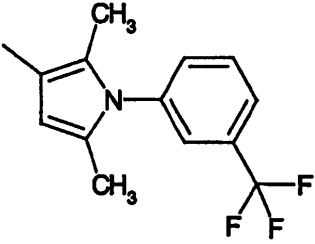
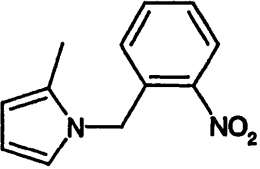
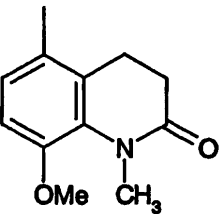
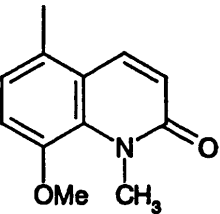
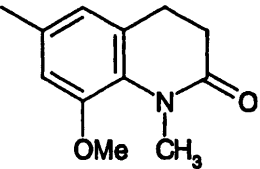
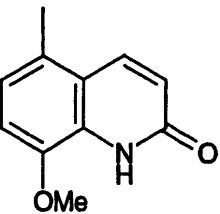
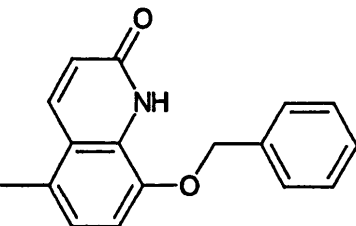
実施例	R1	mp(°C) or MS
1313		437
1314		453
1315		437
1316		453
1317		427
1318		449
1319		449
1320		439
1321		465
1322		461
1323		477
1324		531

【表 7 0】

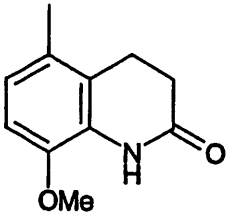
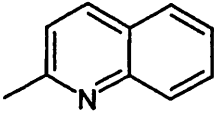
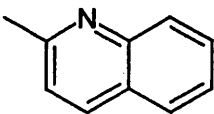
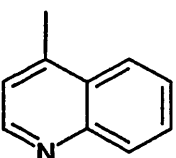
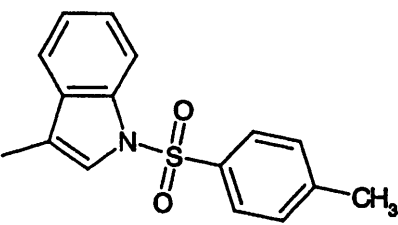
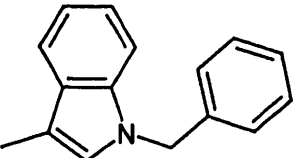
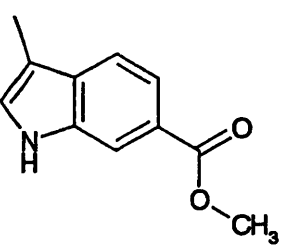
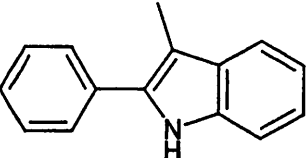


実施例	R1	mp(°C) or MS
1325		507
1326		481
1327		499
1328		453
1329		437
1330		377
1331		189.4 - 190.6
1332		498
1333		453
1334		483
1335		487
1336		201.2 - 203.5

【表 7 1】

実施例	R1	mp(°C) or MS
1337		531
1338		494
1339		483
1340		481
1341		469
1342		467
1343		543

【表 7 2】

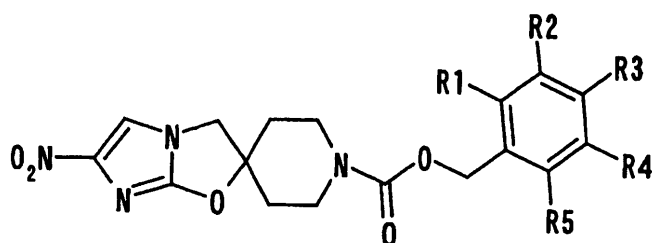
実施例 R1		mp(°C) or MS
1344		469
1345		220.6 - 220.9
1346		421
1347		421
1348		563
1349		499
1350		467
1351		485

C[C@H]1CN2C(=N1)C(=O)N2C1CCN(C1)N=N/C=C\R1

实施例 R1	mp(°C) or MS
1352	153.1 - 157.5
1353	492
1354	416
1355	533
1356	410
1357	487
1358	188.6 - 190.6
1359	440
1360	454
1361	412

40

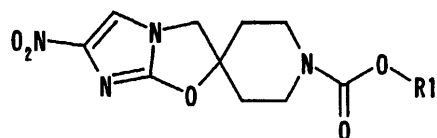
【表 7 4】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	mp(°C)
1362	-H	-H	-F	-H	-H	187 - 188
1363	-H	-H	-Cl	-H	-H	183 - 184
1364	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	169 - 170
1365	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	174 - 175
1366	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	208 - 209
1367	-F	-F	-H	-H	-H	184 - 185
1368	-H	-F	-F	-H	-H	185 - 186
1369	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	183 - 184.5
1370	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	181 - 182
1371	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	175 - 176
1372	-Cl	-H	-H	-H	-H	173 - 174.5
1373	-H	-Cl	-H	-H	-H	173 - 174
1374	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	184 - 186
1375	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	188 - 190
1376	-H	-H	-Ph	-H	-H	187 - 188
1377	-H	-CF ₃	-H	-CF ₃	-H	183 - 184
1378	-F	-F	-F	-F	-F	235 - 237
1379	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	177 - 179
1380	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	201 - 202
1381	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	183 - 185
1382	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	190 - 191
1383	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	188 - 189

【 2 2 0 9 】

【表 7 5】



実施例	R1	mp(°C)
1384	(CH ₃) ₂ CH-	251-253
1385	(CH ₃) ₂ CHCH ₂ -	233-235
1386	C ₈ H ₁₇ -	219-220
1387	Ph(CH ₂) ₂ -	198-200
1388	PhCH=CHCH ₂ -	180-181
1389	Ph(CH ₂) ₃ -	186-187.5
1390	(Ph) ₂ CH-	202-204
1391	Ph-	242-244
1392	2-NaphthylCH ₂ -	173.5-174.5
1393	4-PyridylCH ₂ -	163-164
1394	4-ClPh(CH ₂) ₂ -	198-200
1395	(4-ClPh) ₂ CH-	238-240
1396	4-CH ₃ Ph-	230-231
1397	4-CH ₃ OPh-	248-250
1398	2-BocNHPhCH ₂ -	144-145
1399	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ -	1.80-2.00 (m, 2H), 2.15-2.25 (m, 2H), 3.30-3.40 (m, 5H), 3.68 (t, 2H, J = 4.5Hz), 3.95-4.20 (m, 4H), 4.27 (t, 2H, J = 4.5Hz), 7.54 (s, 1H)
1400		1.46 (s, 9H), 1.80-1.95 (m, 2H), 2.05-2.15 (m, 2H), 2.40-2.50 (m, 4H), 2.66 (t, 2H, J = 5Hz), 3.25-3.45 (m, 6H), 3.90-4.10(m, 4H), 4.24 (t, 2H, J = 5Hz), 7.54 (s, 1H)
1401		1.80-1.95 (m, 2H), 2.05-2.25 (m, 2H), 2.35-2.60 (m, 4H), 2.63-2.81 (m, 2H), 3.25-3.55 (m, 6H), 3.85-4.25 (m, 6H), 5.09 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 4H), 7.54 (s, 1H)

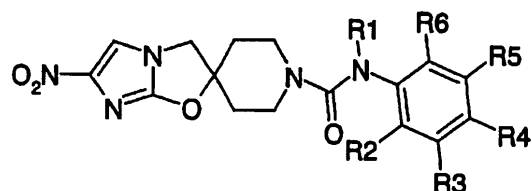
【 2 2 1 0 】

10

20

30

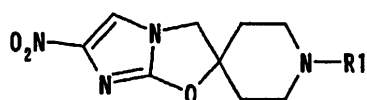
【表 7 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
1402	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	249 - 252(dec.)
1403	-H	-H	-H	-F	-H	-H	238 - 240(dec.)
1404	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	215 - 217
1405	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	231 - 233
1406	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	>300
1407	-H	-H	-F	Morpholino-	-H	-H	240 - 245(dec.)
1408	-H	-H	-H	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-H	>300
1409	-H	-H	-Cl		-H	-H	205 - 207
1410	-H	-H	-H		-H	-H	246 - 250(dec.)
1411	-H	-H	-F		-H	-H	220 - 225(dec.)

【 2 2 1 1 】

【表 7 7】



実施例	R1	Mp(°C)
1412	PhCO-	178-180
1413	PhCH ₂ CO-	170-171
1414	Ph(CH ₂) ₂ CO-	160.5-162
1415	PhOCH ₂ CO-	203-205
1416	(CH ₂) ₂ CHCH ₂ CO-	214-215
1417	4-CF ₃ PhCO-	165-166
1418	PhCH ₂ -	249-251(dec.)
1419	4-PhPhCH ₂ -	262-264(dec.)
1420		195-197(dec.)
1421		226-227(dec.)

【 2 2 1 2 】

実施例 1 4 2 2

(S) - 1 - (2-ブロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル-3- {4- [1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イル} プロパン-2-オール の製造

(R) - 2-ブロモ-4-ニトロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) イミダゾール (485 mg, 1.75 ミリモル)、1- [1- (4-トリフルオロメトキシフ

10

20

30

40

50

ェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン (720 mg、2.19ミリモル) 及びエタノール (10 ml) の混合物を 50℃にて8時間攪拌した。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、黄色アモルファスの (S)-1-(2-ブromo-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イル} プロパン-2-オール (792 mg、収率77%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.13 (3H, s), 1.50-1.75 (2H, m), 1.81-2.00 (2H, m), 2.35 (1H, d, $J=13.9\text{ Hz}$), 2.40-2.86 (12H, m), 3.57-3.76 (2H, m), 3.98 (2H, s), 6.89 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 7.09 (2H, d, $J=8.5\text{ Hz}$), 8.12 (1H, s)。

10

【2213】

実施例1422と同様にして、以下に示す実施例1423～実施例1453の化合物を製造した。

【2214】

実施例1423

(S)-4-{4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-イル} ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.12 (3H, s), 1.29-1.48 (11H, m), 1.67-1.81 (2H, m), 2.34 (1H, d, $J=13.8\text{ Hz}$), 2.38-2.74 (12H, m), 3.97 (2H, s), 4.02-4.14 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

【2215】

実施例1424

(S)-4-{1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペリジン-4-イル} ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

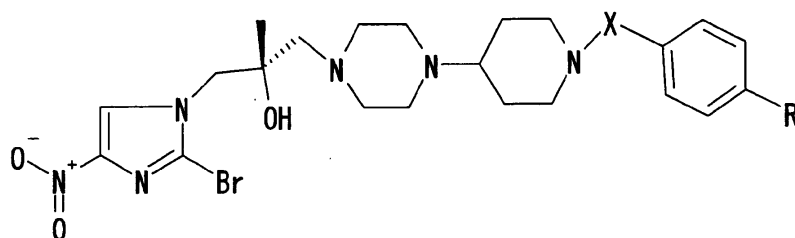
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

30

1.11 (3H, s), 1.38-1.57 (11H, m), 1.69-1.86 (2H, m), 2.24-2.50 (9H, m), 2.67-2.79 (1H, m), 2.86-3.00 (1H, m), 3.31-3.43 (4H, m), 3.95 (2H, s), 8.04 (1H, s)。

【2216】

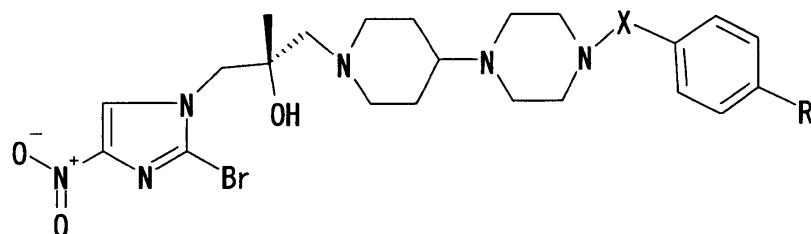
【表 7 8】



実施例	X	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1425	none	OCF ₃	1.13(3H, s), 1.50–1.75(2H, m), 1.81–2.00(2H, m), 2.35(1H, d, J=13.9Hz), 2.40–2.86(12H, m), 3.57–3.76(2H, m), 3.98(2H, s), 6.89(2H, d, J=8.5Hz), 7.09(2H, d, J=8.5Hz), 8.12(1H, s).
1426	C=O	Cl	1.13(3H, s), 1.31–1.56(2H, m), 1.70–2.00(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.65–2.91(12H, m), 3.63–3.84(1H, m), 3.93(2H, s), 4.56–4.74(1H, m), 7.19–7.42(4H, m), 8.13(1H, s).
1427	C=O	OCF ₃	1.14(3H, s), 1.35–1.60(2H, m), 1.74–2.00(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.42–2.93(12H, m), 3.65–3.81(1H, m), 4.00(2H, s), 4.56–4.74(1H, m), 7.25(2H, d, J=8.7Hz), 7.44(2H, d, J=8.7Hz), 8.14(1H, s).
1428	CH ₂	Cl	1.12(3H, s), 1.43–2.05(6H, m), 2.34(1H, d, J=13.9Hz), 2.37–2.95(12H, m), 3.47(2H, s), 3.97(2H, s), 7.12–7.30(4H, m), 8.12(1H, s).
1429	CH ₂	OCF ₃	1.12(3H, s), 1.44–2.05(6H, m), 2.35(1H, d, J=14.0Hz), 2.42–2.93(12H, m), 3.48(2H, s), 3.98(2H, s), 7.15(2H, d, J=8.6Hz), 7.34(2H, d, J=8.6Hz), 8.12(1H, s).

【 2 2 1 7 】

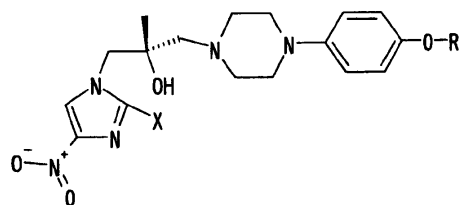
【表 7 9】



実施例	X	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1430	C=O	Cl	1.12(3H, s), 1.43–1.81(4H, m), 2.10–2.62(9H, m), 2.71–3.07(2H, m), 3.31–3.45(4H, m), 3.96(2H, s), 7.24–7.40(4H, m), 8.10(1H, s).
1431	C=O	OCF ₃	1.12(3H, s), 1.45–1.83(4H, m), 2.12–2.57(9H, m), 2.71–3.07(2H, m), 3.28–3.47(4H, m), 3.96(2H, s), 7.25(2H, d, J=8.6Hz), 7.45(2H, d, J=8.6Hz), 8.10(1H, s).
1432	CH ₂	OCF ₃	1.11(3H, s), 1.50–1.98(4H, m), 2.24–3.10(15H, m), 3.54(2H, s), 3.98(2H, s), 7.16(2H, d, J=8.6Hz), 7.34(2H, d, J=8.6Hz), 8.12(1H, s).
1433	CH ₂	Cl	1.11(3H, s), 1.40–1.83(4H, m), 2.25–3.02(15H, m), 3.46(2H, s), 3.95(2H, s), 7.14–7.29(4H, m), 8.12(1H, s).
1434	none	OCF ₃	1.13(3H, s), 1.50–1.64(2H, m), 1.76–1.88(2H, m), 2.15–2.43(5H, m), 2.52–2.95(6H, m), 3.05–3.19(4H, m), 3.98(2H, s), 6.89(2H, d, J=8.7Hz), 7.11(2H, d, J=8.7Hz), 8.1 (1H, s).
1435	none	Cl	1.13(3H, s), 1.50–1.64(2H, m), 1.71–1.90(2H, m), 2.12–2.48(5H, m), 2.55–2.90(6H, m), 3.05–3.19(4H, m), 3.96(2H, s), 6.84(2H, d, J=8.7Hz), 7.18(2H, d, J=8.7Hz), 8.11(1H, s).

【 2 2 1 8 】

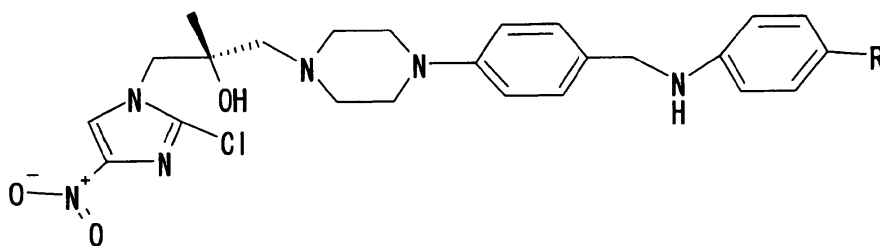
【表 8 0】



実施例	X	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1436	Cl	4-ClPh-	1.17(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.63-2.73(2H, m), 2.76-2.92(2H, m), 3.08-3.18(4H, m), 3.40(1H, s), 4.01(2H, s), 6.80-6.96(6H, m), 7.14-7.24(2H, m), 8.06(1H, s).
1437	Br	4-CF ₃ PhCH ₂ -	1.16(3H, s), 2.39(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.78(2H, m), 2.84-2.92(2H, m), 3.02-3.14(4H, m), 3.46(1H, s), 4.01(2H, s), 5.08(2H, s), 6.89(4H, m), 7.48(2H, d, J=8.3Hz), 7.63(2H, d, J=8.3Hz), 8.12(1H, s).
1438	Br	4-ClPhCH ₂ -	1.16(3H, s), 2.39(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.63-2.78(2H, m), 2.80-2.96(2H, m), 3.04-3.12(4H, m), 3.47(1H, s), 4.01(2H, s), 4.98(2H, s), 6.88(4H, s), 7.35(4H, s), 8.12(1H, s).
1439	Cl	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	1.16(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.76(2H, m), 2.78-2.92(2H, m), 3.04-3.12(4H, m), 3.45(1H, s), 4.00(2H, s), 5.0 (2H, s), 6.89(4H, s), 7.22(2H, d, J=8.6Hz), 7.45(2H, d, J=8.6Hz), 8.06 (1H, s).
1440	Cl	4-CF ₃ OPh-	1.18(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.76(2H, m), 2.78-2.88(2H, m), 3.06-3.20(4H, m), 3.39(1H, s), 4.02(2H, s), 6.84-7.00(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.3Hz), 8.06(1H, s).
1441	Cl	4-CF ₃ Ph-	1.18(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.57(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.77(2H, m), 2.79-2.92(2H, m), 3.06-3.20(4H, m), 3.40(1H, s), 4.03(2H, s), 6.80-7.00(6H, m), 7.53(2H, d, J=8.6Hz), 8.07(1H, s).

【 2 2 1 9 】

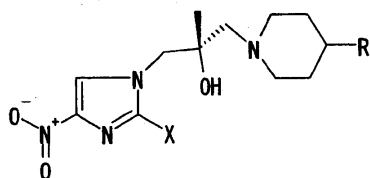
【表 8 1】



実施例	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1442	Cl-	1.17(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.92(4H, m), 3.08-3.24(4H, m), 3.40(2H, s), 4.00(2H, s), 4.20(2H, s), 6.54(2H, d, J=8.7Hz), 6.88(2H, d, J=8.7Hz), 7.09(2H, d, J=8.7Hz), 7.18-7.25(2H, m), 8.06(1H, s).
1443	CF ₃ O-	1.16(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.92(4H, m), 3.08-3.25(4H, m), 3.44(2H, s), 4.02(2H, s), 4.21(2H, s), 6.57(2H, d, J=8.6Hz), 6.89(2H, d, J=8.6Hz), 7.01(2H, d, J=8.3Hz), 7.22(2H, d, J=8.3Hz), 8.06(1H, s).

【 2 2 2 0 】

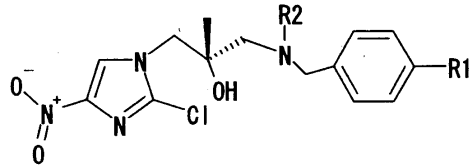
【表 8 2】



実施例	X	R	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1444	Cl		1.15(3H, s), 1.51–1.86(4H, m), 2.27–2.57(3H, m), 2.75–2.92(2H, m), 3.00–3.16(2H, m), 3.56(1H, s), 4.17(2H, s), 6.90–7.02(4H, m), 7.10–7.25(2H, m), 7.56(2H, d, J=8.8Hz), 8.01(1H, s).
1445	Br		1.25(3H, s), 1.50–2.00(8H, m), 2.24–2.67(7H, m), 2.75–3.20(4H, m), 3.97(2H, s), 4.25–4.40(1H, m), 6.88(2H, d, J=8.8Hz), 7.13(2H, d, J=8.8Hz), 8.12(1H, s).
1446	Cl		1.14(3H, s), 1.76–1.93(4H, m), 2.24–2.52(5H, m), 2.74–2.86(1H, m), 2.95–3.07(1H, m), 3.98(2H, s), 7.17(2H, d, J=8.8Hz), 7.55(2H, d, J=8.8Hz), 8.05(1H, s).
1447	Cl		1.13(3H, s), 1.51–1.90(4H, m), 2.19–2.55(5H, m), 2.71–2.83(1H, m), 2.85–3.19(5H, m), 3.51–3.83(4H, m), 3.98(2H, s), 6.90(2H, d, J=8.3Hz), 7.13(2H, d, J=8.3Hz), 8.05(1H, s).
1448	Cl		1.15(3H, s), 1.39–1.83(5H, m), 2.33–2.62(3H, m), 3.00–3.15(2H, m), 3.49–3.61(2H, m), 4.17(2H, s), 6.97–7.05(4H, m), 7.21–7.24(2H, m), 7.53–7.58(2H, m), 8.08(1H, s).
1449	Cl		1.14(3H, s), 1.61–1.81(5H, m), 2.34–2.57(3H, m), 2.77–2.84(2H, m), 3.01–3.06(2H, m), 3.99(2H, s), 5.04(2H, s), 6.89–6.95(2H, m), 7.11–7.25(4H, m), 7.43–7.48(2H, m), 8.09(1H, s).
1450	Cl		1.14(3H, s), 1.45–1.80(5H, m), 2.38–2.60(3H, m), 2.78–2.90(2H, m), 3.01–3.06(2H, m), 3.98(2H, s), 5.11(2H, s), 6.89–6.93(2H, m), 7.12–7.18(2H, m), 7.52–7.55(2H, m), 7.62–7.65(2H, m), 8.08(1H, s).
1451	Cl		1.14(3H, s), 1.38–1.80(5H, m), 2.28–2.60(3H, m), 2.77–2.93(2H, m), 3.02–3.08(2H, m), 3.98(2H, s), 5.01(2H, s), 6.84–6.92(2H, m), 7.11–7.16(2H, m), 7.32–7.36(4H, m), 8.08(1H, s).

【 2 2 2 1 】

【表 8 3】



実施例	R1	R2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1452		CH ₃	1.13(3H, s), 1.48(9H, s), 2.42(3H, s), 2.43(2H, s), 3.03–3.13(4H, m), 3.42(1H, d, J=10.7Hz), 3.50–3.63(5H, m), 3.85(2H, s), 6.84(2H, d, J=7.1Hz), 7.11(2H, d, J=7.1Hz), 7.88(1H, s).
1453		C ₂ H ₅	1.06–1.11(6H, m), 1.48(9H, s), 2.41(1H, d, J=13.2Hz), 2.55(1H, d, J=13.2Hz), 2.64–2.68(2H, m), 3.10–3.13(4H, m), 3.42(1H, d, J=13.2Hz), 3.57–3.60(4H, m), 3.69(1H, d, J=13.2Hz), 3.79(2H, s), 6.83–6.86(2H, m), 7.09–7.12(2H, m), 7.84(1H, s).

【2 2 2 2】

実施例 1 4 5 4

(S) – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2 – { 4 – [1 – (4 – トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン – 4 – イル] ピペラジン – 1 – イルメチル } – 2 , 3 – ジヒドロイミダゾ [2 , 1 – b] オキサゾールの製造

(S) – 1 – (2 – ブロモ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – メチル – 3 – { 4 – [1 – (4 – トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン – 4 – イル] ピペラジン – 1 – イル } プロパン – 2 – オール (7 9 0 m g 、 1 . 3 4 ミリモル) を N , N – ジメチルホルムアミド (4 m l) に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム (6 9 m g 、 1 . 7 4 ミリモル) を加え、同温度下にて 1 時間攪拌した。反応液に酢酸エチル (1 . 3 m l) 、水 (1 0 m l) の順に加え、析出物を濾取し、水洗した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン / メタノール = 1 0 / 1) により精製後、酢酸エチル / イソプロピルエーテルから再結晶することにより、白色粉末の (S) – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2 – { 4 – [1 – (4 – トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン – 4 – イル] ピペラジン – 1 – イルメチル } – 2 , 3 – ジヒドロイミダゾ [2 , 1 – b] オキサゾール (2 7 0 m g 、 収率 4 0 %) を得た。

融点：1 8 0 – 1 8 1 . 5 °C。

【2 2 2 3】

実施例 1 4 5 4 と同様にして、以下に示す実施例 1 4 5 5 ~ 実施例 1 4 6 5 の化合物を製造した。

【2 2 2 4】

実施例 1 4 5 5

(S) – 2 – { 4 – [4 – (4 – クロロフェニル) ピペラジン – 1 – イル] ピペリジン – 1 – イルメチル } – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2 , 3 – ジヒドロイミダゾ [2 , 1 – b] オキサゾール

収率：3 4 %

融点：2 2 6 – 2 2 8 °C。

【2 2 2 5】

実施例 1 4 5 6

(S) – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2 – { 4 – [4 – (4 – トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン – 1 – イル] ピペリジン – 1 – イルメチル } – 2 , 3 – ジヒドロイミダゾ

[2, 1-b] オキサゾール

収率：23%

融点：193-194℃。

【2226】

実施例1457

(S)-2-{4-[4-(4-クロロベンジル)ピペラジン-1-イル]ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率：25%

融点：148-149℃。

【2227】

実施例1458

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-イル]ピペリジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率：21%

融点：142-143℃。

【2228】

実施例1459

(S)-(4-クロロフェニル)-{4-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-イル}メタノン

収率：29%

融点：174-175℃。

【2229】

実施例1460

(S)-{4-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-イル}-(4-トリフルオロメトキシフェニル)メタノン

収率：29%

融点：137-138℃。

【2230】

実施例1461

(S)-2-{4-[1-(4-クロロベンジル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率：24%

融点：168-169℃。

【2231】

実施例1462

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率：27%

融点：140-141℃。

【2232】

実施例1463

(S)-(4-クロロフェニル)-{4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ピペリジン-1-イル}メタノン

収率：30%

融点：218–220℃。

【2233】

実施例1464

(S)–{4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチル)ピペラジン–1–イル]ピペリジン–1–イル}–(4–トリフルオロメトキシフェニル)メタノン

収率：27%

融点：133–134℃。

【2234】

実施例1465

(S)–1'–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチル)–4–(4–トリフルオロメトキシフェノキシ)–[1,4']ビピペリジニル

収率：41%

融点：131–132℃。

【2235】

実施例1466

(S)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチル)ピペラジン–1–イル]ピペリジン–1–カルボン酸 tert–ブチルエステルの製造

(R)–2–クロロ–4–ニトロ–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル)イミダゾール(3g、13.79ミリモル)、4–ピペラジン–1–イル–ピペリジン–1–カルボン酸 tert–ブチルエステル(3.9g、14.48ミリモル)及びエタノール(30ml)の混合物を50℃にて9時間攪拌した。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、黄色アモルファスを得た。これをN,N–ジメチルホルムアミド(18ml)に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(651mg、16.28ミリモル)を加え、同温度下にて1時間攪拌した。反応液に酢酸エチル(6ml)、水(42ml)の順に加え、析出晶を濾取し、水洗した。これを2–プロパノール(20ml)/水(60ml)から再結晶することにより、微黄色粉末の(S)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチル)ピペラジン–1–イル]ピペリジン–1–カルボン酸 tert–ブチルエステル(4.08g、66%)を得た。

融点：181–182℃。

【2236】

実施例1466と同様にして、実施例1467の化合物を製造した。

【2237】

実施例1467

(S)–4–[1–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチル)ピペリジン–4–イル]ピペラジン–1–カルボン酸 tert–ブチルエステル

収率：56%

融点：184–185℃。

【2238】

実施例1468

(S)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメチル)ピペラジン–1–イル]ピペリジン–1–カルボン酸 4–トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造

4–(トリフルオロメトキシ)ベンジルアルコール(480mg、2.50ミリモル)、1,1'–カルボニルビス–1H–イミダゾール(405mg、2.50ミリモル)及

10

20

30

40

50

びN, N-ジメチルホルムアミド (3 ml) の混合物を室温下にて14時間攪拌した。

【2239】

一方、(S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (750 mg、1.66ミリモル) を塩化メチレン (5 ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (5 ml) を加え、室温下にて14時間攪拌した。この反応液を濃縮し、残渣にメタノール (5 ml)、トリエチルアミン (5 ml) を加え、室温下にて10分攪拌後、濃縮した。残渣をN, N-ジメチルホルムアミド (5 ml) に溶解し、これを先程のN, N-ジメチルホルムアミド溶液に加え、50℃にて3時間攪拌した。

10

【2240】

反応液を室温に戻し、水 (40 ml) 中に注ぎ、酢酸エチル (30 ml) により2回抽出した。有機相を合わせ、水 (40 ml) により2回洗浄後、飽和食塩水 (30 ml) により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。有機相を濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製後、酢酸エチル/イソプロピルエーテルから再結晶することにより、淡茶粉末の(S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ピペリジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル (545 mg、58%) を得た。

融点: 105-106℃。

20

【2241】

実施例1468と同様にして、実施例1469の化合物を製造した。

【2242】

実施例1469

(S)-4-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率: 64%

融点: 110-111℃。

【2243】

実施例1470

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-{1-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル]ピペリジン-4-イル}ピペラジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

(S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (750 mg、1.66ミリモル) を塩化メチレン (5 ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (5 ml) を加え、室温下にて1.5時間攪拌した。この反応液を濃縮し、残渣に塩化メチレン (5 ml) 及びトリエチルアミン (5 ml) を加え、室温下にて10分攪拌後、濃縮した。残渣を1,2-ジクロロエタン (20 ml) に溶解し、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロペナール (396 mg、1.83ミリモル) 及びトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム (564 mg、2.66ミリモル) を加え、室温下にて3.5時間攪拌した。反応液を飽和重曹水 (15 ml)、水 (20 ml)、飽和食塩水 (20 ml) の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。この反応液を濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製後、メタノール/水から再結晶することにより、微黄色粉末の(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-{1-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル]ピペリジン-4-イル}ピペラジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (446 mg、49%) を得た。

30

40

50

融点：157－158℃。

【2244】

実施例1470と同様にして、下記に示す実施例1471～実施例1497の化合物を製造した。

【2245】

実施例1471

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-{4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル]ピペラジン-1-イル}ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点：174－175℃。

【2246】

実施例1472

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル]ピペラジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・4-トルエンスルホン酸塩

融点：146.1－148.6℃。

【2247】

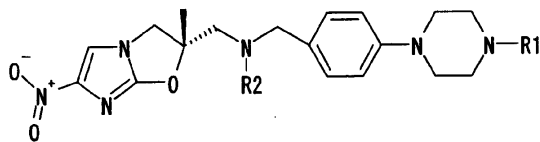
実施例1473

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル]ピペラジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・塩酸塩

融点：133－137℃。

【2248】

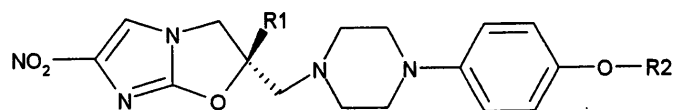
【表84】



実施例	R1	R2	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm
1474		CH ₃	1.48(9H, s), 1.55(3H, s), 2.36(3H, s), 2.61(1H, d, J=12.3Hz), 2.80(1H, d, J=12.3Hz), 3.03-3.15(4H, m), 3.41(1H, d, J=10.8Hz), 3.48-3.60(5H, m), 3.69(1H, d, J=8.1Hz), 4.08(1H, d, J=8.1Hz), 6.85(2H, d, J=7.1Hz), 7.06(2H, d, J=7.1Hz), 7.46(1H, s).
1475		C ₂ H ₅	0.97(3H, t, J=7.1Hz), 1.49(9H, s), 1.53(3H, s), 2.54-2.78(3H, m), 2.93-2.96(1H, m), 3.10-3.13(4H, m), 3.39-3.43(1H, m), 3.57-3.67(6H, m), 3.96(1H, d, J=9.8Hz), 6.83-6.85(2H, m), 7.02-7.05(2H, m), 7.43(1H, s).
1476	H	CH ₃	1.53(3H, s), 2.37(3H, s), 2.60(1H, d, J=12.2Hz), 2.78(1H, d, J=12.2Hz), 2.98-3.18(8H, m), 3.40(1H, d, J=10.8Hz), 3.55(1H, d, J=10.8Hz), 3.66(1H, d, J=8.1Hz), 4.04(1H, d, J=8.1Hz), 6.85(2H, d, J=7.1Hz), 7.06(2H, d, J=7.1Hz), 7.45(1H, s).
1477	H	C ₂ H ₅	0.98(3H, t, J=7.1Hz), 1.53(3H, s), 2.55-2.75(3H, m), 2.93-2.95(1H, m), 3.15-3.18(4H, m), 3.24-3.28(4H, m), 3.37-3.43(1H, m), 3.62-3.67(2H, m), 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 6.82-6.87(2H, m), 7.02-7.05(2H, m), 7.44(1H, s).

【2249】

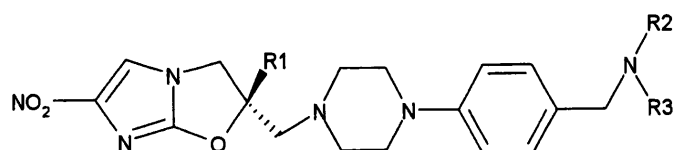
【表 8 5】



実施例	R1	R2	mp(°C)
1478	-CH ₃	4-ClPh-	202.6 - 204.0 dec
1479	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	172.0 - 174.2
1480	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	227.0 - 228.3 dec
1481	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	176 - 179.5
1482	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	114.1 - 116.6
1483	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	105 - 110

【 2 2 5 0 】

【表 8 6】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
1484	-CH ₃	-CH ₃	4-ClPh-	126.2-127.5
1485	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	103.0-106.6
1486	-CH ₃	-H	4-ClPh-	209.8 - 210.3 dec
1487	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPh-	110.0 - 113.5

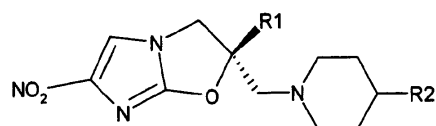
【 2 2 5 1 】

10

20

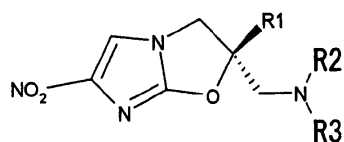
30

【表 8 7】



実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR
1488	-CH ₃		110.6-111.7
1489	-CH ₃		¹ H NMR(CDCl ₃) δ ppm 1.56-1.71(7H, m), 2.16(3H, m), 2.57(1H, d, J=14.9Hz), 2.76-3.10(3H, m), 3.93(1H, d, J=9.8Hz), 4.36(1H, d, J=9.8Hz), 7.12(2H, d, J=8.5Hz), 7.55-7.68(3H, m), 9.04(1H, s).
1490	-CH ₃		¹ H NMR(CDCl ₃) δ ppm 1.48-1.68(4H, m), 1.75-1.95(1H, m), 2.19-2.56(4H, m), 2.75-3.19(9H, m), 3.53-3.77(4H, m), 3.88(1H, d, J=9.7Hz), 4.36(1H, d, J=9.7Hz), 6.89(2H, d, J=8.5Hz), 7.13(2H, d, J=8.5Hz), 7.68(1H, s).
1491	-CH ₃		148.4 - 149.7
1492	-CH ₃		160.4 - 161.8
1493	-CH ₃		164.4 - 167.3 dec
1494	-CH ₃		140.2 - 142.8

【表 8 8】



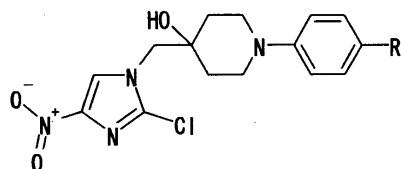
実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹ H NMR
1495	-CH ₃		-CH ₃	143.1 - 145.8
1496	-CH ₃		-C ₂ H ₅	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 0.97(3H, t, J=7.1Hz), 1.51(3H, s), 2.58-2.76(7H, m), 2.89(1H, d, J=14.9Hz), 3.17-3.20(4H, m), 3.38(1H, d, J=13.3Hz), 3.54-3.64(4H, m), 3.89(1H, d, J=9.8Hz), 6.82-6.85(2H, m), 7.01-7.04(2H, m), 7.27-7.30(4H, m), 7.41(1H, s).
1497	-CH ₃		-CH ₃	100.7 - 103.0

【 2 2 5 3 】

実施例 6 4 9 と同様にして、以下に示す化合物を製造した。

【 2 2 5 4 】

【表 8 9】



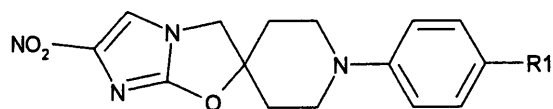
実施例	R	Solvent	¹ H-NMR δ ppm
1498	-Cl	DMSO-d ₆	1.32-1.50(2H,m),1.55-1.75(2H,m),2.86-3.02(2H, m),3.36-3.50(2H,m),4.05(2H,s),4.93(1H,s),6.95(2H,d,J=8.9Hz),7.21(2H,d,J=8.9Hz), 8.35(1H, s).
1499	-OCF ₃	CDCl ₃	1.51-1.67(2H,m),1.76-1.94(2H,m),2.02(1H,s),2.96-3.12(2H,m),3.37-3.56(2H,m),4.07(2H,s),6.9(2H,d,J=8.9Hz),7.12(2H,d,J=8.9Hz),8.00(1H,s).
1500		CDCl ₃	1.57-1.71(2H,m),1.78-1.98(2H,m),2.92-3.08(2H,m),3.24(3H,s),3.35-3.51(2H,m),4.09(2H,s),6.74(2H,d,J=8.9Hz),6.88-7.10(6H,m),8.02(1H,s).
1501		CDCl ₃	1.55-1.69(2H,m),1.80-1.98(2H,m),2.92-3.08(2H,m),3.33-3.49(2H,m),4.09(2H,s),6.82-6.98(6H,m),7.14(2H,d,J=8.9Hz),8.02(1H,s).
1502		CDCl ₃	1.53-1.67(2H,m),1.80-2.16(6H,m),2.84-3.06(4H,m),3.24-3.45(4H,m),4.11(2H,s),4.33-4.47(1H,m),6.80-6.92(6H,m),7.14(2H,d,J=8.9Hz),8.00(1H, s).
1503		CDCl ₃	1.53-1.65(2H,m),1.82-1.98(2H,m),2.84-3.00(2H,m),3.14-3.39(10H,m),4.07(2H,s),6.84-6.96(6H,m),7.14(2H,d,J=8.6Hz),8.01(1H,s).

【 2 2 5 5 】

実施例 6 5 2 と同様にして、以下に示す化合物を製造した。

【 2 2 5 6 】

【表 90】



実施例	R1	mp(°C)
1504	-Cl	242.0 - 245.0
1505	-OCF ₃	235.9 - 236.8 dec.
1506		214.0 - 215.1 dec.
1507		227.3-229.4
1508		237.6-238.4
1509		254.2 - 256.8

【2257】

実施例128と同様にして、以下に示す実施例1510～実施例1888の化合物を製造した。

【2258】

実施例1510

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-4-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点：186-188℃。

【2259】

実施例1511

(R)-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点：157-160℃。

【2260】

実施例1512

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-8-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・4-トルエンスルホン酸塩
融点：207.2-208.0℃(分解)。

【2261】

実施例1513

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジルオキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点：107.9-109.3℃。

【2262】

実施例1514

6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール
融点：173.2-177.3℃。

【2263】

実施例1515

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール
融点：151.0-152.3℃。

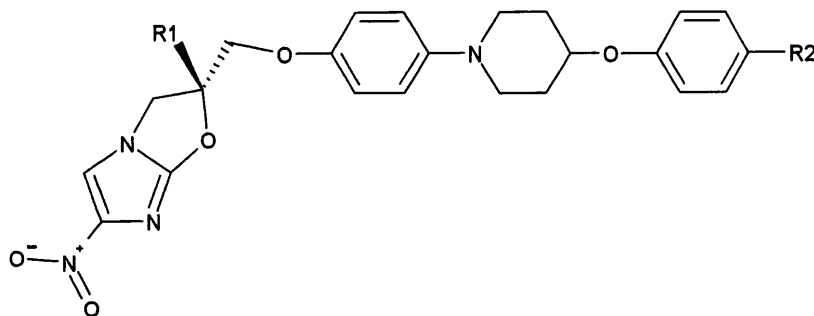
【2264】

実施例1516

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール
融点：199.0-200.5℃。

【2265】

【表91】



実施例	R1	R2	mp(°C)
1517	-CH ₃	-Cl	183.8 - 184
1518	-CH ₃	-CF ₃	179.4 - 180.9
1519	-CH ₃	-F	190.2 - 192.8
1520	-CH ₃	-OCH ₃	193.3 - 194.5
1521	-CH ₃	-CH ₃	198.2 - 201.1 dec
1522	-CH ₃	-H	194.5 - 197.5
1523	-CH ₃	-CN	196.2 - 198.5 dec
1524	-H	-OCF ₃	157.0 - 160.0
1525	-H	-Cl	166.5 - 171.0 dec

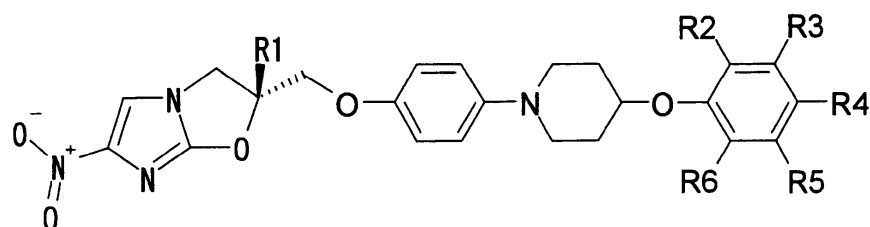
【2266】

10

20

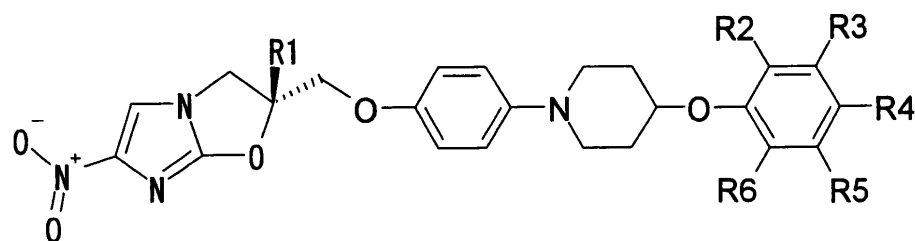
30

【表 9 2】



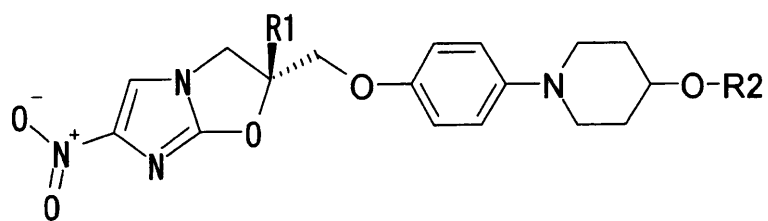
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
1526	-CH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	481
1527	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	481
1528	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	481
1529	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	511
1530	-CH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	511
1531	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	511
1532	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	511
1533	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	451
1534	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	485
1535	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	485
1536	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	485
1537	-CH ₃	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	519
1538	-CH ₃	-Cl	-H	-Cl	-H	-H	519
1539	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-Cl	-H	519
1540	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	519
1541	-CH ₃	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	519
1542	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	519
1543	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	465
1544	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	465
1545	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	465
1546	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	479
1547	-CH ₃	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	479
1548	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	479
1549	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	479
1550	-CH ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	479
1551	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	479
1552	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-F	469
1553	-CH ₃	-H	-H	-H	-F	-H	469
1554	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	469
1555	-CH ₃	-F	-F	-H	-H	-H	487
1556	-CH ₃	-F	-H	-F	-H	-H	487
1557	-CH ₃	-F	-H	-H	-F	-H	487
1558	-CH ₃	-F	-H	-H	-H	-F	487
1559	-CH ₃	-H	-F	-F	-H	-H	487
1560	-CH ₃	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	523
1561	-CH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-H	523
1562	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	523
1563	-CH ₃	-CN	-H	-H	-H	-H	476
1564	-CH ₃	-H	-CN	-H	-H	-H	476
1565	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	-H	476
1566	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	519
1567	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	519

【表 9 3】



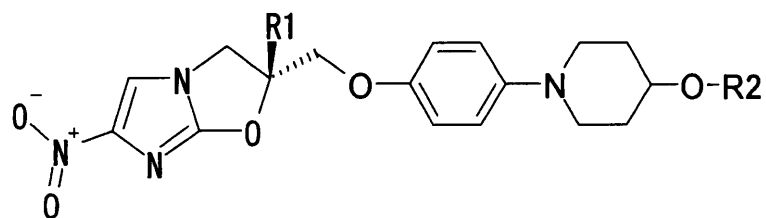
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
1568	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	519
1569	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	535
1570	-CH ₃	-H	-F	-H	-F	-H	487
1571	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	535
1572	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	535
1573	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCH(CH ₃) ₂	509
1574	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	537
1575	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	539
1576	-CH ₃	-H	-H	-Br	-H	-F	547
1577	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	-F	483
1578	-CH ₃	-H	-H	-C ₃ H ₇	-H	-H	493
1579	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-F	-H	503
1580	-CH ₃	-H	-H	-NO ₂	-H	-F	514
1581	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-OCH ₃	521
1582	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	527
1583	-CH ₃	-H	-H	-H	-N(C ₂ H ₅) ₂	-H	522
1584	-CH ₃	-H	-CH=CHCH ₃ (cis)	-H	-H	-OC ₂ H ₅	535
1585	-CH ₃	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	493
1586	-CH ₃	-H	-H	-H	-NHCONH ₂	-H	509
1587	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ COCH ₃	-H	-H	521
1588	-CH ₃	-H	-H	-H	-NHC ₆ H ₅	-H	542
1589	-CH ₃	-H	-H	-NH ₂	-H	-Cl	500
1590	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	523
1591	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-Cl	515
1592	-CH ₃	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	509
1593	-CH ₃	-H	-H	-COCH ₃	-H	-CONH ₂	536
1594	-CH ₃	-H	-H	-COC ₂ H ₅	-H	-H	507
1595	-CH ₃	-H	-H	-COCH ₃	-H	-CH ₃	507
1596	-CH ₃	-H	-H	-COCH ₃	-OH	-H	509
1597	-CH ₃	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	508
1598	-CH ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-H	493
1599	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	541
1600	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	539
1601	-CH ₃	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	497
1602	-CH ₃	-H	-H	-CHF ₂	-H	-H	517

【表 9 4】



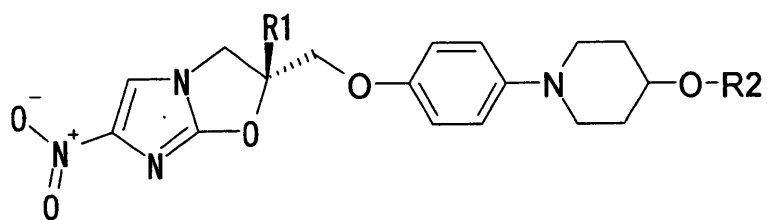
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1603	-CH ₃		495
1604	-CH ₃		501
1605	-CH ₃		507
1606	-CH ₃		518
1607	-CH ₃		518
1608	-CH ₃		522
1609	-CH ₃		519
1610	-CH ₃		531
1611	-CH ₃		525
1612	-CH ₃		502

【表 9 5】



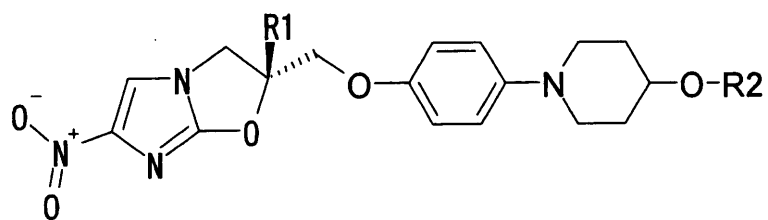
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1613	-CH ₃		502
1614	-CH ₃		517
1615	-CH ₃		521
1616	-CH ₃		541
1617	-CH ₃		519
1618	-CH ₃		505
1619	-CH ₃		502
1620	-CH ₃		516
1621	-CH ₃		507
1622	-CH ₃		505

【表 9 6】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
1623	-CH ₃		491
1624	-CH ₃		584
1625	-CH ₃		582
1626	-CH ₃		516
1627	-CH ₃		568
1628	-CH ₃		659
1629	-CH ₃		635
1630	-CH ₃		673
1631	-CH ₃		508
1632	-CH ₃		505

【表 9 7】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
1633	-CH ₃		452
1634	-CH ₃		452
1635	-CH ₃		492
1636	-CH ₃		493
1637	-CH ₃		503
1638	-CH ₃		

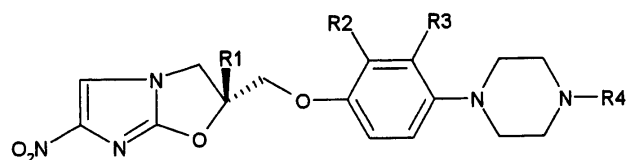
【 2 2 7 2 】

10

20

30

【表 9 8】



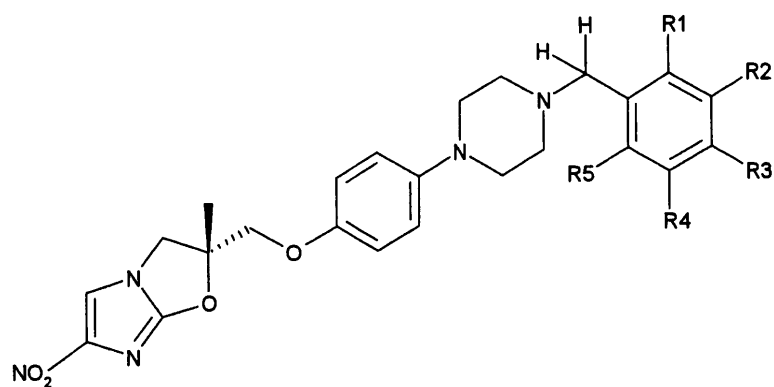
実施例	R1	R2	R3	R4	mp(°C) or ¹ H NMR
1639	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	208 - 210.5
1640	-CH ₃	-H	-H	4-BrPhCH ₂ -	213.5 - 215.4
1641	-CH ₃	-H	-H	4-BrPhCH ₂ OCO-	185.4 - 188.5
1642	-CH ₃	-H	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	255.4 - 257.9 dec
1643	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ PhCH=N-	178.0 - 278.6
1644	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhOCO-	226.5-226.8
1645	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ PhCCCH ₂ OCO-	186.4-187.7
1646	-H	-H	-H	4-CF ₃ OPh-	232.0 - 234.5
1647	-H	-H	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	171.4 - 172.9
1648	-H	-H	-H	4-ClPhCH ₂ -	191.2-192.0
1649	-H	-H	-H	(CH ₃) ₃ COCO-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.48(9H, s), 2.99-3.04(4H, m), 3.55-3.60(4H, m), 4.22-4.37(2H, m), 4.39-4.49(2H, m), 5.56-5.63(1H, m), 6.79-6.91(4H, m), 7.63(1H, s).

【 2 2 7 3 】

10

20

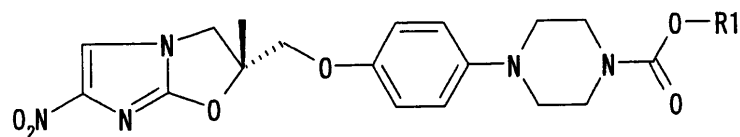
【表 9 9】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1650	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	518
1651	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	495
1652	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	518
1653	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	464
1654	-H	-H	-CN	-H	-H	475
1655	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	526
1656	-H	-H	-F	-H	-H	468
1657	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	518
1658	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	518
1659	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	480
1660	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	496
1661	-H	-H	-SO ₂ CH ₃	-H	-H	528
1662	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	556
1663	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	518
1664	-F	-F	-F	-H	-H	504
1665	-H	-H	-OCOCH ₃	-H	-H	508

【 2 2 7 4 】

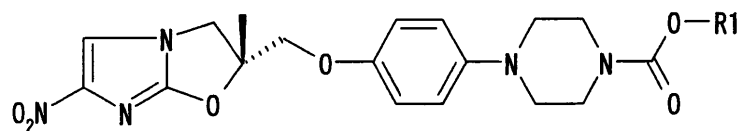
【表 100】



実施例	R1	MS(M+1)
1666	4-CF ₃ OPh-	564
1667	4-CH ₃ OPhCH ₂ -	524
1668	4-CH ₃ PhCH ₂ -	508
1669	4-CH ₃ O ₂ CPhCH ₂ -	552
1670	-CH ₂ C ₆ H ₅	494
1671	4-CH ₃ SPhCH ₂ -	540
1672	4-NO ₂ PhCH ₂ -	539
1673	3,4,5-(CH ₃ O) ₃ PhCH ₂ -	584
1674	2-CH ₃ CONHPhCH ₂ -	551
1675	4-FPhCH ₂ -	512
1676	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	578
1677	4-PhCH ₂ OPhCH ₂ -	600
1678	4-CF ₃ SPhCH ₂ -	594
1679	3-CF ₃ OPhCH ₂ -	578
1680	2-CF ₃ OPhCH ₂ -	578
1681	C ₆ F ₅ CH ₂ -	584
1682	PhCH=CHCH ₂ -	520
1683	4-ClPhCH=CHCH ₂ -	554
1684	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	604
1685	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	508
1686	Ph(CH ₂) ₃ -	522
1687	PhCCCH ₂ -	518
1688	PhS(CH ₂) ₂ -	540
1689	PhCH ₂ O(CH ₂) ₂ -	538
1690	-CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	458
1691	-CH ₂ CH ₂ CN	457
1692	CH ₃ (CH ₂) ₁₅ -	628
1693	CH ₃ CH ₂ O(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	520
1694	-CH ₂ CH ₂ CCH	456
1695	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂ -	586
1696	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	458

【 2 2 7 5 】

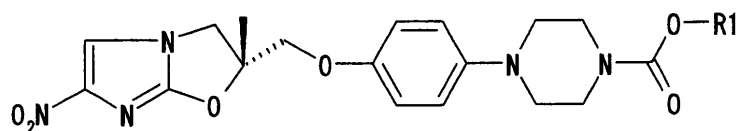
【表 101】



実施例	R1	MS(M+1)
1697		495
1698		495
1699		484
1700		584
1701		596
1702		634
1703		495
1704		552
1705		509
1706		484

【2276】

【表 102】

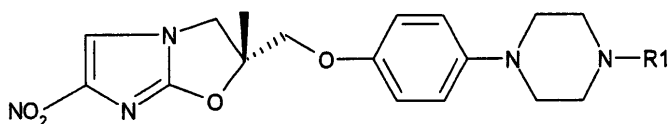


実施例	R1	MS(M+1)
1707		520
1708		529
1709		544

10

【2277】

【表 103】



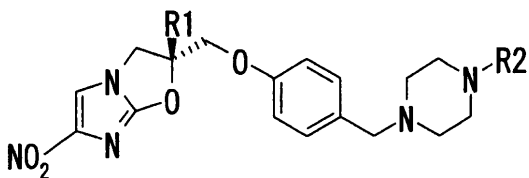
実施例	R1	MS(M+1)
1710	-CH ₂ CH=CH ₂	400
1711	-C ₆ H ₁₃	444
1712	-CH ₂ CN	399
1713	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	430
1714	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	445

20

30

【2278】

【表 104】

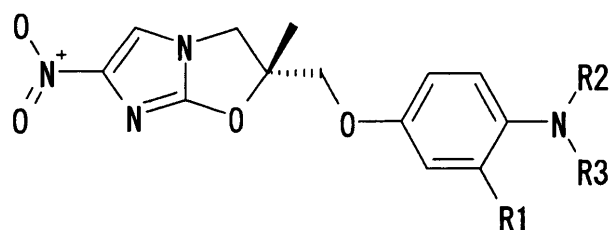


実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR
1715	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	157.9 - 158.8
1716	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	188.4 - 190.2
1717	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	112.1 - 115.4
1718	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	
1719	-CH ₃	4-CF ₃ OPhNHCO-	

40

【2279】

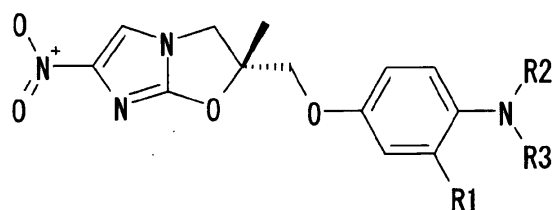
【表 105】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
1720	-H	4-CF ₃ OPh-	-CH ₃	126.9-128.9
1721	-H	4-CF ₃ OPh-	-C ₂ H ₅	102.1 - 103.1
1722	-H	4-ClPh-	-C ₂ H ₅	121.7 - 123.6
1723	-H	-C ₆ H ₅	-CH ₃	169.5 - 171.0
1724	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-CH ₃	134.8 - 136.8
1725	-H	4-ClPhCH ₂ -	-CH ₃	161.4 - 164.1
1726	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-CH ₃	136.4 - 137.9
1727	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-C ₂ H ₅	119 - 120.5
1728	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-C ₂ H ₅	134.3 - 135.7
1729	-H	4-ClPhCH ₂ -	-C ₂ H ₅	135.8 - 137
1730	-F	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-CH ₃	132.7 - 134.7
1731	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	135.9 - 137
1732	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-C ₆ H ₅	198.9 - 200.8
1733	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-C ₆ H ₅	192.7 - 194.7
1734	-H	4-ClPhCH ₂ -	-C ₆ H ₅	195.1 - 196.1
1735	-H	-C ₆ H ₅	-COCH ₃	167.7 - 168.7
1736	-H	4-ClPh-	-COCH ₃	220.0 - 223.5
1737	-H	4-CF ₃ Ph-	-COCH ₃	223.1 - 224.6
1738	-H	4-CF ₃ OPh-	-COCH ₃	243.6 - 244.9
1739	-F	4-ClPh-	-COCH ₃	221.8 - 223.0
1740	-F	4-CF ₃ OPh-	-COCH ₃	240.3 - 242.9
1741	-H	-C ₆ H ₅	-CO ₂ CH ₃	182.7 - 184.8
1742	-H	4-ClPh-	-CO ₂ CH ₃	244.0 - 245.1
1743	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-H	151.4 - 154.3
1744	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-CO ₂ C ₂ H ₅	105.1 - 107.6
1745	-H	4-ClPh(CH ₂) ₂ -	-CH ₃	116.1 - 117.6
1746	-H	4-CF ₃ OPhO(CH ₂) ₃ -	-H	189.9 - 191.0
1747	-H	4-CF ₃ OPhCO-	-CH ₃	143.3 - 145.9

【2280】

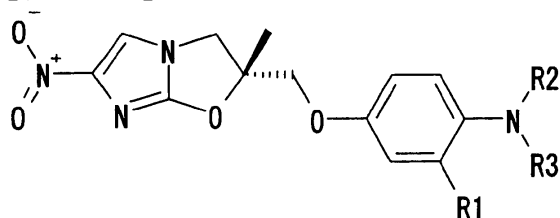
【表 106】



実施例	R1	R2	R3	¹ H NMR
1748	-H	4-CF ₃ Ph-	-CH ₃	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.80(3H, s), 3.28(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.11(1H, d, J=10.2Hz), 4.26(1H, d, J=10.2Hz), 4.52(1H, d, J=10.2Hz), 6.70(2H, d, J=8.7Hz), 6.88(2H, d, J=8.8Hz), 7.13(2H, d, J=8.8Hz), 7.39(2H, d, J=8.7Hz), 7.57(1H, s).
1749	-H	4-ClPh-	-CH ₃	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.79(3H, s), 3.22(3H, s), 4.04(1H, d, J=10.4Hz), 4.08(1H, d, J=10.4Hz), 4.23(1H, d, J=10.1Hz), 4.50(1H, d, J=10.1Hz), 6.70-6.73(2H, m), 6.81-6.84(2H, m), 7.03-7.06(2H, m), 7.12-7.15(2H, m), 7.56(1H, s).
1750	-H	4-CF ₃ Ph-	-C ₂ H ₅	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.20(3H, d, J=7.1Hz), 1.81(3H, s), 3.71(2H, q, J=7.1Hz), 4.07(1H, d, J=10.2Hz), 4.11(1H, d, J=10.2Hz), 4.27(1H, d, J=10.2Hz), 4.52(1H, d, J=10.2Hz), 6.63-6.66(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.10-7.12(2H, m), 7.34-7.37(2H, m), 7.57(1H, s).
1751	-F	4-ClPh-	-CH ₃	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.80(3H, s), 3.20(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.09(1H, d, J=10.1Hz), 4.25(1H, d, J=10.1Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 6.54-6.57(2H, m), 6.64-6.71(2H, m), 7.09-7.19(3H, m), 7.57(1H, s).
1752	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-COCH ₃	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.79(3H, s), 1.85(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.08(1H, d, J=10.2Hz), 4.24(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 4.82(2H, s), 6.78-6.82(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.09-7.11(2H, m), 7.20-7.22(2H, m), 7.56(1H, s).
1753	-H	4-CF ₃ OPhCO-	-CH ₃	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.76(3H, s), 3.45(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.1Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.46(1H, d, J=10.2Hz), 6.69-6.72(2H, m), 6.95-6.98(2H, m), 7.37-7.46(4H, m), 7.55(1H, s).
1754	-H	4-ClPhCO-	-CH ₃	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.77(3H, s), 3.43(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.1Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.46(1H, d, J=10.2Hz), 6.69-6.72(2H, m), 6.94-6.97(2H, m), 7.13-7.23(4H, m), 7.55(1H, s).
1755	-H	4-ClPhCO-	-H	¹ H NMR(DMSO) δ 1.68(3H, s), 4.17-4.20(1H, m), 4.22-4.30(2H, m), 4.36-4.39(1H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.57-7.66(4H, m), 7.94-7.97(2H, m), 8.15(1H, s), 10.19(1H, brs).

【2281】

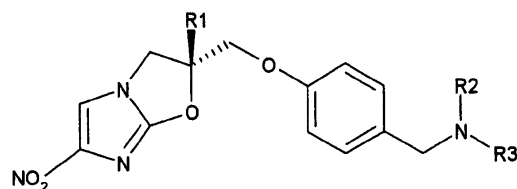
【表 107】



実施例	R1	R2	R3	¹ H NMR
1756	-H	4-ClPhCO-	-H	¹ H NMR(DMSO) δ 1.68(3H, s), 4.17-4.20(1H, m), 4.22-4.30(2H, m), 4.36-4.39(1H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.57-7.66(4H, m), 7.94-7.97(2H, m), 8.15(1H, s), 10.19(1H, brs).
1757	-H	4-CF ₃ PhCO-	-H	¹ H NMR(DMSO) δ 1.68(3H, s), 4.17-4.21(1H, m), 4.24-4.30(2H, m), 4.36-4.40(1H, m), 6.90-6.93(2H, m), 7.65-7.68(2H, m), 7.88-7.90(2H, m), 8.11-8.13(2H, m), 8.16(1H, s), 10.35(1H, brs).
1758	-H	4-CF ₃ OPhCO-	-H	¹ H NMR(DMSO) δ 1.68(3H, s), 4.17-4.20(1H, m), 4.24-4.31(2H, m), 4.36-4.40(1H, m), 6.89-6.92(2H, m), 7.49-7.52(2H, m), 7.63-7.66(2H, m), 8.04-8.06(2H, m), 8.16(1H, s), 10.23(1H, brs).
1759	-H	4-ClPh-	-H	142.6 - 144.7
1760	-H	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₂ -	-H	
1761	-H	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₂ -	-CH ₃	
1762	-H	4-CF ₃ OPhO(CH ₂) ₃ -	-C ₂ H ₅	107.6 - 109.2
1763	-H	4-CF ₃ OPhCOCH ₂ -	-H	
1764	-H	4-CF ₃ OPhCOCH ₂ -	-CH ₃	

【2282】

【表 108】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹ H NMR
1765	-CH ₃	-H	4-ClPh-	171.5 - 173.5
1766	-CH ₃	-H	4-CF ₃ Ph-	172.2 - 174.9
1767	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	138.5 - 141.0
1768	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPh-	165.1 - 167.2
1769	-CH ₃	-COCH ₃	4-CF ₃ OPh-	128.4 - 130.8
1770	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	113.6 - 114.5
1771	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	168.2 - 170.7
1772	-CH ₃	-COCH ₃	4-CF ₃ Ph-	132.8 - 133.9
1773	-CH ₃	-CH ₃	4-ClPh-	160.9 - 163.4
1774	-CH ₃	-CO ₂ C ₂ H ₅	4-CF ₃ OPh-	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.21(3H, t, d=7.1), 1.77(3H, s), 4.05(1H, d, J=10.3Hz), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.15-4.22(3H, m), 4.49(1H, d, J=10.3Hz), 4.78(2H, s), 6.74-6.78(2H, m), 7.07-7.13(6H, m), 7.55(1H, s).
1775	-CH ₃	-COCH ₃	4-ClPh-	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.78(3H, s), 1.86(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.2Hz), 4.05(1H, d, J=10.1Hz), 4.21(1H, d, J=10.1Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 4.78(2H, s), 6.71-6.74(2H, m), 6.87-6.89(2H, m), 7.08-7.11(2H, m), 7.28-7.32(2H, m), 7.55(1H, s).

【2283】

10

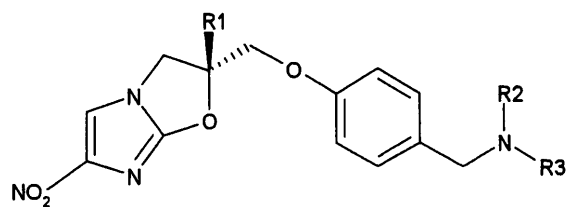
20

30

40

50

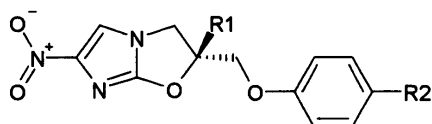
【表 109】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹ H NMR
1776	-CH ₃		-CH ₃	178.7 - 179.7
1777	-CH ₃		-CH ₃	
1778	-CH ₃		-CH ₃	
1779	-CH ₃		-CH ₃	
1780	-CH ₃		-CH ₃	

【 2 2 8 4 】

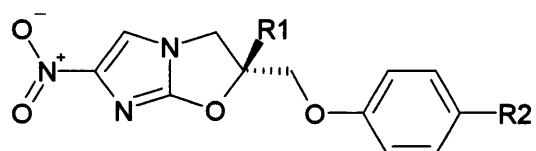
【表 1 1 0】



実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR
1781	-CH ₃		177.4-184.3
1782	-CH ₃		196.3 - 197.8
1783	-CH ₃		212.3-214.0
1784	-CH ₃		251.9 - 253.0
1785	-CH ₃		216.7 - 219.5 dec
1786	-CH ₃		248.1 - 248.2
1787	-CH ₃		150.3 - 154.9
1788	-CH ₃		150.8 - 151.2
1789	-CH ₃		¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.55(1H, s), 1.60(1H, s), 1.77(3H, s), 1.80-1.95(2H, m), 2.15-2.40(2H, m), 3.04-3.27(2H, m), 3.33-3.53(2H, m), 3.95-4.11(2H, m), 4.19(1H, d, J=10.2Hz), 4.50(1H, d, J=10.2Hz), 6.71-6.86(2H, m), 6.88-7.02(2H, m), 7.14-7.31(2H, m), 7.47-7.63(3H, m).
1790	-CH ₃		¹ H NMR(DMSO) 1.67(3H, s), 2.61(2H, brs), 3.13-3.98(2H, m), 3.74(2H, d, J=2.9Hz), 4.08-4.25(3H, m), 4.37(2H, d, J=10.9Hz), 6.28(1H, s), 6.81(2H, d, J=9.1Hz), 6.94(2H, d, J=9.2Hz), 7.18-7.57(5H, m), 8.17(1H, s).

【 2 2 8 5 】

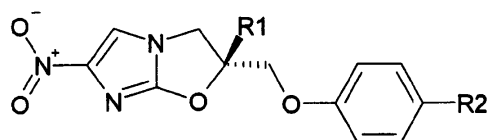
【表 1 1 1】



実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR
1791	-CH ₃		202.0 – 203.5
1792	-CH ₃		206.0
1793	-CH ₃		247.8 – 249.8
1794	-CH ₃		97.7 – 99.7
1795	-CH ₃		172.5–175.8
1796	-CH ₃		160.7 – 163.0
1797	-CH ₃		¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.81(3H, s), 3.44(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.12(1H, d, J=10.0Hz), 4.27(1H, d, J=10.0Hz), 4.52(1H, d, J=10.2Hz), 6.83–6.91(2H, m), 7.39–7.45(2H, m), 7.51–7.56(3H, m), 7.57(1H, s), 7.62–7.68(2H, m)

【 2 2 8 6 】

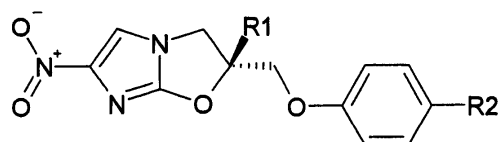
【表 1 1 2】



実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR
1796 A	-CH ₃		202.0 - 203.5
1797 A	-CH ₃		206.0
1798	-CH ₃		247.8 - 249.8
1799	-CH ₃		97.7 - 99.7
1800	-CH ₃		172.5-175.8
1801	-CH ₃		160.7 - 163.0
1802	-CH ₃		¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.81(3H, s), 3.44(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.24Hz), 4.12(1H, d, J=10.0Hz), 4.27(1H, d, J=10.0Hz), 4.52(1H, d, J=10.2Hz), 6.83-6.91(2H, m), 7.39-7.45(2H, m), 7.51-7.56(3H, m), 7.57(1H, s), 7.62-7.68(2H, m)

【 2 2 8 7 】

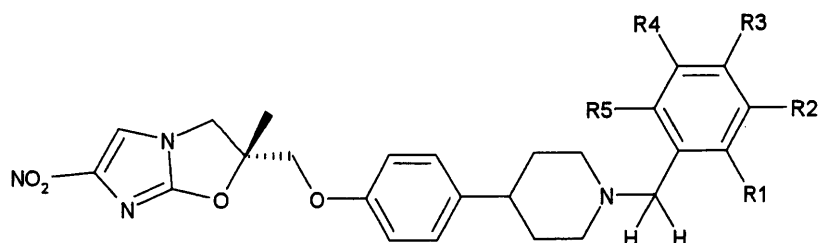
【表 1 1 3】



実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR	
1803	-CH ₃		¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.80(3H, s), 4.01-4.14(2H, m), 4.26(1H, d, J=10.0Hz), 4.51(1H, d, J=10.3Hz), 6.85(2H, d, J=8.6Hz), 7.03-7.09(4H, m), 7.53-7.60(4H, m), 7.66(1H, s)	10
1804	-CH ₃		¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.81(3H, s), 4.05(1H, d, J=10.3Hz), 4.11(1H, d, J=10.0Hz), 4.26(1H, d, J=10.0Hz), 4.51(1H, d, J=10.3Hz), 6.83-7.05(4H, m), 7.20-7.26(2H, m), 7.51-7.60(4H, m), 7.65(1H, s)	
1805	-CH ₃			20
1806	-CH ₃			
1807	-CH ₃			
1808	-CH ₃		209.1 - 212.9	30

【 2 2 8 8 】

【表 1 1 4】



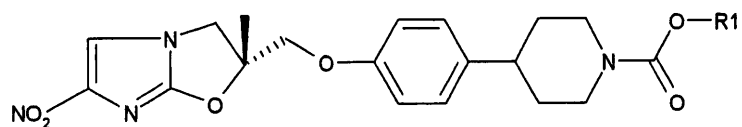
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1809	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	517
1810	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	494
1811	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	517
1812	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	463
1813	-H	-H	-CN	-H	-H	474
1814	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	525
1815	-H	-H	-F	-H	-H	467
1816	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	517
1817	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	517
1818	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	479
1819	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	495
1820	-H	-H	-SO ₂ CH ₃	-H	-H	527
1821	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	555
1822	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	517
1823	-F	-F	-F	-H	-H	503
1824	-H	-H	-OCOCH ₃	-H	-H	507

【 2 2 8 9】

10

20

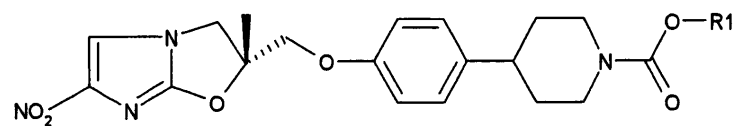
【表 1 1 5】



実施例	R1	MS(M+1)
1825	4-CF ₃ OPh-	563
1826	4-CH ₃ OPhCH ₂ -	523
1827	4-CH ₃ PhCH ₂ -	507
1828	4-CH ₃ O ₂ CPhCH ₂ -	551
1829	-CH ₂ C ₆ H ₅	493
1830	4-CH ₃ SPhCH ₂ -	539
1831	4-NO ₂ PhCH ₂ -	538
1832	3,4,5-(CH ₃ O) ₃ PhCH ₂ -	583
1833	2-CH ₃ CONHPhCH ₂ -	550
1834	4-FPhCH ₂ -	511
1835	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	577
1836	4-PhCH ₂ OPhCH ₂ -	599
1837	4-CF ₃ SPhCH ₂ -	593
1838	3-CF ₃ OPhCH ₂ -	577
1839	2-CF ₃ OPhCH ₂ -	577
1840	C ₆ F ₅ CH ₂ -	583
1841	PhCH=CHCH ₂ -	519
1842	4-ClPhCH=CHCH ₂ -	553
1843	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	603
1844	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	507
1845	Ph(CH ₂) ₃ -	521
1846	PhCCCH ₂ -	517
1847	PhS(CH ₂) ₂ -	539
1848	PhCH ₂ O(CH ₂) ₂ -	537
1849	-CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	457
1850	-CH ₂ CH ₂ CN	456
1851	CH ₃ CH ₂ O(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	519
1852	-CH ₂ CH ₂ CCH	455
1853	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂ -	585
1854	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	457

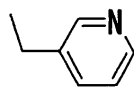
【 2 2 9 0 】

【表 1 1 6】



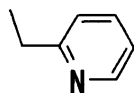
実施例	R1	MS(M+1)
1855		494
1856		494
1857		483
1858		583
1859		595
1860		499
1861		494
1862		551
1863		508
1864		483
1865		519
1866		528

1855



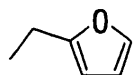
494

1856



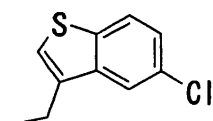
494

1857



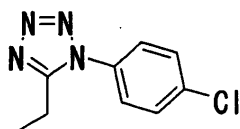
483

1858



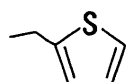
583

1859



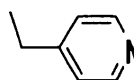
595

1860



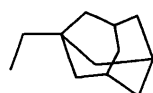
499

1861



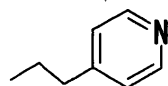
494

1862



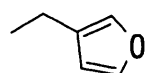
551

1863



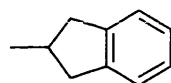
508

1864



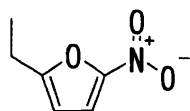
483

1865



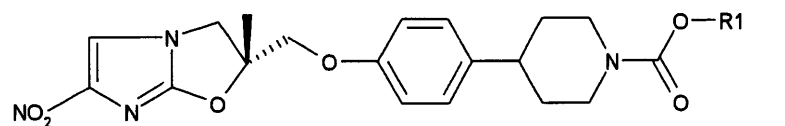
519

1866



528

【表 1 1 7】

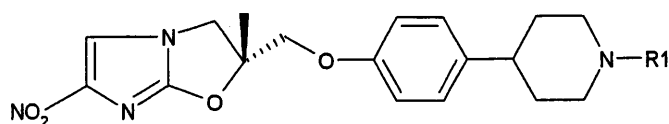


実施例	R1	MS(M+1)
1867		543

10

【 2 2 9 2 】

【表 1 1 8】

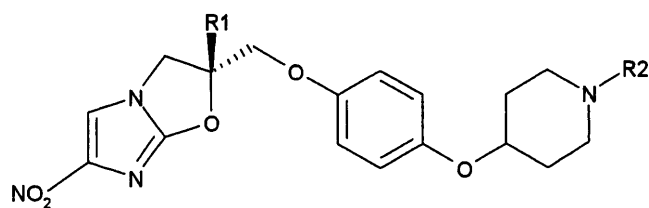


実施例	R1	MS(M+1)
1868	-CH ₂ CH=CH ₂	399
1869	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	463
1870	-C ₆ H ₁₃	443
1871	-CH ₂ CN	398
1872	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	444
1873	PhCOCH ₂ -	477

20

【 2 2 9 3 】

【表 1 1 9】



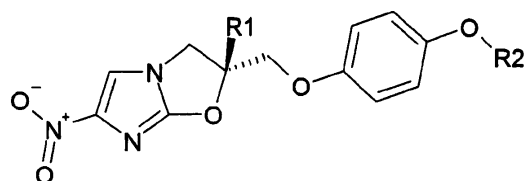
30

実施例	R1	R2	mp(°C)
1874	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	171.4 - 172.4
1875	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ OCO-	130.4 - 131.7
1876	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ OCO-	126.8 - 129.1
1877	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	143.8 - 144.8
1878	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	183.0 - 187.2
1879	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	174.3 - 176.5
1880	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	156.7 - 157.7
1881	-CH ₃	(CH ₃) ₃ COCO-	197.0 - 198.2
1882	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	154.5 - 156.7

40

【 2 2 9 4 】

【表 120】



実施例	R1	R2	mp(°C) or ¹ H NMR
1883	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	214.3 - 216.1
1884	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	158.5 - 160.1
1885	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	161.7 - 164.4
1886	-CH ₃	4-ClPh-	163.5 - 166.3
1887	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.76(3H, s), 4.02(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 5.00(2H, s), 6.77-6.81(2H, m), 6.85-6.90(2H, m), 7.21-7.23(2H, m), 7.42-7.45(2H, m), 7.54(1H, s).
1888	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	¹ H NMR(CDCl ₃) δ 1.77(3H, s), 4.02(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.2Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 5.07(2H, s), 6.77-6.81(2H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.51-7.55(3H, m), 7.62-7.65(2H, m).

【2295】

実施例 1889

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] フェノール (693 mg、1.96 ミリモル) を N, N' - ジメチルホルムアミド (3 ml) に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム (86 mg、2.16 ミリモル) を加え、70 ~ 75 °C にて 20 分攪拌した。この混合物を氷冷し、(R) - 2 - ブロモ - 4 - ニトロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) イミダゾール (720 mg、2.75 ミリモル) を N, N' - ジメチルホルムアミド (3 ml) に溶解した溶液を加え、70 ~ 75 °C にて 20 分攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水 (25 ml) を加え、塩化メチレン (50 ml) により 3 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗後、硫酸マグネシウムにより乾燥した。有機相を減圧濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン / 酢酸エチル = 3 / 1) により精製し、酢酸エチル / イソプロピルエーテルから再結晶することにより、微黄色粉末の (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (343 mg、33%) を得た。

【2296】

実施例 1890

(1) (S) - 4 - [3 - (2 - ブロモ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - プロペニルエステルの製造

(R) - 2 - ブロモ - 4 - ニトロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) イミダゾール (2.04 g、7.78 ミリモル)、ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 2 - プロペニルエステル (2.69 g、8.56 ミリモル) 及び N, N' - ジメチルホルムアミド (10 ml) の混合物を 50 °C にて 20 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水 (45 ml) を加え、酢酸エチル (15 ml) により 2 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。有機相を減

圧濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝1／2）で精製することにより、黄色油状物質の（S）-4-[3-(2-ブロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル（3.77 g、84%）を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.16 (3H, s), 2.36 (1H, d, J=14.0 Hz), 2.43-2.76 (5H, m), 3.21 (1H, s), 3.41-3.57 (4H, m), 4.01 (2H, s), 4.78 (2H, dd, J=1.0 Hz, 6.1 Hz), 6.29-6.43 (1H, m), 6.66 (1H, d, J=16.0 Hz), 7.48 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.58 (2H, d, J=8.3 Hz), 8.10 (1H, s)。

10

【2297】

(2) (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステルの製造

(S)-4-[3-(2-ブロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル（3.5 g、6.07ミリモル）をN,N'-ジメチルホルムアミド（10.5 ml）に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム（316 mg、7.89ミリモル）を加え、同温度下にて1.5時間攪拌した。反応液に酢酸エチル（3.5 ml）及び水（24.5 ml）を加え、30分攪拌した。析出晶を濾取し、水洗した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）により精製した後、2-プロパノール／水から再結晶することにより、微黄色粉末の（S）-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル（2.07 g、69%）を得た。

20

【2298】

参考例448

1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ]ピペリジンの製造

30

4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ]ピペリジン（2.52 g、11.22ミリモル）、2-(4-ブロモフェノキシ)テトラヒドロピラン（2.89 g、11.22ミリモル）、酢酸パラジウム（50 mg、0.22ミリモル）、(S)-(-)-2,2-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチル(BINAP)（212 mg、0.34ミリモル）及びtert-ブトキシナトリウム（1.51 g、15.71ミリモル）を窒素雰囲気下トルエン（30 ml）中にて3時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝20／1）により精製し、淡黄色粉末の1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ]ピペリジン（1.33 g、収率30%）を得た。

40

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.50-2.04 (10H, m), 2.68-2.80 (2H, m), 2.78 (3H, s), 3.50-3.70 (4H, m), 3.85-4.03 (1H, m), 5.31 (1H, t, J=5.7 Hz), 6.72 (2H, d, J=9.1 Hz), 6.90 (2H, d, J=9.2 Hz), 6.98 (2H, d, J=9.2 Hz), 7.17 (2H, d, J=9.1 Hz)。

【2299】

参考例449

50

4- {4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジン-1-イル} フェノールの製造

1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジン (1.33 g、3.32 ミリモル) をエタノール (80 ml) に懸濁し、ピリジニウム p-トルエンスルホナート (0.25 g、1 ミリモル) を加え、70 °C で 8 時間攪拌した。エタノールを減圧留去して残渣に塩化メチレン及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え攪拌した。これを塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣に塩化メチレンおよび n-ヘキサンを加えて攪拌し生成した沈殿を濾取して、薄ピンク色粉末の 4- {4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジン-1-イル} フェノール (922.5 mg、収率 88 %) を得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.79-2.04 (4H, m), 2.67-2.79 (2H, m), 2.79 (3H, s), 3.56-3.68 (2H, m), 4.48 (1H, s), 6.69-6.80 (4H, m), 6.85-6.92 (2H, m), 7.14-7.21 (2H, m)。

【2300】

参考例 448 及び参考例 449 と同様にして以下の化合物を製造した。以下の表において、Ph とあるのはフェニル基又はフェニレン基を意味する。

【2301】

参考例 450

20

(4-クロロフェニル) - (4-ヒドロキシフェニル) メタノン O-メチルオキシム
Ms: 261 (M^+)。

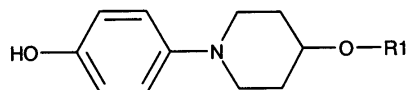
【2302】

参考例 451

(4-ヒドロキシフェニル) - (4-トリフルオロメチルフェニル) メタノン O-メチルオキシム
Ms: 295 (M^+)。

【2303】

【表 1 2 1】



参考例 R1		¹ H NMR or MS
452	-CH ₂ C ₆ H ₅	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.79—1.89(2H, m), 2.01—2.08(2H, m), 2.77—2.87(2H, m), 3.33—3.41(2H, m), 3.53—3.56(2H, m), 4.59(2H, s), 4.63(1H, brs), 6.74(2H, d, J=9.0Hz), 6.87(2H, d, J=9.0Hz), 7.27—7.36(5H, m).
453	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.76—1.90(2H, m), 2.00—2.10(2H, m), 2.84(2H, m), 3.33—3.42(2H, m), 3.51—3.60(1H, m), 4.53(1H, brs), 4.63(2H, s), 6.74(2H, d, J=9.0Hz), 6.87(2H, d, J=9.0Hz), 7.48(2H, d, J=8.1Hz), 7.60(2H, d, J=8.2Hz).
454	4-CF ₃ PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.71—1.93(2H, m), 1.95—2.15(2H, m), 2.71—2.93(2H, m), 3.26—3.46(2H, m), 3.46—3.63(1H, m), 4.50(1H, s), 4.57(2H, s), 6.74(2H, d, J=9.0Hz), 6.87(2H, d, J=8.9Hz), 7.19(2H, d, J=8.5Hz), 7.39(2H, d, J=8.4Hz).
455	4-ClPhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.69—1.91(2H, m), 1.95—2.14(2H, m), 2.72—2.90(2H, m), 3.26—3.44(2H, m), 3.44—3.63(1H, m), 4.46(1H, broad s), 4.54(2H, s), 6.74(2H, d, J=9.0Hz), 6.87(2H, d, J=9.0Hz), 7.20—7.33(4H, m).
456	3,4-Cl ₂ PhCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.71—1.93(2H, m), 1.93—2.18(2H, m), 2.70—2.93(2H, m), 3.22—3.45(2H, m), 3.45—3.65(1H, m), 4.52(2H, s), 4.85(1H, brs), 6.73(2H, d, J=9.0Hz), 6.82(2H, d, J=9.0Hz), 7.19(1H, dd, J=8.2Hz, 2.0Hz), 7.41(1H, d, J=8.2Hz), 7.46(1H, d, J=1.9Hz).
457	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₂ -	Ms:381(M ⁺)
458	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	Ms:393(M ⁺)
459	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₃ -	Ms:395(M ⁺)

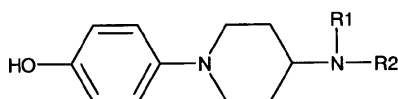
【 2 3 0 4】

10

20

30

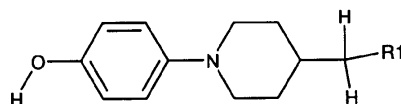
【表 1 2 2】



参考例	R1	R2	NMR or MS	
460	4-ClPh-	-CH ₃	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.79-2.04(4H, m), 2.67-2.79(2H, m), 2.79(3H, s), 3.56-3.68(2H, m), 4.48(1H, s), 6.69-6.80(4H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.14-7.21(2H, m).	10
461	4-CF ₃ Ph-	-H	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.56-1.72(2H, m), 2.13-2.20(2H, m), 2.77-2.88(2H, m), 3.44-3.51(3H, m), 3.92(1H, d, J=7.94Hz), 4.86(1H, s), 6.59-6.63(2H, m), 6.72-6.79(2H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.38-7.42(2H, m).	
462	-CH ₂ C ₆ H ₅	-H	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.26-2.46(3H, m), 2.51-2.80(3H, m), 3.36-3.56(2H, m), 3.86(2H, s), 6.65-6.79(2H, m), 6.79-6.91(2H, m), 7.15-7.43(5H, m).	
463	4-ClPhCH ₂ -	-H	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.34-1.87(2H, m), 1.88-2.11(2H, m), 2.51-2.74(3H, m), 3.26-3.57(m, 2H), 3.82(2H, s), 6.66-6.79(2H, m), 6.79-6.92(2H, m), 7.09-7.41(4H, m).	20
464	3,4-Cl ₂ PhCH ₂ -	-H	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.34-1.80(2H, m), 1.89-2.10(2H, m), 2.50-2.80(3H, m), 3.31-3.54(2H, m), 3.81(2H, s), 6.65-6.79(2H, m), 6.80-6.90(2H, m), 7.11-7.23(1H, d, J=8.0Hz), 7.33-7.42(1H, d, J=8.2Hz), 7.43-7.50(1H, d, J=2.0Hz).	
465	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-H	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.40-1.86(2H, m), 1.87-2.12(2H, m), 2.50-2.80(3H, m), 3.38-3.56(2H, m), 3.92(2H, s), 6.66-6.80(2H, m), 6.80-6.93(2H, m), 7.47(2H, d, J=8.2Hz), 7.58(2H, d, J=8.1Hz).	
466	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-H	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.45-1.70(2H, m), 1.88-2.16(2H, m), 2.48-2.83(3H, m), 3.33-3.57(2H, m), 3.85(2H, s), 6.62-6.78(2H, m), 6.80-6.93(2H, m), 7.17(2H, d, J=8.4Hz), 7.37(2H, d, J=8.5Hz).	30
467	4-CH ₃ OPh-	-H	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.53-1.69(2H, m), 2.13-2.19(2H, m), 2.75-2.86(2H, m), 3.37-3.51(3H, m), 3.63(1H, d, J=7.86Hz), 4.48(1H, s), 6.53-6.61(2H, m), 6.72-6.80(2H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.01-7.05(2H, m).	
468	4-ClPh-	-H	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.52-1.68(2H, m), 2.13-2.18(2H, m), 2.75-2.86(2H, m), 3.35-3.56(4H, m), 4.59(1H, brs), 6.51-6.58(2H, m), 6.70-6.79(2H, m), 6.85-6.93(2H, m), 7.10-7.15(2H, m).	
469	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	Ms:296(M ⁺)	40
470	4-CH ₃ OPh-	-CH ₃	Ms:366(M ⁺)	
471	4-CF ₃ Ph-	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Ms:366(M ⁺)	
472	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-C ₆ H ₅	Ms:426(M ⁺)	
473	(CH ₃) ₃ COCO-	-H	Ms; 292(M ⁺)	
474	(CH ₃) ₃ COCO-	-C ₂ H ₅	Ms; 320(M ⁺)	

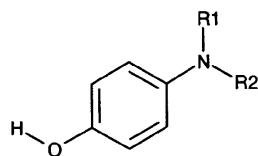
【 2 3 0 5】

【表 1 2 3】



参考例 R1	NMR or MS
475 -C ₆ H ₅	Ms; 267(M ⁺) ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.48—1.63(2H, m), 1.87—1.98(3H, m), 2.62—2.72(2H, m),
476 4-CF ₃ OPhO-	3.51—3.57(2H, m), 3.83(2H, d, J=5.88Hz), 4.50(1H, brs), 6.73—6.78(2H, m), 6.84—6.91(4H, m), 7.12—7.16(2H, m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.36—1.90(5H, m), 2.56—2.68(2H, m), 3.38(2H, d, J=6.31Hz),
477 4-CF ₃ OPhCH ₂ O-	3.44—3.53(2H, m), 4.51(2H, s), 4.66(1H, brs), 6.70—6.77(2H, m), 6.83—6.89(2H, m), 7.17—7.21(2H, m), 7.34—7.39(2H, m).
478 4-CF ₃ OPh-	Ms; 351(M ⁺) ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.31—1.86(5H, m), 2.43—2.77(4H, m), 3.34—3.58(2H, m),
479 4-CF ₃ Ph-	4.57(1H, brs), 6.66—6.80(2H, m), 6.80—6.92(2H, m), 7.28(2H, d, J=7.7Hz), 7.55(2H, d, J=8.1Hz).
480 4-ClPh-	Ms; 301(M ⁺)
481 3,4-Cl ₂ Ph-	Ms; 335(M ⁺) ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.34—1.51(2H, m), 1.68—1.90(3H, m), 2.56—2.67(2H, m),
482 4-ClPhCH ₂ O-	3.36(2H, d, J=6.36Hz), 3.46—3.52(2H, m), 4.43(1H, s), 4.48(2H, s), 6.71—6.78(2H, m), 6.83—6.89(2H, m), 7.27—7.34(4H, m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.37—1.54(2H, m), 1.68—1.90(3H, m), 2.57—2.68(2H, m),
483 4-CF ₃ PhCH ₂ O-	3.39(2H, d, J=6.29Hz), 3.46—3.52(2H, m), 4.57(2H, s), 5.28(1H, s), 6.67—6.74(2H, m), 6.83—6.89(2H, m), 7.43—7.47(2H, m), 7.58—7.62(2H, m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.48—1.63(2H, m), 1.86—1.98(3H, m), 2.61—2.71(2H, m),
484 4-ClPhO-	3.51—3.56(2H, m), 3.82(2H, d, J=5.95Hz), 4.49(1H, s), 6.73—6.91(6H, m), 7.19—7.25(2H, m). ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.38—1.54(2H, m), 1.64—1.79(1H, m), 1.89(2H, d, J=12.9Hz),
485 4-CF ₃ PhNH-	2.62(2H, dt, J=1.99, 11.98Hz), 3.11(2H, t, J=6.27Hz), 3.52(2H, d, J=11.98Hz), 4.00— 4.18(1H, brm), 4.46(1H, brs), 4.39—4.55(1H, brs), 6.60(2H, d, J=8.56Hz), 6.75(2H, d, J=8.89Hz), 6.87(2H, d, J=8.89Hz), 7.40(2H, d, J=8.56Hz) ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.37—1.57(2H, m), 1.61—1.77(1H, m), 1.79—1.97(2H, m),
486 4-ClPhNH-	2.52—2.70(2H, m), 3.04(2H, d, J=6.70Hz), 3.51(2H, d, J=11.98Hz), 3.76—4.76(2H, br), 6.48—6.58(2H, m), 6.71—6.81(2H, m), 6.83—6.92(2H, m), 7.08—7.17(2H, m) ¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.37—1.81(4H, m), 1.90(2H, d, J=6.20Hz), 2.63(2H, t, J=11.68Hz), 3.05(2H, d, J=6.66Hz), 3.52(2H, d, J=11.99Hz), 3.69—4.07(1H, br), 4.18 —4.74(1H, br), 6.49—6.63(2H, m), 6.67—6.82(2H, m), 6.87(2H, d, J=8.64Hz), 7.03(2H, d, J=8.64Hz) ¹ H NMR (DMSO) δ 1.35—1.45(2H, m), 1.68—1.80(3H, m), 2.46—2.56(2H, m),
487 4-CF ₃ OPhNH-	3.40—3.46(2H, m), 4.00(2H, d, J=5.90Hz), 6.61—6.65(2H, m), 6.67—6.81(2H, m), 7.31—7.35(2H, m), 7.45—7.51(2H, m), 8.78(1H, s), 9.79(1H, s).
488 4-ClPhNHCO-	

【表 1 2 4】



参考例	R1	R2	NMR
489	-H	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.58(1H, brs), 3.89(2H, d, J=5.7Hz), 4.24(1H, brs), 6.31(1H, dt, J=15.9, 5.7Hz), 6.57-6.62(3H, m), 6.69-6.73(2H, m), 7.13-7.16(2H, m), 7.36-7.38(2H, m).

10

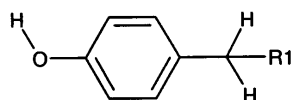
【 2 3 0 7 】

【表 1 2 5】

参考例	R1	R2	NMR	
490	-H		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.21—1.36(2H, m), 1.46(9H, s), 1.94—2.08(2H, m), 2.78—3.00(2H, brm), 3.08—3.26(1H, br), 3.27—3.38(1H, m), 3.87—4.22(2H, br), 4.29—4.58(1H, br), 6.50—6.58(2H, m), 6.66—6.75(2H, m)	10
491	-H		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.44—1.59(2H, m), 2.16(2H, d, J=11.54Hz), 2.92—3.03(2H, m), 3.14—3.32(1H, brs), 3.34—3.47(1H, m), 3.77(2H, d, J=12.96Hz), 4.15—4.33(1H, brs), 6.57(2H, d, J=8.68Hz), 6.72(2H, d, J=8.68Hz), 6.94(2H, d, J=8.76Hz), 7.47(2H, d, J=8.76Hz)	
492	-H		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.44—1.64(2H, m), 2.07—2.22(2H, m), 2.78—2.93(2H, m), 3.25—3.40(1H, m), 3.53—3.67(2H, m), 6.52—6.63(2H, m), 6.67—6.76(2H, m), 6.81—6.91(2H, m), 7.14—7.24(2H, m)	20
493	-H		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.41—1.66(2H, m), 2.09—2.24(2H, m), 2.80—2.97(2H, m), 3.11—3.30(1H, brs), 3.30—3.42(1H, m), 3.53—3.70(2H, m), 4.16—4.34(1H, brs), 6.50—6.62(2H, m), 6.66—6.77(2H, m), 6.85—6.97(6H, m), 7.03—7.17(2H, m)	
494	-CH ₃		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.70—1.96(4H, brs), 2.59—2.86(5H, m), 3.37—3.58(1H, m), 3.60—3.82(2H, m), 4.36(1H, s), 6.63—6.92(6H, m), 7.15—7.23(2H, m)	
495	-CH ₃		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.75—1.92(4H, brs), 2.64—2.84(5H, m), 3.37—3.52(1H, m), 3.63—3.79(2H, m), 4.39(1H, s), 6.67—6.87(4H, m), 6.87—6.94(2H, m), 7.06—7.14(2H, m)	30
496	-C ₂ H ₅		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.05(3H, t, J=6.94Hz), 1.65—1.82(2H, m), 1.82—1.99(2H, m), 2.65—2.83(2H, m), 3.04—3.27(2H, brs), 3.27—3.46(1H, brs), 3.56—3.80(2H, brm), 4.27—4.69(1H, brs), 6.63—6.94(6H, m), 7.03—7.14(2H, m)	
497	-CH ₃		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 2.90(3H, s), 4.00(2H, d, J=5.4Hz), 4.29(1H, brs), 6.34(1H, dt, J=15.9, 5.4Hz), 6.55(1H, d, J=15.9Hz), 6.71—6.79(4H, m), 7.42—7.44(2H, m), 7.53—7.55(2H, m)	40
498	-CH ₃		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.72—1.91(4H, m), 2.72(3H, s), 2.79—2.93(2H, m), 3.45—3.56(1H, m), 3.87(2H, d, J=12.74Hz), 4.38(1H, s), 6.79(2H, d, J=8.93Hz), 6.82(2H, d, J=8.93Hz), 6.93(2H, d, J=8.76Hz), 7.47(2H, d, J=8.76Hz)	

【2 3 0 8】

【表 1 2 6】

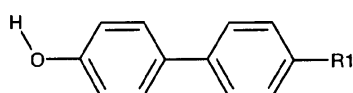


参考例	R1	NMR
499	4-CF ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.96(2H, s), 4.66(1H, s), 6.75-6.79(2H, m), 7.01-7.06(2H, m), 7.26-7.29(2H, m), 7.51-7.54(2H, m).
500	4-ClPh-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.87(3H, brs), 6.74-6.78(2H, m), 7.01-7.04(2H, m), 7.07-7.10(2H, m), 7.22-7.26(2H, m).

10

【 2 3 0 9 】

【表 1 2 7】



参考例	R1	NMR or MS
501		Ms; 406(M ⁺)
502		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.17(3H, t, J=7.01Hz), 1.84-1.96(4H, m), 2.79-2.91(2H, m), 3.31(3H, q, J=7.01Hz), 3.61-3.78(1H, m), 3.81-3.86(2H, m), 4.73(1H, s), 6.69-6.75(2H, m), 6.84-6.91(2H, m), 6.99-7.11(4H, m), 7.41-7.48(4H, m).
503		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.21(3H, t, J=7.03Hz), 1.90-1.98(4H, m), 2.81-2.93(2H, m), 3.37(3H, q, J=7.03Hz), 3.74-3.88(3H, m), 4.75(1H, s), 6.73-6.79(2H, m), 6.84-6.91(2H, m), 6.98-7.04(2H, m), 7.42-7.49(6H, m).
504		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 3.33(3H, s), 4.80(1H, brs), 6.87-6.91(2H, m), 6.96-7.02(2H, m), 7.07-7.14(4H, m), 7.42-7.51(4H, m).
505		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.88-2.02(2H, m), 2.07-2.18(2H, m), 3.09-3.20(2H, m), 3.49-3.59(2H, m), 4.41-4.50(1H, m), 4.74(1H, s), 6.84-6.95(4H, m), 6.98-7.03(2H, m), 7.12-7.17(2H, m), 7.40-7.48(4H, m).
506		¹ H NMR (DMSO) δ 6.82-6.86(2H, m), 7.08-7.20(8H, m), 7.39-7.49(4H, m), 7.59-7.72(6H, m), 9.53(1H, s).
507		¹ H NMR (CDCl ₃) δ 4.73(1H, s), 6.88-6.93(2H, m), 7.01-7.13(4H, m), 7.17-7.22(2H, m), 7.43-7.55(4H, m).

20

30

40

【 2 3 1 0 】

実施例 1 8 9 1

50

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-ピペラジン-1-イル]ベンゾチアゾール-6-イルオキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロ-1H-イミダゾール(51mg, 0.23ミリモル)及び6-ヒドロキシ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-ピペラジン-1-イル]-ベンゾチアゾール(80mg, 0.20ミリモル)を、DMF(5ml)に溶解し、水素化ナトリウム(10mg, 0.25ミリモル)を加え、60℃で1.5時間攪拌した。室温に放冷後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出。合わせた有機層を、水、飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥。これを濾別後、濾液を減圧濃縮。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=1:3→酢酸エチル)で精製し、エタノールから再結晶し、無色粉末結晶の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-ピペラジン-1-イル]ベンゾチアゾール-6-イルオキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(40mg、収率33%)を得た。

融点: 205.6-207.4℃。

【2311】

実施例1892

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ピリジン-5-オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

5-ヒドロキシ-2-{4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]ピペリジン-1-イル]ピリジン}0.67g(1.9ミリモル)及び(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロ-1H-イミダゾール0.51g(2.4ミリモル)をDMF6.7mlに溶解した。これに水素化ナトリウム91mg(2.3ミリモル)を加え、50~55℃にて1時間加熱攪拌した。反応液に水を入れ、塩化メチレンで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、吸引濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/0、9/1、8/2)で分離精製し、更に塩化メチレン/ジイソプロピルエーテル/酢酸エチルによる結晶化により、淡黄色粉末の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ピリジン-5-オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールを0.30g(29%)得た。

¹H-NMR(CDCl₃) δ ppm:

1.77(3H, s), 1.80-1.94(2H, m), 1.94-2.17(2H, m), 3.21-3.44(2H, m), 3.67-3.89(2H, m), 3.96-4.11(2H, m), 4.19(1H, d, J=10.4Hz), 4.36-4.59(2H, m), 6.65(1H, d, J=9.2Hz), 6.83-6.97(2H, m), 7.02-7.20(3H, m), 7.56(1H, s), 7.87(1H, d, J=3.0Hz)。

【2312】

上記実施例1892と同様にして以下の化合物を製造した。以下の表において、Phとあるのはフェニル基又はフェニレン基を意味する。

【2313】

実施例1893

(R)-2-(4-{4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ]ピペリジン-1-イル}フェノキシメチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点: 173.7-175.1℃。

【2314】

実施例 1894

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.23-1.52 (2H, m), 1.52-1.66 (3H, m), 1.66-1.89 (5H, m), 2.43-2.70 (4H, m), 3.50 (2H, d, $J=12.1$ Hz), 3.91-4.09 (2H, m), 4.16 (1H, d, $J=10.1$ Hz), 4.48 (1H, d, $J=10.2$ Hz), 6.66-6.81 (2H, m), 6.81-6.95 (2H, m), 7.05-7.23 (4H, m), 7.54 (1H, s)

融点: 210.9-212.4°C

$[\alpha]_{\text{D}} = -9.0^\circ$ (濃度: 1.0, CHCl_3)。

【2315】

実施例 1895

(R)-2-{4-[4-(3,4-ジクロロベンジル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.24-1.52 (2H, m), 1.52-1.64 (4H, m), 1.64-1.73 (1H, m), 1.73-1.87 (4H, m), 2.38-2.68 (4H, m), 3.49 (2H, d, $J=12.1$ Hz), 3.91-4.09 (2H, m), 4.16 (1H, d, $J=10.2$ Hz), 4.49 (1H, d, $J=10.2$ Hz), 6.67-6.81 (2H, m), 6.81-6.92 (2H, m), 6.94-7.07 (1H, m), 7.25 (1H, s), 7.35 (1H, d, $J=8.2$ Hz), 7.55 (1H, s)

融点: 180.0-181.2°C

$[\alpha]_{\text{D}} = -8.5^\circ$ (濃度: 1.0, CHCl_3)。

【2316】

実施例 1896

(R)-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点: 140.4-141.7°C。

【2317】

実施例 1897

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点: 172.3-172.9°C。

【2318】

実施例 1898

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-{4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル]ピペラジン-1-イル}フェノキシメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点: 199.7-202°C。

【2319】

実施例 1899

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-{4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]ピペラジン-1-イル}フェノキシメチル)-2,3-ジヒドロイ

10

20

30

40

50

ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 194.8-195.6 °C。

【2320】

実施例 1900

(R)-2-(4-{4-[N-(4-クロロフェニル)-N-エチルアミノ]ピペリジン-1-イル}フェノキシメチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 121.4-125 °C。

【2321】

実施例 1901

(R)-2-(4-{4-[N-エチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ]ピペリジン-1-イル}フェノキシメチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 122.5-122.8 °C。

【2322】

実施例 1902

(R)-2-(4-{4-[N-エチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ]ピペリジン-1-イル}フェノキシメチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 105-108.5 °C。

【2323】

実施例 1903

(R)-2-{4-[4-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 210.6-211.6 °C。

【2324】

実施例 1904

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン-1-イル]ベンゾチアゾール-6-イルオキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 203.9-205.2 °C。

【2325】

実施例 1905

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 180.9-182.7 °C。

【2326】

実施例 1906

2-{4-[4-(3,4-ジクロロベンジル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 191.4-192.1 °C。

【2327】

実施例 1907

2-(4-{4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ]ピペリジン-1-イル}フェノキシメチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点: 137.6-141.5 °C。

【2328】

10

20

30

40

50

実施例 1908

(R) - 2 - (4 - {4 - [N - (4 - クロロフェニル) - N - メチルアミノ] ピペリジン - 1 - イル} フェノキシメチル) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール 4 - トルエンスルホン酸塩
融点: 212.6 - 214.1 °C。

【2329】

実施例 1909

(R) - 2 - (4 - {4 - [N - (4 - クロロフェニル) - N - メチルアミノ] ピペリジン - 1 - イル} フェノキシメチル) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール メタンスルホン酸塩
融点: 171.2 - 172.8 °C。

【2330】

実施例 1910

(R) - 2 - (4 - {4 - [N - (4 - クロロフェニル) - N - メチルアミノ] ピペリジン - 1 - イル} フェノキシメチル) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール 塩酸塩
融点: 170.0 - 173.7 °C。

【2331】

実施例 1911

2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (4 - トリフリオロメトキシベンジルオキシメチル) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール
融点: 153.1 - 153.7 °C。

【2332】

実施例 1912

(R) - (4 - クロロフェニル) カルバミン酸 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) フェニル] ピペリジン - 4 - イルメチルエステル
融点: 211.6 - 212.3 °C (分解)。

【2333】

実施例 1913

2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (4 - トリフリオロメチルベンジルオキシメチル) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール
融点: 138.7 - 139.5 °C。

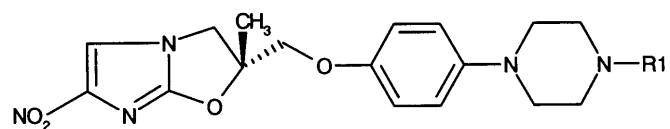
【2334】

10

20

30

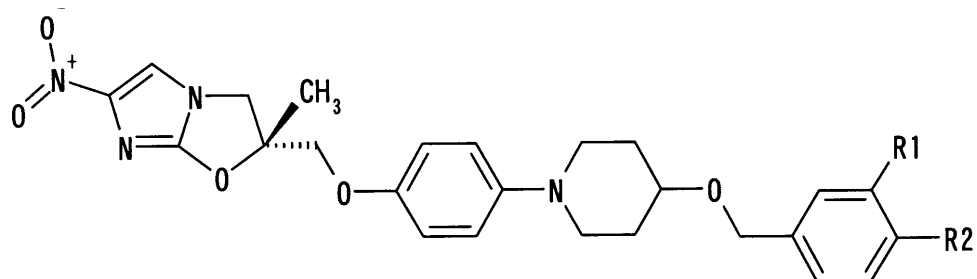
【表 1 2 8】



実施例	R1	mp(°C)
1914		210.0 – 212.1
1915		199.7 – 202.0
1916		194.8 – 195.6
1917		197.1 – 198.6
1918		210.6 – 211.6

【 2 3 3 5】

【表 1 2 9】



実施例	R1	R2	mp(°C)
1919	-H	-H	210.9 – 213.8
1920	-H	-OCF ₃	214.3 – 217.7
1921	-H	-CF ₃	217.4 – 219.7
1922	-H	-Cl	208.7 – 211.6
1923	-Cl	-Cl	198.9 – 202.0

【 2 3 3 6】

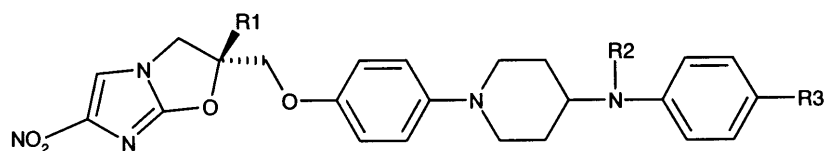
10

20

30

40

【表 1 3 0】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
1924	-CH ₃	-CH ₃	-Cl	173.7 - 175.1
1925	-CH ₃	-H	-CF ₃	178.4 - 181.1 dec
1926	-CH ₃	-CH ₃	-CF ₃	135.0 - 137.5
1927	-CH ₃	-H	-OCF ₃	195.4 - 197.8 dec
1928	-CH ₃	-CH ₃	-OCF ₃	158.1 - 158.8
1929	-CH ₃	-H	-Cl	187.0 - 189.5
1930	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-Cl	121.4 - 125.0
1931	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CF ₃	105.0 - 108.5
1932	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-H	192.5 - 195.3
1933	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	-CF ₃	147.3 - 148.6
1934	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CF ₃	89.5 - 93.4
1935	-CH ₃	-C ₃ H ₇	-CF ₃	103.4 - 107.9
1936	-CH ₃	-C ₄ H ₉	-Cl	122.1-124.0
1937	-CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CO-	-CF ₃	124.7 - 127.0
1938	-CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-CF ₃	157.6 - 160.4
1939	-CH ₃	-C ₄ H ₉	-CF ₃	117.8 - 120.2
1940	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-OCF ₃	122.5 - 122.8
1941	-H	-CH ₃	-OCF ₃	154.0 - 157.3 dec
1942	-H	-C ₂ H ₅	-CF ₃	172.0 - 174.2
1943	-H	-CH ₃	-CF ₃	189.4 - 190.8
1944	-H	-H	-CF ₃	179.2 - 180.7
1945	-H	-CH ₃	-Cl	203.6 - 204.5 dec

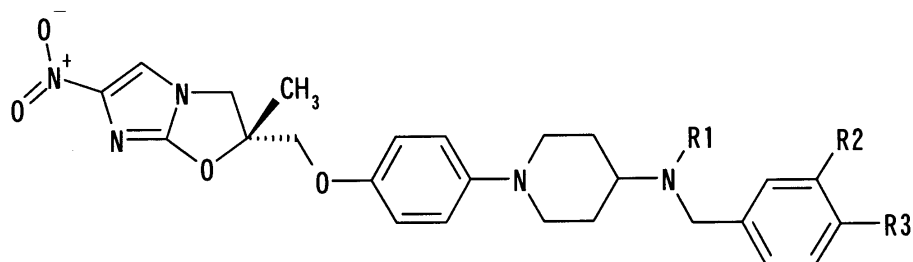
【 2 3 3 7 】

10

20

30

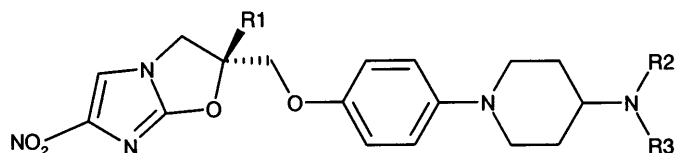
【表 1 3 1】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹ H NMR
1946	-H	-H	-H	215.9 - 217.2
1947	-H	-H	-Cl	211.7 - 213.1
1948	-H	-Cl	-Cl	199.5 - 204.0
1949	-H	-H	-CF ₃	213.5 - 216.5
1950	-H	-H	-OCF ₃	217.6 - 218.4
1951	-CH ₃	-H	-Cl	195.4 - 199.1
1952	-CH ₃	-H	-OCF ₃	204.8 - 207.0
1953	-CH ₃	-H	-H	206.1 - 208.9
1954	-CH ₃	-Cl	-Cl	182.1 - 185.7
1955	-CH ₃	-H	-CF ₃	199.6 - 202.0
1956	-COCH ₃	-H	-Cl	169.9 - 117.4
1957	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-H	-OCF ₃	115.4 - 117.4
1958	-COCH ₃	-Cl	-Cl	¹ H NMR (DMSO) δ 1.42-1.87(8H, m), 2.11(3H, brs), 2.53-2.77(2H, m), 3.52(2H, d, J=12.4Hz), 4.15(1H, d, J=11.9Hz), 4.17(2H, s), 4.35(1H, d, J=10.9Hz), 4.51(2H, brs), 6.63-6.91(4H, m), 7.11-7.28(1H, m), 7.35-7.61(3H, m), 8.01(1H, s).
1959	-CO ₂ C ₆ H ₅	-H	-CF ₃	137.0 - 140.0
1960	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CF ₃	159.9 - 162.8
1961	-C ₂ H ₅	-H	-CF ₃	132.5 - 136.7

【 2 3 3 8 】

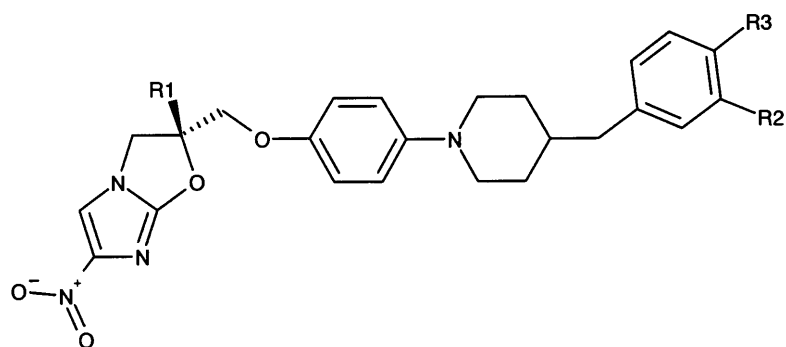
【表 1 3 2】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
1962	-CH ₃	-H	(CH ₃) ₃ COCO-	250.7 - 254.0
1963	-CH ₃	-H	4-ClPhCH ₂ OCO-	232.0 - 237.5
1964	-CH ₃	-C ₂ H ₅	(CH ₃) ₃ COCO-	165.0 - 167.2
1965	-CH ₃	-H	4-CF ₃ Ph(CH ₂) ₂ -	161.2 - 163.5
1966	-CH ₃	-H	4-CF ₃ Ph(CH ₂) ₃ -	194.9 - 196.7
1967	-CH ₃	-H	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	212.3 - 214.7 dec
1968	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ Ph(CH ₂) ₂ -	144.0
1969	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ Ph(CH ₂) ₃ -	172.2 - 173.0
1970	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	212.4 - 214.5 dec
1971	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ CH ₂ OCO-	205.5 - 208.0
1972	-CH ₃	-H	4-ClPhCH ₂ OCO-	232.0 - 237.5 dec
1973	-CH ₃	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ OCO-	201.0 - 203.7
1974	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ OCO-	201.0 - 203.5

【 2 3 3 9 】

【表 1 3 3】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
1975	-CH ₃	-H	-H	209.7 - 212.4
1976	-CH ₃	-H	-OCF ₃	210.7 - 214.0
1977	-CH ₃	-H	-CF ₃	199.5 - 203.1
1978	-CH ₃	-H	-Cl	207.1 - 211.2
1979	-CH ₃	-Cl	-Cl	180.1 - 184.4

【 2 3 4 0 】

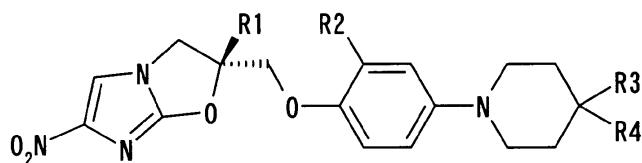
10

20

30

40

【表 1 3 4】



実施例	R1	R2	R3	R4	mp(°C) or ¹ H NMR
1980	-CH ₃	-H	-H	-OH	228.0 - 229.5 dec
1981	-CH ₃	-H	-H	(CH ₃) ₃ COCO-	218.5 - 219.0 dec
1982	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ H	¹ H NMR (DMSO) δ 1.69(3H, s), 2.11(4H, brs), 2.64(1H, brs), 3.48(4H, brs), 4.20(1H, d, J = 11.0Hz), 4.34(2H, s), 4.37(1H, d, J = 11.0Hz), 7.03-7.08(2H, m), 7.69(2H, br), 8.16(1H, s), 12.44(1H, br).
1983	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhNHCO-	251.0 - 254.7 dec
1984	-CH ₃	-H	-OH	-C ₆ H ₅	242.7 - 243.5
1985	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCH ₂ -	185.0 - 186.1
1986	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhOCH ₂ -	226.2 - 226.9 dec
1987	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₅	263.0 - 265.1
1988	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₂ O-	171.8 - 174.2
1989	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ O-	213.7 - 217.4
1990	-CH ₃	-H	-OC ₂ H ₅	-OC ₂ H ₅	153.0 - 156.8
1991	-CH ₃	-H	4-ClPh-	-OH	231.3 - 231.9
1992	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhOCH ₂ -	223.2 - 225.2 dec
1993	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₃ O-	196.8 - 200.0
1994	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhCH ₂ OCH ₂ -	175.3 - 175.5
1995	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ OCH ₂ -	172.3 - 172.9
1996	-H	-H	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCH ₂ -	140.4 - 141.7
1997	-H	-H	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ O-	188.3-189.4
1998	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhOCH ₂ -	220.2 - 223.1
1999	-H	-H	-H	4-CF ₃ PhOCH ₂ -	175.0 - 180
2000	-CH ₃	-H	-H	NH ₂ COO-	208.7-209.9 dec
2001	-CH ₃	-H	-H	3,4-Cl ₂ PhNHCOO-	218.5 - 222.2 dec
2002	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ PhNHCOO-	224.0 - 226.6 dec
2003	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhNHCOO-	236.0 - 238.7 dec
2004	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhNHCOO-	223.0 - 225.5
2005	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₂ -	239.4 - 241.3
2006	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPh(CH ₂) ₃ -	191.4 - 193.2
2007	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhN(CH ₃)COO-	224.6 - 224.9
2008	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhN(C ₂ H ₅)COO-	181.1 - 182.6
2009	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhN(CH ₃)COOCH ₂ -	195.6-195.9
2010	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhN(C ₂ H ₅)COOCH ₂ -	165.0-166.0

【 2 3 4 1 】

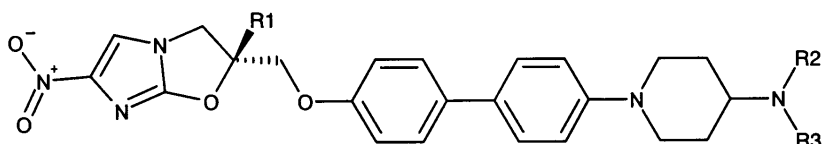
10

20

30

40

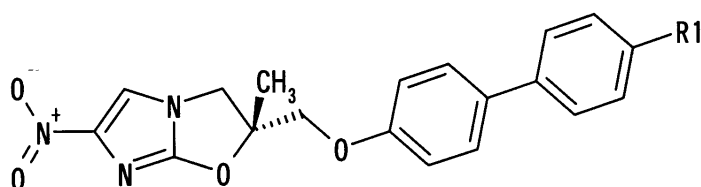
【表 1 3 5】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹ H NMR
2011	-H	4-ClPh-	-C ₂ H ₅	217.6 - 219.4 dec
2012	-CH ₃	4-ClPh-	-C ₂ H ₅	229.3 - 233.0 dec
2013	-H	4-CF ₃ OPh-	-C ₂ H ₅	221.8 - 223.8 dec
2014	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-C ₂ H ₅	245.1 - 247.3 dec
2015	-H	4-CF ₃ Ph-	-C ₂ H ₅	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.21(3H, t, J=7.01Hz), 1.91-1.98(4H, m), 2.82-2.94(2H, m), 3.37(2H, q, J=7.01Hz), 3.74-3.89(3H, m), 4.30-4.51(4H, m), 5.58-5.69(1H, m), 6.74-6.79(2H, m), 6.90-6.95(2H, m), 6.99-7.04(2H, m), 7.42-7.52(6H, m).
2016	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	-C ₂ H ₅	251.8 - 253.5 dec

【 2 3 4 2 】

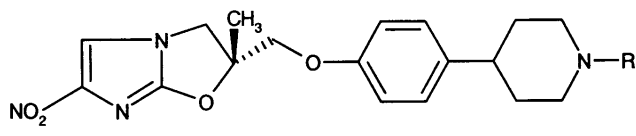
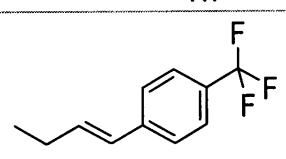
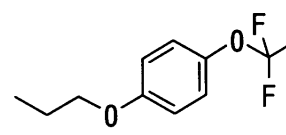
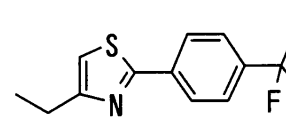
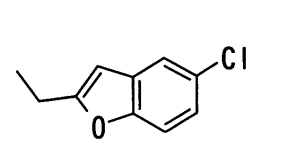
【表 1 3 6】



実施例	R1	mp(°C) or ¹ H NMR
2017	-H	237.7 - 239.6
2018		229.0 - 230.5 dec
2019		252.3 - 253.6 dec
2020		¹ H NMR (DMSO) δ 1.71(3H, s), 4.21(1H, d, J=11.03Hz), 4.34(2H, s), 4.40(1H, d, J=11.03Hz), 6.99(2H, d, J=8.44Hz), 7.10-7.20(8H, m), 7.42(2H, d, J=8.44Hz), 7.57-7.72(8H, m), 8.22(1H, s).
2021		218.0 - 221.0 dec

【 2 3 4 3 】

【表 1 3 7】

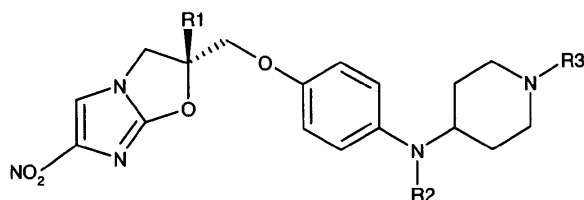
		
実施例	R1	mp(°C)
2022		185.9 – 187.1
2023		190.5 – 191.3
2024		194.6 – 196.4
2025		219.9 – 220.5

【 2 3 4 4 】

10

20

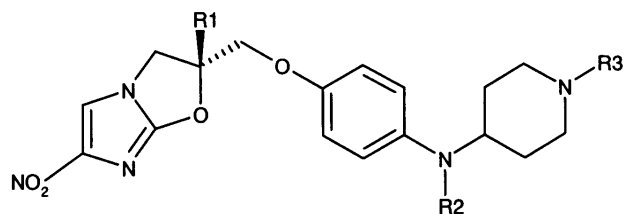
【表 1 3 8】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹ H NMR
2026	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	167.8-168.7
2027	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	154.8-155.9
2028	-CH ₃	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	149.6-153.4
2029	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	145.0-146.9
2030	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	141.8-144.3
2031	-CH ₃	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ OCO-	132.4-135.0
2032	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ OCO-	152.2-155.6
2033	-CH ₃	-H	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	160.5-163.7
2034	-CH ₃	-C ₂ H ₅	4-CF ₃ OPh-	125.2-128.1
2035	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	137.9-139.2
2036	-CH ₃	-CH ₃	4-ClPh-	190.8-193.8
2037	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPh-	145.6-149.3
2038	-CH ₃	-H	4-ClPh-	163.3-167.3
2039	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPhO(CH ₂) ₂ -	140.9-143.1
2040	-CH ₃	-CH ₃	(CH ₃) ₃ COCO-	153.6-154.7
2041	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	181.7 - 183.6
2042	-CH ₃	-H	4-ClPhCH ₂ -	183.7 - 186.6
2043	-CH ₃	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ -	173.0 - 176.3
2044	-CH ₃	-H	4-ClPhCH ₂ OCO-	125.2 - 127.6
2045	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	120.5 - 124.9
2046	-CH ₃	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ OCO-	103.5 - 107.3
2047	-CH ₃	-H	4-CF ₃ Ph-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.46-1.62(2H, m), 1.76(3H, s), 2.08-2.21(2H, m), 2.90-3.05(2H, m), 3.35-3.47(1H, m), 3.70-3.83(2H, m), 3.98-4.06(2H, m), 4.16(1H, d, J=10.20Hz), 4.50(1H, d, J=10.20Hz), 6.53-6.65(2H, m), 6.69-6.77(2H, m), 6.89-6.98(2H, m), 7.43-7.51(2H, m), 7.55(1H, s)
2048	-CH ₃	-H	(CH ₃) ₃ COCO-	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.20-1.37(2H, m), 1.46(9H, s), 1.76(3H, s), 1.94-2.07(2H, brm), 2.77-3.01(2H, brm), 3.23-3.41(2H, brm), 3.94-4.11(4H, m), 4.14(1H, d, J=10.19Hz), 4.49(1H, d, J=10.15Hz), 6.50-6.59(2H, m), 6.67-6.76(2H, m), 7.55(1H, s)
2049	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	129.2 - 132.0
2050	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhNHCO-	179.0 - 182.5

【 2 3 4 5】

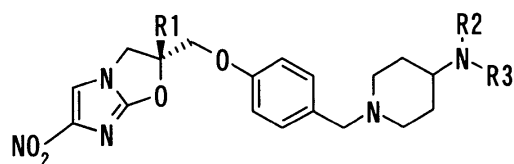
【表 1 3 9】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
2051	-CH ₃	-CH ₃		158.9-160.4
2052	-CH ₃	-CH ₃		143.0-146.5
2053	-CH ₃	-CH ₃		163.9-166.3
2054	-CH ₃	-H		161.7-165.4
2055	-CH ₃	-H		185.7-188.8

【 2 3 4 6 】

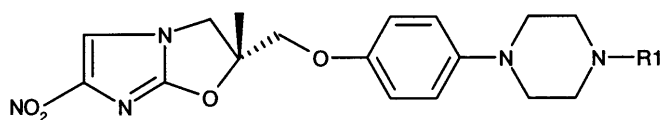
【表 1 4 0】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹ H NMR
2056	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-CH ₃	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.62-1.73(2H, m), 1.73-1.87(5H, m), 1.96-2.12(2H, m), 2.77(3H, s), 2.88-3.03(2H, m), 3.38-3.60(3H, m), 4.00-4.13(2H, m), 4.23(1H, d, J=10.1Hz), 4.50(1H, d, J=10.2Hz), 6.67-6.74(2H, m), 6.76-6.84(2H, m), 7.02-7.10(2H, m), 7.18-7.25(2H, m), 7.56(1H, s)
2057	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	-CH ₃	190.9-192.2
2058	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-CH ₃	143.1-145.7
2059	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	-CH ₃	178.8-183.7
2060	-CH ₃	4-CF ₃ OPhNHCO-	-CH ₃	¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.74-1.87(5H, m), 2.50-2.68(2H, m), 2.68-2.83(2H, m), 2.97(3H, s), 3.42-3.56(2H, m), 3.97-4.17(4H, m), 4.29(1H, d, J=10.3Hz), 4.50(1H, d, J=10.2Hz), 4.55-4.66(1H, m), 6.46-6.55(1H, br), 6.84-6.93(2H, m), 7.10-7.18(2H, m), 7.37-7.44(2H, m), 7.49-7.57(2H, m), 7.58(1H, s)

【 2 3 4 7 】

【表 1 4 1】



実施例	R1	MS(M+1)	
2061		500	10
2062		519	
2063		471	20
2064		485	
2065		470	
2066		442	30
2067		455	
2068		574	
2069		492	40

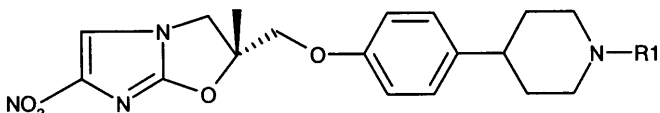
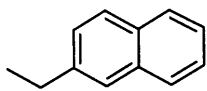
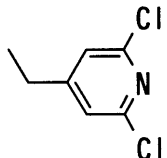
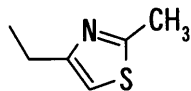
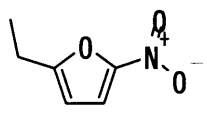
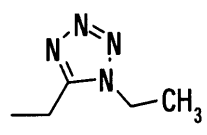
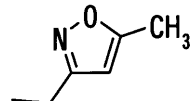
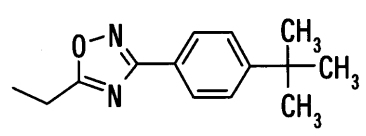
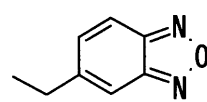
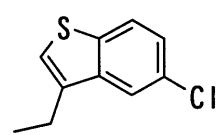
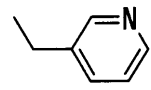
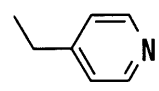
【 2 3 4 8 】

【表 1 4 2】

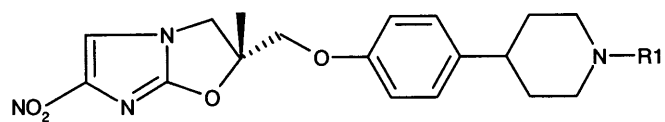
実施例	R1	MS(M+1)
2070		476
2071		478
2072		451
2073		451
2074		451
2075		601
2076		490
2077		564

【 2 3 4 9】

【表 1 4 3】

		
実施例	R1	MS(M+1)
2078		499
2079		518
2080		470
2081		484
2082		469
2083		454
2084		573
2085		491
2086		539
2087		450
2088		450

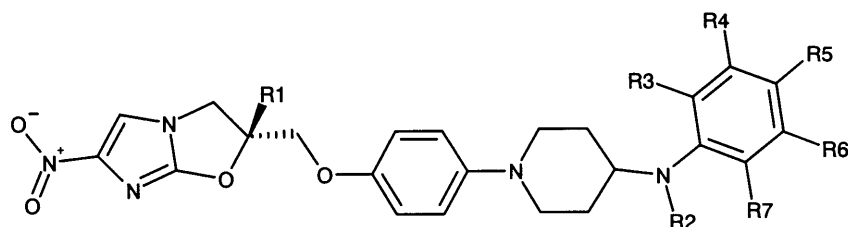
【表 1 4 4】



実施例	R1	MS(M+1)
2089		450
2090		600
2091		489

【 2 3 5 1 】

【表 1 4 5】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	MS(M+1)
2092	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	484
2093	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	498
2094	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	518
2095	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	534
2096	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-CF ₃	-H	586
2097	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₄ H ₉	-H	-H	506
2098	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-H	450
2099	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	480
2100	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-Cl	484
2101	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	-H	484
2102	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	464
2103	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	540
2104	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	534
2105	-CH ₃	-H	-H	-H	-F	-H	-H	468
2106	-CH ₃	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	493
2107	-CH ₃	-H	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	494
2108	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	478
2109	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	522
2110	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	534
2111	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH F ₂	516
2112	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	-OCF ₃	568
2113	-CH ₃	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	542
2114	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	518
2115	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	518
2116	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	518
2117	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-Cl	552
2118	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	492
2119	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	-Cl	-H	514
2120	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-Cl	552
2121	-CH ₃	-H	-F	-F	-F	-F	-F	540
2122	-CH ₃	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	495
2123	-CH ₃	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	475
2124	-CH ₃	-H	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	496
2125	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	532
2126	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	548
2127	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-C ₄ H ₉	-H	-H	520
2128	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	464

【 2 3 5 2】

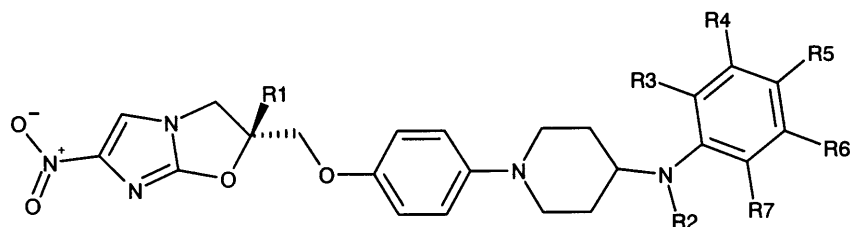
10

20

30

40

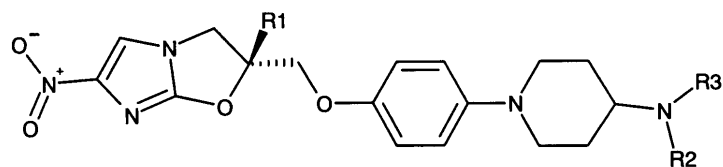
【表 1 4 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	MS(M+1)
2129	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	498
2130	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	498
2131	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	478
2132	-CH ₃	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	554
2133	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	548
2134	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	482
2135	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	507
2136	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	508
2137	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	492
2138	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	521
2139	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	536
2140	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	548
2141	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCHF ₂	530
2142	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-OCF ₃	582
2143	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	556
2144	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	532
2145	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	532
2146	-CH ₃	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	532
2147	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-Cl	566
2148	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-Cl	-H	528
2149	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	510

【 2 3 5 3】

【表 1 4 7】



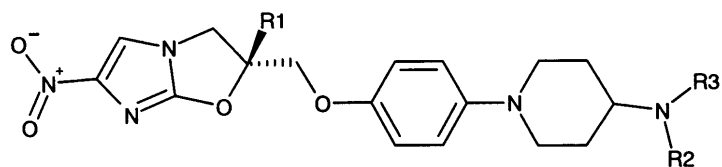
実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
2150	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	-H	498
2151	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	-H	464
2152	-CH ₃	2-ClPhCH ₂ -	-H	498
2153	-CH ₃	3-ClPhCH ₂ -	-H	498
2154	-CH ₃	4-CH ₃ PhCH ₂ -	-CH ₃	492
2155	-CH ₃	3,4,5-(CH ₃ O) ₃ PhCH ₂ -	-CH ₃	568
2156	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	535
2157	-CH ₃	4-CH ₃ OPhCH ₂ -	-H	494
2158	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	-CH ₃	512
2159	-CH ₃	4-FPhCH ₂ -	-H	482
2160	-CH ₃	3,4-(CH ₃ O) ₂ PhCH ₂ -	-H	524
2161	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	490
2162	-CH ₃	(C ₂ H ₅) ₂ N(CH ₂) ₂ -	-C ₂ H ₅	501
2163	-CH ₃	-cyclo-C ₈ H ₁₅	-H	484
2164	-CH ₃	4-ClPh(CH ₂) ₂ -	-H	512
2165	-CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	470

【 2 3 5 4 】

10

20

【表 1 4 8】



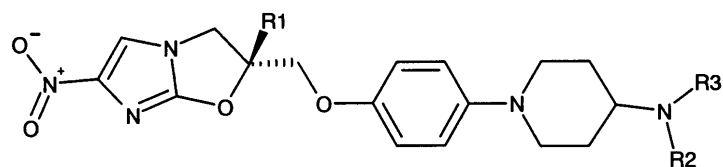
実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
2166	-CH ₃		-CH ₃	522
2167	-CH ₃		-CH ₃	493
2168	-CH ₃		-H	454
2169	-CH ₃		-C ₂ H ₅	493
2170	-CH ₃		-H	644

【 2 3 5 5 】

10

20

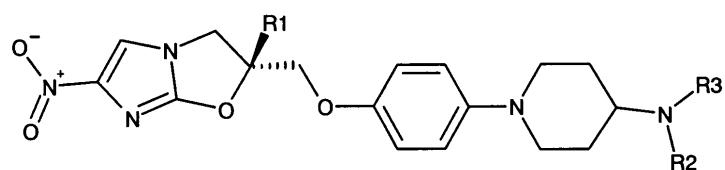
【表 1 4 9】



実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
2171	$-\text{CH}_3$		$-\text{H}$	624
2172	$-\text{CH}_3$		$-\text{H}$	500
2173	$-\text{CH}_3$		$-\text{H}$	600
2174	$-\text{CH}_3$		$-\text{H}$	547

【 2 3 5 6 】

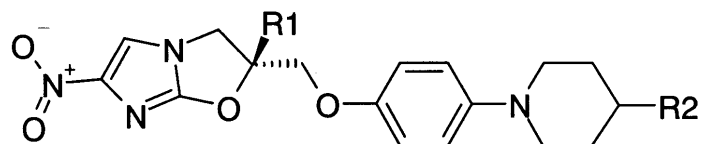
【表 1 5 0】



実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
2175	$-\text{CH}_3$		$-\text{CH}_3$	514
2176	$-\text{CH}_3$		$-\text{CH}_3$	614
2177	$-\text{CH}_3$		$-\text{CH}_3$	561

【 2 3 5 7 】

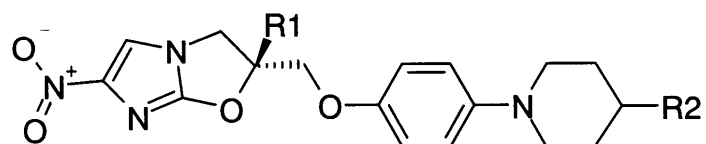
【表 1 5 1】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2178	-CH ₃		490
2179	-CH ₃		553
2180	-CH ₃		534
2181	-CH ₃		575
2182	-CH ₃		485
2183	-CH ₃		539
2184	-CH ₃		577

【 2 3 5 8 】

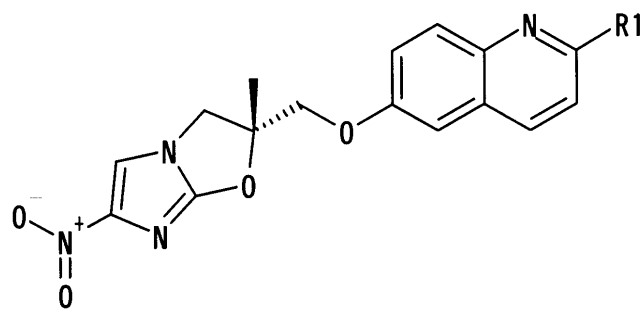
【表 1 5 2】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2185	-CH ₃		632
2186	-CH ₃		618
2187	-CH ₃		566
2188	-CH ₃		560
2189	-CH ₃		561
2190	-CH ₃		581

【 2 3 5 9 】

【表 1 5 3】



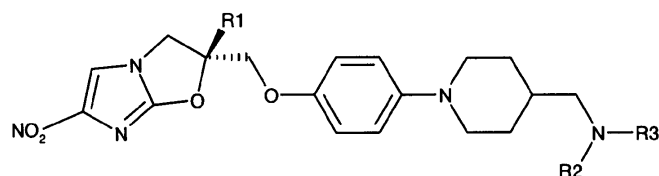
実施例	R1	mp(°C)
2191		218.1 — 219.1
2192		199.6 — 200.1

【 2 3 6 0 】

10

20

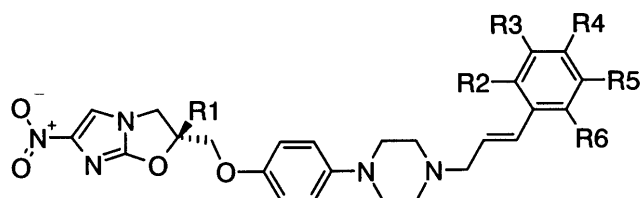
【表 1 5 4】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or ¹ H NMR
2193	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-COCH ₃	148.6 - 149.1
2194	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-C ₂ H ₅	116.8 - 119.2
2195	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-CH ₃	135.6 - 140.9
2196	-CH ₃	4-ClPh-	-CH ₃	141.6 - 146.1
2197	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	-CH ₃	151.4 - 155.0
				¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.29-1.51(2H, brm), 1.67-1.89(6H, brm), 2.13(1.5H, s), 2.20(1.5H, s), 2.46-2.72(2H, brm), 3.12-3.23(1H, brm), 3.27-3.36(1H, brm), 3.44-3.63(2H, brm), 3.96-4.10(2H, brm), 4.10-4.26(1H, brm), 4.49(1H, d, J=10.15Hz), 4.58(1H, s), 4.63(1H, s), 6.63-6.99(4H, brm), 7.12-7.30(4H, m), 7.56(1H, s)
2198	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-COCH ₃	
2199	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-H	181.9 - 182.5
2200	-CH ₃	4-ClPh-	-H	177.6 - 179.1
2201	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	-H	164.7 - 165.8
2202	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-C ₂ H ₅	163.9 - 165.2
2203	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-CH ₃	180.5 - 180.8
2204	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	-CH ₃	169.5 - 170.6
2205	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-CH ₃	166.7 - 167.5
2206	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-H	163.9 - 167.6
2207	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	-H	163.8 - 166.3
2208	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-H	157.0 - 160.8
				¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.29-1.56(11H, brm), 1.60-1.84(6H, m), 2.46-2.66(2H, brm), 3.00-3.24(2H, brm), 3.44-3.57(2H, brm), 3.97-4.08(2H, m), 4.17(1H, d, J=10.12Hz), 4.35-4.55(3H, m), 6.70-6.80(2H, m), 6.81-6.95(2H, m), 7.12-7.20(2H, m), 7.20-7.32(2H, m), 7.50(1H, s)
2209	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	(CH ₃) ₃ COCO-	
				¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.29-1.54(11H, brm), 1.60-1.84(6H, m), 2.48-2.66(2H, brm), 3.00-3.22(2H, brm), 3.51(2H, d, J=12.07Hz), 3.96-4.08(2H, m), 4.17(1H, d, J=10.10Hz), 4.34-4.46(2H, brm), 4.49(1H, d, J=10.10Hz), 6.76(2H, d, J=8.97Hz), 6.81-6.93(2H, brm), 7.07-7.21(2H, brm), 7.29(2H, d, J=8.29Hz), 7.55(1H, s)
2210	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	(CH ₃) ₃ COCO-	
				¹ H NMR (CDCl ₃) δ 1.31-1.57(11H, brm), 1.61-1.88(6H, m), 2.45-2.72(2H, brm), 3.03-3.28(2H, brm), 3.52(2H, d, J=12.05Hz), 3.96-4.08(2H, m), 4.17(1H, d, J=10.15Hz), 4.41-4.51(3H, m), 6.76(2H, d, J=8.95Hz), 6.83-6.96(2H, brm), 7.26-7.42(2H, brm), 7.55(1H, s), 7.59(2H, d, J=7.95Hz)
2211	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	(CH ₃) ₃ COCO-	

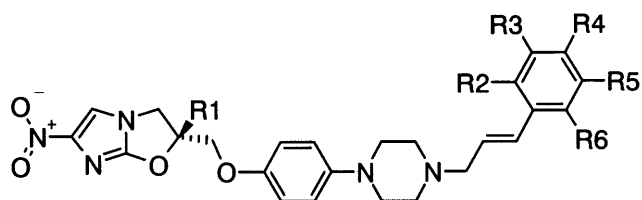
【 2 3 6 1 】

【表 1 5 5】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2212	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	490
2213	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	490
2214	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	560
2215	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	560
2216	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-CH ₃	508
2217	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-CF ₃	-H	578
2218	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	490
2219	-CH ₃	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	532
2220	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	544
2221	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	544
2222	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	544
2223	-CH ₃	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	522
2224	-CH ₃	-H	-H	-COC ₆ H ₅	-H	-H	580
2225	-CH ₃	-H	-H	-F	-CF ₃	-H	562
2226	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-F	562
2227	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	544
2228	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-H	-Cl	544
2229	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	-Cl	578
2230	-CH ₃	-Cl	-H	-Cl	-Cl	-H	578
2231	-CH ₃	-Cl	-H	-Cl	-H	-Cl	578
2232	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	506
2233	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-NO ₂	521
2234	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	544
2235	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	510
2236	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	510
2237	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	-H	501
2238	-CH ₃	-H	-H	-H	-CN	-H	501
2239	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	544
2240	-CH ₃	-H	-H	-OCOCH ₃	-OCH ₃	-H	564
2241	-CH ₃	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	521
2242	-CH ₃	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	519
2243	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OH	492

【表 1 5 6】



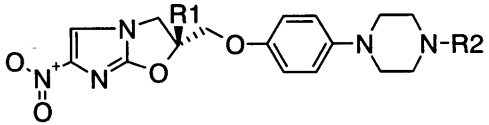
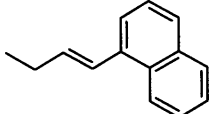
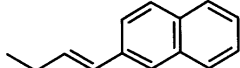
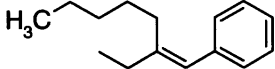
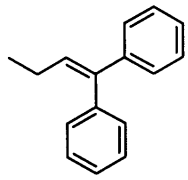
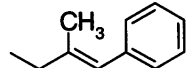
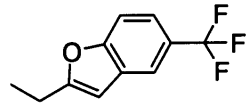
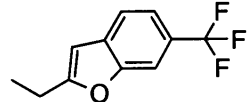
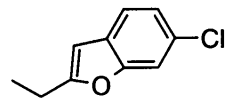
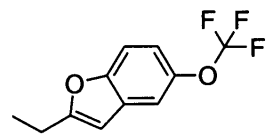
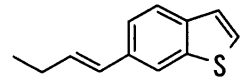
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2244	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-OH	-OCH ₃	-H	552
2245	-CH ₃	-H	-H	-OH	-OCH ₃	-H	522
2246	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	504
2247	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₁₃	-H	-H	560
2248	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	582
2249	-CH ₃	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	568
2250	-CH ₃	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	518
2251	-CH ₃	-H	-H	-OC ₆ H ₁₃	-H	-H	576
2252	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	560

10

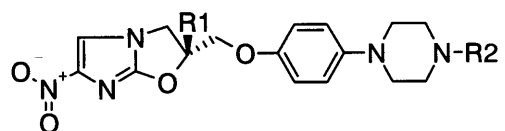
20

【 2 3 6 3】

【表 1 5 7】

			
実施例	R1	R2	MS(M+1)
2253	-CH ₃		526
2254	-CH ₃		526
2255	-CH ₃		546
2256	-CH ₃		552
2257	-CH ₃		490
2258	-CH ₃		558
2259	-CH ₃		558
2260	-CH ₃		524
2261	-CH ₃		574
2262	-CH ₃		532

【表 1 5 8】



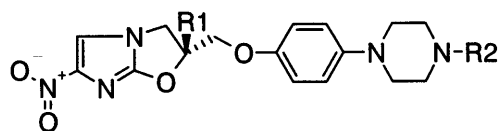
実施例	R1	R2	MS(M+1)
2263	-CH ₃		540
2264	-CH ₃		547
2265	-CH ₃		534
2266	-CH ₃		527

【 2 3 6 5】

10

20

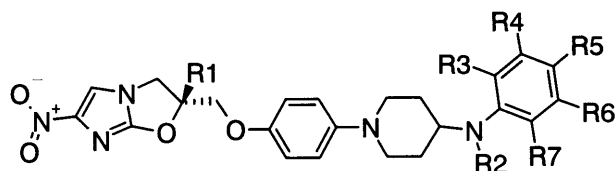
【表 1 5 9】



実施例	R1	R2	mp(°C)
2267	-CH ₃		
2268	-CH ₃		197.7 - 200.1
2269	-H		165.4 - 168.5
2270	-CH ₃		
2271	-CH ₃		

【 2 3 6 6 】

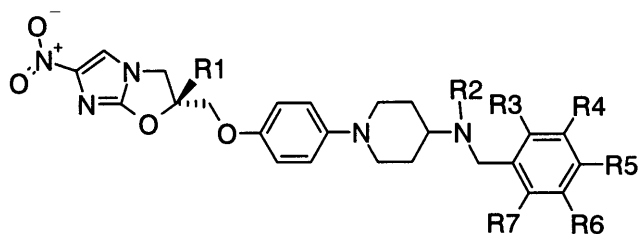
【表 160】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	mp(°C)
2272	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	122 - 124
2273	-CH ₃	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	166.5 - 167
2274	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₃ H ₇	-H	-H	222 - 223
2275	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-C ₃ H ₇	-H	-H	198 - 199
2276	-CH ₃	-H	-H	-H	-F	-H	-H	180.2 - 182.8
2277	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	175.7 - 177.4
2278	-CH ₃	-H	-H	-H	4-CF ₃ OPhO-	-H	-H	167.4 - 170.2
2279	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	4-CF ₃ OPhO-	-H	-H	167.4 - 170.2
2280	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	

【 2 3 6 7 】

【表 161】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	mp(°C)
2281	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	114.5 - 117.3
2282	-CH ₃	-CH ₃	-F	-H	-CF ₃	-H	-H	197.5 - 199.2
2283	-CH ₃	-CH ₃	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	189.6 - 190.2
2284	-CH ₃	-CH ₃	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	176.9 - 178.2
2285	-CH ₃	-CH ₃	-Cl	-H	-Cl	-H	-H	181.6 - 182.4
2286	-CH ₃	-CH ₃	-H	-CF ₃	-H	-CF ₃	-H	193.8 - 195.3
2287	-H	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	

【 2 3 6 8 】

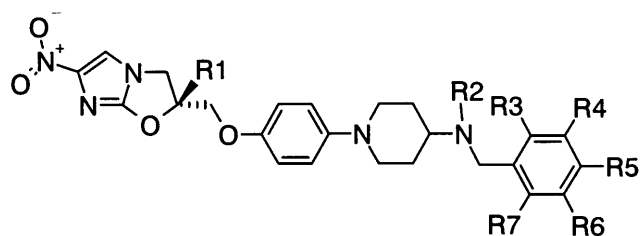
10

20

30

40

【表 1 6 2】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	MS(M+1)
2288	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CN	-H	-H	-H	-H	-H	517
2289	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	560
2290	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	534
2291	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	568
2292	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	506
2293	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	570
2294	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	584
2295	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OC ₈ H ₁₇	-H	-H	606
2296	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	521
2297	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-C ₄ H ₉	-H	-H	534
2298	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	-H	534
2299	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-N(C ₆ H ₅) ₂	-H	-H	645
2300	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCH(CH ₃) ₂	-H	-H	536
2301	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OC(CH ₃) ₃	-H	-H	550
2302	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-O(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	-H	-H	579
2303	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	N(C ₄ H ₉) ₂	-H	-H	605

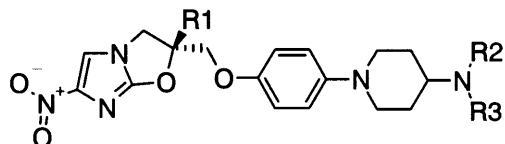
【 2 3 6 9】

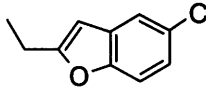
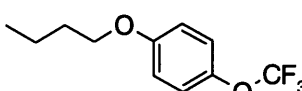
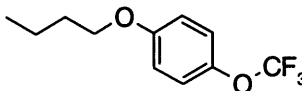
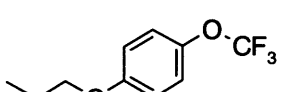
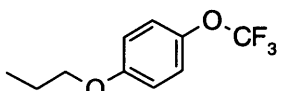
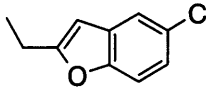
10

20

30

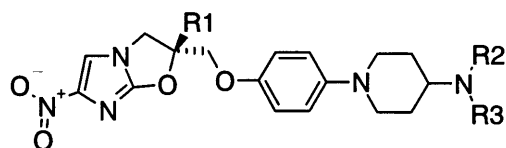
【表 1 6 3】

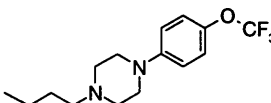
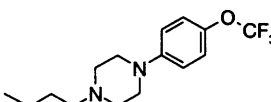
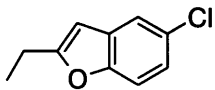
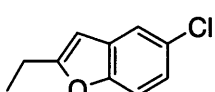
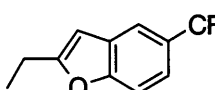
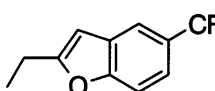


実施例 R1	R2	R3	mp(°C)
2304	-CH ₃ (CH ₃) ₃ COCO-	-CH ₃	
2305	-H (CH ₃) ₃ COCO-	-CH ₃	10
2306	-CH ₃ 4-ClPh-	4-ClPh-	40.3 – 40.7
2307	-CH ₃ 4-CF ₃ Ph-	4-CF ₃ Ph-	104.0 – 108.0
2308	-CH ₃ 4-ClPh-	4-CF ₃ Ph-	
2309	-CH ₃ 4-CF ₃ PhCH ₂ -	-CH ₃	
2310	-H 4-CF ₃ PhCH ₂ -	-CH ₃	167.7 - 169.0
2311	-CH ₃ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	
2312	-CH ₃ 	-CH ₃	20
2313	-CH ₃ 	-H	165.2 - 168.9
2314	-CH ₃ 	-CH ₃	163.0 - 163.9
2315	-CH ₃ 	-H	198.3 - 199.0
2316	-CH ₃ 	-CH ₃	185.7 - 187.7
2317	-H 	-CH ₃	

【 2 3 7 0 】

【表 1 6 4】



実施例 R1	R2	R3	mp(°C)	
2318	-CH ₃		-CH ₃	181.4 – 183.3
2319	-CH ₃		-H	185.0 – 188.8
2320	-CH ₃		-CH ₃	207.4 - 210.0
2321	-H		-CH ₃	219.6 - 221.1
2322	-CH ₃		-CH ₃	194.2 - 196.0
2323	-H		-CH ₃	174.0 - 175.3

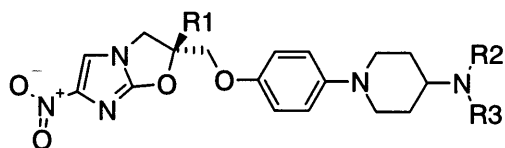
【 2 3 7 1 】

10

20

30

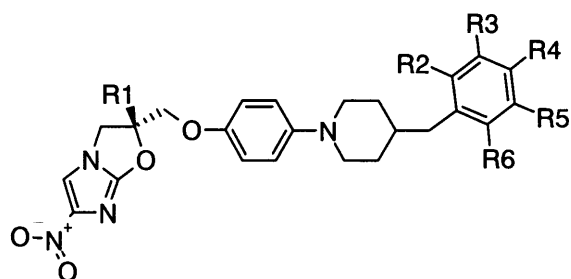
【表 1 6 5】



実施例 R1	R2	R3	MS(M+1)
2324 -CH ₃		-CH ₃	547
2325 -CH ₃		-CH ₃	561
2326 -CH ₃		-C ₂ H ₅	568
2327 -CH ₃		-H	482
2328 -CH ₃		-H	501

【 2 3 7 2 】

【表 1 6 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
2329	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	160.5 - 164.0
2330	-CH ₃	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	
2331	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	
2332	-CH ₃	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	
2333	-H	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	

【 2 3 7 3 】

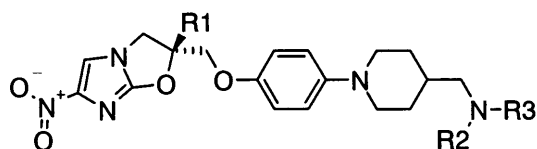
10

20

30

40

【表 1 6 7】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
2334	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-COCH ₃	148.6 - 149.1
2335	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-C ₂ H ₅	116.8 - 119.2
2336	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-CH ₃	135.6 - 140.9
2337	-CH ₃	4-ClPh-	-CH ₃	141.6 - 146.1
2338	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	-CH ₃	151.4 - 155.0
2339	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-COCH ₃	
2340	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	-H	181.9 - 182.5
2341	-CH ₃	4-ClPh-	-H	177.6 - 179.1
2342	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	-H	164.7 - 165.8
2343	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-C ₂ H ₅	163.9 - 165.2
2344	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-CH ₃	180.5 - 180.8
2345	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	-CH ₃	169.5 - 170.6
2346	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-CH ₃	166.7 - 167.5
2347	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	-H	163.9 - 167.6
2348	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	-H	163.8 - 166.3
2349	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	-H	157.0 - 160.8
2350	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	(CH ₃) ₃ COCO-	
2351	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	(CH ₃) ₃ COCO-	
2352	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	(CH ₃) ₃ COCO-	
2353	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO--CH ₃		
2354	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	-CH ₃	
2355	-CH ₃	4-CF ₃ OPhNHCO-	-CH ₃	

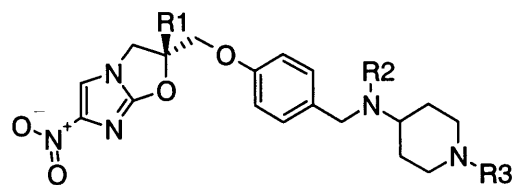
【 2 3 7 4 】

10

20

30

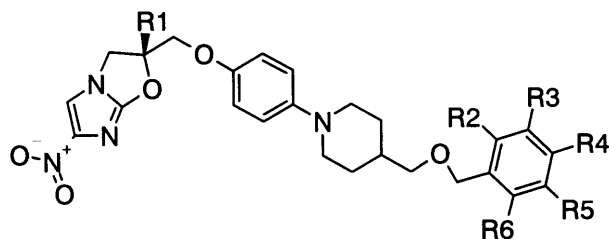
【表 1 6 8】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
2356	-CH ₃	-CH ₃	(CH ₃) ₃ COCO-	159.8-161.0
2357	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	154.3-155.6
2358	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhNHCO-	146.7-149.3
2359	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	139.7-140.6
2360	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	154.7-157.0

【 2 3 7 5 】

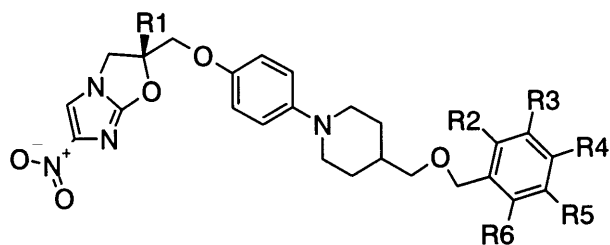
【表 1 6 9】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2361	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-H	-H	513
2362	-CH ₃	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	521
2363	-CH ₃	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	547
2364	-CH ₃	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	535
2365	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	-H	504
2366	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	555
2367	-CH ₃	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	563
2368	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	493
2369	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	563
2370	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-H	-H	513
2371	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	497
2372	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	509
2373	-CH ₃	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	547
2374	-CH ₃	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	547
2375	-CH ₃	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	-H	571
2376	-CH ₃	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	525
2377	-CH ₃	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	563
2378	-CH ₃	-Cl	-H	-F	-H	-H	531
2379	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	547
2380	-CH ₃	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	547
2381	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	507
2382	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-Cl	-H	547
2383	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	507
2384	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	513
2385	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	547
2386	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	493
2387	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	479

【 2 3 7 6 】

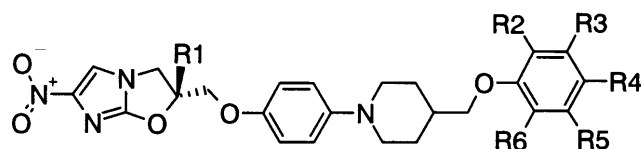
【表 1 7 0】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6
2388	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H

【 2 3 7 7 】

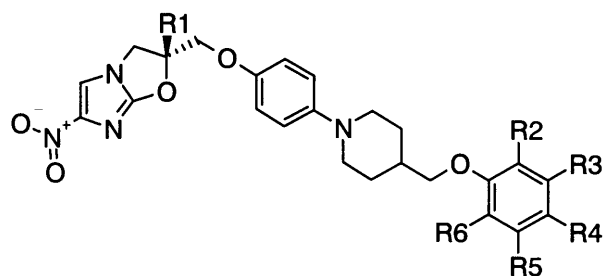
【表 171】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2389	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	495
2390	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	525
2391	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	465
2392	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	499
2393	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	499
2394	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	499
2395	-CH ₃	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	533
2396	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	479
2397	-CH ₃	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	493
2398	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	483
2399	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	537
2400	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	-H	490
2401	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CF ₃	533
2402	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	533
2403	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	533
2404	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	549
2405	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCH(CH ₃) ₂	523
2406	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	551
2407	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	553
2408	-CH ₃	-H	-H	-Br	-H	-F	561
2409	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	-F	497
2410	-CH ₃	-H	-H	-C ₃ H ₇	-H	-H	507
2411	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-F	-H	517
2412	-CH ₃	-H	-H	-NO ₂	-H	-F	528
2413	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-OCH ₃	535
2414	-CH ₃	-H	-H	-H	-N(C ₂ H ₅) ₂	-H	536
2415	-CH ₃	-H	-CH=CHCH ₃ (cis)	-H	-H	-OC ₂ H ₅	549
2416	-CH ₃	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	507
2417	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ COCH ₃	-H	-H	535
2418	-CH ₃	-H	-H	-H	-NHC ₆ H ₅	-H	556
2419	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	537
2420	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-Cl	529

【2378】

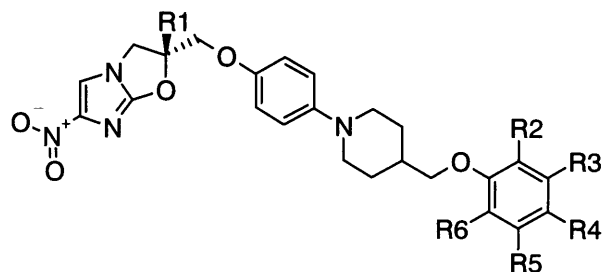
【表 1 7 2】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2421	-CH ₃	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	523
2422	-CH ₃	-H	-H	-COC ₂ H ₅	-H	-H	521
2423	-CH ₃	-H	-H	-COCH ₃	-H	-CH ₃	521
2424	-CH ₃	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	522
2425	-CH ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-H	507
2426	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	555
2427	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	553
2428	-CH ₃	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	511
2429	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-2-BENZTHIAZOLYL	598
2430	-CH ₃	-H	-H	-1-PYRRYL	-H	-H	530
2431	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	541
2432	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	571
2433	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	555
2434	-CH ₃	-H	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	-H	547
2435	-CH ₃	-H	-H	-OC ₈ H ₁₇	-H	-H	593
2436	-CH ₃	-H	-H	-cyclo-C ₅ H ₉	-H	-H	533
2437	-CH ₃	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	557
2438	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₁₃	-H	-H	549

【 2 3 7 9 】

【表 1 7 3】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
2439	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	198.6 – 202.5
2440	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	197.0 – 200.9

【 2 3 8 0 】

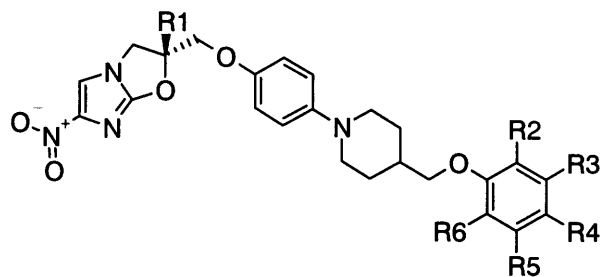
10

20

30

40

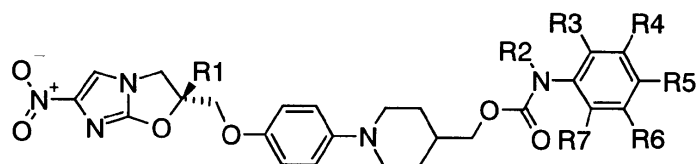
【表 1 7 4】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2441	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	532
2442	-CH ₃	-H	-H	-H	-H		532
2443	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	531
2444	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H		596
2445	-CH ₃	-H	-H	-H	-H		582
2446	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	649

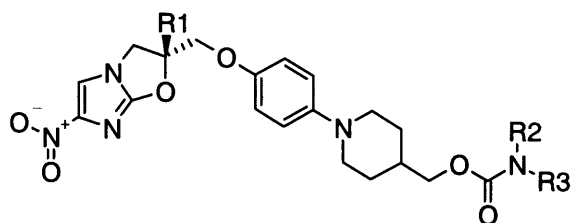
【 2 3 8 1 】

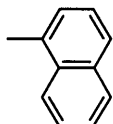
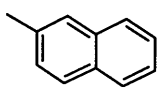
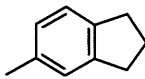
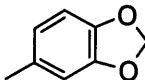
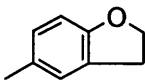
【表 175】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	MS(M+1)
2447	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	-H	508
2448	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	542
2449	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-Cl	-H	542
2450	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	542
2451	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	538
2452	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	538
2453	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	576
2454	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	576
2455	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	576
2456	-CH ₃	-H	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	576
2457	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	592
2458	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	522
2459	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	522
2460	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	522
2461	-CH ₃	-H	-F	-H	-H	-H	-H	526
2462	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	-H	526
2463	-CH ₃	-H	-H	-H	-F	-H	-H	526
2464	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	576
2465	-CH ₃	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	533
2466	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-CF ₃	-H	644
2467	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-CF ₃	-H	610
2468	-CH ₃	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	600
2469	-CH ₃	-H	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	552
2470	-CH ₃	-H	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	554
2471	-CH ₃	-H	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	550
2472	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	550
2473	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₄ H ₉	-H	-H	564
2474	-CH ₃	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₃	556
2475	-CH ₃	-H	-H	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	580
2476	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	584
2477	-CH ₃	-H	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	564
2478	-CH ₃	-H	-H	-H	-OC ₇ H ₁₅	-H	-H	622
2479	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCHF ₂	-H	-H	574
2480	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	598
2481	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₈ H ₁₇	-H	-H	620

【表 1 7 6】



実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
2482	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	-H	522
2483	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-H	536
2484	-CH ₃	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	514
2485	-CH ₃		-H	558
2486	-CH ₃		-H	558
2487	-CH ₃		-H	548
2488	-CH ₃		-H	552
2489	-CH ₃		-H	550

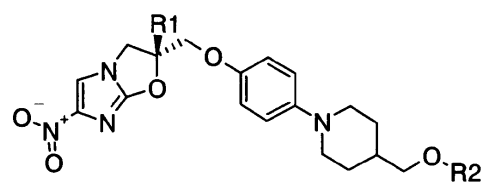
【 2 3 8 3 】

10

20

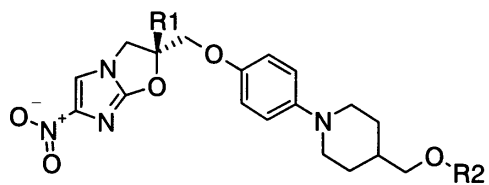
30

【表 1 7 7】



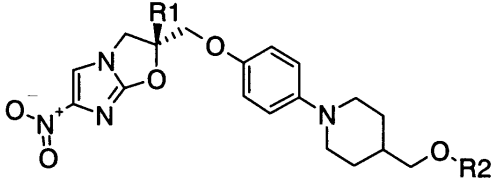
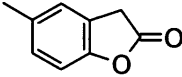
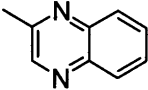
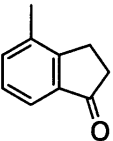
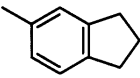
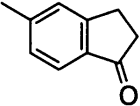
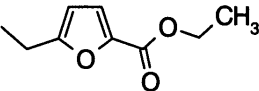
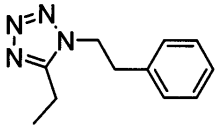
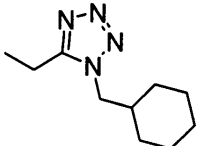
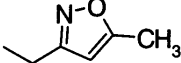
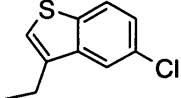
実施例	R1	R2	MS(M+1)
2490	-CH ₃		509
2491	-CH ₃		515
2492	-CH ₃		515
2493	-CH ₃		521
2494	-CH ₃		522
2495	-CH ₃		536
2496	-CH ₃		533
2497	-CH ₃		545
2498	-CH ₃		539
2499	-CH ₃		516
2500	-CH ₃		466

【表 1 7 8】

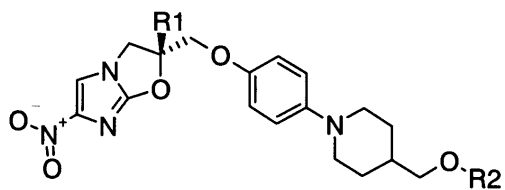


実施例	R1	R2	MS(M+1)
2501	-CH ₃		516
2502	-CH ₃		535
2503	-CH ₃		466
2504	-CH ₃		555
2505	-CH ₃		533
2506	-CH ₃		519
2507	-CH ₃		516
2508	-CH ₃		506
2509	-CH ₃		507
2510	-CH ₃		
2511	-CH ₃		530

【表 1 7 9】

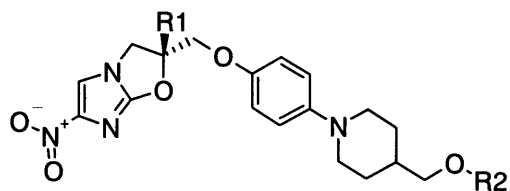
			
実施例	R1	R2	MS(M+1)
2512	-CH ₃		10
2513	-CH ₃		517
2514	-CH ₃		519
2515	-CH ₃		505
2516	-CH ₃		519
2517	-CH ₃		541
2518	-CH ₃		575
2519	-CH ₃		567
2520	-CH ₃		484
2521	-CH ₃		570

【表 180】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2522	-CH ₃		498
2523	-CH ₃		561
2524	-CH ₃		427
2525	-CH ₃		507
2526	-CH ₃		529
2527	-CH ₃		547
2528	-CH ₃		480
2529	-CH ₃		630
2530	-CH ₃		596
2531	-CH ₃		589

【表 1 8 1】



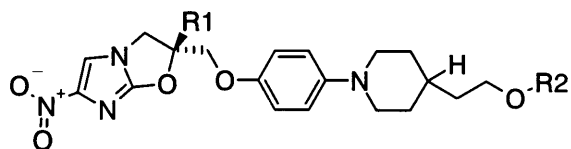
実施例	R1	R2	MS(M+1)
2532	-CH ₃		590
2533	-CH ₃		528
2534	-CH ₃		548
2535	-CH ₃		544

10

20

【 2 3 8 8 】

【表 1 8 2】



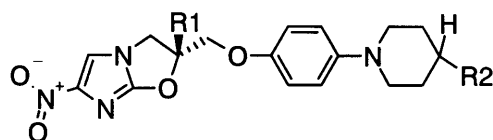
実施例	R1	R2	mp(°C)
2536	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	204.8-206.7
2537	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	198.0-199.2
2538	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	197.6-198.2
2539	-CH ₃	4-ClPhNHCO-	212.7-213.3
2540	-CH ₃	4-ClPhN(CH ₃)CO-	189.4-191.6
2541	-CH ₃	4-ClPhN(C ₂ H ₅)CO-	168.6-171.6
2542	-CH ₃	4-CF ₃ PhNHCO-	216.2 - 217.1 dec
2543	-CH ₃	4-CF ₃ OPhNHCO-	218.3 - 218.5 dec
2544	-H	4-CF ₃ PhNHCO-	
2545	-H	4-CF ₃ OPhNHCO-	
2546	-CH ₃	4-CF ₃ PhN(CH ₃)CO-	195.8 - 199.1
2547	-CH ₃	4-CF ₃ OPhN(CH ₃)CO-	181.0 - 184.2
2548	-H	4-CF ₃ PhN(CH ₃)CO-	
2549	-H	4-CF ₃ OPhN(CH ₃)CO-	

【 2 3 8 9 】

10

20

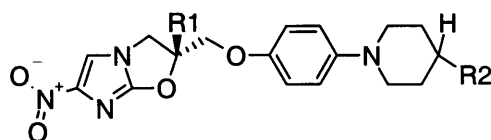
【表 1 8 3】



実施例	R1	R2	mp(°C)
2550	-CH ₃		279-281
2551	-CH ₃		227-229
2552	-CH ₃		225-227
2553	-CH ₃		247-249
2554	-CH ₃		230.8-232
2555	-CH ₃		
2556	-H		248 - 250 dec
2557	-H		254 - 257 dec
2558	-H		259 - 260.5
2559	-H		248.5 - 250
2560	-CH ₃		269 - 271 dec
2561	-CH ₃		274 - 276 dec

【 2 3 9 0 】

【表 1 8 4】



実施例	R1	R2	mp(°C)
2562	-H		163 - 165
2563	-H		200 - 205 dec
2564	-H		172 - 174
2565	-H		206.5 - 208
2566	-CH ₃		234 - 236 dec
2567	-CH ₃		
2568	-CH ₃		
2569	-H	CF ₃ OPh(CH ₂) ₂ -	
2570	-H	CF ₃ OPh(CH ₂) ₃ -	

【 2 3 9 1】

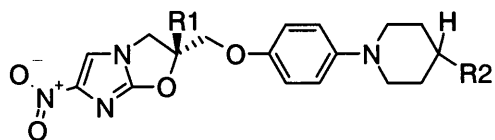
10

20

30

40

【表 1 8 5】



実施例R1	R2	MS(M+1)
2571 -CH ₃		554
2572 -CH ₃		525
2573 -CH ₃		575
2574 -CH ₃		616
2575 -CH ₃		600
2576 -CH ₃		444

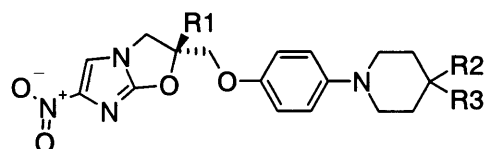
【 2 3 9 2 】

10

20

30

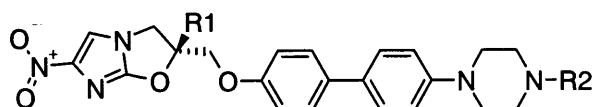
【表 1 8 6】



実施例 R1	R2	R3	mp(°C)
2577 -CH ₃	-H		208.9 - 210.6
2578 -H	-H		172.7 - 175.2
2579 -CH ₃	-H		199.8 - 202.4
2580 -H	-H		150.0 - 151.9

【 2 3 9 3】

【表 1 8 7】



実施例	R1	R2	mp(°C)
2581	-CH ₃	(CH ₃) ₃ COCO-	
2582	-CH ₃	-H	
2583	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	238.2~240.3 dec.
2584	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	247.8~248.5 dec.
2585	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	
2586	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	221.0-226.0
2587	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	248.0-252.0
2588	-CH ₃	3,4-Cl ₂ PhCH ₂ -	222.6-225.1 dec.
2589	-CH ₃	4-FPhCH ₂ -	247.7-249.5
2590	-H	(CH ₃) ₃ COCO-	
2591	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	
2592	-H	4-CF ₃ PhCH ₂ -	
2593	-H	4-ClPhCH ₂ -	

【 2 3 9 4】

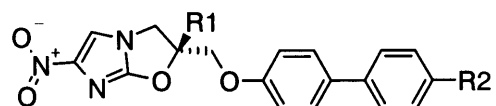
10

20

30

40

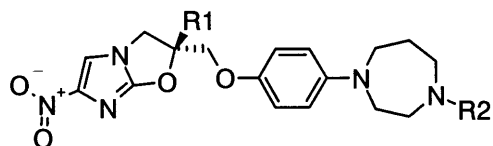
【表 188】



実施例	R1	R2	mp(°C)	
2594	-CH ₃	4-ClPh-	250	dec.
2595	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-		
2596	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-		10
2597	-H	4-ClPh-		
2598	-H	4-CF ₃ Ph-		
2599	-H	4-CF ₃ OPh-		
2600	-CH ₃		203.4 – 206.3	
2601	-CH ₃		200.8 – 203.9	20
2602	-CH ₃		206.6 – 210.2	
2603	-H		203.0 – 205.6	30
2604	-H		188.6 – 191.4	
2605	-H		202.5 – 203.8	40

【2395】

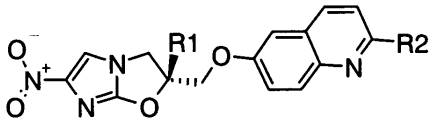
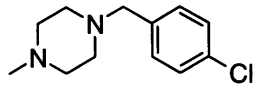
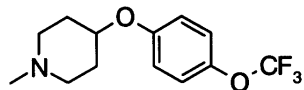
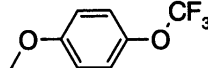
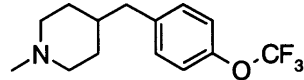
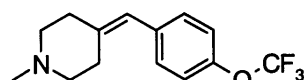
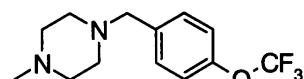
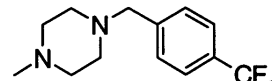
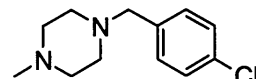
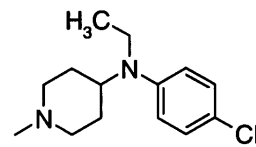
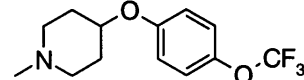
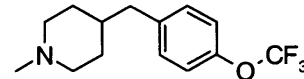
【表 1 8 9】



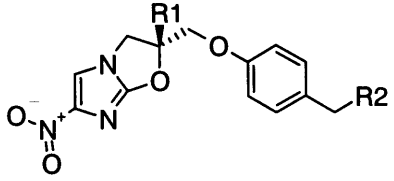
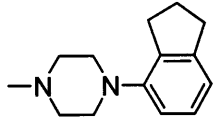
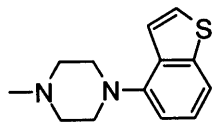
実施例	R1	R2	mp(°C)
2606	-CH ₃	(CH ₃) ₃ COCO-	
2607	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	150.3-153.9
2608	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ -	136.5-138.4
2609	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	150.6-153.5
2610	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	156.6-158.1
2611	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	134.0-137.9
2612	-CH ₃	4-ClPh-	149.7-151.2
2613	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	90.2-93.0
2614	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH ₂ OCO-	86.7-89.0
2615	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ OCO-	109.0-112.3
2616	-CH ₃	4-ClPhNHCO-	
2617	-CH ₃	4-CF ₃ OPhNHCO-	199.0-203.6
2618	-CH ₃	4-CF ₃ PhNHCO-	208.5-212.0
2619	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	
2620	-CH ₃	4-CF ₃ Ph(CH ₂) ₂ -	
2621	-CH ₃	4-CF ₃ Ph(CH ₂) ₃ -	149.5 - 154.0 (二塩酸塩)
2622	-CH ₃	4-ClPhCO-	
2623	-CH ₃	4-CF ₃ PhCO-	
2624	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCO-	

【 2 3 9 6 】

【表 190】

				
実施例	R1	R2	mp(°C)	
2625	-CH ₃		218.1-219.1	
2626	-CH ₃		199.6-200.1	
2627	-CH ₃		133.8-136.2	
2628	-CH ₃			
2629	-CH ₃		193.9-195.9	
2630	-CH ₃		215.5 – 217.4	
2631	-CH ₃			
2632	-H		215.0 - 215.9	
2633	-CH ₃			
2634	-H		191.4 – 192.8	
2635	-H		198.8 – 200.9	

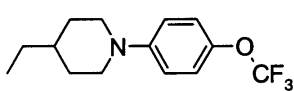
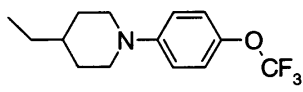
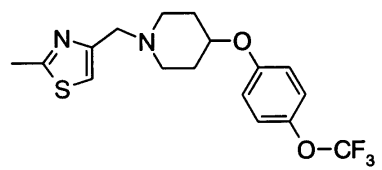
【表 191】

			
実施例	R1	R2	mp(°C)
2636	-CH ₃		162.7 - 165.1
2637	-CH ₃		132.4 - 134.7

10

【2398】

【表 192】

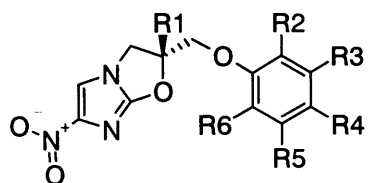
実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
2638	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	
2639	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	165.5-168.1
2640	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPhCH=CHCH ₂ -	193.3-195.3
2641	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPhCH=CHCO-	251.1-254.1
2642	-CH ₃	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH=CHCO-	161.7-163.4
2643	-CH ₃	-H	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	193.4-196.2
2644	-CH ₃	-C ₂ H ₅	4-CF ₃ PhCH=CHCH ₂ -	143.8-145.1
2645	-CH ₃	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ OCO-	198.9-201.2
2646	-CH ₃	-CH ₃		172.5-175.2
2647	-CH ₃			150.5-152.2

30

40

【2399】

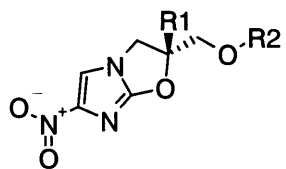
【表 1 9 3】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
2648	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	10
2649	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	20
2650	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	188.4-191.0
2651	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	248.8-251.5
2652	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	218.4-221.0
2653	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	145.6 – 147.8
2654	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	241.2 – 242.5
2655	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	30
2656	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	40
2657	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	

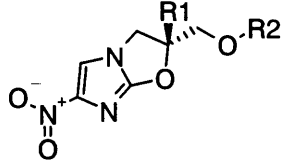
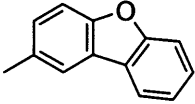
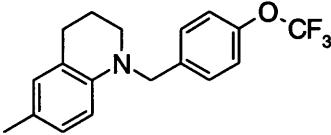
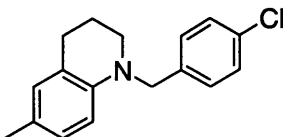
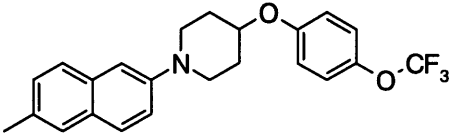
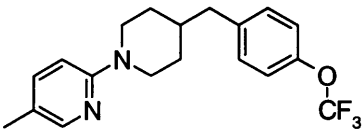
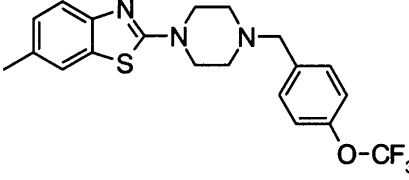
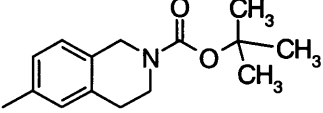
【 2 4 0 0 】

【表 1 9 4】



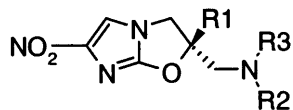
実施例R1	R2	mp(°C)
2658 -CH ₃		185.9-186.7
2659 -CH ₃		191.4-193.9
2660 -CH ₃		172.7-175.3
2661 -CH ₃		200.1-202.7
2662 -CH ₃		179.9-181.9
2663 -CH ₃		175.7-178.5
2664 -CH ₃		
2665 -CH ₃		241.8-244.1

【表 1 9 5】

			
実施例 R1	R2	mp(°C)	
2666	-CH ₃		193.3-194.5 10
2667	-CH ₃		182.3-184.4
2668	-CH ₃		175.7-178.0 20
2669	-CH ₃		
2670	-CH ₃		30
2671	-H		195.0-196.7
2672	-CH ₃		160.7-162.4 40

【 2 4 0 2 】

【表 1 9 6】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
2673	-CH ₃	-CH ₃		
2674	-CH ₃	-CH ₃		
2675	-CH ₃	-C ₂ H ₅		135-136
2676	-CH ₃	-CH ₃		134-135.5
2677	-CH ₃	-CH ₃		
2678	-CH ₃	-CH ₃		

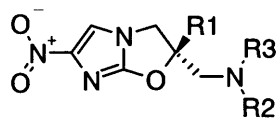
【 2 4 0 3 】

10

20

30

【表 1 9 7】



実施例	R1	R2	R3
2679	-CH ₃	-H	
2680	-H	-H	
2681	-CH ₃	-H	
2682	-H	-H	
2683	-CH ₃	-H	
2684	-H	-H	

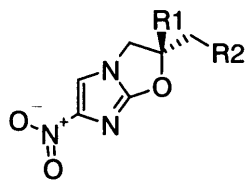
10

20

30

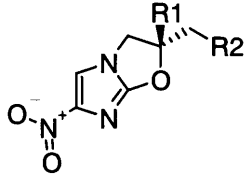
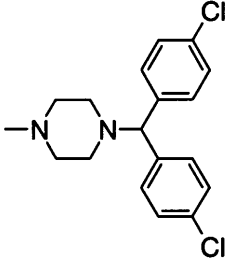
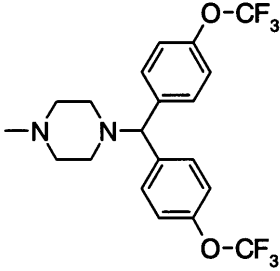
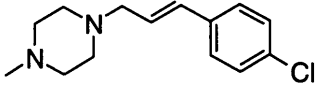
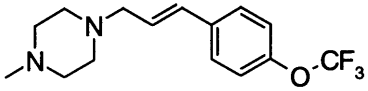
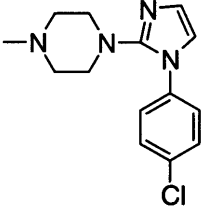
【 2 4 0 4 】

【表 198】



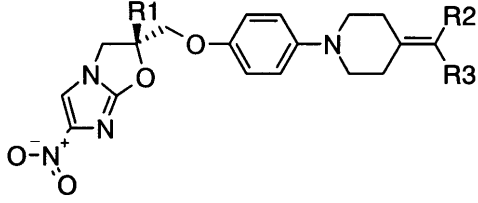
実施例 R1	R2	mp(°C)
2685 -CH ₃		10
2686 -CH ₃		158 - 159
2687 -CH ₃		87 - 88
2688 -CH ₃		132 - 133
2689 -CH ₃		
2690 -CH ₃		80.9 - 82.6
2691 -CH ₃		124.9 - 126.0
2692 -CH ₃		123.8 - 125.3
2693 -CH ₃		172 - 173.5 (マレイン酸塩)

【表 1 9 9】

				
実施例 R1	R2	mp(°C)		
2694 -CH ₃		10		
2695 -CH ₃		20		
2696 -CH ₃		191.5 - 193		
2697 -CH ₃		141.5 - 143		
2698 -CH ₃		217 - 219		

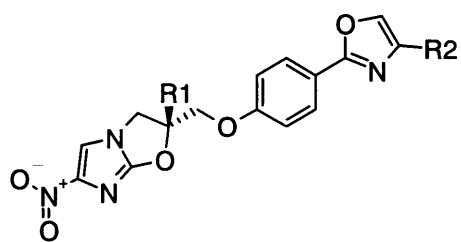
【 2 4 0 6】

【表 2 0 0】

				
実施例 R1	R2	R3	mp(°C)	
2699 -CH ₃	-H	4-CF ₃ OPh-	182.0 - 184.2	40
2700 -H	-H	4-CF ₃ OPh-	143.9 - 146.7	

【 2 4 0 7 】

【表 2 0 1】

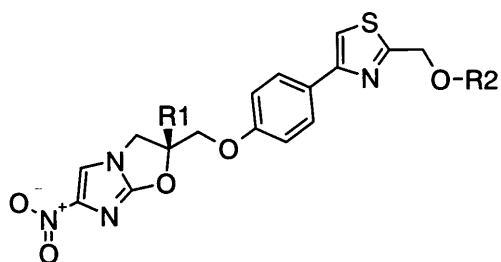


実施例	R1	R2	mp(°C)
2701	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	226.0 – 227.6

10

【 2 4 0 8 】

【表 2 0 2】



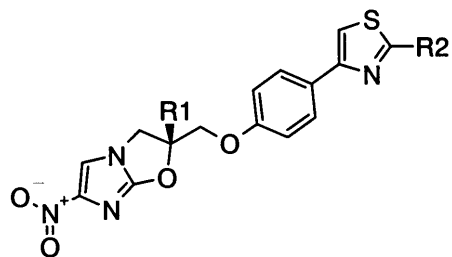
20

実施例	R1	R2
2702	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-
2703	-H	4-CF ₃ OPh-

【 2 4 0 9 】

30

【表 2 0 3】



実施例	R1	R2	mp(°C)
2704	-CH ₃	-C ₆ H ₅	
2705	-H	-C ₆ H ₅	
2706	-CH ₃	4-FPh-	
2707	-H	4-FPh-	
2708	-CH ₃	4-ClPh-	
2709	-H	4-ClPh-	243.0 – 246.0 dec
2710	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	
2711	-H	4-CF ₃ Ph-	
2712	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	203.0 – 204.3
2713	-H	4-CF ₃ OPh-	218.0 – 219.4
2714	-CH ₃	3,4-Cl ₂ Ph-	
2715	-H	3,4-Cl ₂ Ph-	
2716	-CH ₃	-NHC ₆ H ₅	
2717	-H	-NHC ₆ H ₅	
2718	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	
2719	-H	4-ClPhCH ₂ -	
2720	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	
2721	-H	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	

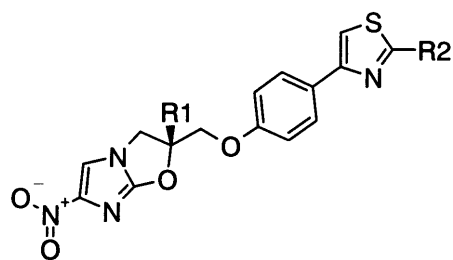
10

20

30

【 2 4 1 0 】

【表 204】



実施例 R1	R2
2722 -CH ₃	
2723 -H	
2724 -CH ₃	
2725 -H	
2726 -CH ₃	
2727 -H	
2728 -CH ₃	
2729 -CH ₃	
2730 -H	
2731 -CH ₃	

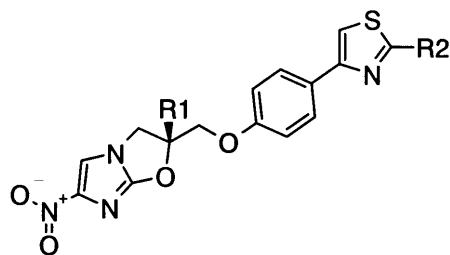
10

20

30

40

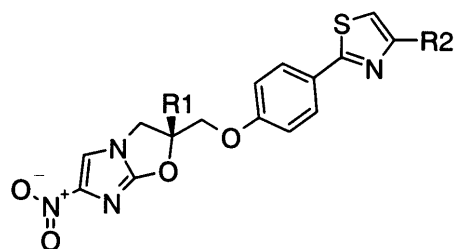
【表 205】



実施例 R1	R2	
2732 -H		10
2733 -CH3		
2734 -CH3		20
2735 -H		
2736 -CH3		
2737 -CH3		
2738 -CH3		30
2739 -CH3		
2740 -H		
2741 -H		40

【 2 4 1 2 】

【表 2 0 6】

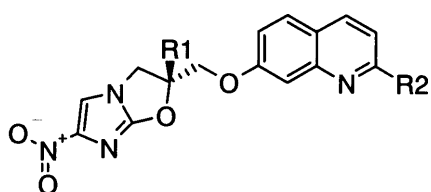


実施例	R1	R2	mp(°C)
2742	-CH ₃	-C ₆ H ₅	182.0 – 183.0
2743	-H	-C ₆ H ₅	257.0 – 259.0
2744	-CH ₃	4-ClPh-	
2745	-H	4-ClPh-	231.0 – 233.5 dec
2746	-CH ₃	4-FPh-	
2747	-H	4-FPh-	
2748	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	
2749	-H	4-CF ₃ Ph-	
2750	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	
2751	-H	4-CF ₃ OPh-	
2752	-CH ₃	3,4-Cl ₂ Ph-	
2753	-H	3,4-Cl ₂ Ph-	
2754	-CH ₃	4-CF ₃ OPhOCH ₂ -	
2755	-H	4-CF ₃ OPhOCH ₂ -	

10

【 2 4 1 3 】

【表 2 0 7】

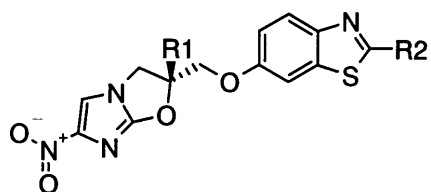


実施例	R1	R2	mp(°C)
2756	-CH ₃		182.6 – 184.8
2757	-CH ₃		109.8 – 112.7

40

【 2 4 1 4 】

【表 208】



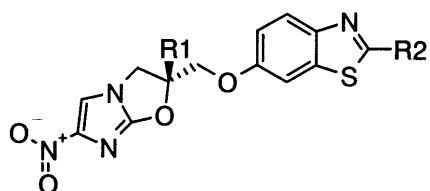
実施例 R1	R2	mp(°C)
2758 -CH ₃		223.8 – 225.6
2759 -CH ₃		168.3 – 171.2
2760 -CH ₃		

10

20

【 2415】

【表 209】

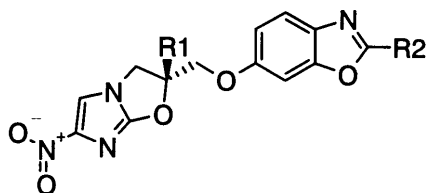


実施例 R1	R2	mp(°C)
2761 -CH ₃	-C ₆ H ₅	249.3 – 250.0
2762 -CH ₃	4-ClPh-	257.8 – 258.2
2763 -H	-C ₆ H ₅	249.2 – 252.1 dec
2764 -H	4-ClPh-	

30

【 2416】

【表 2 1 0】

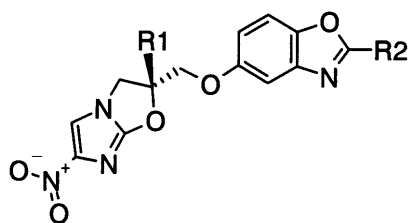


実施例	R1	R2
2765	-CH ₃	

10

【 2 4 1 7】

【表 2 1 1】



20

実施例	R1	R2	mp(°C)
2766	-CH ₃	-C ₆ H ₅	221.2 – 222.1
2767	-CH ₃	4-ClPh-	229.8 – 232.1
2768	-H	-C ₆ H ₅	246.2 – 247.0
2769	-H	4-ClPh-	260.4 – 260.9

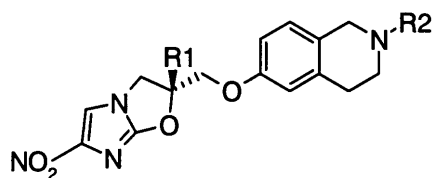
【 2 4 1 8】

30

実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
2770	-CH ₃	-H	-C ₆ H ₅	144.0 – 146.3
2771	-CH ₃	-H	4-ClPh-	191.0 – 193.9 dec
2772	-H	-H	-C ₆ H ₅	
2773	-H	-H	4-ClPh-	
2774	-CH ₃	-CH ₃	-C ₆ H ₅	
2775	-CH ₃	-CH ₃	4-ClPh-	
2776	-H	-CH ₃	-C ₆ H ₅	
2777	-H	-CH ₃	4-ClPh-	

20

【表 2 1 3】

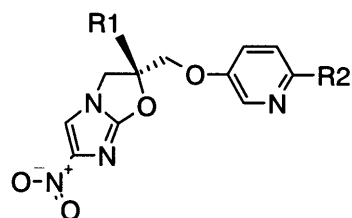


实施例	R1	R2	mp(°C)
2778	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	180.9 – 183.1
2779	-CH ₃	4-CF ₃ OphCH ₂ -	151.1 – 154.1

30

【 2 4 2 0 】

【表 2 1 4】



実施例	R1	R2	mp(°C)
2780	-CH ₃		166.7 - 169.2
2781	-H		139.8 - 141.6
2782	-CH ₃		
2783	-H		174.2 - 176.8
2784	-CH ₃		197.0 - 199.3
2785	-H		177.9 - 179.3
2786	-CH ₃		199.6 - 201.2
2787	-H		169.6 - 173.2
2788	-CH ₃		210.9 - 212.0
2789	-H		188.0 - 190.0

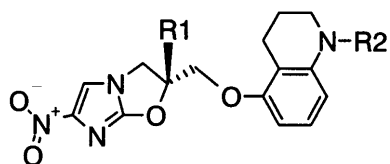
10

20

30

40

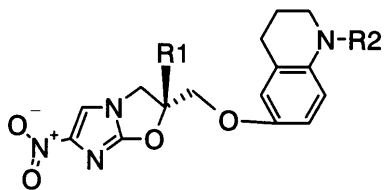
【表 2 1 5】



実施例	R1	R2	mp(°C)
2790	-CH ₃	4-ClPh-	238 - 239
2791	-CH ₃	4-CF ₃ Ph-	199 - 200
2792	-CH ₃	4-ClPhCH ₂ -	199 - 200
2793	-CH ₃	4-CF ₃ OPhCH ₂ -	172 - 173

【 2 4 2 2 】

【表 2 1 6】



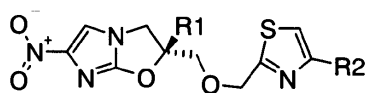
実施例	R1	R2	mp(°C)
2794	-CH ₃	4-ClPh-	175.5 - 176.5
2795	-CH ₃	4-CF ₃ OPh-	122.5 - 124 dec

【 2 4 2 3 】

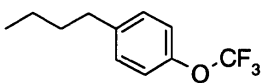
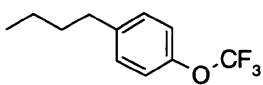
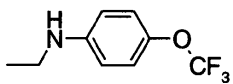
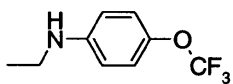
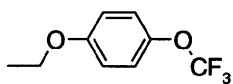
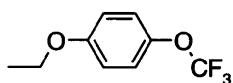
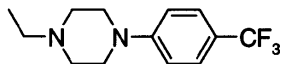
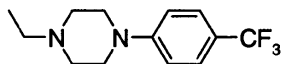
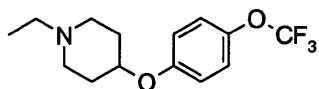
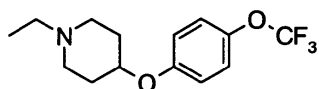
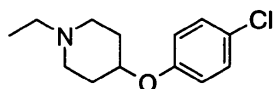
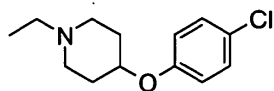
10

20

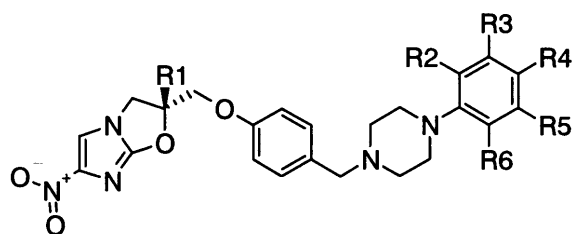
【表 2 1 7】



実施例	R1	R2
2796	-CH ₃	
2797	-H	
2798	-CH ₃	
2799	-H	
2800	-CH ₃	
2801	-H	
2802	-CH ₃	
2803	-H	
2804	-CH ₃	
2805	-H	
2806	-CH ₃	
2807	-H	



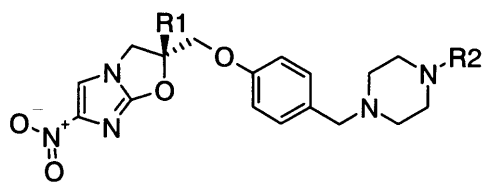
【表 2 1 8】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2808	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	526
2809	-CH ₃	-H	-H	(CH ₃) ₃ COCO-			
2810	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	522
2811	-CH ₃	-C ₆ H ₅	-H	-H	-H	-H	526
2812	-CH ₃	-H	-H	-OH	-H	-H	
2813	-CH ₃	-H	-H	4-ClPhO-			576

【 2 4 2 5】

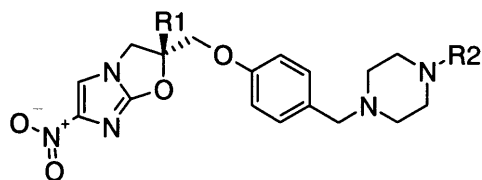
【表 2 1 9】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2814	-CH ₃		524
2815	-CH ₃		504
2816	-CH ₃		523
2817	-CH ₃		20
2818	-CH ₃		508
2819	-CH ₃		30
2820	-CH ₃		
2821	-CH ₃		
2822	-CH ₃		500

【 2 4 2 6 】

【表 2 2 0】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2823	-CH ₃		533
2824	-CH ₃		490
2825	-CH ₃		490
2826	-CH ₃		506
2827	-CH ₃		491
2828	-CH ₃		490
2829	-CH ₃		517
2830	-CH ₃		548
2831	-CH ₃		519

【 2 4 2 7 】

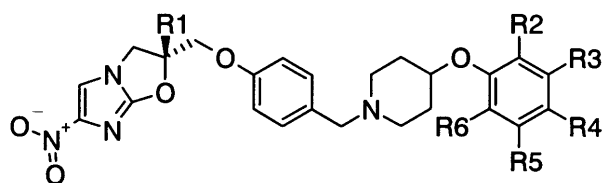
10

20

30

40

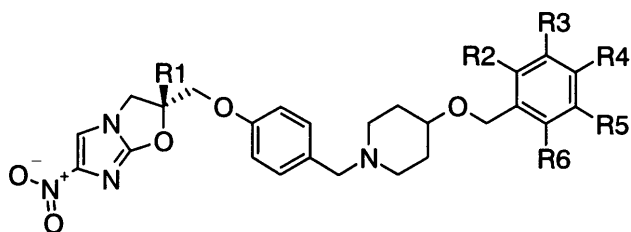
【表 2 2 1】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2832	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	571
2833	-CH ₃	-H	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	-H	547
2834	-CH ₃	-H	-H	-OC ₈ H ₁₇	-H	-H	593
2835	-CH ₃	-H	-H	-cyclo-C ₅ H ₉	-H	-H	533
2836	-CH ₃	-H	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	557

【 2 4 2 8 】

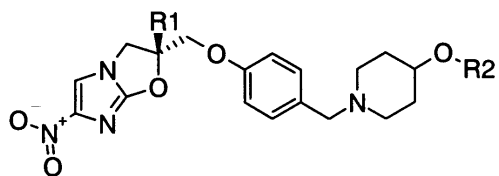
【表 2 2 2】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2837	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	513
2838	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-H	-H	513
2839	-CH ₃	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	521
2840	-CH ₃	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	547
2841	-CH ₃	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	-H	535
2842	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	547
2843	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	493
2844	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	-H	504
2845	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	555
2846	-CH ₃	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	563
2847	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	493
2848	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	563
2849	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-H	-H	513
2850	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	497
2851	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	509
2852	-CH ₃	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	547
2853	-CH ₃	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	547
2854	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	537
2855	-CH ₃	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	-H	571
2856	-CH ₃	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	525
2857	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	479
2858	-CH ₃	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	563
2859	-CH ₃	-Cl	-H	-F	-H	-H	531
2860	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	547
2861	-CH ₃	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	547
2862	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	507
2863	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-Cl	-H	547
2864	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	-H	507

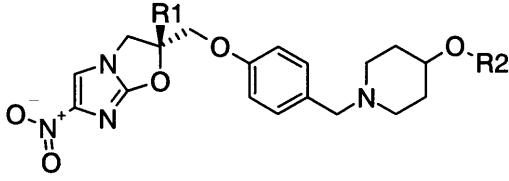
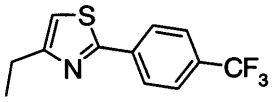
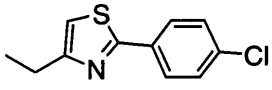
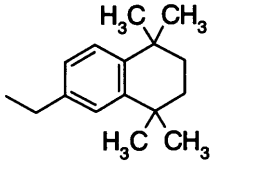
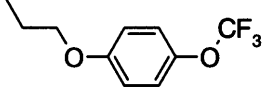
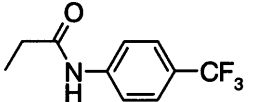
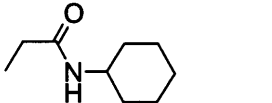
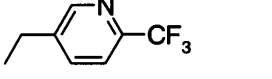
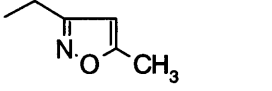
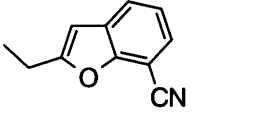
【 2 4 2 9】

【表 2 2 3】



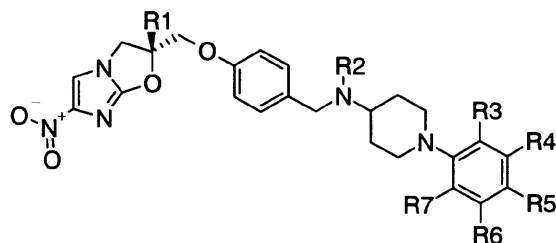
実施例	R1	R2	MS(M+1)
2865	-CH ₃		541
2866	-CH ₃		575
2867	-CH ₃		567
2868	-CH ₃		603
2869	-CH ₃		569
2870	-CH ₃		
2871	-CH ₃		561
2872	-CH ₃	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	507
2873	-CH ₃		529
2874	-CH ₃		547
2875	-CH ₃		

【表 2 2 4】

				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
2876	-CH ₃		630	10
2877	-CH ₃		596	
2878	-CH ₃		589	20
2879	-CH ₃		593	
2880	-CH ₃		590	
2881	-CH ₃			30
2882	-CH ₃		548	
2883	-CH ₃			
2884	-CH ₃		544	40

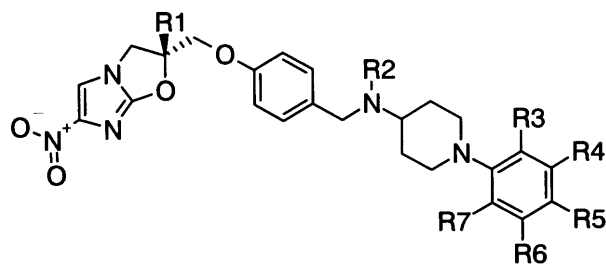
【 2 4 3 1 】

【表 2 2 5】



実施例 R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	MS(M+1)
2885	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	562
2886	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	546
2887	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	503
2888	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-NO ₂	-H	523
2889	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	521
2890	-CH ₃	-CH ₃	-OCF ₃	-H	-H	-H	562
2891	-CH ₃	-CH ₃	-H	-OCF ₃	-H	-H	562
2892	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂	-H	585
2893	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	550
2894	-CH ₃	-CH ₃	-H	-CF ₃	-H	-H	546
2895	-CH ₃	-CH ₃	-H	-CF ₃	-Cl	-H	580
2896	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	492
2897	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-C(CH ₃) ₃	-H	534
2898	-CH ₃	-CH ₃	-CF ₃	-H	-H	-H	546
2899	-CH ₃	-CH ₃	-Cl	-Cl	-H	-H	546
2900	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-SCH ₃	-H	524
2901	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	520
2902	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	570
2903	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OC ₆ H ₁₃	-H	578
2904	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₁₃	-H	562
2905	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	584
2906	-CH ₃	-CH ₃	-Cl	-H	-Cl	-H	546
2907	-CH ₃	-CH ₃	-H	-Cl	-Cl	-H	580
2908	-CH ₃	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-H	512
2909	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	508
2910	-CH ₃	-CH ₃	-H	-Cl	-Cl	-H	546
2911	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-OCHF ₂	-H	544
2912	-CH ₃	-CH ₃	-H	-F	-Cl	-H	530
2913	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H		-H	561
2914	-CH ₃	-CH ₃	-H	-CH ₃	-Cl	-H	526
2915	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H		-H	545

【表 2 2 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	MS(M+1)
2916	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	
2917	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	
2918	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	568
2919	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	591
2920	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	
2921	-CH ₃	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-H	-H	512
2922	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	554

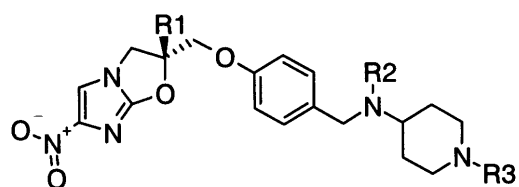
【 2 4 3 3 】

10

20

30

【表 2 2 7】



実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
2923	-CH ₃	-CH ₃		534
2924	-CH ₃	-CH ₃		536
2925	-CH ₃	-CH ₃		528
2926	-CH ₃	-CH ₃		549
2927	-CH ₃	-CH ₃		528
2928	-CH ₃	-CH ₃		522
2929	-CH ₃	-CH ₃		532
2930	-CH ₃	-CH ₃		529
2931	-CH ₃	-CH ₃		566

【 2 4 3 4 】

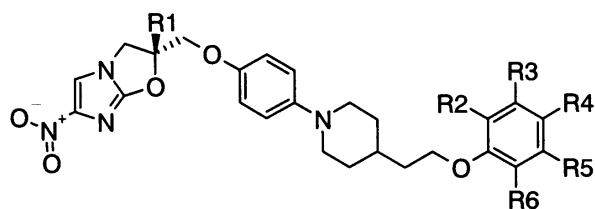
10

20

30

40

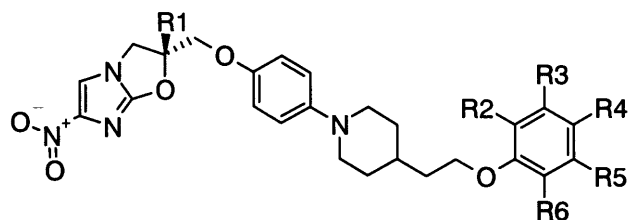
【表 2 2 8】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2932	-CH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	509
2933	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	509
2934	-CH ₃	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	539
2935	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	479
2936	-CH ₃	-Cl	-H	-H	-H	-H	513
2937	-CH ₃	-H	-Cl	-H	-H	-H	513
2938	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-H	-H	513
2939	-CH ₃	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	547
2940	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	493
2941	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	507
2942	-CH ₃	-H	-H	-F	-H	-H	497
2943	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	551
2944	-CH ₃	-H	-H	-CN	-H	-H	504
2945	-CH ₃	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	547
2946	-CH ₃	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	547
2947	-CH ₃	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	547
2948	-CH ₃	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	563
2949	-CH ₃	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	
2950	-CH ₃	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	
2951	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	546
2952	-CH ₃		-H	-H	-H	-H	546
2953	-CH ₃	-OCH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	537
2954	-CH ₃	-F	-H	-H	-CH ₃	-H	511
2955	-CH ₃	-H	-F	-Cl	-H	-H	
2956	-CH ₃	-F	-H	-NO ₂	-H	-H	542
2957	-CH ₃	-OCH ₃	-H	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-H	
2958	-CH ₃	-H	-N(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	-H	
2959	-CH ₃	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH=CHCH ₃ (cis)	-H	

【 2 4 3 5】

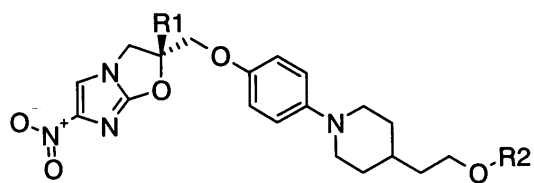
【表 2 2 9】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2960	-CH ₃	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	
2961	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ COCH ₃	-H	-H	
2962	-CH ₃	-H	-NHC ₆ H ₅	-H	-H	-H	
2963	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	
2964	-CH ₃	-Cl	-H	-OCH ₃	-H	-H	
2965	-CH ₃	-H	-H	-COC ₂ H ₅	-H	-H	
2966	-CH ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	-H	
2967	-CH ₃	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	
2968	-CH ₃	-H	-H		-H	-H	
2969	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	
2970	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	585
2971	-CH ₃	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	569
2972	-CH ₃	-H	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	-H	561
2973	-CH ₃	-H	-H	-OC ₈ H ₁₇	-H	-H	607
2974	-CH ₃	-H	-H	-cyclo-C ₅ H ₉	-H	-H	547
2975	-CH ₃	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	-H	571
2976	-CH ₃	-H	-H	-C ₆ H ₁₃	-H	-H	563

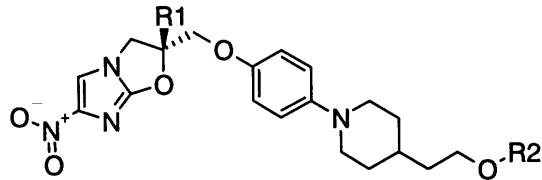
【 2 4 3 6 】

【表 2 3 0】

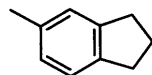
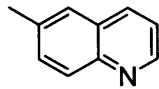


実施例	R1	R2	MS(M+1)
2977	-CH ₃		523
2978	-CH ₃		529
2979	-CH ₃		529
2980	-CH ₃		550
2981	-CH ₃		530
2982	-CH ₃		530
2983	-CH ₃		530
2984	-CH ₃		550
2985	-CH ₃		530

【表 2 3 1】



実施例 R1	R2
2986 -CH ₃	
2987 -CH ₃	



【2 4 3 8】

実施例 2 9 8 8

(R) - 2 - メチル - 2 - { 4 - [N - メチル - N - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) アミノ] フェノキシメチル } - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール

10

実施例 2 9 8 9

(R) - 4 - { 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) フェニル] - 3 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ウレイド } - ピペリジン - 1 - カルボン酸 (4 - トリフルオロメトキシフェニル) アミド

実施例 2 9 9 0

6 - ニトロ - 2 - { 4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシメチル) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール

30

実施例 2 9 9 1

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [4 - (テトラヒドロピラン - 2 - イルオキシメチル) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール

実施例 2 9 9 2

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [4 - (ヒドロキシメチル) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール

実施例 2 9 9 3

2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] ベンジル } - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール

40

融点 : 184 . 9 - 186 . 8 °C。

【2 4 3 9】

試験例 1

抗菌試験 (寒天平板希釈法)

実施例 3 9 7 で得られた 2 , 3 - ジヒドロ - 6 - ニトロイミダゾ [2 , 1 - b] オキサゾール化合物について、結核菌属 (M.tuberculosis H37Rv) に対する最小発育阻止濃度を、7 H 1 1 培地 (BBL社製) を用いて求めた。上記菌株は、予め 7 H 9 培地 (BBL社製) で培養し、生菌数を算出し、- 8 0 °C で凍結保存した菌液を使用し、最終生菌数を約 1 0 ⁶

50

C F U / m l に調製しておいた。このように調製した菌液を、試験化合物含有の 7 H 1 1 寒天培地に 5 μ l 接種し、37℃で14日間培養した後、最小発育阻止濃度を測定するための試験に供した。

【2440】

M. tuberculosis H37Rv に対する最小発育阻止濃度は、0.024 μ g / m l であった。

【2441】

試験例 2

抗菌試験（寒天平板希釈法）

実施例 2019 で得られた 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物について、結核菌属 (M. tuberculosis H37Rv) に対する最小発育阻止濃度を、7 H 1 1 培地 (B B L 社製) を用いて求めた。上記菌株は、予め 7 H 9 培地 (B B L 社製) で培養し、生菌数を算出し、-80℃で凍結保存した菌液を使用し、最終生菌数を約 106 C F U / m l に調製しておいた。このように調製した菌液を、試験化合物含有の 7 H 1 1 寒天培地に 5 μ l 接種し、37℃で14日間培養した後、最小発育阻止濃度を測定するための試験に供した。

10

【2442】

M. tuberculosis H37Rv に対する最小発育阻止濃度は、0.0015 μ g / m l であった。

【2443】

20

試験例 3

抗菌試験（寒天平板希釈法）

下記の表に示す供試化合物について、結核菌属 (M. tuberculosis Kurono) に対する最小発育阻止濃度を、7 H 1 1 培地 (B B L 社製) を用いて求めた。上記菌株は、予め 7 H 9 培地 (B B L 社製) で培養し、生菌数を算出し、-80℃で凍結保存した菌液を使用し、最終生菌数を約 106 C F U / m l に調製しておいた。このように調製した菌液を、試験化合物含有の 7 H 1 1 寒天培地に 5 μ l 接種し、37℃で14日間培養した後、最小発育阻止濃度を測定するための試験に供した。

結果を以下の表に示す。

【2444】

30

【表 2 3 2】

供試化合物	最小発育阻止濃度 ($\mu\text{g/ml}$)	
実施例 141 の化合物	0.006	
実施例 504 の化合物	0.2	
実施例 1511 の化合物	0.024	
実施例 1518 の化合物	0.012	
実施例 1542 の化合物	0.024	
実施例 1571 の化合物	0.024	10
実施例 1576 の化合物	0.024	
実施例 1647 の化合物	0.1	
実施例 1827 の化合物	0.024	
実施例 1891 の化合物	0.2	
実施例 1898 の化合物	0.006	
実施例 1899 の化合物	0.012	
実施例 1920 の化合物	0.003	
実施例 1921 の化合物	0.003	20
実施例 1924 の化合物	0.024	
実施例 1976 の化合物	0.006	
実施例 1978 の化合物	0.024	
実施例 1989 の化合物	0.0015	
実施例 1992 の化合物	0.0015	
実施例 1995 の化合物	0.012	
実施例 1997 の化合物	0.024	
実施例 1998 の化合物	0.0015	
実施例 1999 の化合物	0.024	30
実施例 2005 の化合物	0.003	
実施例 2022 の化合物	0.003	
実施例 2024 の化合物	0.006	
実施例 2035 の化合物	0.024	
実施例 2075 の化合物	0.024	
実施例 2090 の化合物	0.024	
実施例 2101 の化合物	0.024	
実施例 2104 の化合物	0.024	
実施例 2112 の化合物	0.024	40
実施例 2115 の化合物	0.024	
実施例 2120 の化合物	<0.012	
実施例 2130 の化合物	0.024	
実施例 2216 の化合物	<0.012	
実施例 2221 の化合物	0.024	
実施例 2225 の化合物	<0.012	
実施例 2226 の化合物	<0.012	

【表 2 3 3】

供試化合物	最小発育阻止濃度 ($\mu\text{g/ml}$)	
実施例 2227 の化合物	<0.12	
実施例 2228 の化合物	0.024	
実施例 2230 の化合物	0.024	
実施例 2235 の化合物	<0.012	
実施例 2236 の化合物	0.024	10
実施例 2239 の化合物	<0.012	
実施例 2261 の化合物	<0.012	
実施例 2267 の化合物	0.024	
実施例 2272 の化合物	0.024	
実施例 2274 の化合物	0.024	
実施例 2275 の化合物	0.024	
実施例 2278 の化合物	0.012	
実施例 2279 の化合物	0.012	
実施例 2280 の化合物	0.012	20
実施例 2282 の化合物	<0.008	
実施例 2283 の化合物	0.024	
実施例 2286 の化合物	0.012	
実施例 2312 の化合物	0.024	
実施例 2316 の化合物	0.024	
実施例 2329 の化合物	0.39	
実施例 2330 の化合物	0.05	
実施例 2361 の化合物	0.024	
実施例 2370 の化合物	0.024	30
実施例 2377 の化合物	0.024	
実施例 2378 の化合物	0.024	
実施例 2398 の化合物	0.05	
実施例 2409 の化合物	0.024	
実施例 2492 の化合物	0.024	
実施例 2502 の化合物	0.024	
実施例 2504 の化合物	<0.012	
実施例 2536 の化合物	0.012	
実施例 2537 の化合物	0.024	40
実施例 2538 の化合物	0.024	
実施例 2550 の化合物	0.024	
実施例 2553 の化合物	0.05	
実施例 2554 の化合物	0.024	
実施例 2555 の化合物	0.024	
実施例 2569 の化合物	0.024	
実施例 2584 の化合物	0.1	

【表 2 3 4】

供試化合物	最小発育阻止濃度 ($\mu\text{g/ml}$)
実施例 2585 の化合物	0.024
実施例 2588 の化合物	0.012
実施例 2611 の化合物	0.024
実施例 2628 の化合物	0.003
実施例 2629 の化合物	0.012
実施例 2646 の化合物	0.05
実施例 2651 の化合物	0.78
実施例 2658 の化合物	0.012
実施例 2669 の化合物	0.024
実施例 2670 の化合物	0.006
実施例 2997 の化合物	0.024

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 6 1 K 31/4439	(2006.01)	A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 K 31/4725	(2006.01)	A 6 1 K 31/4725	
A 6 1 K 31/4709	(2006.01)	A 6 1 K 31/4709	
A 6 1 K 31/498	(2006.01)	A 6 1 K 31/498	
A 6 1 K 31/428	(2006.01)	A 6 1 K 31/428	
A 6 1 K 31/438	(2006.01)	A 6 1 K 31/438	
A 6 1 K 31/551	(2006.01)	A 6 1 K 31/551	
A 6 1 K 31/425	(2006.01)	A 6 1 K 31/425	
A 6 1 K 31/4545	(2006.01)	A 6 1 K 31/4545	
A 6 1 K 31/517	(2006.01)	A 6 1 K 31/517	
A 6 1 K 31/46	(2006.01)	A 6 1 K 31/46	
C 0 7 D 498/04	(2006.01)	C 0 7 D 498/04	1 0 3
C 0 7 D 519/00	(2006.01)	C 0 7 D 519/00	3 0 1

- (72)発明者 長谷川 武司
徳島県板野郡藍住町徳命字元村146-11 第一愛日ハイツ607
- (72)発明者 原口 佳和
徳島県徳島市中吉野町4丁目20-17 リッシュ良庵IV108号室
- (72)発明者 黒田 武志
徳島県板野郡北島町江尻字夷ノ本24-13
- (72)発明者 松崎 敬之
徳島県徳島市南島田町2丁目89
- (72)発明者 田井 国憲
徳島県徳島市川内町金岡5-2 ラ・フォーレKAWAUCHI107
- (72)発明者 小松 眞
徳島県板野郡松茂町笹木野字八山開拓91-5
- (72)発明者 松本 眞
徳島県鳴門市鳴門町高島字北418
- (72)発明者 橋詰 博之
徳島県鳴門市撫養町南浜字東浜527-1 ダイアパレス鳴門1401
- (72)発明者 富重 辰夫
徳島県徳島市川内町沖島422-1 グラン川内タワー310
- (72)発明者 清家 祐治
徳島県鳴門市撫養町立岩字芥原1-13
- (72)発明者 川▲崎▼ 昌則
徳島県名西郡石井町石井字石井685-1-101
- (72)発明者 住田 卓美
徳島県徳島市東新町2丁目20番地704
- (72)発明者 宮村 伸
徳島県板野郡松茂町広島字北川向二ノ越147-13
- (72)発明者 大黒 絹枝
徳島県徳島市川内町沖島422-1 1304号
- (72)発明者 田中 一穂
徳島県板野郡藍住町勝瑞字成長22-2-401
- (72)発明者 竹村 勲
徳島県鳴門市撫養町斎田字見白6-3

審査官 三上 晶子

- (56)参考文献 特開2004-149527 (JP, A)
特開2004-269500 (JP, A)
特表平11-508270 (JP, A)

- (58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C07D498/00-498/22
C07D513/00-521/00
A61K 31/33- 33/44
A61P 1/00- 43/00
CAplus/REGISTRY (STN)