(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2007 年10 月11 日 (11.10.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/114213 A1

(51) 国際特許分類:
C07C 69/616 (2006.01) *A61K 31/428* (2006.01)
A61K 31/216 (2006.01) *A61K 31/44* (2006.01)
A61K 31/343 (2006.01) *A61K 31/4406* (2006.01)
A61K 31/357 (2006.01) *A61K 31/4409* (2006.01)
A61K 31/381 (2006.01) *A61K 31/451* (2006.01)
A61K 31/404 (2006.01) *A61K 31/47* (2006.01)
A61K 31/415 (2006.01) *A61K 31/472* (2006.01)
A61K 31/4155 (2006.01) *A61K 31/495* (2006.01)
A61K 31/4164 (2006.01) *A61K 31/496* (2006.01)
A61K 31/4184 (2006.01) *A61K 31/5375* (2006.01)
[続葉有]

(21) 国際出願番号: PCT/JP2007/056791

(22) 国際出願日: 2007 年3 月29 日 (29.03.2007)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2006-095008 2006 年3 月30 日 (30.03.2006) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 旭化成ファーマ株式会社 (ASAHI KASEI PHARMA CORPORATION) [JP/JP]; 〒1018481 東京都千代田区神田美土代町９番地１ Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 松本 明子 (MATSUMOTO, Akiko) [JP/JP]; 〒1008440 東京都千代田区有楽町一丁目１番２号 Tokyo (JP). 正田 基 (SHODA, Motoshi) [JP/JP]; 〒1008440 東京都千代田区有楽町一丁目１番２号 Tokyo (JP). 栗山 浩 (KURIYAMA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒1008440 東京都千代田区有楽町一丁目１番２号 Tokyo (JP).

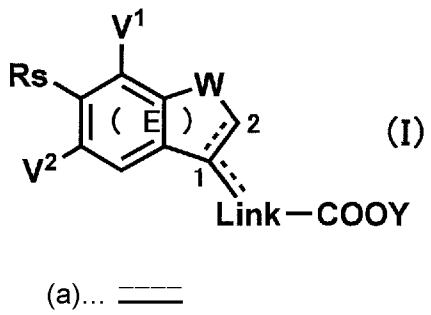
(74) 代理人: 特許業務法人特許事務所サイクス (SIKS & CO.); 〒1040031 東京都中央区京橋一丁目８番７号 京橋日殖ビル８階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
[続葉有]

(54) **Title:** SUBSTITUTED BICYCLIC CYCLIC DERIVATIVE AND USE THEREOF

(54) 発明の名称: 置換二環式環状誘導体及びその用途



(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a compound capable of inhibiting the production of a prostaglandin or leukotriene. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] Disclosed is a compound represented by the general formula (I) or a salt thereof: (I) wherein (a) represents a single or double bond; "Link" represents a single bond or a linear saturated or unsaturated hydrocarbon having 1 to 2 carbon atoms; W represents a single bond, an oxygen or sulfur atom, N(Rw) or the like, wherein Rw represents a hydrogen atom, an alkyl group having 1 to 8 carbon atoms or the like; Rs represents -D-Rx or the like; D represents a single bond, an oxygen or sulfur atom or the like; Rx represents a linear or branched saturated alkyl group having 3 to 8 carbon atoms or the like; one of V^1 and V^2 represents Zx and the other represents AR, wherein Zx represents a hydrogen atom, a linear or branched saturated alkyl group having 1 to 4 carbon atoms or the like and AR represents a partially or completely unsaturated fused bicyclic carbon ring or hetero ring; and Y represents a hydrogen atom, a lower alkyl group having 1 to 4 carbon atoms or the like.

[続葉有]

WO 2007/114213 A1

CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(51) 国際特許分類 [続葉有]:

A61K 31/5377 (2006.01)	***C07D 213/30*** (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)	***C07D 213/55*** (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)	***C07D 215/14*** (2006.01)
A61P 19/02 (2006.01)	***C07D 217/00*** (2006.01)
A61P 21/00 (2006.01)	***C07D 231/54*** (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)	***C07D 265/30*** (2006.01)
A61P 25/04 (2006.01)	***C07D 277/62*** (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)	***C07D 295/14*** (2006.01)
A61P 29/02 (2006.01)	***C07D 307/54*** (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)	***C07D 307/80*** (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)	***C07D 319/20*** (2006.01)
A61P 37/02 (2006.01)	***C07D 333/24*** (2006.01)
A61P 37/08 (2006.01)	***C07D 333/60*** (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)	***C07D 401/10*** (2006.01)
C07C 69/618 (2006.01)	***C07D 401/12*** (2006.01)
C07C 69/736 (2006.01)	***C07D 401/14*** (2006.01)
C07C 217/76 (2006.01)	***C07D 403/10*** (2006.01)
C07C 229/42 (2006.01)	***C07D 403/12*** (2006.01)
C07C 229/50 (2006.01)	***C07D 405/10*** (2006.01)
C07D 209/18 (2006.01)	***C07D 405/12*** (2006.01)
C07D 211/14 (2006.01)	***C07D 409/10*** (2006.01)

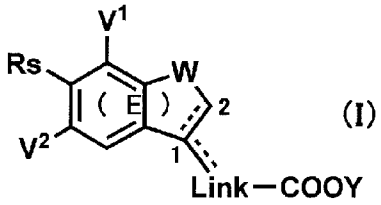
添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

【課題】 プロスタグランジン産生抑制作用及びロイコトリエン産生抑制作用を有する化合物を提供する。

【解決手段】 一般式(I):



(I)

[式中、＝＝＝ は、単結合、又は二重結合を示し、Linkは、単結合を示すか、あるいは炭素数1～2個の直鎖状の飽和又は不飽和炭化水素を示し、Wは、単結合、酸素原子、イオウ原子、又はN(Rw)などを示し、Rwは、水素原子、炭素数1～8個のアルキル基などを示し、Rsは－D－Rxなどを示し、Dは単結合、酸素原子、イオウ原子、などを示し、Rxは、炭素数3～8個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基などを示し、V^1及びV^2はこれらの一方がZxを示し、且つそのときの他方はARを示し、Zxは水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基などを示し、ARは部分不飽和又は完全不飽和である縮合二環式の炭素環又は複素環を示し、Yは、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基などを示す]で表される化合物又はその塩。

明 細 書

置換二環式環状誘導体及びその用途

技術分野

[0001] 本発明は新規な置換二環式環状誘導体に関する。さらに詳しく述べれば、医薬の有効成分として有用な置換二環式環状誘導体に関する。

背景技術

[0002] 哺乳動物の生体内では炎症性や物理的などの種々の刺激によって種々のプロスタグランジン及び種々のロイコトリエンが産生される。

プロスタグランジン類及びロイコトリエン類はいずれもアラキドン酸の代謝物質であって脂質メディエーターと呼ばれる生理活性物質であり、各種細胞表面あるいは細胞内に発現する受容体と結合することによって哺乳動物の各種の生理反応を引き起こす。

アラキドン酸はホスファチジルコリンなどの細胞膜の構成成分であるリン脂質を基質としてホスフォリパーゼA_2（PLA_2）の酵素活性によって産生される。

[0003] PLA_2により産生されたアラキドン酸は構成型のシクロオキシゲナーゼ（COX）－1あるいは誘導型のCOX－2の酵素活性によりプロスタグランジン（PG）H_2に変換され、さらに各合成酵素によりPGE_2、PGD_2、$PGF_2\alpha$、PGI_2、トロンボキサン（TX）A_2等に変換される。一方、アラキドン酸は5－リポキシゲナーゼ（5－LO）によっても代謝されてロイコトリエン（LT）A_4となり、さらにLTA_4ヒドロラーゼ、LTC_4シンターゼやグルタチオンSトランスフェラーゼの酵素活性により、LTB_4、LTC_4、LTD_4、LTE_4等に変換される[グッドマンギルマン薬理書第9版（廣川書店）、1999年、801頁]、[C. D. Funk、サイエンス（SCIENCE）、2001年、294巻、1871頁]。

[0004] プロスタグランジン類はそれぞれに特異的な受容体と結合し、例えば発熱、血管透過性亢進、血管拡張、腫脹又は痛みなどの炎症反応、気管支平滑筋収縮、血小板凝集、腫瘍細胞増殖、骨吸収促進、神経細胞変性などを引き起こし各種疾患での症状発現あるいは病態形成において重要な役割を担っている。

ロイコトリエン類はそれぞれに特異的な受容体と結合し、例えば白血球の過剰集積

又は血管透過性亢進などの炎症反応、平滑筋収縮、粘液分泌、腫瘍細胞増殖などを引き起こす生理活性物質であり、各種疾患での症状発現及び病態形成において重要な役割を担っている。

[0005] 炎症反応そのものは病原物質や障害に直面したときに生体が生き長らえるために必須の反応であるが、ある状況や疾病においては炎症反応が過度に生じ、あるいは明らかな利益をもたらす理由なしに持続することがある[グッドマンギルマン薬理書第9版(廣川書店)、1999年、827頁]。本明細で記述されている急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態とは、急性一過的又は慢性持続的な過度の又は利益をもたらさない炎症反応が生じている状態をいう。また、炎症反応とは、例えば熱等による物理的障害、感染性物質、虚血、抗原－抗体反応などの刺激により引き起こされる一連の出来事であって、よく知られた肉眼的な臨床的兆候として発赤、腫脹、痛覚過敏、発痛を伴うものである。これらの組織学的な機序として血管拡張、血管透過性亢進、白血球及び食細胞の浸潤、組織の分解や線維化が起こることが知られている[グッドマンギルマン薬理書第9版(廣川書店)、1999年、827頁]。これらの組織学的な反応の多くはプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンによって引き起こされ、プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンが炎症反応において重要な役割を担っていることが知られている。

[0006] 例えば、自己免疫疾患であり慢性の炎症性疾患の一つである慢性関節リウマチの病態組織においてはCOX－2の発現及びPGE_2やTXA_2の産生ならびに5－LOの発現及びLTB_4の産生が認められ[Bonnetら、プロスタグランジンズ(Prostaglandins)、1995年、50巻、127頁]、また5－LOの活性化に必要な蛋白であるFLAPを欠損したマウスでは慢性関節リウマチの病態モデルであるコラーゲン誘発関節炎の症状が野生型マウスに比べて軽微であることが報告されており[Griffithsら、ジャーナル・オブ・エクスペリメンタル・メディシン(J. Exp. Med)、1997年、185巻、1123頁]、慢性関節リウマチの病態形成においてプロスタグランジン及びロイコトリエンが重要な役割を担っていることが示されている。

[0007] 慢性アレルギー性疾患の一つである気管支喘息の病態組織においてはPGD_2及びTXA_2の産生過剰ならびにLTC_4及びLTD_4の産生過剰が認められ[Wenzelら、ア

メリカン・レビュー・オブ・レスピラトリー・ディジーズ(Am. Rev. Respir. Dis)、1990年、142巻、112頁]、さらにはPGD$_2$受容体欠損マウスでは気管支喘息の病態モデルである気道過敏性反応が起きにくいことが報告され[Matsuokaら、サイエンス(SCIENCE)、2000年、287巻、2013頁]、気管支喘息におけるプロスタグランジン及びロイコトリエンの役割が重要であることが示されている。

[0008] 虚血再灌流後の脳組織においてCOX－2の発現が上昇し、PGE$_2$やTXA$_2$濃度が増加し、一方で5－LOの活性が上がり、LTC$_4$の産生量が増加し[Ohtsukiら、アメリカン・ジャーナル・オブ・フィジオロジー(Am. J. Physiol.)、1995年、268巻、1249頁]、プロスタグランジン及びロイコトリエンが虚血再灌流障害として認められる梗塞の形成に重要な役割を担っていることが知られている。

神経変性を伴う疾患の一つであるアルツハイマー病の病態組織において、COX活性及び5－LO活性が上昇し、またプロスタグランジン及びロイコトリエンがアルツハイマー病の病因物質の一つであるβアミロイド蛋白の形成を引き起こすとともに、さらに神経細胞の変性を引き起こすことが示され[Sugayaら、ジャパニーズ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー(Jpn. J. Pharmacol.)、2000年、82巻、85頁]、プロスタグランジン及びロイコトリエンがアルツハイマー病などの神経変性性疾患の形成に重要な役割を担っていると考えられている。

[0009] また、例えば、大腸がんの病態組織において、COX及び5－LOが発現し、またプロスタグランジン及びロイコトリエンの産生量が増加しており[Dreylingら、バイオキミカ・バイオフィジカ・アクタ(Biochim. Biophys. Acta)、1986年、878巻、184頁]、さらにロイコトリエンが大腸がん細胞の増殖を引き起こすことが報告されている[Qiaoら、バイオキミカ・バイオフィジカ・アクタ(Biochim. Biophys. Acta)、1995年、1258巻、215頁]、[Hongら、キャンサー・リサーチ(Cancer Res.)、1999年、59巻:2223頁]。大腸がんの組織においてもプロスタグランジン及びロイコトリエンが重要な役割を担っていると考えられている。

プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの疾患、病態への関与は上記に例示した疾患にとどまらず、急性又は慢性の炎症反応が認められる様々な状態、各種の疾患あるいは各種の病態にプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンが関与し、それ

らが重要な役割を担っていることが示されている。

[0010] このことから、各種のプロスタグランジン産生抑制剤又はロイコトリエン産生抑制剤が急性又は慢性の炎症反応が認められる状態、各種疾患あるいは病態の予防剤又は治療剤として用いられている。プロスタグランジンの産生抑制作用を持つ医薬として各種の非ステロイド性抗炎症剤（NSAIDS）があり、慢性関節リウマチや変形性関節炎の治療剤、外傷などに対する消炎鎮痛剤、脳梗塞又は心筋梗塞の予防剤あるいは大腸ポリポージスの予防剤などとして使われている。しかし、各種のNSAIDSはプロスタグランジンの産生のみを抑制する結果、ロイコトリエンの産生量を増加させ、喘息発作、胃腸障害などの副作用を引き起こし、加えて腎障害などの副作用を発揮する。またこれらのNSAIDSでは効果を発揮する用量と副作用を発揮する用量との差が小さく、治療効果の点でも満足のいくものはない。ロイコトリエンの産生抑制作用を持つ医薬として欧州特許第279263号明細書に記載されている5－LO阻害剤は喘息の予防剤として知られているが、肝障害などの副作用を発現させることから投与量が制限され治療効果の点で満足のいくものではない。ステロイド剤はプロスタグランジンとロイコトリエンの両者の産生を抑制することから各種の急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態、各種疾患あるいは病態に対して予防剤又は治療剤として使われているが、その作用は脂質メディエーターの産生抑制作用にとどまらず、免疫抑制作用による感染症の誘発及び憎悪、正常細胞増殖抑制作用による成長遅延、皮膚萎縮あるいは消化性潰瘍などの強い副作用を持つためにその使用は制限されたものになっている。

[0011] また、以上のことから、プロスタグランジンとロイコトリエンの両者の産生を抑制し、副作用が少ない化合物は哺乳動物における上記のような生体の状態、疾患又は病態に対する治療剤又は予防剤として有効であると考えられ、またこのような化合物と既存の医薬品とを併用する方法はさらに有効な治療方法又は予防方法であると考えられることから、プロスタグランジンとロイコトリエンの両者の産生を抑制する化合物の開発とその医薬品化が熱望されている。

[0012] 本発明の化合物に構造が類似する化合物としては、例えば、WO99／19291にビフェニル－5－アルカン酸誘導体及びその用途が報告されているが、本発明の化合

物の一般式(I)中の環(E)及びARに対比する部分がフェニル基であり構造上の特徴が異なる。また、米国特許第5391817号明細書(特開平7－22399号公報)にはビアリールホスホリパーゼA_2阻害剤が記載されているが、本発明化合物の一般式(I)中の環(E)及びARに対比する部分がフェニル基のみであり構造上の特徴が異なる。WO00／35886にはプロテアーゼ阻害剤として二環式複素環化合物が報告されているが、本発明化合物の一般式(I)中の環(E)及びAR上の置換基に対比する部分が異なり、さらに、当該特許明細書に開示された化合物がプロスタグランジン産生抑制作用またはロイコトリエン産生抑制作用を有するか否かについて何ら言及もなされていない。WO03／011842には、インダン酢酸誘導体が、また、WO04／011446には、インダン、ジヒドロベンゾフラン及びテトラヒドロナフタレンカルボン酸誘導体が報告されているが、本発明化合物の一般式(I)中のARに対比する部分が異なり、さらに、当該特許明細書に開示された化合物がプロスタグランジン産生抑制作用またはロイコトリエン産生抑制作用を有するか否かについて何ら言及もなされていない。また、WO03／07686には置換フェニルアルカン酸誘導体及びその用途が報告されているが、本発明化合物の一般式(I)中の環(E)に対比する部分がベンゼン環に限定されており構造上の特徴が異なる。WO05／016862には置換アリールアルカン酸誘導体及びその用途が報告されているが、本発明化合物の一般式(I)中の環(E)に対比する部分がベンゼン環及びピリジン環に限定されており構造上の特徴が異なる。

特許文献1:国際公開第WO99／19291パンフレット

特許文献2:米国特許第5391817号パンフレット

特許文献3:国際公開第WO00／35886パンフレット

特許文献4:国際公開第WO03／011842パンフレット

特許文献5:国際公開第WO04／011446パンフレット

特許文献6:国際公開第WO03／07686パンフレット

特許文献7:国際公開第WO05／016862パンフレット

発明の開示

発明が解決しようとする課題

[0013] 本発明の課題は、優れたプロスタグランジン産生抑制作用及びロイコトリエン産生抑制作用を有する新規な化合物を提供することにある。本発明の別の課題は、脂質メディエーターに起因する哺乳動物における各種の炎症性疾患、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患、疼痛、線維症を予防及び／又は治療する化合物を提供することにある。本発明のさらに別な課題は、該化合物を含有する医薬組成物を提供することにある。

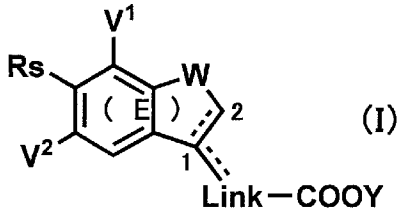
課題を解決するための手段

[0014] 前記課題を解決するために本発明者らは鋭意研究した結果、新規化合物である後記一般式で示される置換二環式環状誘導体が優れたプロスタグランジン産生抑制作用及びロイコトリエン産生抑制作用を有することを見出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は以下に関するものである。

[0015] ＜1＞一般式(I)：

[化1]



(I)

[式中、＝＝＝ は、単結合又は二重結合を示し(但し、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合、及び環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が共に二重結合を示すことはなく、またLinkが単結合を示すとき環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合は単結合を示す)；

Linkは、単結合を示すか、あるいは炭素数1～2個の直鎖状の飽和又は不飽和炭化水素を示し；

Wは、単結合、メチレン基、酸素原子、イオウ原子、又はN(Rw)を示し；

Rwは、水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は－A^6－Qpを示し；

A^6は、単結合又はメチレン基を示し；

Qpはフェニル基を示し、該フェニル基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されていてもよく；

T^1は、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、水酸基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、ニトロ基、炭素数1～4個のアルコキシ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示し;

Rsは、－D－Rx又は－N(Ry)(Rz)を示し;

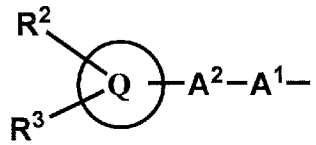
Dは、単結合、酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、$-S(O)_2-$、又は－C(O)－を示し;

Rxは、炭素数3～8個の直鎖状又は分枝鎖状飽和アルキル基を示すか、あるいは次式:

R^1-A^a- (Ra)

で表されるRa、次式:

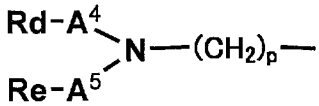
[化2]



(Rb)

で表されるRb、又は次式:

[化3]



(Rc)

で表されるRcを示し;

Ra中のA^aは、単結合、炭素数1～3個のアルキレン(aa)、又は炭素数2～3個のアルケニレン(aa')を示し、アルキレン(aa)及びアルケニレン(aa')はそれぞれ独立に炭素数1～4個の低級アルキル基で置換されていてもよく;

R^1は、炭素数3～7個の環状飽和アルキル基又は炭素数6～8個の縮合環式飽和アルキル基を示し、R^1は1個又は同一若しくは異なる2個以上の炭素数1～4の低級アルキル基で置換されていてもよく;

Rb中のQは、部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環ある

いは複素環(q)を示し、環上の任意の位置でA^2と結合し、複素環(q)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含み;

A^1は、単結合、炭素数1～3個のアルキレン(a1)、又は炭素数2～3個のアルケニレン(a1')を示し、アルキレン(a1)及びアルケニレン(a1')はそれぞれ独立に炭素数1～4個の低級アルキル基又はフェニル基で置換されていてもよく;

A^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、$-S(O)_2-$、又は－N(R^4)－を示し(ただしA^2が酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、$-S(O)_2-$、又は－N(R^4)－を示すときには、A^1はエチレン又はトリメチレンを示す);

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、$-OR^5$、－N(R^6)($R^{6'}$)、$-NHCOR^7$、$-NHSO_2R^8$、又は$-A^6-Q$aを示すか、あるいはそれらが互いに繋がってメチレンジオキシ基を示し;

Qaは、部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環(qa)を示し、環上の任意の位置でA^6と結合し、1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されていてもよく、複素環(qa)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含み;

R^4及びR^6は、それぞれ独立に水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示し;

R^5及びR^7は、それぞれ独立に水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は$-A^6-Q$aを示し;

R^8は、炭素数1～4個の低級アルキル基を示し;

$R^{6'}$は、R^6と同義であるか、あるいはR^6と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示し;

Rc中のpは、2～4のいずれかの整数を示し;

A^4は、単結合、メチレン、又はエチレンを示し;

A^5は、－C(O)－、－C(S)－、又は$-S(O)_2-$を示し;

Rdは、水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又はQaを示し;

Reは、炭素数1～8個のアルキル基、－A^6－Qa、－$(CH_2)_i R^{14}$、－OR^{28}、－SR^{28}、又は－$N(R^{29})(R^{30})$を示し；

iは1～3のいずれかの整数を示し；

R^{14}は、水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、カルボキシル基、又は炭素数1～4個のN，N－ジアルキルカルバモイル基を示し；

R^{28}は、炭素数1～8個のアルキル基又は－A^6－Qaを示し；

R^{29}は、炭素数1～8個のアルキル基、炭素数1～4個のアルコキシカルボニル基、又は－A^6－Qaを示し；

R^{30}は、水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示すか、あるいはR^{29}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示し；

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、エチル基、又は－A^5－Reを示し；

Ryは、水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は－A^6－Qpを示すか、あるいはRzと繋がって窒素原子とともに原子数3～7の飽和又は不飽和の環状置換基(qy)を形成し、環状置換基(qy)は、該窒素原子とは別に窒素原子、酸素原子、又はイオウ原子のいずれか1個含んでもよく、さらに環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個のRfで置換されてもよく；

Rfは、炭素数1～8個のアルキル基又は－A^6－Qpを示し；

V^1及びV^2は、これらの一方はZxを示し、且つそのときの他方はARを示し；

Zxは、水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、－OR^9、又は－$N(Rn^1)(Rn^2)$を示し；

R^9は、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は－A^6－Qpを示し；

Rn^1は、水素原子又は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基を示し；

Rn^2は、Rn^1と同義であるか、あるいは－COR^{23}若しくは－SO_2R^{24}を示すか、又はRn^1と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成し；

R^{23}は、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数1～4個の低級アルコキ

シ基、－O－A^6－Qp、又は－N(R^{25})(R^{26})を示し；

R^{25}は、水素原子又は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基を示し；

R^{26}は、R^{25}と同義であるか、あるいはR^{25}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成し；

R^{24}は、炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示し；

ARは、部分不飽和又は完全不飽和である縮合二環式の炭素環又は複素環(ar)を示し、1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよく；

複素環(ar)は、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含み；

Xaは、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、炭素数3～7個の環状飽和アルキル基、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、－$(CH_2)_i R^{14}$、－OR^{10}、－N(R^{11})(R^{12})、－SO_2R^{13}、又は－COR^{27}を示し；

R^{10}は、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基又は－$(CH_2)_i R^{14}$を示し；

R^{11}は、水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示し；

R^{12}は、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、－COR^{15}、又は－SO_2R^{16}を示すか、あるいはR^{11}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示し；

R^{15}は、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、アミノ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基、又は－A^6－Qa示し；

R^{13}及びR^{16}はそれぞれ独立に炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示し；

R^{27}は、水素原子、水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示し；

Yは、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、－$(CH_2)_m N(R^{18})(R^{19})$、又は－$C(R^{20})_2 OC(O)A^3R^{21}$を示し；

mは、整数2又は3を示し;

R^{18}は、R^{19}と同じであるか、あるいはR^{19}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示し;

R^{19}は、メチル基、エチル基、又はプロピル基を示し;

R^{20}は、水素原子、メチル基、エチル基、又はプロピル基を示し;

R^{21}は、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数3～6個の環状飽和アルキル基、又はフェニル基を示し;

A^3は、単結合又は酸素原子を示す。]で表される化合物〔以下、単に「本発明化合物(I)」と称することがある〕又はその塩。

[0016] ＜2＞一般式(I)において、V^1がZxであり、V^2がARである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

＜3＞一般式(I)において、Wがメチレン基である上記＜1＞又は＜2＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜4＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2又はCH_2CH_2であるか、又は環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHであり;

Wがメチレン基である上記＜1＞又は＜2＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜5＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2であるか、又は環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結

合であるときLinkはCHであり；

Wがメチレン基である上記＜１＞又は＜２＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0017] ＜６＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2であり；

Wがメチレン基である上記＜１＞又は＜２＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜７＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2、又はCH_2CH_2のいずれかであり；

Wが酸素原子である上記＜１＞又は＜２＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜８＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2、又はCH_2CH_2のいずれかであり；

WがNH又はN(メチル)である上記＜１＞又は＜２＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0018] ＜９＞一般式(I)において、V^1又はV^2のうちのいずれかであるARがナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール

、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1，8〕ナフチリジン、〔1，5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン、チエノ〔3，2－c〕ピリジン、チエノ〔3，2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1，3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの環の残基（上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）である上記＜1＞から＜8＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0019] ＜10＞一般式(I)において、V^1又はV^2のうちのいずれかであるARがナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾ

ール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－7－イル

基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－5－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－4－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5－a〕ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ〔4, 5－b〕ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかの基である上記＜1＞から＜8＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0020] ＜11＞一般式(I)において、V^1又はV^2のうちのいずれかであるARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、

3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1，2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，2，3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソ

キノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基である上記＜1＞から＜8＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0021] ＜12＞一般式(I)において、V^1又はV^2のうちのいずれかであるARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N，N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基である上記＜1＞から＜8＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜13＞一般式(I)において、RsにRbが含まれるとき、そのRb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基、4H－クロメニル基、ジヒドロベンゾジオキシル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ピロロピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、チエノピリジニル基、チエノピラゾリル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール基、又はジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール基(上記の基は環上の任意の位置でA^2と結合する)のいずれかの基であり；

構造中のいずれかの部分にQaが存在するとき、そのQaが、フェニル基、ピリジル基

、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、又はインダゾリル基(上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されていてもよく、環上の任意の位置でA^6と結合する)のいずれかの基である上記<1>から<12>のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0022] <14>一般式(I)において、Rsが、−D−Rxを示すときのDが単結合、酸素原子、又はイオウ原子である上記<1>から<13>のいずれかに記載の化合物又はその塩。

<15>一般式(I)において、Rsが−D−Rxを示すときのDが単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2−エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2−シクロペンチルエチル基、2−シクロヘキシルエチル基、又は2−シクロヘプチルエチル基のいずれかの基であるか、あるいは先に示したRbであり;

RxがRbを示すときのRb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、−N(メチル)−、又は−N(エチル)−のいずれかであり;

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、又はメチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、−N(メチル)−、又は−N(エチル)−であるとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、又はメチルトリメチレン基の

いずれかであり);

R^2及びR^3がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N,N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり;

Rsが、－N(Ry)(Rz)であるときのRzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基であり;

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基であるときRyは水素原子以外の置換基であり)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよい上記＜1＞から＜13＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0023] ＜16＞一般式(I)において、Rsが－D－Rxを示すときのDが単結合、又は酸素原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの基であるか、あるいは先に示したRbであり;

RxがRbを示すときのRb中のQが、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;

RbのA[1]が、A[2]が単結合であるとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかであり、またA[2]が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－であるときエチレン基であり；

R[2]及びR[3]がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかであり；

Rsが、－N（Ry）（Rz）であるときのRzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基であり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基である）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）が、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよい上記＜1＞から＜13＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0024] ＜17＞一般式（I）において、Rsが、－D－Rxを示すときのDが単結合、又は酸素原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基

、4, 7－ジメチルインダン－2－イル基、5, 6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4, 7－ジフルオロインダン－2－イル基、5, 6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4, 7－ジクロロインダン－2－イル基、5, 6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4, 7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5, 6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4, 7－ジメトキシインダン－2－イル基、5, 6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジフルオロフェニルメチル基、3, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 3－ジクロロフェニルメチル基、2, 4－ジクロロフェニルメチル基、2, 5－ジクロロフェニルメチル基、2, 6－ジクロロフェニルメチル基、3, 4－ジクロロフェニルメチル基、3, 5－ジクロロフェニルメチル基、3, 6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2

－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

Rsが－N(Ry)(Rz)を示すときの－N(Ry)(Rz)が、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]ア

ミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフ

ルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)

ピペリジノ基、2，6－ジメチルピペリジノ基、3，5－ジメチルピペリジノ基、4，4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3，5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3，5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3，4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3，5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3，6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかである上記＜1＞から＜13＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0025] ＜18＞一般式(I)において、Rsが、－D－Rxを示すときのDが単結合である上記＜1＞から＜17＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜19＞一般式(I)において、Rsが、－O－Rxである上記＜1＞から＜17＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜20＞一般式(I)において、Rsが、－S－Rxである上記＜1＞から＜15＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜21＞一般式(I)において、Rsが、－N(Ry)(Rz)である上記＜1＞から＜17＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜22＞一般式(I)において、Rsが、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、3，5－ジメチルフェニル基、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－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、2，3－ジフルオロフェニル基、2，4－ジフルオロフェニル基、2，5－ジフルオロフェニル基、3，4－ジフルオロフェニル基、2，3－ジクロロフェニル基、2，4－ジクロロフェニル基、2，5－ジクロロフェニル基、2，6－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－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、4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、フラン－2－イル基、フラン－3－イル基、チオフェン－2－イル基、又はチオフェン－3－イル基である上記＜1＞から＜13＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0026] ＜23＞一般式(I)において、V^1又はV^2のうちのいずれかであるZxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN，N－ジメチルアミノ基である上記＜1＞から＜22＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜24＞一般式(I)において、V^1又はV^2のうちのいずれかであるZxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ

基である上記＜1＞から＜22＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜25＞Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞から＜24＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜26＞Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞から＜24＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

[0027] ＜27＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2又はCH_2CH_2のいずれかであり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;

Dが、単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、あるいは先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかあり;

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA^2が酸

素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－のいずれかあるとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである）；

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり；

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基であるときRyは水素原子以外の置換基である）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよく；

環（E）上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN，N－ジメチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール

、1H－ベンゾトリアゾール、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1，8〕ナフチリジン、〔1，5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン、チエノ〔3，2－c〕ピリジン、チエノ〔3，2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1，3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの残基（上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）であり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0028] ＜28＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH$_2$、又はCH$_2$CH$_2$のいずれかであり；

Wが、酸素原子であり；

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり；

Dが、単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、あるいは先に示したRbであり；

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり；

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり；

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであるとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである)；

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり；

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である)、Rzと

繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1がZxを示し、V^2がARを示し;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1, 2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3, 2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1, 3－ジヒドロピロロ〔2, 3－b〕ピリジン、1, 3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1, 8〕ナフチリジン、〔1, 5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3, 2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2, 3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4, 3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1, 3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3, 4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピラジン、1H－イミダゾ〔4, 5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの

残基(上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい)であり;

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N,N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N,N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N,N－ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N,N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN,N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり;

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0029] ＜29＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;

LinkがCH_2、又はCH_2CH_2のいずれかであり;

Wが、NH、又はN(メチル)のいずれかであり;

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;

Dが、単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、あるいは先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフ

チル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり；

RbのA[2]が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－のいずれかであり；

RbのA[1]が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり（但しA[2]が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－のいずれかであるとき、A[1]は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである）；

R[2]及びR[3]が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり；

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－１－イル基、イミダゾール－１－イル基、ピラゾール－１－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）が、１個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、１個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよく；

環（E）上の置換基V[1]がZxを示し、V[2]がARを示し；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メ

トキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1, 2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3, 2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1, 3－ジヒドロピロロ〔2, 3－b〕ピリジン、1, 3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1, 8〕ナフチリジン、〔1, 5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3, 2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2, 3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4, 3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1, 3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3, 4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピラジン、1H－イミダゾ〔4, 5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの残基（上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）であり;

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N, N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N, N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニ

ル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0030] ＜30＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2又はCH_2CH_2のいずれかであり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり；

Wが、メチレン基であり；

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり；

Dが、単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、先に示したRbであり；

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり；

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり；

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかで

あり(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである);

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N, N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり;

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり;

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環が、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、

ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾー

ル－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－7－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1，3－ジヒドロインドール－5－イル基、1，3－ジヒドロインドール－4－イル基、1，3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかであり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基

、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N, N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N－ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N, N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり;

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0031] ＜31＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;

LinkがCH_2、又はCH_2CH_2のいずれかであり;

Wが、酸素原子であり;

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;

Dが、単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、あるいは先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－

のいずれかであり;

RbのA[1]が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA[2]が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであるとき、A[1]は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである);

R[2]及びR[3]が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N, N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり;

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり;

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V[1]がZxを示し、V[2]がARを示し;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基

、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1

，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－7－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1，3－ジヒドロインドール－5－イル基、1，3－ジヒドロインドール－4－イル基、1，3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ〔

4，5－b]ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかであり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0032] ＜32＞一般式（I）において、環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2、又はCH_2CH_2のいずれかであり；

Wが、NH、又はN（メチル）のいずれかであり；

Rsが、－D－Rxあるいは－N（Ry）（Rz）のいずれかであり；

Dが、単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、あるいは先に示したRbであり；

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであるとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである);

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N, N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり;

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり;

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1がZxを示し、V^2がARを示し;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－プロピルアミノ基、Ｎ－イソプロピルアミノ基、又はN，Ｎ－ジメチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－２－イル基、ナフタレン－１－イル基、ベンゾフラン－５－イル基、ベンゾフラン－４－イル基、ベンゾフラン－２－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－５－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－４－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－２－イル基、インドール－５－イル基、インドール－４－イル基、インドール－６－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、ベンゾチアゾール－５－イル基、ベンゾチアゾール－４－イル基、ジヒドロ－3Ｈ－ベンゾチアゾール－６－イル基、ジヒドロ－3Ｈ－ベンゾチアゾール－７－イル基、ジヒドロ－3Ｈ－ベンゾチアゾール－５－イル基、ジヒドロ－3Ｈ－ベンゾチアゾール－４－イル基、キノリン－６－イル基、キノリン－３－イル基、キノリン－５－イル基、キノリン－７－イル基、ジヒドロ－1Ｈ－キノリン－６－イル基、ジヒドロ－1Ｈ－キノリン－５－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－５－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－４－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－６－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－７－イル基、1Ｈ－インダゾール－５－イル基、1Ｈ－インダゾール－４－イル基、1Ｈ－インダゾール－６－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－５－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－４－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－６－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－７－イル基、2Ｈ－インダゾール－５－イル基、2Ｈ－インダゾール－４－イル基、2Ｈ－インダゾール－６－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－６－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－７－イル基、1Ｈ－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－５－イル基、1Ｈ－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－４－イル基、イソキノリン－６－イル基、イソキノリン－３－イル基、イソキノリン－５－イル基、イソキノリン－７－イル基、ジヒドロ－2Ｈ－イソキノリン－６－イル基、ジヒドロ－2Ｈ－イソキノリン－５－イル基、シンノリン－６－イル基、シンノリン－５－イル基、キナゾリン－６－イル基、キナゾリン－７－イル基、キナゾリン－５－イル基、キノキサリン－２－イル基、キノキサリン－６－イル基、キノキサリン－５－イル基、1Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル基、1Ｈ－ベンゾイミダゾール－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－４－イル基、ベンゾオキサゾ

ール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－7－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1，3－ジヒドロインド

ール－５－イル基、1，3－ジヒドロインドール－４－イル基、1，3－ジヒドロインドール－６－イル基、1H－ピラゾロ〔3，４－d〕チアゾール－５－イル基、2H－イソインドール－５－イル基、2H－イソインドール－４－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，５－a〕ピリミジン－６－イル基、1H－ピラゾロ〔3，４－b〕ピラジン－５－イル基、1H－イミダゾ〔4，５－b〕ピラジン－５－イル基、7H－プリン－２－イル基、4H－クロメン－６－イル基、又は4H－クロメン－５－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかであり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、２－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、２－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、２－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、２－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、２－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－２－カルボキシアミノ基、２－ヒドロキシアセチルアミノ基、２－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0033] ＜33＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2又はCH_2CH_2のいずれかであり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり；

Wが、メチレン基であり；

Rsが、Rxであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、先に示したRbであり；

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり；

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－のいずれかであり；

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり（但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである）；

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり；

環（E）上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN，N－ジメチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、イン

ドール－５－イル基、インドール－４－イル基、インドール－６－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、ベンゾチアゾール－５－イル基、ベンゾチアゾール－４－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾチアゾール－６－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾチアゾール－７－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾチアゾール－５－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾチアゾール－４－イル基、キノリン－６－イル基、キノリン－３－イル基、キノリン－５－イル基、キノリン－７－イル基、ジヒドロ－１Ｈ－キノリン－６－イル基、ジヒドロ－１Ｈ－キノリン－５－イル基、ベンゾ〔ｄ〕イソチアゾール－５－イル基、ベンゾ〔ｄ〕イソチアゾール－４－イル基、ベンゾ〔ｄ〕イソチアゾール－６－イル基、ベンゾ〔ｄ〕イソチアゾール－７－イル基、１Ｈ－インダゾール－５－イル基、１Ｈ－インダゾール－４－イル基、１Ｈ－インダゾール－６－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソチアゾール－５－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソチアゾール－４－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソチアゾール－６－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソチアゾール－７－イル基、２Ｈ－インダゾール－５－イル基、２Ｈ－インダゾール－４－イル基、２Ｈ－インダゾール－６－イル基、イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン－６－イル基、イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン－７－イル基、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジン－４－イル基、イソキノリン－６－イル基、イソキノリン－３－イル基、イソキノリン－５－イル基、イソキノリン－７－イル基、ジヒドロ－２Ｈ－イソキノリン－６－イル基、ジヒドロ－２Ｈ－イソキノリン－５－イル基、シンノリン－６－イル基、シンノリン－５－イル基、キナゾリン－６－イル基、キナゾリン－７－イル基、キナゾリン－５－イル基、キノキサリン－２－イル基、キノキサリン－６－イル基、キノキサリン－５－イル基、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル基、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－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－４－イル基、ベンゾオキサゾール－７－イル基、１Ｈ－ピロロ〔３，２－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピロロ〔３，２－ｂ〕ピリジン－６－イル基、ベンゾ〔１，２，５〕チアジアゾール－５－イル基、ベンゾ〔１，２，５〕チアジアゾール－４－イル基、１Ｈ－ベンゾトリアゾール－５－イル基、１Ｈ－ベンゾトリアゾール－４－イル基、１，３－ジヒドロピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１，３－ジヒドロピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジン－４－イル基、１，３－ジヒドロベンゾイミダゾール－５－イル基、１，３－ジヒドロベンゾイミダゾール－４－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベ

ンゾオキサゾール－６－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－７－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－５－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－４－イル基、フタラジン－６－イル基、フタラジン－５－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－３－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－４－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－３－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－４－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－６－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－４－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－５－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－４－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－５－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－６－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－６－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－４－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－５－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－４－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－５－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－４－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－６－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－７－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－２－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－３－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－６－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－２－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－３－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－５－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－６－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－５－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－４－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－５－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－４－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－６－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－７－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－５－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－４－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－６－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－７－イル基、インドリジン－７－イル基、インドリジン－６－イル基、インドリジン－８－イル基、1，3－ジヒドロインドール－５－イル基、1，3－ジヒドロインドール－４－イル基、1，3－ジヒドロインドール－６－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール－５－イル基、2H－イソインドール－５－イル基、2H－イソインドール－４－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン－６－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン－５－イル基、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン－５－イル基、7H－プリン－２－イル基、4H－クロメン－６－イル基、又は4H－クロメン－５－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以

上のXaで置換されていてもよい）のいずれかであり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、２－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、２－カルボキシエチル基、Ｎ，Ｎ－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、２－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、２－カルボキシエチルオキシ基、Ｎ，Ｎ－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、２－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－２－カルボキシアミノ基、２－ヒドロキシアセチルアミノ基、２－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（Ｎ，Ｎ－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、Ｎ－メチルスルファモイル基、Ｎ，Ｎ－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はＮ，Ｎ－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜１＞に記載の化合物又はその塩。

[0034] ＜34＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2又はCH_2CH_2のいずれかであり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり；

Wが、メチレン基であり；

Rsが、－Ｏ－Ｒｘであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、２－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、２－シクロペンチルエチル基、２－シクロヘキシルエチル基、２－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、先に示したRbであり；

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである);

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N, N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－4－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノ

リン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル

基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－7－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1，3－ジヒドロインドール－5－イル基、1，3－ジヒドロインドール－4－イル基、1，3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかであり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ

基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N－ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N, N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり;

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0035] ＜35＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2又はCH_2CH_2のいずれかであり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、－S－Rxであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチ

レン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり（但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである）；

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり；

環（E）上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN，N－ジメチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イ

ル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3

－a]ピリジン－7－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－2－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－3－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－6－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－2－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－3－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－5－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－6－イル基、1H－チエノ[3, 2－c]ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ[3, 2－c]ピラゾール－4－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－5－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－4－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－d]チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5－a]ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－b]ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ[4, 5－b]ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかであり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N, N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N－ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N, N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0036] ＜36＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2又はCH_2CH_2のいずれかであり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、－N(Ry)(Rz)であり;

Rzが、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである);

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環が、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよく；

環（E）上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN，N－ジメチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－

5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフタリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－

5－イル基、1H－ピラゾロ〔4, 3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン－7－イル基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－5－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－4－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5－a〕ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ〔4, 5－b〕ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかであり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N, N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－

2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N－ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N, N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり;

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0037] ＜37＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;

Dは、単結合、又は酸素原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの置換基であるか、先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかであり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;

RbのA^1が、A^2が単結合であるとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかであり、またA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであるときエチレン基であり;

R^2及びR^3がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかであり；

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであり（但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）が、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよく；

環（E）上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－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、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基及びベンゾオキサゾール－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかの置換基であり；

Xaが、オキソ基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、水酸基、

メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、又はカルボキシル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0038] ＜38＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり；

Wが、メチレン基であり；

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり；

Dが、単結合、又は酸素原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－

イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニ

ル－Ｎ－メチルアミノ)エチル基、又は2－(Ｎ－エチル－Ｎ－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

置換基－Ｎ(Ry)(Rz)が、Ｎ,Ｎ－ジメチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ,Ｎ－ジエチルアミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－プロピルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－プロピルアミノ基、Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソプロピルアミノ基、Ｎ－ブチルアミノ基、Ｎ－ブチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ブチル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソブチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－イソペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－(2－エチルブチル)アミノ基、Ｎ－(2－エチルブチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘプチルアミノ基、Ｎ－(シクロペンチルメチル)アミノ基、Ｎ－(シクロペンチルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、Ｎ－(シクロヘキシルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－フェニルアミノ基、Ｎ－(2－メチルフェニル)アミノ基、Ｎ－(4－メチルフェニル)アミノ基、Ｎ－(2－フルオロフェニル)アミノ基、Ｎ－(3－フルオロフェニル)アミノ基、Ｎ－(4－フルオロフェニル)アミノ基、Ｎ－(2－クロロフェニル)アミノ基、Ｎ－(3－クロロフェニル)アミノ基、Ｎ－(4－クロロフェニル)アミノ基、Ｎ－(インダン－2－イル)アミノ基、Ｎ－(1－フェニルエチル)アミノ基、Ｎ－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－ベンジルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2－フルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3－フルオロフェ

ニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペ

リジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)

ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－

ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，2，3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの

基であり;

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0039] ＜39＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;

LinkがCH_2であり;

Wが、酸素原子であり;

Rsが、－D－Rxであり;

Dが、単結合、又は酸素原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1

－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジフルオロフェニルメチル基、3, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 3－ジクロロフェニルメチル基、2, 4－ジクロロフェニルメチル基、2, 5－ジクロロフェニルメチル基、2, 6－ジクロロフェニルメチル基、3, 4－ジクロロフェニルメチル基、3, 5－ジクロロフェニルメチル基、3, 6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又

はN－メチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－

6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基であり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0040] ＜40＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2であり；

Wが、酸素原子であり；

Rsが、－N(Ry)(Rz)であり；

置換基－N(Ry)(Rz)が、N，N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N，N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－（2－エチルブチル

)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，5－ジフルオロ

フェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリ

ジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－

(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)

－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基であり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0041] ＜41＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合で

あるときLinkがCHであり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4, 7－ジメチルインダン－2－イル基、5, 6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4, 7－ジフルオロインダン－2－イル基、5, 6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4, 7－ジクロロインダン－2－イル基、5, 6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4, 7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5, 6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4, 7－ジメトキシインダン－2－イル基、5, 6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジフルオロフェニルメチル基、3, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 3－ジクロロフェニルメチル基、2, 4－ジクロロフェニルメチ

ル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり；

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N，N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2，3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェ

ン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2，3－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1，2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，2，3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－

1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基であり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0042] ＜42＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり；

Wが、メチレン基であり；

Rsが、－O－Rxであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシ

インダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－

(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシ

エチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1, 2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1, 2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基であり;

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0043] ＜43＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、－N(Ry)(Rz)であり;

置換基－N(Ry)(Rz)が、N,N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N,N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェ

ニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペ

リジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)

ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－

ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，2，3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの

基であり;

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0044] ＜44＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、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、3,5－ジメチルフェニル基、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－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、2,3－ジフルオロフェニル基、2,4－ジフルオロフェニル基、2,5－ジフルオロフェニル基、3,4－ジフルオロフェニル基、2,3－ジクロロフェニル基、2,4－ジクロロフェニル基、2,5－ジクロロフェニル基、2,6－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－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、4－(N,N－ジメチルアミノ)フェニル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4,7－ジメチルインダン－2－イル基、5,6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4,7－ジフルオロインダン－2－イル基、5,6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4,7－ジクロロインダン－2－イル基、5,6－ジクロロインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4,7－ジメトキシインダン－2－イル基、5,6－ジメトキシインダン－2－イル基、フラン－2－イル基、フラン－

3－イル基、チオフェン－2－イル基、又はチオフェン－3－イル基のいずれかであり；

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミ

ノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基であり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0045] ＜45＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2であり；

Wが、メチレン基であり；

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり；

Dが、単結合、又は酸素原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル

基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの置換基であるか、先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかであり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;

RbのA^1が、A^2が単結合であるとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかであり、またA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－であるときエチレン基であり;

R^2及びR^3がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかであり;

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり;

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基であるときRyは水素原子以外の置換基である)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－6－

イル基、キノリン－３－イル基、1H－インダゾール－５－イル基、イソキノリン－６－イル基、シンノリン－６－イル基、又はベンゾオキサゾール－５－イル基のいずれかであり（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかの置換基であり；

Xaが、オキソ基、メチル基、エチル基、プロピル基、２－ヒドロキシエチル基、水酸基、メトキシ基、２－ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ基、２－ヒドロキシエチルアミノ基、又はカルボキシル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜１＞に記載の化合物又はその塩。

[0046] ＜46＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2であり；

Wが、メチレン基であり；

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり；

Dが、単結合、又は酸素原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、２－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、２－メチルフェニル基、４－メチルフェニル基、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－チエニル基、３－チエニル基、２－フリル基、３－フリル基、インダン－２－イル基、４－メチルインダン－２－イル基、５－メチルインダン－２－イル基、４，７－ジメチルインダン－２－イル基、５，６－ジメチルインダン－２－イル基、４－フルオロインダン－２－イル基、５－フルオロインダン－２－イル基、４，７－ジフルオロインダン－２－イル基、５，６－ジフルオロインダン－２－イル基、４－クロロインダン－２－イル基、５－クロロインダン－２－イル基、４，７－ジクロロインダン－２－イル基、５，６－ジクロロインダン－２－イル基、４－ヒドロキシインダン－２－イル基、５－ヒドロキシ

インダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－

(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

置換基－N(Ry)(Rz)が、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル

－Ｎ－(４－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２－フルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２－フルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(３－フルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(３－フルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(４－フルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(４－フルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(２－クロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２－クロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(３－クロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(３－クロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(４－クロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(４－クロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(２，３－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２，３－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(２，４－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２，４－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(２，５－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２，５－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(３，４－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(３，４－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(３，５－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(３，５－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(２，３－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２，３－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(２，４－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２，４－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(２，５－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２，５－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(２，６－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(２，６－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(３，４－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(３，４－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(３，５－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(３，５－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－[２－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[２－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－[３－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[３－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－[４－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[４－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、２－メチルピロリジノ基、３－メチルピロリジノ基、２，５－ジメチルピロリジノ基、３，４－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、２－メチルピペリジノ基、３－メ

チルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロ

フェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6

－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0047] ＜47＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2であり；

Wが、メチレン基であり；

Rsが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メ

トキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジフルオロフェニルメチル基、3, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 3－ジクロロフェニルメチル基、2, 4－ジクロロフェニルメチル基、2, 5－ジクロロフェニルメチル基、2, 6－ジクロロフェニルメチル基、3, 4－ジクロロフェニルメチル基、3, 5－ジクロロフェニルメチル基、3, 6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1, 2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかであり;

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0048] ＜48＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;

LinkがCH_2であり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、－O－Rxであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4, 7－ジメチルインダン－2－イル基、5, 6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4, 7－ジフルオロイ

ンダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニ

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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1, 2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかであり;

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0049] ＜49＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;

LinkがCH_2であり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、－N(Ry)(Rz)であり；

置換基－N(Ry)(Rz)が、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(

4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シク

ロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニル

メチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1, 2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかであり;

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化

合物又はその塩。

＜50＞一般式(I)において、

Wが、メチレン基又は酸素原子であり;

Rsが、－D－Rxである場合のDが単結合又は酸素原子であり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子又はアミノ基であり;

ARが、インドール又は1H－インダゾールである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

＜51＞一般式(I)において、一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2又はCH_2CH_2であるか、又は環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHであり;

Wがメチレン基であり;

Rsが、－D－Rxである場合のDが単結合又は酸素原子であり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子又はアミノ基であり;

ARが、インドール又は1H－インダゾールである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

＜52＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2であるか、又は環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHであり;

Wがメチレン基であり;

Rsが、－D－Rxである場合のDが単結合又は酸素原子であり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子又はアミノ基であり;

ARが、インドール又は1H－インダゾールである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

＜53＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;

LinkがCH_2であり;

Wがメチレン基であり;

Rsが、－D－Rxである場合のDが単結合又は酸素原子であり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子又はアミノ基であり;

ARが、インドール又は1H－インダゾールである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

＜54＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;

LinkがCH_2、又はCH_2CH_2のいずれかであり;

Wが酸素原子であり;

Rsが、－D－Rxである場合のDが単結合又は酸素原子であり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子又はアミノ基であり;

ARが、インドール又は1H－インダゾールである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

＜55＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;

LinkがCH_2であり;

Wがメチレン基であり;

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;

Dが、単結合又は酸素原子であり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子又はアミノ基であり;

ARが、インドール又は1H－インダゾールである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

＜56＞Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、あるいは先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;

RbのA^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであるとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである);

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N,N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ

基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかである上記＜50＞～＜55＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜57＞Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロ

フェニルメチル基、2, 5－ジクロロフェニルメチル基、2, 6－ジクロロフェニルメチル基、3, 4－ジクロロフェニルメチル基、3, 5－ジクロロフェニルメチル基、3, 6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかである上記＜50＞～＜55＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜58＞Rzが、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、先に示したRbであり;

Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;

RbのA^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－

のいずれかであり;

RbのA[1]が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり(但しA[2]が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A[1]は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである);

R[2]及びR[3]が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N, N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり;

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環が、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよい上記＜50＞～＜57＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜59＞置換基－N(Ry)(Rz)が、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチル

アミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－イソペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）アミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘプチルアミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－フェニルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（インダン－２－イル）アミノ基、Ｎ－（１－フェニルエチル）アミノ基、Ｎ－［１－（２－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（２－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－ベンジルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ

－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリ

ジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニル

メチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかである上記＜50＞～＜57＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜60＞ARが、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、又は1H－インダゾール－6－イル基(上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい)である上記＜50＞～＜59＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜61＞ARが、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－

1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、又は3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基である上記＜50＞～＜59＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜62＞ARが、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、又は1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基のいずれかである上記＜50＞～＜59＞のいずれかに記載の化合物又はその塩。

＜63＞一般式(I)において、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;

Wが、メチレン基であり;

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;

Dが、単結合、又は酸素原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロイ

ンダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニ

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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

置換基－N(Ry)(Rz)が、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ

基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェ

ニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2

－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかであり;

環(E)上の置換基V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子又はアミノ基のいずれかであり;

ARが、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イ

ル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、又は1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基のいずれかの基であり;

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである上記＜1＞に記載の化合物又はその塩。

[0050] 本発明の別の観点からは、

＜64＞本明細書に記載された全ての選択肢の任意の組合せを含む前記一般式(I)で表される化合物又はその薬理学上許容される塩を有効成分として含有する医薬;

が提供される。

本発明の医薬は

＜65＞本明細書に記載された全ての選択肢の任意の組合せを含む前記一般式(I)で表される化合物又はその薬理学上許容される塩を有効成分として含むプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生抑制剤

としての種々の疾患に対する適応が可能である。

すなわち、

＜66＞プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生により惹起される疾患の予防及び／又は治療のための上記＜64＞に記載の医薬;

が提供され、上記疾患の予防及び／又は治療のための医薬として例えば、

＜67＞哺乳動物の炎症性疾患の予防及び／又は治療のための上記＜64＞に記

載の医薬;

＜68＞哺乳動物の自己免疫疾患の予防及び／又は治療のための上記＜64＞に記載の医薬;

＜69＞哺乳動物のアレルギー性疾患の予防及び／又は治療のための上記＜64＞に記載の医薬;

＜70＞哺乳動物の解熱及び／又は鎮痛のための上記＜64＞に記載の医薬;

＜71＞哺乳動物の線維症の予防及び／又は治療のための上記＜64＞に記載の医薬;

などが本発明により提供される。

[0051] また、本発明の別の観点からは、

＜72＞哺乳動物における急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態の予防及び／又は治療のための上記＜64＞に記載の医薬も提供される。

これらの医薬の好ましい態様によれば、

＜73＞上記予防及び／又は治療に有効な量の前記一般式(I)で表される化合物又はその薬学的に許容される塩と薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物の形態の上記＜64＞から＜72＞のいずれかに記載の医薬が提供される。

[0052] さらに別の観点からは、本発明により、

＜74＞プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生により惹起される疾患の予防及び／又は治療方法であって、本明細書に記載された全ての選択肢の任意の組合せを含む前記一般式(I)で表される化合物又はその薬学的に許容される塩の予防及び／又は治療有効量を哺乳類動物に投与する工程を含む方法が提供される。

上記の予防及び／又は治療方法として例えば、

＜75＞哺乳動物の炎症性疾患の予防及び／又は治療方法である上記＜74＞に記載の方法;

＜76＞哺乳動物の自己免疫疾患の予防及び／又は治療方法である上記＜74＞に記載の方法;

＜77＞哺乳動物のアレルギー性疾患の予防及び／又は治療方法である上記＜74＞に記載の方法;

＜78＞哺乳動物の解熱及び／又は鎮痛方法である上記＜74＞に記載の方法;及び

＜79＞哺乳動物の線維症の予防及び／又は治療方法である上記＜74＞に記載の方法などが本発明により提供される。

[0053] 本発明の医薬又は予防及び／又は治療方法の適用対象となる疾患又は症状としては、 例えば、関節炎、慢性関節リウマチ、悪性関節リウマチ、若年性関節リウマチ、フェルティ症候群、成人スティル病、変形性関節炎、滑膜炎、痛風、人工関節インプラントのゆるみ、発熱、一般的な感冒、痛覚過敏、火傷、熱傷、ケロイド形成、月経痛、月経困難、月経痙攣、アレルギー反応、アレルギー性接触過敏症、アレルギー性鼻炎、花粉症、アレルギー性結膜炎、過敏性肺臓炎、アレルギー性気管支肺真菌症、気腫、急性呼吸促迫症候群、喘息、気管支炎、慢性閉塞性肺疾患、慢性気管支炎、肺気腫、びまん性汎細気管支炎、気道閉塞症、移植片対宿主症候群、蕁麻疹、紫外線皮膚炎、アトピー性皮膚炎、癌、骨髄性白血病、肉腫、脳腫瘍、悪液質、組織潰瘍、消化性潰瘍、胃炎、急性及び慢性膵炎、限局性腸炎、潰瘍性大腸炎、憩室炎、再発性胃腸病変、胃腸出血、炎症性腸疾患、クローン病、腸管型ベーチェット病、感染性腸炎、虚血性腸炎、放射線腸炎、薬剤性腸炎、過敏性腸症候、急性肝炎、劇症性肝炎、慢性肝炎、肝硬変、脂肪肝、アルコール性肝障害、薬剤性肝障害(薬物中毒肝炎)、うっ血性肝炎、自己免疫性肝炎、原発性胆汁性肝硬変、肝性ポルフィリン症等の肝疾患(肝障害、肝不全)、凝固、貧血、強直性脊椎炎、再狭窄、歯周病、表皮水泡症、アテローム性硬化症、大動脈瘤、結節性動脈周囲炎、うっ血性心不全、不整脈、心筋梗塞、脳梗塞、発作、大脳虚血、頭部外傷、脊髄損傷、脊髄性筋萎縮症、神経痛、神経変性疾患、アルツハイマー病、ルーウィボディ病、シャイドレイガー症候群、ライ症候群、進行性核上性麻痺、進行性多巣性白質脳症、正常圧水頭症、亜急性硬化性全脳炎、前頭葉型痴呆、急性灰白髄炎(ポリオ)、ポリオ神経症、ウイルス性脳炎、クロイツフェルト－ヤコブ病、クールー病、牛海綿状脳症(狂牛病)、スクレイピー、てんかん、大脳アミロイド血管障害、自己免疫疾患、ハンティングトン病、パーキンソン病、片頭痛、うつ病、躁病、躁うつ病、遺伝性小脳性運動失調、末梢神経障害、緑内障、疼痛、歯肉炎、手術後の痛み、筋萎縮性側策硬化症、

骨粗鬆症、多発性硬化症、目の脈管形成、角膜損傷、黄斑変性、結膜炎、異常創傷治癒、筋肉もしくは関節の捻挫又は緊張、腱炎、皮膚疾患、尋常性乾癬、膿疱性乾癬、乾癬性紅皮症、関節症性乾癬、重症筋無力症、多発性筋炎、筋炎、滑液包炎、糖尿病、腫瘍浸潤、腫瘍成長、腫瘍転移、角膜傷跡、強膜炎、免疫不全疾患、強皮症、好酸球性筋膜炎、敗血症、エンドトキシンショック、早産、低プロトロンビン血症、血友病、甲状腺炎、サルコイドーシス、ベーチェット症候群、過敏症、腎臓疾患、リケッチア感染症、原虫症、生殖疾患、敗血症ショック、歯痛、抜歯後の痛み、背腰痛、肩関節周囲炎、頚肩腕症候群、腱鞘炎、急性上気道炎、帯状疱疹、線維症、肺線維症、薬剤誘起性肺線維症、塵肺症、慢性間質性肺炎、肉芽腫性間質性肺炎、線維化性間質性肺炎、腎線維症、腎盂腎炎、各種続発性萎縮腎、糸球体腎炎、慢性腎炎、糸球体硬化、肝線維症、心筋梗塞後の心線維症、特発性心筋症、膵硬化症、膵線維症、膵石症、高安動脈炎、慢性甲状腺炎、皮膚筋炎、多発性筋炎、骨髄線維症、Banti病、後腹膜線維症、各種放射線傷害と診断された疾患あるいはそれらの疾患であると疑われる症状などが挙げられる。

発明の効果

[0054] 本発明化合物(I)又は薬理学的に許容されるその塩は、プロスタグランジン及びロイコトリエンの両者の産生に対して抑制作用を有し、ヒトや動物に投与した場合、プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンが関与する疾患、病態に対して優れた予防及び／又は治療効果を示し、しかも毒性が著しく低いという特徴を有する。

発明を実施するための最良の形態

[0055] この出願は2006年3月30日に日本国において出願された特願2006－095008号に優先権を主張して出願された特許出願である。上記特願2006－095008号の明細書及び請求の範囲の全ての開示を参照により本明細書の開示として含める。

本明細書において、炭素原子を単に“C”で、水素原子を“H”で、酸素原子を“O”で、イオウ原子を“S”で、また窒素原子を“N”で示すことがある。

前記一般式(I)における ---- は、単結合、又は二重結合を示す。但し、一般式(I)における環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合、及び環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が共に二重結合を示すことはな

く、またLinkが単結合を示すとき環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合は単結合を示す。

一般式(I)における環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合、及び環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が共に単結合を示す場合、環(E)上の1位の環構成炭素原子は不斉炭素原子となり、少なくとも2種類の光学異性体が存在するが、光学異性体又は上述の不斉炭素以外にその他置換基内に存在する不斉炭素によるジアステレオ異性体などの純粋な形態の立体異性体、又は立体異性体の任意の混合物、ラセミ体などは、いずれも本発明の範囲に包含される。

[0056] 前記一般式(I)におけるLinkとしては、単結合を示すか、炭素数1～2個の直鎖状の飽和又は不飽和炭化水素が例示される。

Linkが単結合を示す場合には、一般式(I)における環(E)上の1位の環構成炭素原子とCOOYは直接結合していることを意味し、このとき環(E)上の1位の環構成炭素原子とCOOYは単結合で結合する。

炭素数1～2個の直鎖状の飽和炭化水素としては、CH_2、又はCH_2CH_2が好ましく、CH_2は非常に好ましい。Linkがこれら飽和炭化水素を示す場合、環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合は単結合で結合する。

炭素数1～2個の不飽和炭化水素としては、環(E)上の1位の環構成炭素原子との結合を含む炭素－炭素結合のなかに二重結合又は三重結合の不飽和結合がある炭化水素を意味する。環(E)上の1位の環構成炭素原子及びCOOYとの結合を含めた不飽和炭化水素の具体的な例としては、

環(E)上の1位の環構成炭素原子(二重結合)CH－COOY;

環(E)上の1位の環構成炭素原子(二重結合)$CHCH_2$－COOY;

環(E)上の1位の環構成炭素原子－CH(二重結合)CH－COOY;

環(E)上の1位の環構成炭素原子(二重結合)C(二重結合)CH－COOY;

環(E)上の1位の環構成炭素原子－C(三重結合)C－COOY;

などが挙げられる。これらのうち、

環(E)上の1位の環構成炭素原子(2重結合)CH－COOY;

は特に好ましい例である。

LinkとしてCH、CH_2、CH_2CH_2は好ましい例であり、CH、CH_2は特に好ましい例であり、CH_2は非常に好ましい例である。

[0057] 前記一般式(I)におけるWは、単結合、メチレン基、酸素原子、イオウ原子、又はN(Rw)を示す。すなわちWが単結合を示すとき環(E)はベンゾシクロブタン環あるいはベンゾシクロブテン環を示し、Wがメチレン基を示すとき環(E)はインダン環あるいはインデン環を示し、Wが酸素原子を示すとき環(E)はジヒドロベンゾフラン環あるいはベンゾフラン環を示し、Wがイオウ原子を示すとき環(E)はジヒドロベンゾチオフェン環あるいはベンゾチオフェン環を示し、WがN(Rw)を示すとき環(E)はインドリン環あるいはインドール環を示す。Wのうち好ましい例としてはメチレン基、酸素原子、N(Rw)等が挙げられ、メチレン基は特に好ましい例である。

WのうちN(Rw)のRwは水素原子、炭素数1～8個のアルキル基又は$-A^6-Qp$を示す。炭素数1～8個のアルキル基とは、直鎖状若しくは分岐状の飽和アルキル基又は直鎖状若しくは分岐状の部分的に不飽和結合を含むアルキル基、あるいは炭素数3～7のシクロアルキル基を含んでもよいアルキル基を表し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－メチルブチル基、2，2－ジメチルプロピル基、ヘキシル基、4－メチルペンチル基、2，3－ジメチルブチル基、2－エチルブチル基、ヘプチル基、オクチル基、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、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－メチルシクロペンチル基、3－メチルシクロペンチル基、3，4－ジメチルシクロペンチル基、4－メチルシクロヘキシル基、4，4－ジメチルシクロヘキシル基、4－エチルシクロヘキシル基、4－メチルシクロヘキシルメチル基等が挙げられる。Rwのうち水素原子、メチル基などは好ましい例である。

[0058] 置換基$-A^6-Qp$のA^6は単結合、又はメチレン基を表し、Qpは1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されていてもよいフェニル基を示す。置換基T^1は炭素

数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、水酸基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、ニトロ基、炭素数1～4個のアルコキシ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。置換基－A^6－Qpの具体的な例としては、フェニル基、メチルフェニル基、クロロフェニル基、ベンジル基、メチルベンジル基、クロロベンジル基、ジクロロベンジル基、フルオロベンジル基、トリフルオロメチルベンジル基、ニトロベンジル基、メトキシフェニル基、N－メチルアミノベンジル基、N，N－ジメチルアミノベンジル基等が挙げられる。

本明細書において、例えば、A^6、QpやT^1に代表されるとおり、異なる部分に同一の記号を用いている場合がある。これらの記号は同一の置換基の群を示すが、それぞれ置換基は独立したものであることから、常に同一の置換基が選択されなければならないことを意味せず、結果的に同一、または異なる種類の置換基が選択されることを妨げるものではない。

[0059] Wを含む環（E）として好適な例としては、Wがメチレン基を示し、且つ環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示す、すなわち環（E）がインダン環を示す例が挙げられる。好適な例の別の態様としてWが酸素原子を示し、且つ環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合を示す、すなわち環（E）がベンゾフラン環を示す例が挙げられる。さらに好適な例の別の態様としてWがNH、又はN（メチル）を示し、且つ環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合を示す、すなわち環（E）が1H－インドール環、又は1－メチルインドール環を示す例が挙げられる。これらのうち環（E）がインダン環を示す例は特に好ましい。

[0060] 前記一般式（I）におけるRsは－D－Rxあるいは－N（Ry）（Rz）を示す。

Dは、単結合、酸素原子、イオウ原子、－S（O）－、－$S(O)_2$－、又は－C（O）－を表す。これらのうち単結合、酸素原子及びイオウ原子は好ましい例であり、単結合、酸素原子は特に好ましい例である。

Rxは、炭素数3～8個の直鎖状又は分枝鎖状飽和アルキル基、あるいは先に示したRa、Rb又はRcを示す。

Rxのうち炭素数3～8個の直鎖状又は分枝鎖状の飽和アルキル基としては、例え

ば、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、1－メチルプロピル基、t－ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－メチルブチル基、2，2－ジメチルプロピル基、ヘキシル基、4－メチルペンチル基、2，3－ジメチルブチル基、2－エチルブチル基、ヘプチル基、オクチル基等が挙げられるが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基などは特に好ましい。

Rxのうち、RaのR^1は炭素数1～4の低級アルキル基で置換されているか、あるいは無置換の炭素数3～7個の環状飽和アルキル基又は炭素数6～8個の縮合環式飽和アルキル基として定義される。R^1のうち炭素数3～7個の環状飽和アルキル基としてはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基等が挙げられるが、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基は特に好ましい。またR^1のうち炭素数6～8個の縮合環式飽和アルキル基としてはビシクロ[2，2，1]ヘプチル基、ビシクロ[2，2，2]オクチル基などが挙げられる。

[0061] R^1に置換する炭素数1～4の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基等が挙げられる。炭素数1～4の低級アルキル基が置換したR^1の例としてはメチルシクロペンチル基、メチルシクロヘキシル基、メチルビシクロ[2，2，1]ヘプチル基などが挙げられる。

A^aは単結合、炭素数1～3個のアルキレン(aa)すなわちメチレン基、エチレン基又はトリメチレン基、あるいは炭素数2～3個のアルケニレン(aa')すなわちエテニレン基又はプロペニレン基として定義される。アルキレン(a)及びアルケニレン(a')は炭素数1～4個の低級アルキル基で置換される場合も含まれる。このときの炭素数1～4個の低級アルキル基とはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基等が挙げられる。A^aの好ましい例としては、単結合、メチレン基、エチレン基、トリメチレン基などが挙げられ、単結合、メチレン基、又はエチレン基が特に好ましい例として挙げられる。

Raの具体例としてはシクロプロピル基、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、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロ

ペンチルエチル基、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、2－メチルシクロペンチル基、3－メチルシクロペンチル基、3，4－ジメチルシクロペンチル基、4－メチルシクロヘキシル基、4，4－ジメチルシクロヘキシル基、4－エチルシクロヘキシル基、4－メチルシクロヘキシルメチル基、ビシクロ[2，2，1]ヘプタン－2－メチル基、ビシクロ[2，2，2]オクタン－2－メチル基、3－メチルビシクロ[2，2，1]ヘプタン－2－メチル基、ビシクロ[2，2，1]ヘプト－1－イルメチル基、ビシクロ[2，2，2]オクト－1－メチル基などが挙げられるが、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基などは好ましく、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基などは特に好ましい。

[0062] Rxのうち、RbのA^2は単結合、酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、－$S(O)_2$－、又は－N(R^4)－と定義される。R^4は炭素数1～4個の低級アルキル基と定義され、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基等が挙げられるが、メチル基、エチル基は特に好ましい例である。A^2のうち特に好ましい例としては単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、－N(エチル)－が挙げられる。

A^1は単結合、炭素数1～3個のアルキレン(a1)すなわちメチレン基、エチレン基又はトリメチレン基、あるいは炭素数2～3個のアルケニレン(a1')すなわちエテニレン基又はプロペニレン基として定義される。但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、－$S(O)_2$－又は－N(R^4)－を示すときA^1はアルキレン(a1)、又はアルケニレン(a1')のいずれかである。またアルキレン(a1)及びアルケニレン(a1')は炭素数1～4個の低級アルキル基又はフェニル基で置換される場合も含まれる。このときの炭素数1～4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基等が挙げられるがメチル基、エチル基は好ましい例である。A^1の好ましい例としては、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレ

ン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基などが挙げられる（但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、－S(O)$_2$－又は－N(R^4)－を示すときエチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかが好ましい）。また、A^2が単結合を示すときには、A^1は単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基であることが特に好ましい（但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、－S(O)$_2$－又は－N(R^4)－を示すときには、A^1がエチレン基であることが特に好ましい）。

[0063] RbのQは、部分的不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環（q）の残基と定義され、複素環（q）は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれる同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含む環を意味する。「残基」とは、環構成原子に結合する水素原子を除くことにより形成される一価の基のことである。単環式の炭素環又は複素環の残基としては原子数5～7個の部分的飽和又は完全不飽和である置換基を示し、例えばフェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基などが挙げられる。これらのうちフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基などは好ましい例であり、フェニル基、チエニル基、フリル基などは特に好ましい例である。

縮合二環式の炭素環あるいは複素環としては原子数8～11個の部分不飽和又は完全不飽和である環を示し、その残基としては、例えばナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基、4H－クロメニル基、ジヒドロベンゾジオキシル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ピロロピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、チエノピリジニル基、チエノピラゾリル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール基などが挙げられる。これらのうちナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル

基、ジヒドロベンゾジオキシル基などは好ましい例として挙げられ、インダニル基は特に好ましい例の一つである。

[0064] Qは環上の任意の位置でA^2と結合する。結合位置を表したQの好ましい例としてはフェニル基、2－又は3－チエニル基、2－又は3－フリル基、2－、3－又は4－ピリジル基、2－、4－又は5－オキサゾリル基、1－又は2－ナフチル基、1－、2－、5－又は6－テトラヒドロナフチル基、インダン－1－イル基、インダン－2－イル基、インダン－4－イル基、インダン－5－イル基、1－、2－、3－、4－、5－、6－又は7－インドリル基、2－、あるいは5－又は6－ジヒドロベンゾジオキシル基などが挙げられ、これらのうちフェニル基、2－又は3－チエニル基、2－又は3－フリル基、インダン－2－イル基などは特に好ましい例である。

Rb中、R^2及びR^3はQの置換基であり、それぞれ独立に水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、$-OR^5$、$-N(R^6)(R^{6'})$、$-NHCOR^7$、$-NHSO_2R^8$、$-A^6-Qa$を示すか、あるいはこれらは互いに繋がってメチレンジオキシ基を示すものと定義される。これらのうち水素原子、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基などは特に好ましい例である。炭素数1～4個の直鎖状又は分枝鎖状飽和アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基等が挙げられるがメチル基は特に好ましい例である。

[0065] 置換基$-N(R^6)(R^{6'})$のR^6は水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。$R^{6'}$はR^6と同義であるか、あるいはR^6と繋がってこれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。「R^6と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する」場合としては、例えば、ピロリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基などの窒素原子を含む環状アミノアルキル基が形成される場合を挙げることができる。従って、$-N(R^6)(R^{6'})$の具体例としてはアミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基、N，N－ジエチルアミノ基、ピペリジノ基、ピロリジノ基、モルホリノ基などが挙げられN，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基などは

好ましい例であり、N, N－ジメチルアミノ基は特に好ましい例である。

R^5及びR^7それぞれ独立に水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基又は－A^6－Qa基と定義される。R^5のうち水素原子は特に好ましい一例である。炭素数1～4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基等が挙げられ、このうちメチル基は好ましい例である。

[0066] 置換基－A^6－QaのA^6は前述と同義である。Qaは部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環(qa)と定義され、複素環(qa)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含む置換基を意味する。単環式の炭素環あるいは複素環としては原子数5～7個の部分不飽和又は完全不飽和の環であり、その残基としては、例えばフェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基などが挙げられる。縮合二環式の炭素環あるいは複素環としては原子数8～11個の部分不飽和又は完全不飽和である環を表し、その残基としては、例えばナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基などが挙げられる。

Qaはその環上の任意の位置でA^6と結合する。さらにQaは1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されていてもよい。T^1は前述と同義である。

[0067] －A^6－Qaの具体例としてフェニル基、メチルフェニル基、クロロフェニル基、ベンジル基、メチルベンジル基、クロロベンジル基、ジクロロベンジル基、フルオロベンジル基、トリフルオロメチルベンジル基、ニトロベンジル基、メトキシフェニル基、N－メチルアミノベンジル基、N, N－ジメチルアミノベンジル基、フリル基、チエニル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル

基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基などが挙げられる。

R^8はそれぞれ炭素数1～4個の低級アルキル基と定義され、炭素数1～4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基等が挙げられる。

R^2及びR^3のうち好ましい例としては水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基が挙げられ、水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基は特に好ましい。

[0068] Rbのうち特に好ましい例としては、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニル

メチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基などが挙げられる。

[0069] Rcのpは2～4のいずれかの整数として定義され、具体的にはpが2の場合エチレン、3の場合トリメチレン、また4の場合テトラメチレンを表す。

A^4は、単結合、メチレン、又はエチレンを表す。

Rdは水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は基Qaを表す。

置換基－A^4－Rdの具体的な例としては水素原子、メチル基、エチル基、プロピル

基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソアミル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、2－(シクロプロピル)エチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、2－(シクロペンチル)エチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、2－(シクロヘキシル)エチル基、フェニル基、4－メチルフェニル基、4－クロロフェニル基、4－フルオロフェニル基、ベンジル基、4－クロロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－(4－クロロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、ピリジン－2－イル基、ピリジン－3－イル基、ピリジン－4－イル基、(ピリジン－2－イル)メチル基、(ピリジン－3－イル)メチル基、又は(ピリジン－4－イル)メチル基などが挙げられる。

A^5は－C(O)－、－C(S)－、又は－S(O)$_2$－を表す。

Reは炭素数1～8個のアルキル基、－A^6－Qa基、－$(CH_2)_i R^{14}$基、－OR^{28}基、－SR^{28}基、又は－$N(R^{29})(R^{30})$基を表す。基Qa及び－A^6－Qaは前述と同義である。

[0070] 炭素数1～8個のアルキル基とは、直鎖状若しくは分岐状の飽和アルキル基又は直鎖状若しくは分岐状の部分的に不飽和結合を含むアルキル基、あるいは炭素数3～7のシクロアルキル基を含んでもよいアルキル基を表し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－メチルブチル基、2，2－ジメチルプロピル基、ヘキシル基、4－メチルペンチル基、2，3－ジメチルブチル基、2－エチルブチル基、ヘプチル基、オクチル基、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、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－メチルシクロペンチル基、3－メチルシクロペンチル基、3，4－ジメチルシクロペンチル基、4－メチルシクロヘキシル基、4，4－ジメチルシクロヘキシル基、4－エチルシクロヘキシル基、4－メチルシクロヘキシルメチル基等が挙げられる。

置換基－$(CH_2)_i R^{14}$のiは1～3のいずれかの整数を表し、R^{14}は水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、カルボキシル基、又は炭素数1～4個のN，N－ジアルキルカルバモイル基を表す。炭素数1～4個のアルコキシ基としてはメトキシ基、エトキシ基、

プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブチルオキシ基、又はt－ブチルオキシ基などが挙げられる。炭素数1～4個のN，N－ジアルキルカルバモイル基としてはN，N－ジメチルカルバモイル基、N，N－ジエチルカルバモイル基などが挙げられる。

置換基－OR^{28}又は－SR^{28}のR^{28}は炭素数1～8個のアルキル基又は－A^6－Qaを表すがこれらは前述のものと同義である。

[0071] 置換基－$N(R^{29})(R^{30})$のR^{29}は炭素数1～8個のアルキル基、炭素数1～4個のアルコキシカルボニル基、又は－A^6－Qaを表す。これらのうち炭素数1～8個のアルキル基及び－A^6－Qaは前述のものと同義である。炭素数1～4個のアルコキシカルボニル基としてはメチルオキシカルボニル基、エチルオキシカルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、ブチルオキシカルボニル基、イソブチルオキシカルボニル基、又はt－ブチルオキシカルボニル基などが挙げられる。R^{30}は水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示すか、あるいはR^{29}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。炭素数1～4個の低級アルキル基の意味は前述のものと同義である。「R^{29}と繋がってそられが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する」場合の例としては、例えばピロリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基などの窒素原子を含む環状アミノアルキル基などが挙げられる。

[0072] 置換基－A^5－Reの具体的な例としてはアセチル基、チオアセチル基、メタンスルホニル基、プロピオニル基、エチルチオカルボニル基、ブチリル基、プロピルチオカルボニル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t－ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、

チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4－メチルフェニルカルボニル基、4－メチルフェニルチオカルボニル基、4－メチルフェニルスルホニル基、4－クロロフェニルカルボニル基、4－クロロフェニルチオカルボニル基、4－フルオロフェニルカルボニル基、4－フルオロフェニルチオカルボニル基、フェニルメチルカルボニル基、4－メチルフェニルメチルカルボニル基、4－クロロフェニルメチルカルボニル基、4－フルオロフェニルメチルカルボニル基、(ピリジン－2－イル)カルボニル基、(ピリジン－2－イル)チオカルボニル基、(ピリジン－3－イル)カルボニル基、(ピリジン－4－イル)カルボニル基、(フラン－2－イル)カルボニル基、(チオフェン－2－イル)カルボニル基、メチルオキシカルボニル基、メチルスルファニルカルボニル基、メチルオキシチオカルボニル基、メチルオキシカルボニルアミノカルボニル基、カルバモイル基、N－メチルカルバモイル基、N－メチルチオカルバモイル基、N, N－ジメチルカルバモイル基、N, N－ジメチルチオカルバモイル基、N, N－ジメチルスルファモイル基、エチルオキシカルボニル基、エチルオキシカルボニルアミノカルボニル基、N－エチルカルバモイル基、N－エチルチオカルバモイル基、N, N－ジエチルカルバモイル基、N, N－ジエチルチオカルバモイル基、N, N－ジエチルスルファモイル基、プロピルオキシカルボニル基、N－プロピルカルバモイル基、N－プロピルチオカルバモイル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N－イソプロピルカルバモイル基、N－イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N－ブチルカルバモイル基、N－ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N－イソブチルカルバモイル基、N－イソブチルチオカルバモイル基、t－ブチルオキシカルボニル基、N－t－ブチルカルバモイル基、N－t－ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N－シクロプロピルカルバモイル基、N－シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N－シクロペンチルカルバモイル基、N－シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N－シクロヘキシルカルバモイル基、N－シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N－フェニルカルバモイル基、N－フェニルチオカルバモイル基、4－メチルフェニルオキシカルボニル基、N－(4－メチルフェ

ニル)カルバモイル基、N－(4－メチルフェニル)チオカルバモイル基、4－クロロフェニルオキシカルボニル基、N－(4－クロロフェニル)カルバモイル基、N－(4－クロロフェニル)チオカルバモイル基、4－フルオロフェニルオキシカルボニル基、N－(4－フルオロフェニル)カルバモイル基、N－(4－フルオロフェニル)チオカルバモイル基、フェニルメチルオキシカルボニル基、4－メチルフェニルメチルオキシカルボニル基、4－クロロフェニルメチルオキシカルボニル基、4－フルオロフェニルメチルオキシカルボニル基、N－(ピリジン－2－イル)カルバモイル基、N－(ピリジン－2－イル)チオカルバモイル基、N－(ピリジン－3－イル)カルバモイル基、N－(ピリジン－3－イル)チオカルバモイル基、N－(ピリジン－4－イル)カルバモイル基、N－(ピリジン－4－イル)チオカルバモイル基、N－(フラン－2－イル)カルバモイル基、N－(チオフェン－2－イル)カルバモイル基、(ピロリジノ－1－イル)カルボニル基、(ピペリジノ－1－イル)カルボニル基、又は(モルホリノ－4－イル)カルボニル基などが挙げられる。

[0073] Rcの具体例としては、2－(N－イソブチリル－N－メチルアミノ)エチル基、2－(N－エチル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチリル－N－プロピルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチリル－N－イソプロピルアミノ)エチル基、2－(N－ブチル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－(N－シクロプロピル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチルメチル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－(N－シクロヘキシル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－(N－シクロヘキシルメチル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチリル－N－フェニルアミノ)エチル基、2－[N－イソブチリル－N－(4－メチルフェニル)アミノ]エチル基、2－[N－(4－クロロフェニル)－N－イソブチリルアミノ]エチル基、2－[N－(4－フルオロフェニル)－N－イソブチリルアミノ]エチル基、2－(N－ベンジル－N－イソブチリルアミノ)エチル基、2－[N－(4－クロロフェニルメチル)－N－イソブチリルアミノ]エチル基、2－[N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－イソブチリルアミノ]エチル基、2－[N－[2－(4－クロロフェニル)エチル]－N－イソブチリルアミノ]エチル基、2－[N－[2－(4－フルオロフェニル)

エチル]－N－イソブチリルアミノ]エチル基、2－(N－イソブチルチオカルボニル－N－メチルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチルチオカルボニル－N－イソプロピルアミノ)エチル基、2－(N－ブチル－N－イソブチルチオカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチル－N－イソブチルチオカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチル－N－イソブチルチオカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチルメチル－N－イソブチルチオカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチルチオカルボニル－N－フェニルアミノ)エチル基、2－(N－ベンジル－N－イソブチルチオカルボニルアミノ)エチル基、2－[N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－イソブチルチオカルボニルアミノ]エチル基、2－(N－メチル－N－ピバロイルアミノ)エチル基、2－(N－イソプロピル－N－ピバロイルアミノ)エチル基、2－(N－ブチル－N－ピバロイルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチル－N－ピバロイルアミノ)エチル基、2－(N－シクロヘキシル－N－ピバロイルアミノ)エチル基、2－(N－シクロヘキシルメチル－N－ピバロイルアミノ)エチル基、2－(N－フェニル－N－ピバロイルアミノ)エチル基、2－(N－ベンジル－N－ピバロイルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチルカルボニル－N－メチルアミノ)エチル基、2－(N－ブチル－N－シクロペンチルカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチルカルボニル－N－イソブチルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチルカルボニル－N－シクロペンチルメチルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチルカルボニル－N－フェニルアミノ)エチル基、2－[N－シクロペンチルカルボニル－N－(4－フルオロフェニル)アミノ]エチル基、2－(N－ベンジル－N－シクロペンチルカルボニルアミノ)エチル基、2－[N－シクロペンチルカルボニル－N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ]エチル基、2－(N－メチル－N－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、2－(N－エチル－N－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、2－(N－フェニルスルホニル－N－プロピルアミノ)エチル基、2－(N－イソプロピル－N－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、2－(N－ブチル－N－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチル－N－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、2－(N－シクロプロピル－N－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチル－N－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチルメチル－N－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、2

－(Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、２－(Ｎ－シクロヘキシルメチル－Ｎ－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、２－(Ｎ－フェニル－Ｎ－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、２－[Ｎ－(４－フルオロフェニル)－Ｎ－フェニルスルホニルアミノ]エチル基、２－(Ｎ－ベンジル－Ｎ－フェニルスルホニルアミノ)エチル基、２－[Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)－Ｎ－メチルアミノ]エチル基、２－[Ｎ－ブチル－Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)アミノ]エチル基、２－[Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)－Ｎ－イソブチルアミノ]エチル基、２－[Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)－Ｎ－シクロペンチルアミノ]エチル基、２－[Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)－Ｎ－シクロヘキシルメチルアミノ]エチル基、２－[Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)－Ｎ－フェニルアミノ]エチル基、２－{Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)－Ｎ－(４－フルオロフェニル)アミノ}エチル基、２－[Ｎ－ベンジル－Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)アミノ]エチル基、２－{Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)－Ｎ－(４－フルオロフェニルメチル)アミノ}エチル基、２－{Ｎ－(Ｎ－ブチルカルバモイル)－Ｎ－[２－(４－フルオロフェニル)エチル]アミノ}エチル基、２－[Ｎ－(Ｎ－イソプロピルチオカルバモイル)－Ｎ－メチルアミノ]エチル基、２－[Ｎ－ブチル－Ｎ－(Ｎ－イソプロピルチオカルバモイル)アミノ]エチル基、２－[Ｎ－イソブチル－Ｎ－(Ｎ－イソプロピルチオカルバモイル)アミノ]エチル基、２－[Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－(Ｎ－イソプロピルチオカルバモイル)アミノ]エチル基、２－[Ｎ－シクロヘキシルメチル－Ｎ－(Ｎ－イソプロピルチオカルバモイル)アミノ]エチル基、２－[Ｎ－(Ｎ－イソプロピルチオカルバモイル)－Ｎ－フェニルアミノ]エチル基、２－{Ｎ－(４－フルオロフェニル)－Ｎ－(Ｎ－イソプロピルチオカルバモイル)アミノ}エチル基、２－[Ｎ－ベンジル－Ｎ－(Ｎ－イソプロピルチオカルバモイル)アミノ]エチル基、２－(Ｎ－イソブチルオキシカルボニル－Ｎ－メチルアミノ)エチル基、２－(Ｎ－ブチル－Ｎ－イソブチルオキシカルボニルアミノ)エチル基、２－(Ｎ－イソブチル－Ｎ－イソブチルオキシカルボニルアミノ)エチル基、２－(Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－イソブチルオキシカルボニルアミノ)エチル基、２－(Ｎ－シクロヘキシルメチル－Ｎ－イソブチルオキシカルボニルアミノ)エチル基、２－(Ｎ－イソブチルオキシカルボニル－Ｎ－フェニルアミノ)エチル基、２－[Ｎ－(４－フルオロフェニル)－Ｎ－イソブチルオキシカルボニルアミノ]エチル基、２－(Ｎ－ベン

ジル－N－イソブチルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2－[N－(N－シクロペンチルカルバモイル)－N－メチルアミノ]エチル基、2－[N－ブチル－N－(N－シクロペンチルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－(N－シクロペンチルカルバモイル)－N－イソブチルアミノ]エチル基、2－[N－シクロペンチル－N－(N－シクロペンチルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－シクロヘキシルメチル－N－(N－シクロペンチルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－(N－シクロペンチルカルバモイル)－N－フェニルアミノ]エチル基、2－[N－ベンジル－N－(N－シクロペンチルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－(N－シクロヘキシルチオカルバモイル)－N－メチルアミノ]エチル基、2－[N－ブチル－N－(N－シクロヘキシルチオカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－(N－シクロヘキシルチオカルバモイル)－N－イソブチルアミノ]エチル基、2－[N－(N－シクロヘキシルチオカルバモイル)－N－シクロペンチルアミノ]エチル基、2－[N－シクロヘキシルメチル－N－(N－シクロヘキシルチオカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－(N－シクロヘキシルチオカルバモイル)－N－フェニルアミノ]エチル基、2－[N－ベンジル－N－(N－シクロヘキシルチオカルバモイル)アミノ]エチル基、2－(N－メチル－N－フェニルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－ブチル－N－フェニルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－イソブチル－N－フェニルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－シクロペンチル－N－フェニルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－シクロヘキシルメチル－N－フェニルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－フェニル－N－フェニルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2－(N－ベンジル－N－フェニルオキシカルボニルアミノ)エチル基、2－[N－メチル－N－(N－フェニルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－ブチル－N－(N－フェニルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－イソブチル－N－(N－フェニルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－シクロペンチル－N－(N－フェニルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－シクロヘキシルメチル－N－(N－フェニルカルバモイル)アミノ]エチル基、2－[N－フェニル－N－(N－フェニルカルバモイル)アミノ]エチル基、又は2－[N－ベンジル－N－(N－フェニルカルバモイル)アミノ]エチル基などが挙げられる。

[0074] Rxのうち特に好ましい具体例としては、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イ

ソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニル

メチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基などが挙げられる。

[0075] 前記一般式(I)におけるRsが－N(Ry)(Rz)を表すとき、RzはRxと同義であるか、あるいはメチル基、エチル基、又は－A^5－Re基を表すものと定義される。－A^5－Reについては前述のものと同義である。

Rzの好ましい例は、Rxの好ましい例と同様であるか、あるいは、Ryが水素原子以外の置換基を示すときメチル基、又はエチル基であり、また特に好ましい例についても、Rxの特に好ましい例と同様であるか、Ryが水素原子以外の置換基を示すときメチル基、又はエチル基である。Rzのメチル基、エチル基以外の特に好ましい具体例としては、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、イ

ンダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニ

ル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基などが挙げられる。

[0076] Ryは水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は－A^6－Qpを表す。具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－メチルブチル基、2, 2－ジメチルプロピル基、ヘキシル基、4－メチルペンチル基、2, 3－ジメチルブチル基、2－エチルブチル基、ヘプチル基、オクチル基、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、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－メチルシクロペンチル基、3－メチルシクロペンチル基、3, 4－ジメチルシクロペンチル基、4－メチルシクロヘキシル基、4, 4－ジメチルシクロヘキシル基、4－エチルシクロヘキシル基、4－メチルシクロヘキシルメチル基等が挙げられる。－A^6－Qpは前述のものと同義である。

Ryの好ましい例としては、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基などが挙げられ、また特に好ましい例としては、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基などが挙げられる。

[0077] またRyはRzと繋がって窒素原子とともに原子数3～7の飽和あるいは不飽和の環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)は、窒素原子とは別に窒素原子、

酸素原子、又はイオウ原子のいずれか1個含んでもよく、さらに環状置換基(qy)は1個又は同一若しくは異なる2個のRfで置換されてもよい。環状置換基(qy)の具体的な好ましい例としては、ピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、チオモルフォリノ基などの窒素原子を含む環状置換基が挙げられ、ピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基などは特に好ましい例である。Rfは、炭素数1～8個のアルキル基、又は－A^6－Qpを表し、置換基－A^6－Qpは前述のものと同義である。Rfの好ましい例としては、炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)が挙げられ、特に好ましい例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)が挙げられる。

[0078] Rfの特に好ましい具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジ

フルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基などが挙げられる。

[0079] また環状置換基(qy)が窒素原子を2つ含む飽和環であるピペラジノ基、ホモピペラジノ基である場合、環Eと結合していない窒素原子がRfで置換している場合が好ましく、この場合のRfとして特に好ましい例として－A^6－Qpが挙げられ、具体例としてはフェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基などが挙げられる。

[0080] 置換基－N(Ry)(Rz)のうち好ましい例としては、

[Rzは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基のいずれかの置換基を示すか、先に示したRbを示し；Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフ

チル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し;

RbのA[2]は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;

RbのA[1]は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し(但しA[2]が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すときエチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す);

R[2]及びR[3]はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N, N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し;

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基を示すか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよい]という条件を満たす場合が挙げられる。

[0081] また、置換基－N(Ry)(Rz)のうち特に好ましい例としては、

[Rzは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシ

ル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの置換基を示すか、先に示したRbを示し；

Rb中のQは、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかを示し；

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し；

RbのA^1は、A^2が単結合を示すとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかを示し、またA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、RbのA^1は、エチレン基を示し；

R^2及びR^3はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかを示し；

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよい]という条件を満たす場合が挙げられる。

[0082] 置換基－N(Ry)(Rz)のうち特に好ましい具体例としては、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イ

ソブチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－イソペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）アミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘプチルアミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－フェニルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（インダン－２－イル）アミノ基、Ｎ－（１－フェニルエチル）アミノ基、Ｎ－［１－（２－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（２－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－ベンジルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）－Ｎ

－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニ

ルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－

ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基などが挙げられる。

[0083] 前記一般式(I)におけるRsのうち好ましい例としては、

[Rsは－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し;

Dは、単結合、酸素原子、又はイオウ原子を示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基を示すか、あるいは先に示したRbを示し;

Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し;

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;

RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す);

R^2及びR^3はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し；

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基を示し；

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－１－イル基、イミダゾール－１－イル基、ピラゾール－１－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）は、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよい]という条件を満たす場合が挙げられる。

[0084] また前記一般式（I）におけるRsのうち特に好ましい例としては、

[Rsは－D－Rxあるいは－N（Ry）（Rz）を示し；

Dは、単結合、又は酸素原子を示し；

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、２－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの置換基を示すか、先に示したRbを示し；

Rb中のQは、フェニル基、２－チエニル基、３－チエニル基、２－フリル基、３－フリル基、又はインダン－２－イル基のいずれかを示し；

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－を示し；

RbのA^1は、A^2が単結合を示すとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチ

レン基、又はエチレン基のいずれかを示し、またA[2]が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－を示すときエチレン基を示し；

R[2]及びR[3]はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかを示し；

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基を示し；

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよい]という条件を満たす場合が挙げられる。

[0085] 前記一般式（I）におけるRsのうち特に好ましい別の態様としては、

[Rsは、－D－Rxあるいは－N（Ry）（Rz）を示し；

Rsは、－D－Rxを示すときのDは、単結合、又は酸素原子を示し；

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フ

ルオロインダン－２－イル基、５－フルオロインダン－２－イル基、４，７－ジフルオロインダン－２－イル基、５，６－ジフルオロインダン－２－イル基、４－クロロインダン－２－イル基、５－クロロインダン－２－イル基、４，７－ジクロロインダン－２－イル基、５，６－ジクロロインダン－２－イル基、４－ヒドロキシインダン－２－イル基、５－ヒドロキシインダン－２－イル基、４，７－ジヒドロキシインダン－２－イル基、５，６－ジヒドロキシインダン－２－イル基、４－メトキシインダン－２－イル基、５－メトキシインダン－２－イル基、４，７－ジメトキシインダン－２－イル基、５，６－ジメトキシインダン－２－イル基、１－フェニルエチル基、１－（２－フルオロフェニル）エチル基、１－（３－フルオロフェニル）エチル基、１－（４－フルオロフェニル）エチル基、１－（２－クロロフェニル）エチル基、１－（３－クロロフェニル）エチル基、１－（４－クロロフェニル）エチル基、１－（２－メトキシフェニル）エチル基、１－（３－メトキシフェニル）エチル基、１－（４－メトキシフェニル）エチル基、ベンジル基、２－メチルフェニルメチル基、３－メチルフェニルメチル基、４－メチルフェニルメチル基、２，３－ジメチルフェニルメチル基、３，５－ジメチルフェニルメチル基、２－フルオロフェニルメチル基、３－フルオロフェニルメチル基、４－フルオロフェニルメチル基、２－クロロフェニルメチル基、３－クロロフェニルメチル基、４－クロロフェニルメチル基、２，３－ジフルオロフェニルメチル基、２，４－ジフルオロフェニルメチル基、２，５－ジフルオロフェニルメチル基、３，４－ジフルオロフェニルメチル基、２，３－ジクロロフェニルメチル基、２，４－ジクロロフェニルメチル基、２，５－ジクロロフェニルメチル基、２，６－ジクロロフェニルメチル基、３，４－ジクロロフェニルメチル基、３，５－ジクロロフェニルメチル基、３，６－ジクロロフェニルメチル基、２－（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、３－（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、４－（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、２－ヒドロキシフェニルメチル基、３－ヒドロキシフェニルメチル基、４－ヒドロキシフェニルメチル基、２－メトキシフェニルメチル基、３－メトキシフェニルメチル基、４－メトキシフェニルメチル基、２－（２－メチルフェニル）エチル基、２－（３－メチルフェニル）エチル基、２－（４－メチルフェニル）エチル基、２－（２－メトキシフェニル）エチル基、２－（３－メトキシフェニル）エチル基、２－（４－メトキシフェニル）エチル基、２－（２－フルオロフェニル）エチル基、２－（３－フルオロフェニル）エチル基、２－（４－フルオロフェニル）エチル基、２－（２－

クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し;

Rsが－N(Ry)(Rz)を示すときの－N(Ry)(Rz)は、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル

)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル

]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2，5－ジメチルピロリジノ基、3，4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2，6－ジメチルピペリジノ基、3，5－ジメチルピペリジノ基、4，4－ジメ

チルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかを示す]という条件を満たす場合が挙げられる。

[0086] また、前記一般式(I)におけるRsのうち特に好ましい別の態様として、Rsが－D－Rxを示し、Dが単結合を示し、RxはRbを示し、且つRb中のA^1、A^2が単結合を示す全ての条件を満たす場合が挙げられる。具体的な例としてはRsがフェニル基、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、3, 5－ジメチルフェニル基、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－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,

3－ジフルオロフェニル基、2，4－ジフルオロフェニル基、2，5－ジフルオロフェニル基、3，4－ジフルオロフェニル基、2，3－ジクロロフェニル基、2，4－ジクロロフェニル基、2，5－ジクロロフェニル基、2，6－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－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、4－（N，N－ジメチルアミノ）フェニル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、フラン－2－イル基、フラン－3－イル基、チオフェン－2－イル基、チオフェン－3－イル基などを示す場合特に好ましい例として挙げられる。

[0087] 前記一般式(I)における環(E)上の置換基V^1及びV^2は、これらの一方はZxを示し、且つそのときの他方はARを示す。すなわちV^1がZxであるときV^2はARであり、またV^2がZxであるときV^1はARである。これらのうちV^1がZxであり、V^2がARである場合は好ましい例である。

Zxは、水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、－OR^9、又は－N(Rn^1)(Rn^2)として定義される。これらのうち水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基などは好ましい例として挙げられ、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子などは特に好ましい例として挙げられる。

Zxのうち炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基とはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又はt－ブチル基等が挙げられ、これらのうちメチル基は特に好ましい例である。

R^9は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は－A^6－Qpを表す。このうち水素原子は特に好ましい例として挙げられる。炭素数1～4個の低級アルキル基と

してはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又はt－ブチル基等が挙げられ、メチル基は特に好ましい例である。－A^6－QpのA^{6}及びQpは前述のものと同義である。－OR^9のうち好ましい例としては水酸基、メトキシ基等が挙げられ、水酸基は特に好ましい一例である。

[0088] Rn^1は水素原子又は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基を表し、水素原子は特に好ましい例として挙げられる。炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又はt－ブチル基等が挙げられ、このうちメチル基、エチル基、プロピル基、又はイソプロピル基等は好ましい例として挙げられ、メチル基は特に好ましい例である。

Rn^2はRn^1と同義であるか、あるいは－COR^{23}基又は－SO_2R^{24}基を表すか、Rn^1と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。

R^{23}は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数1～4個の低級アルコキシ基、－O－A^6－Qp、又は－N(R^{25})(R^{26})を表す。R^{25}は水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基を表す。R^{26}はR^{25}と同義であるか、あるいはR^{25}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。「R^{25}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する」場合としては、例えば、ピロリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基などの窒素原子を含む環状アミノアルキル基が形成される場合を挙げることができる。

－COR^{23}の具体的な例としては、ホルミル基、アセチル基、t－ブチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルバモイル基、N－メチルカルバモイル基、N，N－ジメチルカルバモイル基、ピペリジン－1－カルボニル基、モルホリン－4－カルボニル基などが挙げられる。

[0089] R^{24}は炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。－SO_2R^{24}の具体的な例としては、メシル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基などが挙げら

れる。

Rn^2のうち水素原子、メチル基などは好ましい例であり水素原子は特に好ましい例である。

－N(Rn^1)(Rn^2)の具体例としては、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基、N，N－ジエチルアミノ基、ピペリジノ基、ピロリジノ基、モルホリノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、t－ブチルオキシカルボニルアミノ基、フェニルオキシカルボニルアミノ基、ベンジルオキシカルボニルアミノ基、カルバモイルアミノ基、N－メチルカルバモイルアミノ基、N，N－ジメチルカルバモイルアミノ基、ピペリジン－1－カルボニルアミノ基、モルホリン－4－カルボニルアミノ基、メシルアミノ基、スルファモイルアミノ基、N－メチルスルファモイルアミノ基、N，N－ジメチルスルファモイルアミノ基などが挙げられ、このうち好ましい例としてはアミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基などが挙げられ、アミノ基、N－メチルアミノ基などは特に好ましい例として挙げられる。

Zxとして好ましい例は水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基などが挙げられ、特に好ましい例として水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N－メチルアミノ基などが挙げられる。また、最も好ましい例として水素原子又はアミノ基が挙げられる。

[0090] 前記一般式(I)におけるARは、部分不飽和又は完全不飽和である縮合二環式の炭素環又は複素環(ar)の残基として定義される。またARは1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい。複素環(ar)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれる同一若しくは異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含む環を意味する。

「縮合二環式の炭素環あるいは複素環」とは原子数8～11個の部分不飽和又は完全不飽和である環を意味する。好ましくは窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択された環構成ヘテロ原子を1又は2個含む5員環の複素環同士が融合した8

個の原子からなる部分不飽和又は完全不飽和である環、窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択された環構成ヘテロ原子を1又は2個を含む5員環の複素環と6員環の炭素環又は窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択されたヘテロ原子を1又は2個含む6員環複素環とが融合した9個の原子からなる部分不飽和又は完全不飽和である環、あるいは6員環の炭素環又は窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択された環構成ヘテロ原子を1又は2個を含む6員環複素環と6員環の炭素環又は窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択された環構成ヘテロ原子を1又は2個を含む6員環複素環とが融合した10個の原子からなる部分不飽和又は完全不飽和である環が例として挙げられる。ARを構成する環のうちでヘテロ原子を含まない炭素環の場合、ナフタレン環は特に好ましい例である。またARを構成する環のうちで環構成ヘテロ原子を含む複素環(ar)のうち、環構成ヘテロ原子の数は1～2個の場合が好ましい例である。

[0091] 一般式(I)におけるARにおいて、ARを構成する好適な環の具体的な例としては、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1，8〕ナフチリジン、〔1，5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン、チエノ〔3，2－c〕ピリジン、チエノ〔3，2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1，3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン、1H

－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン、7H－プリン、4H－クロメンなどが挙げられる。これらのうちナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール及びジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾールは特に好ましい一群である。さらにナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、キノリン、1H－インダゾール及びイソキノリンは非常に好ましい例である。また、インドール又は1H－インダゾールは最も好ましい例である。

[0092] ARは、AR上の任意の炭素原子と前記一般式(I)中の芳香環(E)上の環構成炭素原子とで結合している。ARを構成する環のうち、芳香環(E)と置換位置を特定した好適な例としては、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕

イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジ

ン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－7－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1，3－ジヒドロインドール－5－イル基、1，3－ジヒドロインドール－4－イル基、1，3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、4H－クロメン－5－イル基などが挙げられる。これらのうちナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－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、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基及びベンゾオキサゾール－5－イル基などは特に好ましい一群であり、ナフタレン－2－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、1H－インダゾール

－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基などは非常に好ましい例である。また、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、又は1H－インダゾール－6－イル基は最も好ましい例である。

[0093] またARは1個又は同一若しくは異なる2以上のXaで置換されていてもよい。Xaの置換位置としては芳香環(E)と結合していないAR上の炭素原子、及び／又は窒素原子が存在する場合はその窒素原子上が挙げられる。

置換基Xaは炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、炭素数3～7個の環状飽和アルキル基、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、$-(CH_2)_iR^{14}$、$-OR^{10}$、$-N(R^{11})(R^{12})$、$-SO_2R^{13}$、又は$-COR^{27}$を表す。但しAR中に窒素原子が存在する場合、その窒素原子に置換してもよいXaは炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、炭素数3～7個の環状飽和アルキル基、又は$-(CH_2)_iR^{14}$のいずれかを表す。

置換基Xaのうちオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、又はトリフルオロメチル基は好ましい例である。

置換基Xaのうち炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基とは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又はt－ブチル基などが挙げられ、これらのうちメチル基、エチル基、又はプロピル基は特に好ましい例である。

また炭素数3～7個の環状飽和アルキル基としてはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、又はシクロヘプチル基などが挙げられる。

$-(CH_2)_iR^{14}$は、前述のものと同義であるが、これらうち2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基は好ましい例であり、2－ヒドロキシエチル基は特に好ましい例である。

[0094] $-OR^{10}$のR^{10}は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は$-(CH_2)_iR^{14}$基を表し、これらのうち水素原子は特に好ましい例である。炭素数1～4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブ

チル基、t－ブチル基等が挙げられる。このうちメチル基は特に好ましい例である。－$(CH_2)_i R^{14}$は前述のものと同義である。従って、－OR^{10}うち水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基などは好ましい例であり水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基は特に好ましい例である。

－$N(R^{11})(R^{12})$のR^{11}は水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を表し、R^{12}は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、－COR^{15}、又は－SO_2R^{16}を示すか、あるいはR^{11}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。－COR^{15}中のR^{15}は炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、アミノ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基、又は－A^6－Qaを表す。また－SO_2R^{16}中のR^{16}は炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。－$N(R^{11})(R^{12})$の具体的な例としてはアミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基、N，N－ジエチルアミノ基、ピペリジノ基、ピロリジノ基、モルホリノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、ベンゾイル基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、N－メチルカルバモイルアミノ基、N，N－ジメチルカルバモイルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、スルファモイルアミノ基、N－メチルスルファモイルアミノ基、又はN，N－ジメチルスルファモイルアミノ基などが挙げられ、このうち好ましい例としてはアミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、又は（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基などが挙げられ、アミノ基、N－メチルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基、又は2－ヒドロキシエチルアミノ基は特に好ましい例として挙げられる。

[0095] －SO_2R^{13}のR^{13}は炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。－SO_2R^{13}の好適な例としてはメタンスルホ

ニル基、スルファモイル基、Ｎ－メチルスルファモイル基、又はN，Ｎ－ジメチルスルファモイル基などが挙げられる。

－COR^{27}のR^{27}は水素原子、水酸基又は炭素数1～4個のアルコキシ基、炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。－COR^{27}の具体的な例としてはホルミル基、カルボキシル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、アセチル基、プロピオニル基、カルバモイル基、Ｎ－メチルカルバモイル基、又はN，Ｎ－ジメチルカルバモイル基などが挙げられ、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，Ｎ－ジメチルカルバモイル基などは好ましい例であり、カルボキシル基は特に好ましい例である。

基Xaのうち好ましい例としてはオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、２－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、２－カルボキシエチル基、N，Ｎ－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、２－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、２－カルボキシエチルオキシ基、N，Ｎ－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、２－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－２－カルボキシアミノ基、２－ヒドロキシアセチルアミノ基、２－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，Ｎ－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、Ｎ－メチルスルファモイル基、N，Ｎ－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，Ｎ－ジメチルカルバモイル基などが挙げられる。また基Xaのうち特に好ましい例としては、オキソ基、メチル基、エチル基、プロピル基、２－ヒドロキシエチル基、水酸基、メトキシ基、２－ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、Ｎ－メチルアミノ基、N，Ｎ－ジメチルアミノ基、２－ヒドロキシエチルアミノ基、又はカルボキシル基などが挙げられる。窒素原子上に置換してもよい基Xaのうち好ましい例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシメチル基、２－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、２－カルボキシエチル基、又はN，Ｎ－ジメチルカルバモイルメチル基が挙げられ、このうち特に好ましい例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、又は2－ヒドロキシエチル基が挙げられる。

[0096] 基Xaで置換されているか又は無置換のARのうち、好ましい例としては、ナフタレン－1－イル基、ナフタレン－2－イル基、6－フルオロナフタレン－2－イル基、6－クロロナフタレン－2－イル基、6－(トリフルオロメチル)ナフタレン－2－イル基、5－ヒドロキシナフタレン－1－イル基、5－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－1－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、7－ヒドロキシナフタレン－1－イル基、7－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、5－メトキシナフタレン－1－イル基、5－メトキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－1－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、7－メトキシナフタレン－1－イル基、7－メトキシナフタレン－2－イル基、5－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、7－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、5－(カルボキシメチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－(カルボキシメチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、7－(カルボキシメチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、5－(N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、7－(N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、5－アミノナフタレン－1－イル基、5－アミノナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－1－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、7－アミノナフタレン－1－イル基、7－アミノナフタレン－2－イル基、5－(N－メチルアミノ)ナフタレン－1－イル基、5－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－1－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、7－(N－メチルアミノ)ナフタレン－1－イル基、7－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、5－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－1－イル基、5－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－1－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、7－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－1－イル基、7－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、5－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、7－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、5－アセチルアミノナフタレン－2－イル基、6－アセチルアミノナフタレン－2－イル基、6－(2－アミ

ノアセチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシアセチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、7－(2－ヒドロキシアセチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－[(フラン－2－カルボニル)アミノ]ナフタレン－2－イル基、7－[(フラン－2－カルボニル)アミノ]ナフタレン－2－イル基、6－[(ベンゼン－2－カルボニル)アミノ]ナフタレン－2－イル基、7－[(ベンゼン－2－カルボニル)アミノ]ナフタレン－2－イル基、6－カルバモイルアミノナフタレン－2－イル基、6－メチルスルホニルアミノナフタレン－2－イル基、6－スルファモイルアミノナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルスルファモイルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－メタンスルホニルナフタレン－2－イル基、6－スルファモイルナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルスルファモイル)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルスルファモイル)ナフタレン－2－イル基、6－カルボキシナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2－カルボキシベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、2－カルボキシベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2－カルボキシ－3－メチルベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、2－カルボキシ－3－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－アセチルベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、3－アセチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－アセチル－2－メチルベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、3－アセチル－2－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－ヒドロキシメチルベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、3－ヒドロキシメチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－ヒドロキシメチル－2－メチルベンゾ〔b〕フラン－4－イル基、3－ヒドロキシメチル－2－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2－カルボキシベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、2－カルボキシベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2－カルボキシ－3－メチルベンゾ〔b〕

チオフェン－4－イル基、2－カルボキシ－3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－アセチルベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、3－アセチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－アセチル－2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、3－アセチル－2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－ヒドロキシメチルベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、3－ヒドロキシメチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－ヒドロキシメチル－2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、3－ヒドロキシメチル－2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－4－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－4－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－4－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1H－インドール－4－イル基、2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－3－メチル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－ヒドロキシメチル－1H－インドール－4－イル基、3－ヒドロキシメチル－1H－インドール－5－イル基、3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1，2－ジメチル－1H－インドール－4－イル基、1，2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，3－ジメチル－1H－インドール－4－イル基、1，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1，2，3－トリメチル－1H－インドール－4－イル基、1，2，3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1－メチル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1－メチル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1，3－ジメチル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1－メチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチ

ル－1，2－ジメチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1，2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、3－ヒドロキシメチル－1－メチル－1H－インドール－4－イル基、3－ヒドロキシメチル－1－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－ヒドロキシメチル－1，2－ジメチル－1H－インドール－4－イル基、3－ヒドロキシメチル－1，2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－4－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－4－イル基、1－エチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1－エチル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1－エチル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1－エチル－3－メチル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1－エチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1－エチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1－エチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシメチル－1H－インドール－4－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ

－3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－ヒドロキシメチル－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、3－ヒドロキシメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－4－イル基、3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－4－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－4－イル基

、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－ヒドロキシメチル－1H－インドール－4－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－ヒドロキシメチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－カルボキシメチル－1H－インドール－4－イル基、1－カルボキシメチ

ル－1H－インドール－5－イル基、1－カルボキシメチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－カルボキシメチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－カルボキシメチル－3－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－カルボキシメチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－カルボキシメチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－4－イル基、1－カルボキシメチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1－カルボキシメチル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1－カルボキシメチル－1H－インドール－5－イル基、2－カルボキシ－1－カルボキシメチル－3－メチル－1H－インドール－4－イル基、2－カルボキシ－1－カルボキシメチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1－カルボキシメチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1－カルボキシメチル－1H－インドール－5－イル基、3－アセチル－1－カルボキシメチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、3－アセチル－1－カルボキシメチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－カルボキシメチル－3－ヒドロキシメチル－1H－インドール－4－イル基、1－カルボキシメチル－3－ヒドロキシメチル－1H－インドール－5－イル基、1－カルボキシメチル－3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1H－インドール－4－イル基、1－カルボキシメチル－3－ヒドロキシメチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－(N－メチルアミノ)ベンゾチアゾール－6－イル基、2－(N，N－ジメチルアミノ)ベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、2－メチルキノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－メチルキノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、3－メチルベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、3－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1，3－

ジメチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(カルボキシメチル)－1H－インダゾール－5－イル基、1－(カルボキシメチル)－3－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、3－メチルベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、2－メチル－2H－インダゾール－5－イル基、2，3－ジメチル－2H－インダゾール－5－イル基、2－エチル－2H－インダゾール－5－イル基、2－エチル－3－メチル－2H－インダゾール－5－イル基、2－プロピル－2H－インダゾール－5－イル基、3－メチル－2－プロピル－2H－インダゾール－5－イル基、2－(2－ヒドロキシエチル)－2H－インダゾール－5－イル基、2－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－2H－インダゾール－5－イル基、2－(カルボキシメチル)－2H－インダゾール－5－イル基、2－(カルボキシメチル)－3－メチル－2H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、2－メチル－イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、3－メチル－イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、2，3－ジメチル－イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、2－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、3－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，2－ジメチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジメチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、2，3－ジメチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，2，3－トリメチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－2，3－ジメチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－

プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－2－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－3－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、2，3－ジメチル－1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（カルボキシメチル）1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（カルボキシメチル）－2－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（カルボキシメチル）－3－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（カルボキシメチル）－2，3－ジメチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－メチルイソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、2－メチルキナゾリン－6－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、2－メチルキノキサリン－6－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－4－イル基、1－メチル－1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、2－メチル－1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1，2－ジメチル－1H－ベンゾイミダゾール－5－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、2－メチルベンゾオキサゾール－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、2－メチル－1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、3－メチル－1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジメチル－1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1－メチル－1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1－

エチル－1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－2－オン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－2－オン－4－イル基、1－メチル－1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－2－オン－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－2－オン－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－2－オン－4－イル基、1－メチル－1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－2－オン－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－2－チオン－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－2－チオン－4－イル基、1－メチル－1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－2－チオン－5－イル基、3H－ベンゾオキサゾール－2－オン－6－イル基、3H－ベンゾオキサゾール－2－オン－7－イル基、3H－ベンゾオキサゾール－2－オン－5－イル基、3H－ベンゾオキサゾール－2－オン－4－イル基、3－メチル－3H－ベンゾオキサゾール－2－オン－6－イル基、3H－ベンゾオキサゾール－2－チオン－6－イル基、3H－ベンゾオキサゾール－2－チオン－7－イル基、3H－ベンゾオキサゾール－2－チオン－5－イル基、3H－ベンゾオキサゾール－2－チオン－4－イル基、3－メチル－3H－ベンゾオキサゾール－2－チオン－6－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、2－メチル－1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、3－メチル－1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1，3－ジメチル－1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、2－メチル－1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、3－メチル－1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジメチル－1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1－メチル－1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピラ

ゾロ〔4, 3－b〕ピリジン－5－イル基、3－メチル－1H－ピラゾロ〔4, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－ピラゾロ〔4, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン－4－イル基、1－メチル－1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン－6－イル基、1－エチル－1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン－6－イル基、3－メチル－1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン－6－イル基、1, 3－ジメチル－1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン－4－イル基、1－メチル－1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン－5－イル基、3－メチル－1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン－4－イル基、1－メチル－1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン－5－イル基、3－メチル－1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン－5－イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン－7－イル基、3－メチル〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン－6－イル基、2－メチルチエノ〔3, 2－c〕ピリジン－2－イル基、3－メチルチエノ〔3, 2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン－6－イル基、2－メチルチエノ〔3, 2－b〕ピリジン－2－イル基、3－メチルチエノ〔3, 2－b〕ピリジン－2－イル基、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－4－イル基、1－メチル－1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－5－イル基、1－エチル－1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－5－イル基、3－メチル－1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、3

－メチルベンゾ〔d〕イソオキサゾール－５－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－５－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－４－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－６－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－７－イル基、３－メチルベンゾ〔c〕イソオキサゾール－５－イル基、インドリジン－７－イル基、インドリジン－６－イル基、インドリジン－８－イル基、１，３－ジヒドロインドール－２－オン－５－イル基、１，３－ジヒドロインドール－２－オン－４－イル基、１，３－ジヒドロインドール－２－オン－６－イル基、１－メチル－１，３－ジヒドロ－インドール－２－オン－５－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔３，４－ｄ〕チアゾール－５－イル基、２Ｈ－イソインドール－５－イル基、２Ｈ－イソインドール－４－イル基、２－メチル－２Ｈ－イソインドール－５－イル基、４Ｈ－クロメン－６－イル基、４Ｈ－クロメン－５－イル基、クロメン－４－オン－７－イル基、クロメン－４－オン－６－イル基などが挙げられる。

[0097] また、特に好ましい例としては、ナフタレン－２－イル基、６－ヒドロキシナフタレン－２－イル基、６－メトキシナフタレン－２－イル基、６－（２－ヒドロキシエチルオキシ）ナフタレン－２－イル基、６－アミノナフタレン－２－イル基、６－（Ｎ－メチルアミノ）ナフタレン－２－イル基、６－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ）ナフタレン－２－イル基、６－（２－ヒドロキシエチルアミノ）ナフタレン－２－イル基、ベンゾ〔ｂ〕フラン－５－イル基、２－メチルベンゾ〔ｂ〕フラン－５－イル基、３－メチルベンゾ〔ｂ〕フラン－５－イル基、２，３－ジメチルベンゾ〔ｂ〕フラン－５－イル基、ベンゾ〔ｂ〕チオフェン－５－イル基、２－メチルベンゾ〔ｂ〕チオフェン－５－イル基、３－メチルベンゾ〔ｂ〕チオフェン－５－イル基、２，３－ジメチルベンゾ〔ｂ〕チオフェン－５－イル基、１Ｈ－インドール－５－イル基、２－メチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、３－メチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、２，３－ジメチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１－メチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１，２－ジメチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１，３－ジメチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１，２，３－トリメチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１－エチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１－エチル－２－メチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１－エチル－３－メチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１－エチル－２，３－ジメチル－１Ｈ－インドール－５－イル基、１－プロピル－１Ｈ－インドール－５－イル基、２－メチル－１－プロピル－１Ｈ－インドール－５－イル基、３－メチル－１

－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インドール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基などが挙げられる。

[0098] さらに、非常に好ましい例としては、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－（N，N－ジメチルアミノ）ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチ

アゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基などが挙げられる。また、最も好ましい例としては、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、又は1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基が挙げられる。

[0099] 前記一般式(I)における基Yは水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、－$(CH_2)_m N(R^{18})(R^{19})$、又は－$C(R^{20})_2 OC(O)A^3R^{21}$として定義され、このうち水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基は好ましい例であり、水素原子は特に好ましい例である。

炭素数1～4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基などが挙げられる。このうちメチル基、エチル基は特に好ましい例である。

－$(CH_2)_m N(R^{18})(R^{19})$のうちmは整数2又は3と定義される。$R^{18}$は$R^{19}$と同じであるか、$R^{19}$と繋がって窒素原子とともに3～6員環を形成している飽和の含窒素シクロアルキル基を示すか又は窒素原子とともにモルホリノ基を形成しているものであり、R^{19}はメチル基、エチル基又はプロピル基として定義される。－$(CH_2)_m N(R^{18})(R^{19})$の例としては2－(N，N－ジメチルアミノ)エチル基、2－(N，N－ジエチルアミノ)エチル基、2－(N，N－ジプロピルアミノ)エチル基、3－(N，N－ジメチルアミノ)プロピル基、3－(N，N－ジエチルアミノ)プロピル基、2－(N，N－ジプロピルアミノ)プロピル基、2－ピロリジン－1－イルエチル基、2－ピペリジン－1－イルエチル基、2－モルホリン－4－イルエチル基、3－ピロリジン－1－イルプロピル基、3－ピペリジン－1－イルプロピル基、3－モルホリン－4－イルプロピル基などが挙げられる。

[0100] －$C(R^{20})_2 OC(O)A^3R^{21}$のうち$R^{20}$は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基と

定義される。R^{21}は炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数3～6個の環状飽和アルキル基又はフェニル基と定義される。炭素数1～4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t－ブチル基等が挙げられ、炭素数3～6個の環状飽和アルキル基はシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基が挙げられる。A^3は単結合、又は酸素原子と定義される。$-C(R^{20})_2OC(O)A^3R^{21}$の例としてはアセトキシメチル基、プロピオニルオキシメチル基、ブチリルオキシメチル基、(2－メチルプロピオニル)オキシメチル基、(2，2－ジメチルプロピオニル)オキシメチル基、シクロプロピオニルオキシメチル基、シクロペンタノイルオキシメチル基、シクロヘキサノイルオキシメチル基、フェニルカルボキシメチル基、1－アセトキシ－1－メチルエチル基、1－メチル－1－(2－メチルプロピオニルオキシ)エチル基、1－シクロペンタノイルオキシ－1－メチルエチル基、1－シクロヘキサノイルオキシ－1－メチルエチル基、メトキシカルボニルオキシメチル基、エトキシカルボニルオキシメチル基、イソプロピルオキシカルボニルオキシメチル基、t－ブチルオキシカルボニルオキシメチル基、シクロプロピルオキシカルボニルオキシメチル基、シクロペンチルオキシカルボニルオキシメチル基、シクロヘキシルオキシカルボニルオキシメチル基、フェニルオキシカルボニルオキシメチル基、1－メトキシカルボニルオキシ－1－メチルエチル基、1－エトキシカルボニルオキシ－1－メチルエチル基、1－イソプロピルオキシカルボニルオキシ－1－メチルエチル基、1－t－ブチルオキシカルボニルオキシ－1－メチルエチル基、1－シクロプロピルオキシカルボニルオキシ－1－メチルエチル基、1－シクロペンチルオキシカルボニルオキシ－1－メチルエチル基、1－シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ－1－メチルエチル基、1－メチル－1－フェニルオキシカルボニルオキシエチル基などが挙げられる。

[0101] 本発明の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又はその塩において、以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかを示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2又はCH_2CH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し;

Dは、単結合、酸素原子、又はイオウ原子を示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基を示すか、あるいは先に示したRbを示し;

Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し;

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;

RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す);

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N,N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し;

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基を示し;

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか(但し、Rzがメチル

基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1, 2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3, 2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1, 3－ジヒドロピロロ〔2, 3－b〕ピリジン、1, 3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1, 8〕ナフチリジン、〔1, 5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3, 2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2, 3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4, 3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1, 3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3, 4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピラジ

ン、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの残基（上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示し；

Xaは、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基のいずれかを示し；

Yは、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。

[0102] また本発明の別の好ましい態様では、一般式（I）で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合を示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し；

LinkがCH_2、又はCH_2CH_2のいずれかを示し；

Wは、酸素原子を示し；

Rsは、－D－Rxあるいは－N（Ry）（Rz）を示し；

Dは、単結合、酸素原子、又はイオウ原子を示し；

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエ

チル基を示すか、あるいは先に示したRbを示し;

Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し;

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;

RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す);

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N, N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し;

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基を示し;

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1, 2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3, 2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1, 3－ジヒドロピロロ〔2, 3－b〕ピリジン、1, 3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1, 8〕ナフチリジン、〔1, 5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3, 2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2, 3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4, 3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4, 3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピリジン、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3－a〕ピリジン、チエノ〔3, 2－c〕ピリジン、チエノ〔3, 2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3, 2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1, 3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3, 4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3, 4－b〕ピラジン、1H－イミダゾ〔4, 5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの残基(上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい)を示し;

Xaは、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N, N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－

2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N－ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N, N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N－ジメチルカルバモイル基のいずれかを示し;

Yは、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。

[0103] またさらに本発明の別の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し;

LinkがCH_2、又はCH_2CH_2のいずれかを示し;

Wは、NH、又はN(メチル)を示し;

Rsは、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し;

Dは、単結合、酸素原子、又はイオウ原子を示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基を示すか、あるいは先に示したRbを示し;

Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し;

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;

RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを

示し(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す);

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N, N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し;

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基を示し;

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ[b]チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ[d]イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ[c]イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ[1, 2－a]ピリジン、1H－ピロロ[2, 3－b]ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベ

ンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1，8〕ナフチリジン、〔1，5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン、チエノ〔3，2－c〕ピリジン、チエノ〔3，2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1，3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの残基（上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示し；

Xaは、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基のいずれかを示し；

Yは、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。

[0104] また本発明の別の好ましい態様では、一般式（I）で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかを示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2又はCH_2CH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し;

Dは、単結合、酸素原子、又はイオウ原子を示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基を示すか、先に示したRbを示し;

Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し;

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;

RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す);

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N,N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し;

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基を示し;

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1

Ｈ－インダゾール－４－イル基、１Ｈ－インダゾール－６－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソチアゾール－５－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソチアゾール－４－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソチアゾール－６－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソチアゾール－７－イル基、２Ｈ－インダゾール－５－イル基、２Ｈ－インダゾール－４－イル基、２Ｈ－インダゾール－６－イル基、イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン－６－イル基、イミダゾ〔１，２－ａ〕ピリジン－７－イル基、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジン－４－イル基、イソキノリン－６－イル基、イソキノリン－３－イル基、イソキノリン－５－イル基、イソキノリン－７－イル基、ジヒドロ－２Ｈ－イソキノリン－６－イル基、ジヒドロ－２Ｈ－イソキノリン－５－イル基、シンノリン－６－イル基、シンノリン－５－イル基、キナゾリン－６－イル基、キナゾリン－７－イル基、キナゾリン－５－イル基、キノキサリン－２－イル基、キノキサリン－６－イル基、キノキサリン－５－イル基、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル基、１Ｈ－ベンゾイミダゾール－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－４－イル基、ベンゾオキサゾール－７－イル基、１Ｈ－ピロロ〔３，２－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピロロ〔３，２－ｂ〕ピリジン－６－イル基、ベンゾ〔１，２，５〕チアジアゾール－５－イル基、ベンゾ〔１，２，５〕チアジアゾール－４－イル基、１Ｈ－ベンゾトリアゾール－５－イル基、１Ｈ－ベンゾトリアゾール－４－イル基、１，３－ジヒドロピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１，３－ジヒドロピロロ〔２，３－ｂ〕ピリジン－４－イル基、１，３－ジヒドロベンゾイミダゾール－５－イル基、１，３－ジヒドロベンゾイミダゾール－４－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾオキサゾール－６－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾオキサゾール－７－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾオキサゾール－５－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾオキサゾール－４－イル基、フタラジン－６－イル基、フタラジン－５－イル基、〔１，８〕ナフチリジン－３－イル基、〔１，８〕ナフチリジン－４－イル基、〔１，５〕ナフチリジン－３－イル基、〔１，５〕ナフチリジン－４－イル基、１Ｈ－ピロロ〔３，２－ｃ〕ピリジン－６－イル基、１Ｈ－ピロロ〔３，２－ｃ〕ピリジン－４－イル基、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｃ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｃ〕ピリジン－４－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔４，３－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔４，３－ｂ〕ピリジン－６－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔４，３－ｃ〕ピリジン－６－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔４，３－ｃ〕ピリジン－４－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔

3, 4－c]ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－c]ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－b]ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－b]ピリジン－4－イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3－a]ピリジン－6－イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3－a]ピリジン－7－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－2－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－3－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－6－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－2－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－3－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－5－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－6－イル基、1H－チエノ[3, 2－c]ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ[3, 2－c]ピラゾール－4－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－5－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－4－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－d]チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5－a]ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－b]ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ[4, 5－b]ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示し；

Xaは、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N, N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N, N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N, N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニ

ル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基のいずれかの基を示し；

Yは、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。

[0105] また本発明の別の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかを示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2又はCH_2CH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsは、Rxを示し；

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基を示すか、先に示したRbを示し；

Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し；

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し；

RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示す

とき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す）；

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し；

環（E）上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し；

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN，N－ジメチルアミノ基のいずれかを示し；

ARは、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキ

ノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－7－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン

－5－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1，3－ジヒドロインドール－5－イル基、1，3－ジヒドロインドール－4－イル基、1，3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示し；

Xaは、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基を示し；

Yは、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。

[0106] さらに本発明の別の好ましい態様は、一般式（I）で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかを示し;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2又はCH_2CH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し;
Wは、メチレン基を示し;
Rsは、－O－Rxを示し;
Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基を示すか、先に示したRbを示し;
Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し;
RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;
RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す);
R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N,N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN, N－ジメチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1, 2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1, 2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－４－イル基、ベンゾオキサゾール－７－イル基、1H－ピロロ〔3，２－b〕ピリジン－５－イル基、1H－ピロロ〔3，２－b〕ピリジン－６－イル基、ベンゾ〔1，２，５〕チアジアゾール－５－イル基、ベンゾ〔1，２，５〕チアジアゾール－４－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－５－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－４－イル基、1，３－ジヒドロピロロ〔2，３－b〕ピリジン－５－イル基、1，３－ジヒドロピロロ〔2，３－b〕ピリジン－４－イル基、1，３－ジヒドロベンゾイミダゾール－５－イル基、1，３－ジヒドロベンゾイミダゾール－４－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－６－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－７－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－５－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－４－イル基、フタラジン－６－イル基、フタラジン－５－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－３－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－４－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－３－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－４－イル基、1H－ピロロ〔3，２－c〕ピリジン－６－イル基、1H－ピロロ〔3，２－c〕ピリジン－４－イル基、1H－ピロロ〔2，３－c〕ピリジン－５－イル基、1H－ピロロ〔2，３－c〕ピリジン－４－イル基、1H－ピラゾロ〔4，３－b〕ピリジン－５－イル基、1H－ピラゾロ〔4，３－b〕ピリジン－６－イル基、1H－ピラゾロ〔4，３－c〕ピリジン－６－イル基、1H－ピラゾロ〔4，３－c〕ピリジン－４－イル基、1H－ピラゾロ〔3，４－c〕ピリジン－５－イル基、1H－ピラゾロ〔3，４－c〕ピリジン－４－イル基、1H－ピラゾロ〔3，４－b〕ピリジン－５－イル基、1H－ピラゾロ〔3，４－b〕ピリジン－４－イル基、〔1，２，４〕トリアゾロ〔4，３－a〕ピリジン－６－イル基、〔1，２，４〕トリアゾロ〔4，３－a〕ピリジン－７－イル基、チエノ〔3，２－c〕ピリジン－２－イル基、チエノ〔3，２－c〕ピリジン－３－イル基、チエノ〔3，２－c〕ピリジン－６－イル基、チエノ〔3，２－b〕ピリジン－２－イル基、チエノ〔3，２－b〕ピリジン－３－イル基、チエノ〔3，２－b〕ピリジン－５－イル基、チエノ〔3，２－b〕ピリジン－６－イル基、1H－チエノ〔3，２－c〕ピラゾール－５－イル基、1H－チエノ〔3，２－c〕ピラゾール－４－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－５－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－４－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－６－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－７－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－５－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－４－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－６－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－７－イル基、インドリジン－７

－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1，3－ジヒドロインドール－5－イル基、1，3－ジヒドロインドール－4－イル基、1，3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン－5－イル基、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン－5－イル基、7H－プリン－2－イル基、4H－クロメン－6－イル基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示し；

Xaは、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基を示し；

Yは、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。

[0107] さらに本発明の別の好ましい態様は、一般式（I）で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかを示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2又はCH_2CH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し；

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、－S－Rxを示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、2－シクロヘプチルエチル基を示すか、先に示したRbを示し;

Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し;

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;

RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し(但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す);

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N,N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN,N－ジメチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－

イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾー

ル－５－イル基、１，３－ジヒドロベンゾイミダゾール－４－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾオキサゾール－６－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾオキサゾール－７－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾオキサゾール－５－イル基、ジヒドロ－３Ｈ－ベンゾオキサゾール－４－イル基、フタラジン－６－イル基、フタラジン－５－イル基、〔１，８〕ナフチリジン－３－イル基、〔１，８〕ナフチリジン－４－イル基、〔１，５〕ナフチリジン－３－イル基、〔１，５〕ナフチリジン－４－イル基、１Ｈ－ピロロ〔３，２－ｃ〕ピリジン－６－イル基、１Ｈ－ピロロ〔３，２－ｃ〕ピリジン－４－イル基、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｃ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピロロ〔２，３－ｃ〕ピリジン－４－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔４，３－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔４，３－ｂ〕ピリジン－６－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔４，３－ｃ〕ピリジン－６－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔４，３－ｃ〕ピリジン－４－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔３，４－ｃ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔３，４－ｃ〕ピリジン－４－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔３，４－ｂ〕ピリジン－５－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔３，４－ｂ〕ピリジン－４－イル基、〔１，２，４〕トリアゾロ〔４，３－ａ〕ピリジン－６－イル基、〔１，２，４〕トリアゾロ〔４，３－ａ〕ピリジン－７－イル基、チエノ〔３，２－ｃ〕ピリジン－２－イル基、チエノ〔３，２－ｃ〕ピリジン－３－イル基、チエノ〔３，２－ｃ〕ピリジン－６－イル基、チエノ〔３，２－ｂ〕ピリジン－２－イル基、チエノ〔３，２－ｂ〕ピリジン－３－イル基、チエノ〔３，２－ｂ〕ピリジン－５－イル基、チエノ〔３，２－ｂ〕ピリジン－６－イル基、１Ｈ－チエノ〔３，２－ｃ〕ピラゾール－５－イル基、１Ｈ－チエノ〔３，２－ｃ〕ピラゾール－４－イル基、ベンゾ〔ｄ〕イソオキサゾール－５－イル基、ベンゾ〔ｄ〕イソオキサゾール－４－イル基、ベンゾ〔ｄ〕イソオキサゾール－６－イル基、ベンゾ〔ｄ〕イソオキサゾール－７－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソオキサゾール－５－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソオキサゾール－４－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソオキサゾール－６－イル基、ベンゾ〔ｃ〕イソオキサゾール－７－イル基、インドリジン－７－イル基、インドリジン－６－イル基、インドリジン－８－イル基、１，３－ジヒドロインドール－５－イル基、１，３－ジヒドロインドール－４－イル基、１，３－ジヒドロインドール－６－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔３，４－ｄ〕チアゾール－５－イル基、２Ｈ－イソインドール－５－イル基、２Ｈ－イソインドール－４－イル基、〔１，２，４〕トリアゾロ〔１，５－ａ〕ピリミジン－６－イル基、１Ｈ－ピラゾロ〔３，４－ｂ〕ピラジン－５－イル基、１Ｈ－イミダゾ〔４，５－ｂ〕ピラジン－５－イル基、７Ｈ－プリン－２－イル基、４Ｈ－クロメン－６－イル

基、又は4H－クロメン－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示し；

Xaは、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基を示し；

Yは、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。

[0108] さらに本発明の別の好ましい態様は、一般式（I）で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかを示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2又はCH_2CH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し；

Wがメチレン基を示し；

Rsは、－N（Ry）（Rz）を示し；

Rzは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は

2－シクロヘプチルエチル基のいずれかの置換基を示すか、先に示したRbを示し；

Rb中のQは、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基を示し；

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－を示し；

RbのA^1は、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示し（但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－を示すときエチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかを示す）；

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示し；

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基を示すか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）は、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよく；

環（E）上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し；

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－プロピルアミノ基、Ｎ－イソプロピルアミノ基、又はN，Ｎ－ジメチルアミノ基のいずれかを示し；

ARは、ナフタレン－２－イル基、ナフタレン－１－イル基、ベンゾフラン－５－イル基、ベンゾフラン－４－イル基、ベンゾフラン－２－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－５－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－４－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－２－イル基、インドール－５－イル基、インドール－４－イル基、インドール－６－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、ベンゾチアゾール－５－イル基、ベンゾチアゾール－４－イル基、ジヒドロ－3Ｈ－ベンゾチアゾール－６－イル基、ジヒドロ－3Ｈ－ベンゾチアゾール－７－イル基、ジヒドロ－3Ｈ－ベンゾチアゾール－５－イル基、ジヒドロ－3Ｈ－ベンゾチアゾール－４－イル基、キノリン－６－イル基、キノリン－３－イル基、キノリン－５－イル基、キノリン－７－イル基、ジヒドロ－1Ｈ－キノリン－６－イル基、ジヒドロ－1Ｈ－キノリン－５－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－５－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－４－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－６－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－７－イル基、1Ｈ－インダゾール－５－イル基、1Ｈ－インダゾール－４－イル基、1Ｈ－インダゾール－６－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－５－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－４－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－６－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－７－イル基、2Ｈ－インダゾール－５－イル基、2Ｈ－インダゾール－４－イル基、2Ｈ－インダゾール－６－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－６－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－７－イル基、1Ｈ－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－５－イル基、1Ｈ－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－４－イル基、イソキノリン－６－イル基、イソキノリン－３－イル基、イソキノリン－５－イル基、イソキノリン－７－イル基、ジヒドロ－2Ｈ－イソキノリン－６－イル基、ジヒドロ－2Ｈ－イソキノリン－５－イル基、シンノリン－６－イル基、シンノリン－５－イル基、キナゾリン－６－イル基、キナゾリン－７－イル基、キナゾリン－５－イル基、キノキサリン－２－イル基、キノキサリン－６－イル基、キノキサリン－５－イル基、1Ｈ－ベンゾイミダゾール－５－イル基、1Ｈ－ベンゾイミダゾール－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－４－イル基、ベンゾオキサゾ

ール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，8〕ナフチリジン－4－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－3－イル基、〔1，5〕ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン－4－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－6－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン－7－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－c〕ピリジン－6－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－2－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－3－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、チエノ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1，3－ジヒドロインド

ール－５－イル基、1，3－ジヒドロインドール－４－イル基、1，3－ジヒドロインドール－６－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール－５－イル基、2H－イソインドール－５－イル基、2H－イソインドール－４－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン－６－イル基、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン－５－イル基、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン－５－イル基、7H－プリン－２－イル基、4H－クロメン－６－イル基、又は4H－クロメン－５－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示し；

Xaは、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、２－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、２－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、２－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、２－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、２－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－２－カルボキシアミノ基、２－ヒドロキシアセチルアミノ基、２－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基を示し；

Yは、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す。

[0109] 本発明の特に好ましい態様は、一般式（I）で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合を示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsは、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し;

Dは、単結合、又は酸素原子を示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの置換基を示すか、先に示したRbを示し;

Rb中のQは、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかを示し;

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し;

RbのA^1は、A^2が単結合を示すとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかを示し、またA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示すときエチレン基を示し;

R^2及びR^3はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかを示し;

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基を示し;

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し；

ARは、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－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、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかの置換基を示し；

Xaは、オキソ基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、又はカルボキシル基を示し；

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0110] また本発明の特に好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsは、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し；

Dは、単結合、又は酸素原子を示し；

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－

エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニル

メチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し;

置換基－N(Ry)(Rz)は、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N

－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメ

チル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(

2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかを示し；

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し；

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し；

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチ

ル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基を示し；

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0111] さらに本発明の特に好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メ

チルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－イン

ドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2，3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基を示し；

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0112] さらに本発明の特に好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、－O－Rxを示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1

－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジフルオロフェニルメチル基、3, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 3－ジクロロフェニルメチル基、2, 4－ジクロロフェニルメチル基、2, 5－ジクロロフェニルメチル基、2, 6－ジクロロフェニルメチル基、3, 4－ジクロロフェニルメチル基、3, 5－ジクロロフェニルメチル基、3, 6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又

はN－メチルアミノ基のいずれかを示し；

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－

6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基を示し；

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0113] さらに本発明の特に好ましい別の態様は、一般式（I）で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合を示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsは、－N（Ry）（Rz）を示し；

置換基－N（Ry）（Rz）は、N，N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N，N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N

－エチルアミノ基、Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソブチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－イソペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）アミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘプチルアミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－フェニルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（インダン－２－イル）アミノ基、Ｎ－（１－フェニルエチル）アミノ基、Ｎ－［１－（２－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（２－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－ベンジルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）ア

ミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、

4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2，6－ジメチルピペリジノ基、3，5－ジメチルピペリジノ基、4，4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3，5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3，5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2，4－

ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－

インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基を示し；

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0114] さらに本発明の特に好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合を

示し；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2を示し、また環E上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHを示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsはフェニル基、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、3，5－ジメチルフェニル基、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－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、2，3－ジフルオロフェニル基、2，4－ジフルオロフェニル基、2，5－ジフルオロフェニル基、3，4－ジフルオロフェニル基、2，3－ジクロロフェニル基、2，4－ジクロロフェニル基、2，5－ジクロロフェニル基、2，6－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－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、4－（N，N－ジメチルアミノ）フェニル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、フラン－2－イル基、フラン－3－イル基、チオフェン－2－イル基、又はチオフェン－3－イル基のいずれかを示し；

環（E）上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し；

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し；

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシ

ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール

－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基を示し；

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0115] 本発明の非常に好ましいの態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し；

LinkがCH_2を示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsは－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し；

Dは、単結合、又は酸素原子を示し；

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの置換基を示すか、先に示したRbを示し；

Rb中のQは、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかを示し；

RbのA^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－を示し；

RbのA[1]は、A[2]が単結合を示すとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかを示し、またA[2]が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－を示すときエチレン基を示し；

R[2]及びR[3]はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかを示し；

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基を示し；

Ryは、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかを示すか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基を示す）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよく；

環（E）上の置換基V[1]はZxを示し、V[2]はARを示し；

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し；

ARは、ナフタレン－2－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかの置換基を示し；

Xaは、オキソ基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N，N－ジメ

チルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、又はカルボキシル基を示し；

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0116] また本発明の非常に好ましいの別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し；

LinkがCH_2を示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsは、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し；

Dは、単結合、又は酸素原子を示し；

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1

－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジフルオロフェニルメチル基、3, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 3－ジクロロフェニルメチル基、2, 4－ジクロロフェニルメチル基、2, 5－ジクロロフェニルメチル基、2, 6－ジクロロフェニルメチル基、3, 4－ジクロロフェニルメチル基、3, 5－ジクロロフェニルメチル基、3, 6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し;

置換基－N(Ry)(Rz)は、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－

プロピルアミノ基、Ｎ－イソプロピル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソプロピルアミノ基、Ｎ－ブチルアミノ基、Ｎ－ブチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ブチル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソブチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－イソペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）アミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘプチルアミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－フェニルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（インダン－２－イル）アミノ基、Ｎ－（１－フェニルエチル）アミノ基、Ｎ－［１－（２－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（２－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－ベンジルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニ

ルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，４－ジフルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，４－ジフルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，５－ジフルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，５－ジフルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３，４－ジフルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３，４－ジフルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３，５－ジフルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３，５－ジフルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，３－ジクロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，３－ジクロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，４－ジクロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，４－ジクロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，５－ジクロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，５－ジクロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，６－ジクロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，６－ジクロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３，４－ジクロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３，４－ジクロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３，５－ジクロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３，５－ジクロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－［２－（トリフルオロメチル）フェニルメチル］アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－［２－（トリフルオロメチル）フェニルメチル］アミノ基、Ｎ－［３－（トリフルオロメチル）フェニルメチル］アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－［３－（トリフルオロメチル）フェニルメチル］アミノ基、Ｎ－［４－（トリフルオロメチル）フェニルメチル］アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－［４－（トリフルオロメチル）フェニルメチル］アミノ基、ピロリジノ基、２－メチルピロリジノ基、３－メチルピロリジノ基、２，５－ジメチルピロリジノ基、３，４－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、２－メチルピペリジノ基、３－メチルピペリジノ基、４－メチルピペリジノ基、４－エチルピペリジノ基、４－プロピルピペリジノ基、４－イソプロピルピペリジノ基、４－ブチルピペリジノ基、４－イソブチルピペリジノ基、４－シクロペンチルピペリジノ基、４－シクロヘキシルピペリジノ基、４－（シクロペンチルメチル）ピペリジノ基、４－（シクロヘキシルメチル）ピペリジノ基、４－フェニルピペリジノ基、４－（２－メチルフェニル）ピペリジノ基、４－（４－メチルフェニル）ピペリジノ基、４－（２－フルオロフェニル）ピペリジノ基、４－（３－フルオロフェニル）ピ

ペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピ

ペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1, 2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかを示し;

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0117] さらに本発明の非常に好ましいの別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し;

LinkがCH_2を示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフル

オロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し；

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し；

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し；

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N，N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾー

ル－６－イル基、キノリン－３－イル基、キノリン－６－イル基、２－オキソ－１，２－ジヒドロキノリン－６－イル基、1H－インダゾール－５－イル基、１－メチル－1H－インダゾール－５－イル基、１－エチル－1H－インダゾール－５－イル基、イソキノリン－６－イル基、１－オキソ－１，２－ジヒドロイソキノリン－６－イル基、シンノリン－６－イル基、又はベンゾオキサゾール－５－イル基のいずれかを示し；

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0118] さらに本発明の非常に好ましいの別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し；

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し；

LinkがCH_2を示し；

Wは、メチレン基を示し；

Rsは－O－Rxを示し；

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、２－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、２－メチルフェニル基、４－メチルフェニル基、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－チエニル基、３－チエニル基、２－フリル基、３－フリル基、インダン－２－イル基、４－メチルインダン－２－イル基、５－メチルインダン－２－イル基、４，７－ジメチルインダン－２－イル基、５，６－ジメチルインダン－２－イル基、４－フルオロインダン－２－イル基、５－フルオロインダン－２－イル基、４，７－ジフルオロインダン－２－イル基、５，６－ジフルオロインダン－２－イル基、４－クロロインダン－２－イル基、５－クロロインダン－２－イル基、４，７－ジクロロインダン－２－イル基、５，６－ジクロロインダン－２－イル基、４－ヒドロキシインダン－２－イル基、５－ヒドロキシインダン－２－イル基、４，７－ジヒドロキシインダン－２－イル基、５，６－ジヒドロキシインダン－２－イル基、４－メトキシインダン－２－イル基、５－メトキシインダン－２－イル基、４，７－ジメトキシインダン－２－イル基、５，６－ジメトキシインダン－２－イル

基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジフルオロフェニルメチル基、3, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 3－ジクロロフェニルメチル基、2, 4－ジクロロフェニルメチル基、2, 5－ジクロロフェニルメチル基、2, 6－ジクロロフェニルメチル基、3, 4－ジクロロフェニルメチル基、3, 5－ジクロロフェニルメチル基、3, 6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル

基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N,N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2,3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1,2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1,2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかを示し;

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0119] さらに本発明の非常に好ましいの別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し;

LinkがCH_2を示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、－N(Ry)(Rz)を示し;

置換基－N(Ry)(Rz)は、N,N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N,N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N

－エチル－Ｎ－イソブチルアミノ基、Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－イソペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－エチル－Ｎ－イソペンチルアミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）アミノ基、Ｎ－（２－エチルブチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチルアミノ基、Ｎ－シクロペンチル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシルアミノ基、Ｎ－シクロヘキシル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘプチルアミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロペンチルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）アミノ基、Ｎ－（シクロヘキシルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－フェニルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニル）アミノ基、Ｎ－（インダン－２－イル）アミノ基、Ｎ－（１－フェニルエチル）アミノ基、Ｎ－［１－（２－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－フルオロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（２－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（３－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－［１－（４－クロロフェニル）エチル］アミノ基、Ｎ－ベンジルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（３－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－（４－メチルフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－フルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（３－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（４－クロロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）アミノ基、Ｎ－（２，３－ジフルオロフェニルメチル）－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－（２，４－ジ

フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メ

チルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペ

ラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかを示し;

ARは、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1, 2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかを示し;

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0120] 本発明の最も好ましい態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し;

LinkがCH_2を示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)を示し;

Dは、単結合、又は酸素原子を示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4, 7－ジメチルインダン－2－イル基、5, 6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4, 7－ジフルオロインダン－2－イル基、5, 6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4, 7－ジクロロインダン－2－イル基、5, 6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4, 7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5, 6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4, 7－ジメトキシインダン－2－イル基、5, 6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2, 3－ジメチルフェニルメチル基、3, 5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2, 3－ジフルオロフェニルメチル基、2, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 5－ジフルオロフェニルメチル基、3, 4－ジフルオロフェニルメチル基、2, 3－ジクロロフェニルメチル基、2, 4－ジクロロフェニルメチ

ル基、2, 5－ジクロロフェニルメチル基、2, 6－ジクロロフェニルメチル基、3, 4－ジクロロフェニルメチル基、3, 5－ジクロロフェニルメチル基、3, 6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し;

置換基－N(Ry)(Rz)は、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチル

メチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3，5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3，5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチ

ルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－ク

ロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(

2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子又はアミノ基のいずれかを示し;

ARは、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基のいずれかを示し;

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0121] また本発明の最も好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し;

LinkがCH_2を示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシ

インダン－２－イル基、４－メトキシインダン－２－イル基、５－メトキシインダン－２－イル基、４，７－ジメトキシインダン－２－イル基、５，６－ジメトキシインダン－２－イル基、１－フェニルエチル基、１－（２－フルオロフェニル）エチル基、１－（３－フルオロフェニル）エチル基、１－（４－フルオロフェニル）エチル基、１－（２－クロロフェニル）エチル基、１－（３－クロロフェニル）エチル基、１－（４－クロロフェニル）エチル基、１－（２－メトキシフェニル）エチル基、１－（３－メトキシフェニル）エチル基、１－（４－メトキシフェニル）エチル基、ベンジル基、２－メチルフェニルメチル基、３－メチルフェニルメチル基、４－メチルフェニルメチル基、２，３－ジメチルフェニルメチル基、３，５－ジメチルフェニルメチル基、２－フルオロフェニルメチル基、３－フルオロフェニルメチル基、４－フルオロフェニルメチル基、２－クロロフェニルメチル基、３－クロロフェニルメチル基、４－クロロフェニルメチル基、２，３－ジフルオロフェニルメチル基、２，４－ジフルオロフェニルメチル基、２，５－ジフルオロフェニルメチル基、３，４－ジフルオロフェニルメチル基、２，３－ジクロロフェニルメチル基、２，４－ジクロロフェニルメチル基、２，５－ジクロロフェニルメチル基、２，６－ジクロロフェニルメチル基、３，４－ジクロロフェニルメチル基、３，５－ジクロロフェニルメチル基、３，６－ジクロロフェニルメチル基、２－（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、３－（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、４－（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、２－ヒドロキシフェニルメチル基、３－ヒドロキシフェニルメチル基、４－ヒドロキシフェニルメチル基、２－メトキシフェニルメチル基、３－メトキシフェニルメチル基、４－メトキシフェニルメチル基、２－（２－メチルフェニル）エチル基、２－（３－メチルフェニル）エチル基、２－（４－メチルフェニル）エチル基、２－（２－メトキシフェニル）エチル基、２－（３－メトキシフェニル）エチル基、２－（４－メトキシフェニル）エチル基、２－（２－フルオロフェニル）エチル基、２－（３－フルオロフェニル）エチル基、２－（４－フルオロフェニル）エチル基、２－（２－クロロフェニル）エチル基、２－（３－クロロフェニル）エチル基、２－（４－クロロフェニル）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－［４－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノ）フェニル］エチル基、２－フェニルオキシエチル基、２－（２－クロロフェニルオキシ）エチル基、２－（３－クロロフェニルオキシ）エチル基、２－

(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子又はアミノ基のいずれかを示し;

ARは、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、又は1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基のいずれかを示し;

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0122] さらに本発明の最も好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し;

LinkがCH_2を示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは－O－Rxを示し;

Rxは、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，

6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－

[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子又はアミノ基のいずれかを示し;

ARは、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、又は1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基のいずれかを示し;

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0123] さらに本発明の最も好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示し;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合を示し;

LinkがCH_2を示し;

Wは、メチレン基を示し;

Rsは、－N(Ry)(Rz)を示し;

置換基－N(Ry)(Rz)は、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シク

ロヘキシル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－シクロヘプチルアミノ基、Ｎ－(シクロペンチルメチル)アミノ基、Ｎ－(シクロペンチルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、Ｎ－(シクロヘキシルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－フェニルアミノ基、Ｎ－(2－メチルフェニル)アミノ基、Ｎ－(4－メチルフェニル)アミノ基、Ｎ－(2－フルオロフェニル)アミノ基、Ｎ－(3－フルオロフェニル)アミノ基、Ｎ－(4－フルオロフェニル)アミノ基、Ｎ－(2－クロロフェニル)アミノ基、Ｎ－(3－クロロフェニル)アミノ基、Ｎ－(4－クロロフェニル)アミノ基、Ｎ－(インダン－2－イル)アミノ基、Ｎ－(1－フェニルエチル)アミノ基、Ｎ－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、Ｎ－ベンジルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－ベンジル－Ｎ－エチルアミノ基、Ｎ－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－メチル－Ｎ－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2－フルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3－フルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(4－フルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2－クロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3－クロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(4－クロロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、Ｎ－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)－Ｎ－メチルアミノ基、Ｎ－(3，5－ジフ

ルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフ

ェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフ

ェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかを示し;

環(E)上の置換基V^1はZxを示し、V^2はARを示し;

Zxは、水素原子又はアミノ基のいずれかを示し;

ARは、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、又は1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基のいずれかを示し;

Yは、水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

[0124] 本発明化合物(I)は置換基の種類により1個又は2個以上の不斉炭素を有する場合がある。例えば上述の環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合、及び環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が共に単結合を示す場合やRsが不斉炭素を含む場合など、不斉炭素が1個の場合2種の光学異性体が存在し、不斉炭素が2個の場合には4種の光学異性体と2種類のジアステレオ異性体が存在する。光学異性体又はジアステレオ異性体などの純粋な形態の立体異性体、又は立体異性体の任意の混合物、ラセミ体などは、いずれも本発明の範囲に包含される。また、本発明化合物(I)は二重結合の存在やシクロアルキル環構造に基づく幾何異性体として存在する場合もあるが、純粋な形態の任意の幾何異性体又は幾何異性体の任意の混合物も本発明の範囲に包含される。ラセミ体などの混合物は製造の容易さの点から好ましい場合がある。

本発明化合物(I)の塩としては、薬学上許容される塩が好ましい。例えば、(1)Yが水素原子のとき;(2)AR中にカルボキシル基、フェノール性水酸基を含むとき;(3)Zxがフェノール性水酸基のときなど、(1)～(3)の一つ以上条件を満たす際は酸性基の数に応じて1～3個のアルカリ塩を形成することを意味する。アルカリ塩としては、例えばナトリウム、アンモニア等の無機塩基又はトリエチルアミン等の有機塩基との塩を挙げることができる。

また(1)Rsが、置換された又は無置換のアミノ基を含む場合など、塩基の性質を持

つとき;(2)AR自体が塩基としての性質を持つ環状置換基であるとき;(3)AR中に置換された又は無置換のアミノ基を含むとき;(4)Zxが置換された又は無置換のアミノ基のときなど、(1)～(4)の一つ以上条件を満たす際は塩基性基の数に応じて1～4個の酸性塩を形成することを意味する。酸性塩としては、例えば塩酸、硫酸等の無機酸又は酢酸、クエン酸等の有機酸との塩を挙げることができる。

[0125] ＜本発明化合物の製造方法＞

本発明化合物(I)は、たとえば、下記の諸方法の反応を用いて製造することができる。

ただし、本発明化合物、あるいはその製造中間体の構造中にカルボキシル(COOH)基、水酸(OH)基、チオール(SH)基、ホルミル(CHO)基を含むケトン又はカルボニル(C(O))基、あるいはアミノ(NH)基が含まれる場合、必要に応じてそれらの置換基は保護基によって保護されてもよい。本発明化合物、あるいはその製造中間体の構造中に、例えばインドール環やインダゾール環のように環中にNHを含む複素環が含まれる場合、該NHも保護されてもよいアミノ基である。

それら保護基の種類については、例えば以下のものが挙げられるが、これらに限定されるものではなく、保護基の種類、選択、導入については、通常の化学文献、たとえばプロテクティブ グループ イン オーガニック シンセシス第三版(Protective Groups In Organic Synthesis THIRD EDITION)(John Wiley&Sons社出版)あるいは当文献記載の参考文献などを参照し検討することで選択することができる。

[0126] 本発明化合物、あるいはその製造中間体の構造中にカルボキシル(COOH)基が含まれる場合には、そのカルボキシル基は基Rp^1で保護されてもよく、水酸(OH)基が含まれる場合には、その水酸基は基Rp^2で保護されてもよく、ホルミル(CHO)基が含まれる場合には、そのホルミル基は基Rp^3で保護されてもよく、また、アミノ基(NH)が含まれる場合には、基Rp^4で保護されていてもよい。

Rp^1は、例えば炭素数1～4個のアルキル基、炭素数2～4個のアルケニル基、炭素数1～4個のアルコキシ基で置換された炭素数1～4個のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～4個のアルキル基などが挙げられ、具体的にはメチ

ル基、エチル基、t－ブチル基、アリル基、メトキシエチル基、トリクロロエチル基などが挙げられる。また、Rp^1として例えば、基－Ap^1－Rp^5なども挙げられる。基－Ap^1－Rp^5のAp^1は単結合、メチレン基、又は－$CH_2C(O)$－を表し、Rp^5は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXpで置換されていてもよいフェニル基を表す。置換基Xpは炭素数1～4個のアルキル基、水酸基、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基、ニトロ基、炭素数1～4個のアルコキシ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。－Ap^1－Rp^5の具体的な例としては、フェニル基、メチルフェニル基、クロロフェニル基、ベンジル(Bn)基、メチルベンジル基、クロロベンジル基、ジクロロベンジル基、フルオロベンジル基、トリフルオロメチルベンジル基、ニトロベンジル基、メトキシフェニル基、N－メチルアミノベンジル基、N, N－ジメチルアミノベンジル基、又はフェナシル基などが挙げられる。このうち炭素数1～4個のアルキル基などは特に好ましい例として挙げられる。

[0127] Rp^2は、例えば、炭素数1～4個のアルキル基、炭素数2～4個のアルケニル基、炭素数1～4個のアルコキシ基で置換された炭素数1～4個のアルキル基、1～3個のハロゲン原子で置換された炭素数1～4個のアルキル基、3個の同一又は異なる炭素数1～4個のアルキル基あるいはフェニル基により置換されたシリル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロフリル基、プロパルギル基、基－Ap^1－Rp^5、基－CH_2－Ap^2－Rp^6、基－C(O)Rp^6、又は基－COORp^6などを表す。Ap^2は酸素原子又は硫黄原子を表し、Rp^6は水素原子、炭素数1～4個のアルキル基、トリメチルシリルエチル基、クロロメチル基、トリクロロメチル基、トリフルオロメチル基、9－フルオレニルメチル基、アダマンチル基、アリル基、又は基－Ap^1－Rp^5などを表す。Rp^2として具体的には、メチル基、エチル基、t－ブチル基、アリル基、メトキシメチル(MOM)基、メトキシエチル(MEM)基、トリクロロエチル基、フェニル基、メチルフェニル基、クロロフェニル基、ベンジル基、メチルベンジル基、クロロベンジル基、ジクロロベンジル基、フルオロベンジル基、トリフルオロメチルベンジル基、ニトロベンジル基、メトキシフェニル基、N－メチルアミノベンジル基、N, N－ジメチルアミノベンジル基、フェナシル基、トリチル基、1－エトキシエチル(EE)基、テトラヒドロピラニル(THP)基、テトラヒドロフリル基、プロパルギル基、トリメチルシリル(TMS)基、トリエチルシリル(TES)基、t－ブ

チルジメチルシリル(TBDMS)基、t－ブチルジフェニルシリル(TBDPS)基、アセチル(Ac)基、ピバロイル基、ベンゾイル基、アリルオキシカルボニル(Alloc)基、又は2,2,2－トリクロロエトキシカルボニル(Troc)基などが挙げられる。

[0128] Rp^3は、例えばアセタール基などを表し、具体的には、ジメチルアセタールなどが挙げられる。

Rp^4は、例えば1個又は同一若しくは異なる2個以上の基－Ap^1－Rp^5、基－C(O)Rp^6、基－COORp^6などを表す。具体的にはベンジル基、メチルベンジル基、クロロベンジル基、ジクロロベンジル基、フルオロベンジル基、トリフルオロメチルベンジル基、ニトロベンジル基、メトキシフェニル基、N－メチルアミノベンジル基、N,N－ジメチルアミノベンジル基、フェナシル基、アセチル基、トリフルオロアセチル基、ピバロイル基、ベンゾイル基、アリルオキシカルボニル基、2,2,2－トリクロロエトキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、t－ブトキシカルボニル(Boc)基、1－メチル－1－(4－ビフェニル)エトキシカルボニル(Bpoc)基、9－フルオレニルメトキシカルボニル基、ベンジルオキシメチル(BOM)基、又は2－(トリメチルシリル)エトキシメチル(SEM)基などが挙げられる。

[0129] 保護基は、製造工程の途中、あるいは最終段階において製造と同時、又は順次に、脱保護化することにより目的化合物に変換することができる。カルボキシル基、水酸基、チオール基、ホルミル基を含むケトン又はカルボニル基、あるいはアミノ基の脱保護反応はよく知られており、例えば、(1)アルカリ加水分解、(2)酸性条件下における脱保護反応、(3)加水素分解による脱保護反応、(4)シリル基の脱保護反応、(5)金属を用いた脱保護反応、(6)金属錯体を用いた脱保護反応等が挙げられる。

これらの方法は具体的には、

(1)アルカリ加水分解による脱保護反応は、例えば極性溶媒中塩基と反応せしめることで行われる。ここで用いる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム、水酸化バリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ナトリウムメトキシド、又はカリウムt－ブトキシドなどのアルカリ金属塩基や、トリエチルアミンなどの有機塩基が挙げられる。これらの使用量は反応物に対し、アルカリ金属塩基の場合、通常は1～20倍モル量、好ましくは1～10倍モル量が例示され、また、

有機塩基の場合、1倍モル～大過剰量が例示される。反応溶媒は、通常、反応を妨げない不活性媒体、好ましくは極性溶媒中で反応せしめることが好ましい。極性溶媒としては水、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、又はジオキサン等が挙げられ、必要に応じてこれらを混合して用いることができる。反応温度は、例えば－10℃～溶媒の還流温度までの適当な温度が選択される。反応時間はアルカリ金属塩基を用いた場合、通常は0．5～72時間で、好ましくは1～48時間が例示され、有機塩基を用いた場合、通常は5時間～14日間が例示されるが、薄層クロマトグラフィー（TLC）、高速液体クロマトグラフィー（HPLC）等により反応経過を追跡することが可能であるから、通常は目的化合物の収量が最大となるところで適宜反応を終了させればよい。

[0130] （2）酸性条件下での脱保護反応は、例えば有機溶媒（ジクロロメタン、クロロホルム、ジオキサン、酢酸エチル、又はアニソール等）中、有機酸（酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、又はp－トルエンスルホン酸等）、ルイス酸（三臭化ホウ素、三フッ化ホウ素、臭化アルミ、または塩化アルミ等）又は無機酸（塩酸、又は硫酸等）若しくはこれらの混合物（臭化水素／酢酸等）中、－10～100℃の温度で行なわれる。また添加剤としてエタンチオール、又は1，2－エタンジチオールなどを添加する方法もある。

（3）加水素分解による脱保護反応は、例えば溶媒[エーテル系（テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、又はジエチルエーテル等）、アルコール系（メタノール、又はエタノール等）、ベンゼン系（ベンゼン、又はトルエン等）、ケトン系（アセトン、又はメチルエチルケトン等）、ニトリル系（アセトニトリル等）、アミド系（ジメチルホルムアミド等）、エステル系（酢酸エチル等）、水、酢酸、又はそれらの2種類以上の混合溶媒等]中、触媒（パラジウム炭素粉末、酸化白金（PtO_2）、活性化ニッケル等）の存在下、常圧又は加圧下の水素ガス、ギ酸アンモニウム、又はヒドラジン水和物などの水素源存在下、－10～60℃での温度で行なわれる。

（4）シリル基の脱保護反応は、例えば水と混和しうる有機溶媒（テトラヒドロフラン、又はアセトニトリル等）中、テトラ－n－ブチルアンモニウムフルオリド等を用いて、－10～60℃の温度で行なわれる。

[0131] （5）金属を用いた脱保護反応は、例えば酸性溶媒（酢酸、pH4．2～7．2の緩衝液

又はそれらの溶液とテトラヒドロフラン等の有機溶媒との混合液)中、粉末亜鉛の存在下、超音波をかけるか、又は超音波をかけないで、－10～60℃の温度で行なわれる。

(6)金属錯体を用いた脱保護反応は、例えば有機溶媒(ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、アセトニトリル、ジオキサン、又はエタノール等)、水又はそれらの混合溶媒中、トラップ試薬(水素化トリブチルスズ、トリエチルシラン、ジメドン、モルホリン、ジエチルアミン、又はピロリジン等)、有機酸(酢酸、ギ酸、又は2－エチルヘキサン酸等)及び／又は有機酸塩(2－エチルヘキサン酸ナトリウム、又は2－エチルヘキサン酸カリウム等)の存在下、ホスフィン系試薬(トリフェニルホスフィン等)の存在下又は非存在下、金属錯体[テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)、二塩化ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)、酢酸パラジウム(II)、又は塩化トリス(トリフェニルホスフィン)ロジウム(I)等]を用いて、－10～60℃の温度で行なわれる。

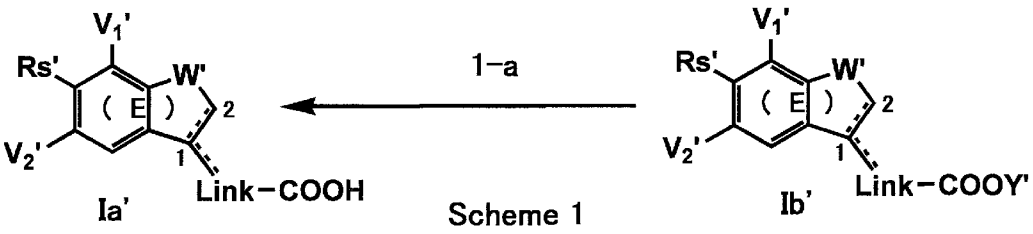
また上記以外にも通常の化学文献、例えば前記のプロテクティブ・グループ・イン・オーガニック・シンセシスあるいは当文献記載の参考文献など参照し検討することで脱保護反応を行うことができる。

当業者には容易に理解できることではあるが、これらの保護－脱保護反応を組み合わせ、また使い分けることにより、目的とする本発明化合物、あるいはその製造中間体に容易に誘導することができる。

[0132] 〔製造法1〕(工程a)

次Scheme1;

[化4]



Scheme 1

で表されるように、本発明化合物(I)の一部であって、その基Yが水素原子を示す一般式(Ia')(式中、Linkは前記と同義であり、Rs'は前記Rsと同じか、あるいは水酸

基、アミノ基など保護可能な官能基が含まれる場合、保護化された水酸基、又は保護化されたアミノ基であってもよく、V1'及びV2'は、これらの一方がZx'を示し、且つそのときの他方はAr'を示し、Zx'は前記Zxと同じかZx中に水酸基、アミノ基が含まれる場合、保護化された水酸基、又は保護化されたアミノ基であってもよい。またAr'は前記Arと同じか、あるいはAr中に水酸基、カルボキシル基、又はアミノ基が含まれる場合、保護化された水酸基、保護化されたカルボキシル基、又は保護化されたアミノ基であってもよい。W'は前記Wと同じか、Wが窒素原子の場合保護化された窒素原子でもよい)で表される本発明化合物〔以下、単に「化合物(Ia')」と称する〕は、一般式(Ib')(式中、Rs'、V1'、V2'、W'、及びLinkは前記と同義であり、Y'は炭素数1～4個の低級アルキル基を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(Ib')」と称する〕を加水分解し、基OY'を水酸基(OH)へと変化せしめ、もし存在するならば、水酸基、アミノ基、又はカルボキシル基の保護基を同時又は順次に、脱保護化して製造することができる。

[0133] 化合物(Ib')のY'は、炭素数1～4個の低級アルキル基が好ましいが、本反応式(1)により結果的に除去されてしまうので、カルボキシル基における通常の保護基を採用することもできる。その場合には、化合物(Ib')を作る前段階の工程、またその前段階の工程を適宜、用いる保護基に置き換えて製造することができることを、当業者は容易に理解できる。

化合物(Ib')から化合物(Ia')への変換反応においては、通常、塩基中で反応せしめることが好ましい。また、化合物(Ib')から化合物(Ia')への反応は、通常、反応を妨げない不活性媒体、好ましくは極性溶媒中で反応せしめることが好ましい。

ここで用いる塩基としては、たとえば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ナトリウムメトキシド、カリウムt－ブトキシドなどのアルカリ金属塩基や、トリエチルアミンなどの有機塩基が挙げられる。これらの使用量は化合物(Ib')に対し、アルカリ金属塩基の場合、通常は1～20倍モル、好ましくは1～10倍モルが例示され、また、有機塩基の場合、1倍モル～大過剰量が例示される。

[0134] また、極性溶媒としては水、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン等が挙げられ、必要に応じてこれらを混合して用いることができる。反応温度は、例え

ば室温～溶媒の還流温度までの適当な温度が選択される。反応時間はアルカリ金属塩基を用いた場合、通常は0．5～72時間で、好ましくは1～48時間が例示され、有機塩基を用いた場合、通常は5時間～14日間が例示されるが、薄層クロマトグラフィー（TLC）、高速液体クロマトグラフィー（HPLC）等により反応経過を追跡することが可能であるから、通常は化合物（Ia’）の収量が最大となるところで適宜反応を終了させればよい。

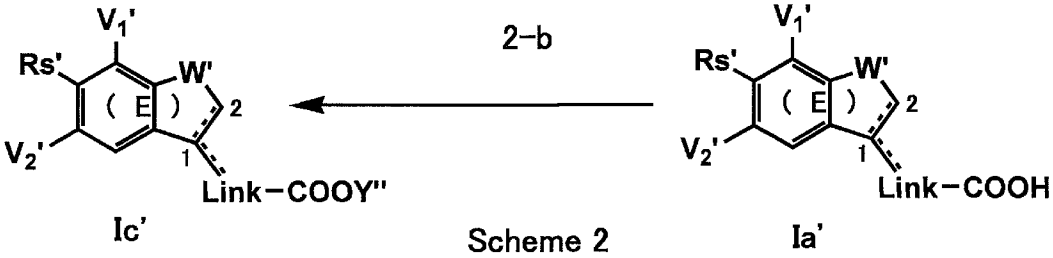
このようにして得られた化合物（Ia’）を遊離カルボン酸の状態で反応液から採取するには、極性溶媒が水溶性溶媒である場合には、該溶媒を留去し塩酸水などの無機酸にて中和後、残渣を非水溶性溶媒に溶解した後、弱酸性水溶液、水等で洗浄して、溶媒を留去することにより行うことが好ましい。極性溶媒が非水溶性溶媒である場合には、無機酸にて中和後、弱酸性水溶液、水等で洗浄した後、溶媒を留去することにより行うことが好ましい。

また反応後、化合物（Ia’）が用いた塩基との塩を形成して固体となる場合、これを常法により単離、精製することにより化合物（Ia’）の塩を得ることができる。

[0135] 〔製造法2〕（工程b）

次Scheme2；

[化5]



Scheme 2

で表されるように、本発明化合物（I）の一部であって、そのYがY”を示す一般式（Ic’）［式中、Rs’、V1’、V2’、W’、及びLinkは前記と同義であり、Y”は炭素数1～4個の低級アルキル基、－$(CH_2)_m$N$(R^{18})(R^{19})$又は－C$(R^{20})_2$OC(O)A^3R^{21}を示す］で表される化合物〔以下、単に「化合物（Ic’）」と称する〕は、化合物（Ib’）のカルボキシル基（基COOH）を常法によりエステル化することにより製造できる。

[0136] 化合物（Ic’）の製造方法として、たとえば化合物（Ib’）を無機ハロゲン化物と無溶

媒又は不活性溶媒中反応し、酸ハロゲン化物とした後、直接、あるいは不活性な溶媒に溶解したものを過剰量の目的のY"の水酸化物と反応する方法などが挙げられる。このときの無機ハロゲン化物としては塩化チオニル、塩化ホスホリル、五塩化リン、三塩化リンなどがあり、塩化チオニルが好ましい例である。使用する量は、通常は化合物(Ib')に対して1倍モル～大過剰が例示され、好ましくは1．5～5倍モルが例示される。ここで用いられる不活性溶媒としては、たとえば、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等のベンゼン類が例示される。これらは単独、あるいは混合溶媒として用いることが例示される。反応を促進するため触媒量のN，N－ジメチルホルムアミドを加えてもよい。反応温度は通常は室温～溶媒の還流温度までの適当な温度が選択される。

[0137] 目的のY"の水酸化物との反応に用いる不活性な溶媒としては、たとえば、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等のベンゼン類が例示されるが溶媒を使用せず過剰量のY"の水酸化物と反応することも可能である。反応温度は－10℃～室温までの適当な温度が選択される。

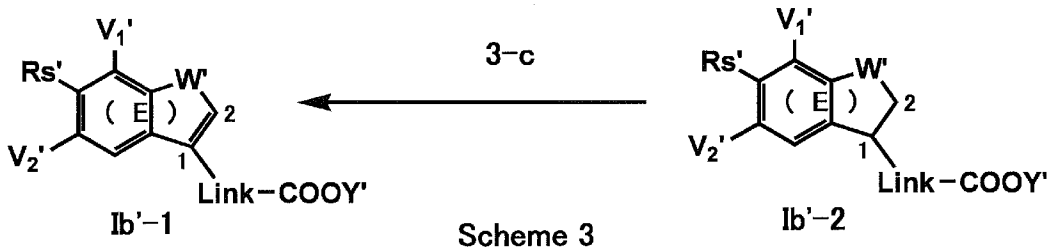
化合物(Ic')を製造するためのその他の方法として、たとえば、新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、1002頁に記載の「アルコールによるエステル化」、同書籍同巻、1002頁に記載の「O－アルキル化剤によるエステル化」、同書籍同巻、1008頁に記載の「ハロゲン化アルキルによるエステル化」、同書籍22巻、45頁に記載の「脱水剤を用いるエステル化反応」などが挙げられる。またV1、V2、及び環(E)中のWに上記反応条件において反応性のある水酸基又はアミノ基が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

このようにして製造した化合物(Ic')の基V1'、V2'、及び環(E)中のW'に水酸基又はアミノ基の保護基が存在するならば、これらの保護基を化合物(Ic')の製造と同時、又は順次に、前述の方法により脱保護化することで本発明化合物(I)に変換することができる。

[0138] 〔製造法3〕(工程c)

次Scheme3;

[化6]



Scheme 3

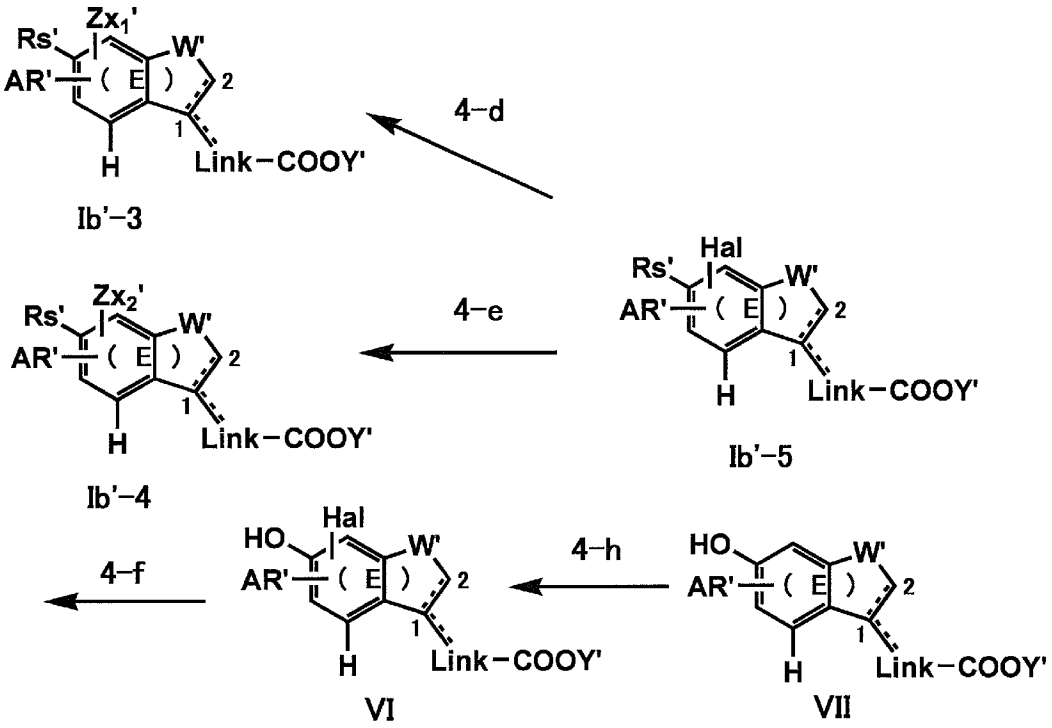
で示されるごとく、本発明化合物(I)の一部であって、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が二重結合を示す一般式(Ib'－1)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'、Link及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下、単に「化合物(Ib'－1)」と称する]は本発明化合物(I)の一部であって、環E上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合を示す一般式(Ib'－2)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'、Link及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下、単に「化合物(Ib'－2)」と称する]を脱水素反応せしめることにより製造することができる。

脱水素反応については、通常の文献、例えば新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、15巻、1088頁に記載の方法に準じて製造する方法などが挙げられる。たとえば白金、パラジウム、イリジウム、ロジウム、ニッケルなどの金属触媒や硫黄、セレンを用い、有機溶媒中加熱条件などがある。またベンゼン、テトラリン、ニトロベンゼン、オレイン酸、けい皮酸、マレイン酸など水素受容体を添加する方法、窒素、二酸化炭素を系中に通じる方法も例示される。金属触媒としてはパラジウム炭素、ロジウム／アルミナなどが例示され、有機溶媒としてはトルエン、トリグライム、シメンなどが例示される。

[0139] 〔製造法4〕

次Scheme4;

[化7]



Scheme 4

で表されるように、本発明化合物(I)のうちZxがZx1'を示し、Zx1'がNRn1Rn2もしくは保護されていてもよいアミノ基(−NH−R^{P4})を表す一般式(Ib'−3)(式中、Rs'、AR'、W'、Link及びY'は前記と同義であり、Hは水素原子を示す)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'−3)」と称する]及び、本発明化合物(I)のうちZxがZx2'を示し、Zx2'は炭素数1～4個の直鎖場若しくは分岐状飽和アルキル基を表す一般式(Ib'−4)(式中、Rs'、AR'、W'、Link、Y'、及びHは前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'−4)」と称する]は以下に示す方法でも製造することができる。また、基Rs、AR、Zx又は環(E)中のWに下記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基等が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

[0140] 〔製造法4〕(工程d)

化合物(Ib'−3)は、本発明化合物(I)の一部であって、基Halが臭素原子、塩素原子、ヨウ素原子いずれかのハロゲン原子を表す一般式(Ib'−5)(式中、Rs'、AR'、W'、Link、Y'、及びHは前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物Ib'−5」と称する]から、たとえば文献[Buchwaldら、Journal of American c

hemical society、1994年、7901頁、Hartwigら、Journal of American chemical society、1994年、5969頁]などに記載のBuchwald－Hartwig反応によっても製造することができる。すなわち化合物(Ib'－5)と置換基Z1'となる市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能な置換アミン[－NH(Rn1)(Rn2)]または保護されていてもよいアミン[－NH(R^{P4})]などを有機溶媒中1，1'－ビス(ジフェニルホスフィノ)－フェロセン、2，2'－ビス(ジフェニルホスフィノ)－1，1'－ビナフチル、2－(ジ－t－ブチルホスフィノ)－ビフェニル、2－(ジシクロヘキシルホスフィノ)－2'－(N，N－ジメチルアミノ)－ビフェニル、4，5－ビス(ジフェニルホスフィノ)－9，9'－ジメチルキサンチン、トリフェニルホスフィン、トリ－o－トリルホスフィン、トリ－t－ブチルホスフィンなどのホスフィン配位子と酢酸パラジウム、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、塩化パラジウム、[1，1'－ビス(ジフェニルホスフィノ)－フェロセン]ジクロロパラジウムジクロロメタン錯体などのパラジウム触媒、及びリン酸カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウムt－ブトキシド、ナトリウムt－ブトキシド、フッ化セシウム、フッ化カリウム、水酸化バリウム、トリエチルアミンなどの塩基存在下反応させることにより得る方法がある。パラジウムの価数は0であっても＋2であってもよい。溶媒はトルエン、キシレン、ヘキサンなどの炭化水素系溶媒、ジメチルホルムアミドなどのアミド系溶媒、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルなどのエーテル系溶媒が例示され、必要に応じてこれらを混合して用いることができる。

[0141] 〔製造法4〕(工程e)

化合物(Ib'－4)は化合物(Ib'－5)からたとえば文献[第4版実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、25巻、403頁]に記載のSuzuki反応を行うことにより製造することもできる。すなわち化合物(Ib'－5)と置換基Z2'となる市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能なボロン酸誘導体を有機溶媒中、市販のパラジウム触媒又はパラジウム錯体と配位子とから調製される触媒及び塩基の存在下反応することが挙げられる。

パラジウム触媒は、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、テトラキス(メチルジフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジ

クロロビス(トリ－o－トリルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリシクロヘキシルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリエチルホスフィン)パラジウム、酢酸パラジウム、塩化パラジウム、塩化ビス(アセトニトリル)パラジウム、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、塩化ビス(ジフェニルホスフィノフェロセン)パラジウムなど市販されている触媒を購入してそのまま反応系中に加えてもよいし、酢酸パラジウムやトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウムなどと任意の配位子から別途調製、単離した触媒を加えてもよい。また、酢酸パラジウムやトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウムなどと任意の配位子を混合することによって反応系中で実際に反応に関与すると考えられる触媒を調製してもよい。パラジウムの価数は0であっても＋2であってもよい。配位子としては、トリフェニルホスフィン、トリ(o－トリル)ホスフィン、トリ(シクロヘキシル)ホスフィン、トリ(t－ブチル)ホスフィン、ジシクロヘキシルフェニルホスフィン、1，1'－ビス(ジ－t－ブチルホスフィノ)フェロセン、2－ジシクロヘキシルホスフィノ－2'－ジメチルアミノ－1，1'－ビフェニル、2－(ジ－t－ブチルホスフィノ)ビフェニルなどのホスフィン配位子及びイミダゾル－2－イリデンカルベン類などのホスフィンミミック配位子などが例示される。

[0142] 塩基としては炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、フッ化セシウム、フッ化カリウム、リン酸カリウム、酢酸カリウム、トリエチルアミン、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、リチウムメトキシドなどを用いることが例示される。

反応系としては、水－有機溶媒の2相系、含水有機溶媒あるいは有機溶媒の均一系いずれであってもよい。有機溶媒としては、トルエン、キシレン、ヘキサンなどの炭化水素系溶媒、塩化メチレンなどのハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミドなどのアミド系溶媒、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジグライムなどのエーテル系溶媒、メタノール、エタノールなどのアルコール系溶媒、アセトニトリルなどのニトリル系溶媒、アセトン、シクロヘキサノンなどのケトン系溶媒、酢酸エチルなどのエステル系溶媒、ピリジンなどのヘテロ環系溶媒などを用いることが例示される。また、2種類以上の有機溶媒を混合して用いてもよい。

[0143] 反応条件については、[宮浦憲夫、鈴木章、Chemical Review、1995年、95巻、2457頁、及びV. Snieckus、Chemical Review、1990年、90巻、879頁]など

やこれら文献記載の参考文献を参照することができる。

さらに、上記反応で二重結合が生成する場合、必要に応じて生成した二重結合を通常の化学文献記載の還元反応を用いて単結合とし製造することもできる。たとえば、メタノールなどアルコール系溶媒や酢酸エチルなどエステル系溶媒の単独又は混合溶媒中、パラジウム炭素粉末、酸化白金(PtO_2)、活性化ニッケルなどの触媒存在下、水素ガス、ギ酸アンモニウム、ヒドラジン水和物などの水素源を用いて水素添加し、二重結合を単結合に変化する方法などがある。

基AR、Rsあるいは環(E)中のW中に、上記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

[0144] 〔製造法4〕(工程f)

化合物(Ib'－5)は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(VI)(式中、AR'、W'、Link、Y'、H、及びHalは前記と同義であり、OHは水酸基を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(VI)」と称する〕を以下に示すいずれかの方法で製造することができる。

〔製造法4〕(工程f－1)

化合物(VI)から化合物(Ib'－5)を製造する方法としては、たとえば化合物(VI)をアルキル化剤;

Rx－G (XXX)

(式中、Rxは前記と同義であり、Gは塩素、臭素、ヨウ素、メシラート基、トリフラート基又はアレーンスルホネート基を表す)で表される化合物〔以下、単に「アルキル化剤」と称する〕と反応することにより製造することができる。たとえば不活性溶媒中、適当な塩基の存在下反応する方法が挙げられる。

ここで用いるアルキル化剤としては、市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能なアルキル又はアリールのヨウ化物、臭化物、塩化物、あるいはアルキルアルコール又はアリールアルコールを常法によりメシル化、アレーンスルホニル化、トリフルオロメタンスルホニル化して得られるアルキル又はアリールの硫酸エステルなどが挙げられる。この反応に用いる不活性溶媒としては、たとえばメタノール、

エタノール等のアルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等のベンゼン類、N, N－ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、アセトン等が挙げられ、必要に応じてこれらを混合して用いることができる。ここで用いる塩基としては、たとえば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、カリウムt－ブトキシド等のアルカリ金属化合物、ピリジン、4－ジメチルアミノピリジン、1, 8－ジアザビシクロ〔5, 4, 0〕－ウンデセン、トリメチルアミン、トリエチルアミン等の有機第3級アミンが例示される。反応の進行が遅い場合、必要に応じて原料に対して0．1～1．5倍モルのヨウ化カリウム、銅粉末などの触媒を加えてもよい。

[0145] 〔製造法4〕(工程f－2)

一方、化合物(VI)から化合物(Ib'－5)はたとえば文献[O. Mitsunobu、SYNTHESIS、1981年、1頁]記載の光延反応によっても製造することができる。すなわち化合物(Ib'－5)と置換基Rxとなる市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能なアルキルアルコール(RxOH)を有機溶媒中トリフェニルホスフィン、トリブチルホスフィン等のホスフィン類とアゾジカルボン酸ジエチル、アゾジカルボン酸ジイソプロピル、N, N, N', N'－テトラメチルアゾジカルボキサミド、1, 1'－(アゾジカルボニル)ジピペリジン、N, N, N', N'－テトライソプロピルカルボキサミド等のアゾ化合物の存在下反応させることにより得る方法がある。溶媒はジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、塩化メチレンなどのハロゲン系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン等のベンゼン類が例示され必要に応じてこれらを混合して用いることができる。

[0146] 〔製造法4〕(工程f－3)

化合物(Ib'－5)は第4版実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、20巻、200頁に記載のごとく、化合物(VI)のフェノール性水酸基に酸触媒存在下、市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能なアルケンを付加することで置換基Rxに変化せしめ製造することも例として挙げられる。ここで用いるアルケンとしては、たとえばイソブチレン、シクロペンテン、シクロヘキセン、シクロヘプテンや置換されているかあるいは無置換のスチレン、α－メチルスチレンなどの芳香環を持

つアルケンなどが挙げられる。使用する酸触媒としては塩酸、硫酸などの鉱酸、三フッ化ホウ素（溶媒コンプレックスも含む）、テトラフルオロホウ酸、トリフルオロスルホン酸などを用いることが例示される。溶媒はジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、塩化メチレンなどのハロゲン系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン等のベンゼン類が例示され必要に応じてこれらを混合して用いることができる。また反応せしめるアルケンを溶媒として使用することもある。

[0147] 〔製造法4〕（工程f－4）

化合物（Ib'－5）のうち置換基Rxが前述の基Rbを示しA^1及びA^2がともに単結合を示す化合物は第4版実験化学講座（日本化学会編、丸善株式会社出版）、20巻、191頁に記載のごとく、化合物（VI）とハロゲン化アリールを塩基性条件下で反応せしめることにより製造する方法が挙げられる。ここで用いるハロゲン化アリールとしては市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能な置換されているかあるいは無置換のアリールの塩化物、臭化物あるいはヨウ化物が挙げられ臭化物あるいはヨウ化物が好ましい。又はハロゲン化アリールの替わりにアリールトリフラートを用いてもよい。ここで用いる塩基としては、たとえば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、カリウムt－ブトキシド等のアルカリ金属化合物、ピリジン、4－（ジメチルアミノ）ピリジン、1，8－ジアザビシクロ〔5，4，0〕－ウンデセン、トリメチルアミン、トリエチルアミン等の有機第3級アミンが例示される。反応に触媒として銅粉、ハロゲン化第一銅あるいは銅アルコキシドを加えることもある。また相間移動触媒やクラウンエーテルを加えることも例として挙げられる。反応溶媒としてはトルエン、キシレン、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ニトロベンゼンなどの炭化水素系溶媒、ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミドなどのアミド系溶媒、ジオキサン、ジグライムなどのエーテル系溶媒、ピリジンなどのヘテロ環系溶媒などを用いることができる。

また化合物（Ib'－5）のうち置換基Rxが基Rbを示しA^1及びA^2がともに単結合を示す化合物は文献［辻（J. Tsuji）、有機合成協会誌2001年、59巻、6号、609頁］に記載の方法、あるいは当文献記載の参考文献に準じて製造する方法も挙げられる。すなわち化合物VIを溶媒中、市販のパラジウム触媒又はパラジウム錯体と配位子か

ら調製される触媒と、塩基の存在下、市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能なハロゲン化アリールあるいはアリールトリフラートと反応することにより得ることができる。

[0148] パラジウム触媒は、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、テトラキス(メチルジフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリ－o－トリルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリシクロヘキシルホスフィン)パラジウム、ジクロロビス(トリエチルホスフィン)パラジウム、酢酸パラジウム、塩化パラジウム、塩化ビス(アセトニトリル)パラジウム、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、塩化ビス(ジフェニルホスフィノフェロセン)パラジウムなど市販されている触媒を購入してそのまま反応系中に加えてもよいし、酢酸パラジウムやトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウムなどと任意の配位子から別途調製、単離した触媒を加えてもよい。また、酢酸パラジウムやトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウムなどと任意の配位子を混合することによって反応系中で実際に反応に関与すると考えられる触媒を調製してもよい。パラジウムの価数は0であっても＋2であってもよい。配位子としては、トリフリルホスフィン、トリ(o－トリル)ホスフィン、トリ(シクロヘキシル)ホスフィン、トリ(t－ブチル)ホスフィン、ジシクロヘキシルフェニルホスフィン、1，1'－ビス(ジ－t－ブチルホスフィノ)フェロセン、2－ジシクロヘキシルホスフィノ－2'－ジメチルアミノ－1，1'－ビフェニル、2－(ジ－t－ブチルホスフィノ)ビフェニルなどのホスフィン配位子及びイミダゾル－2－イリデンカルベン類などのホスフィンミミック配位子などが例示される。

塩基としては炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、フッ化セシウム、フッ化カリウム、リン酸カリウム、酢酸カリウム、トリエチルアミン、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、リチウムメトキシドなどを用いることが例示される。

有機溶媒としては、トルエン、キシレン、ヘキサンなどの炭化水素系溶媒、塩化メチレンなどのハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミドなどのアミド系溶媒、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジグライムなどのエーテル系溶媒、ピリジンなどのヘテロ環系溶媒などが例示される。また、2種類以上の有機溶媒を混合して用いてもよい。

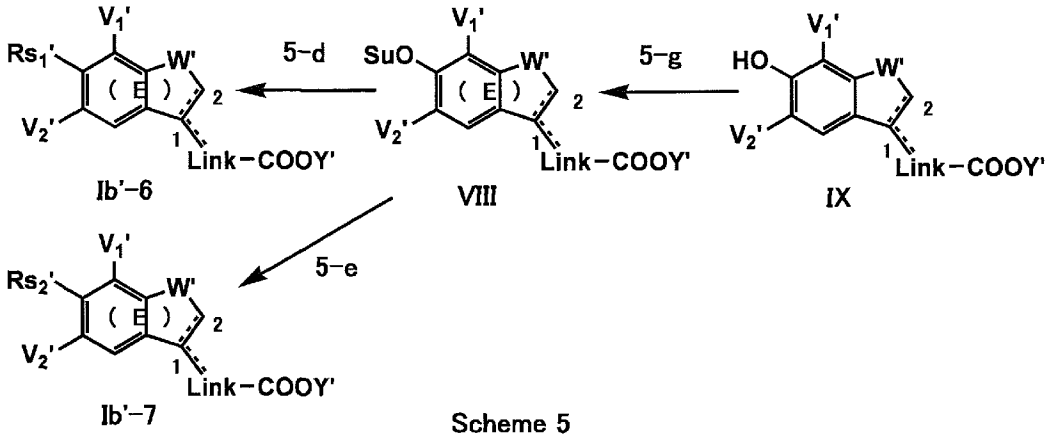
〔製造法4〕(工程h)

化合物(VI)は、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(VII)(式中、AR'、W'、Link、Y'、H、及び基OHは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(VII)」と称する〕をハロゲン化することにより製造することができる。ハロゲン化のうち塩素化については通常の化学文献、たとえば新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)14巻、354頁に記載の方法で製造する方法が挙げられる。たとえば塩素(Cl_2)による方法、塩化スルフリルによる方法などがある。また臭素化については通常の化学文献、たとえば新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、354頁に記載の方法で製造する方法が挙げられる。たとえば臭素(Br_2)による方法、N－ブロモスクシンイミドによる方法などがある。またヨウ素化については、通常の化学文献、たとえば新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、423頁に記載の方法で製造する方法が挙げられる。たとえばヨウ素(I_2)による方法、三ヨウ化カリウムによる方法などがある。

[0149] 〔製造法5〕

次Scheme5;

[化8]



Scheme 5

で表されるように、本発明化合物(I)のうちRs'がRs1'を示し、Rs1'は保護されていてもよい基[－N(Ry)(Rz)]を示すか、または保護されていてもよい基Rb中A1が単結合をA2が[－N(R4)]を示す一般式(Ib'－6)(式中、V1'、V2'、W'、Link、及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'－6)」と称する

]及び本発明化合物(I)のうちRs'がRs2'を示し、Rs2' は単結合－Rx'を示す一般式(Ib'－7)(式中、V1'、V2'、W'、Link、及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'－7)」と称する]は以下に示す方法でも製造することができる。また、基Rs、V1、V2又は環(E)中のWに下記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基等が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

[0150] 〔製造法5〕(工程d)

化合物(Ib'－6)は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(VIII)(式中、V1'、V2'、W'、Link、及びY'は前記と同義であり、基SuOはメタンスルホネート基、トリフルオロメタンスルホネート基、又は芳香環部分が1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されてもよいアレーンスルホネート基を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(VIII)」と称する〕から製造法4の工程dで示した方法で置換基Rs1'となる市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能な置換アミンを導入することにより製造することができる。

〔製造法5〕(工程e)

化合物(Ib'－7)は化合物(VIII)から製造法4の工程eで示した方法で置換基Rs2'となる市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能なボロン酸誘導体を反応することにより製造することができる。

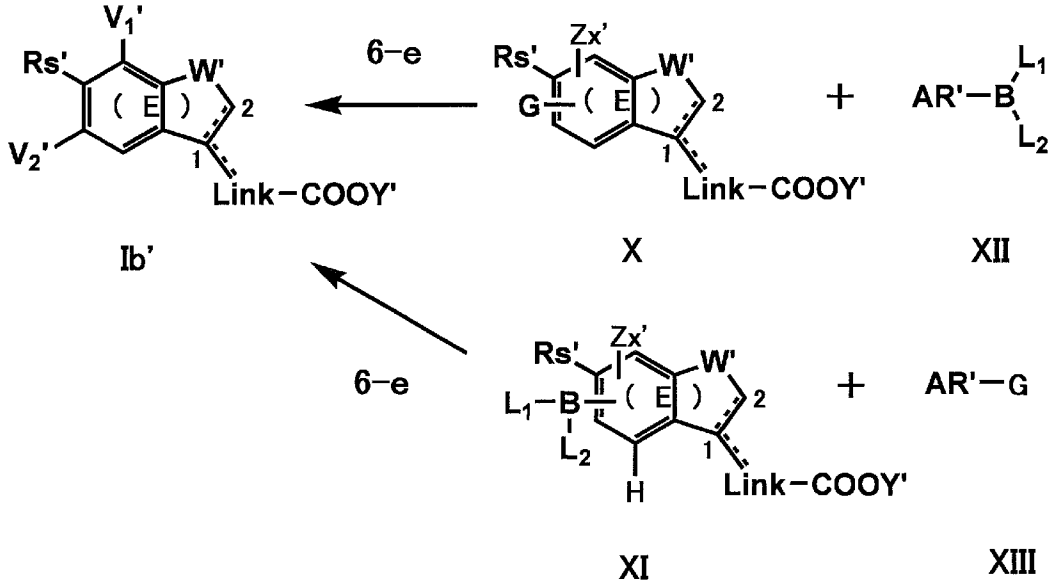
〔製造法5〕(工程g)

化合物(VIII)は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(IX)(式中、V1'、V2'、W'、Link、Y'、及び基OHは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(IX)」と称する〕をスルホン酸エステル化することにより製造することができる。スルホン酸エステル化については、通常の化学文献、たとえば新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、1793頁に記載の方法で製造する方法が挙げられる。たとえばスルホン酸クロリドによる方法、無水スルホン酸による方法などがある。

[0151] 〔製造法6〕(工程e)

次Scheme6;

[化9]



Scheme 6

で表されるように、化合物(Ib')は、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(X)(式中、Rs'、Zx'、G, W'、Link、及びY'は前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(X)」と称する〕と一般式(XII)で表されるボロン酸誘導体(式中、AR'は前記と同義であり、Bはホウ素原子を示す、またL^1及びL^2はそれぞれ独立に水酸基、炭素数1ないし8個のアルコキシ基(たとえばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、シクロヘキシルオキシ基)、又は置換若しくは無置換フェニルオキシ基を示すか、あるいはL^1とL^2とが互いに結合してホウ素原子を含む環[この環は飽和又は不飽和どちらでもよく、ホウ素以外のヘテロ原子(たとえば酸素原子)を含む環であってもよく、またこれらの環上はさらに置換されていてもよい]を形成したアリールホウ酸の5又は6員環環状エステル(たとえば9−ボラビシクロ[3, 3, 1]ノナン、1, 3, 2−ジオキサボロラン、4, 4, 5, 5−テトラメチル−1, 3, 2−ジオキサボロラン)を示す。)〔以下、単に「化合物(XII)」と称する〕と反応せしめることで製造することもできる。また化合物(Ib')の製造方法としては、一般式(XI)(式中、Rs'、Zx'、W'、Link、Y'、B、L1、L2は前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XI)」と称する〕と一般式(XIII)で表される化合物(式中、AR'及びGは前記と同義である)〔以下、単に「化合物(XIII)」と称する〕との組

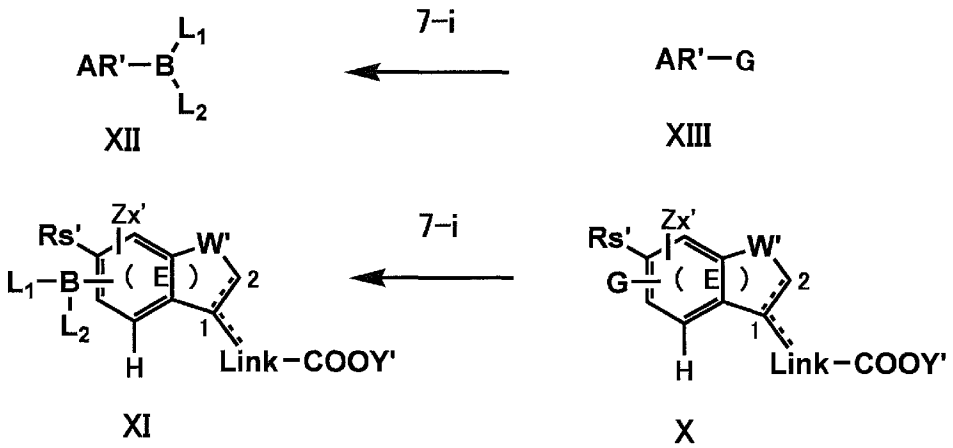
み合わせで反応せしめる方法も挙げられる。

すなわちScheme6で表される双方あるいはいずれかの組み合わせで、製造法4の工程eで示した方法に従って製造することができる。

[0152] 〔製造法7〕(工程i)

化合物(XII)及び化合物(XI)は、市販されている試薬を用いるか、または次Scheme7;

[化10]



Scheme 7

で表されるように、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる、化合物(XIII)(式中、AR'、及びGは前記と同義である)〔以下、単に「化合物(XIII)」と称する〕及び化合物(X)(Rs'、G、W'、Link、Y'及びHは前記と同義である)〔以下、単に「化合物(X)」と称する〕を前述の文献[Chemical Review、1995年、95巻、2457頁]又は[Y. Satohら、SYNTHESIS、1994年、1146頁]に記載の方法あるいはこれら文献記載の参考文献に準じて製造することができる。また、基Rs、Zx、又は環(E)中のWに下記反応条件において反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基等が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

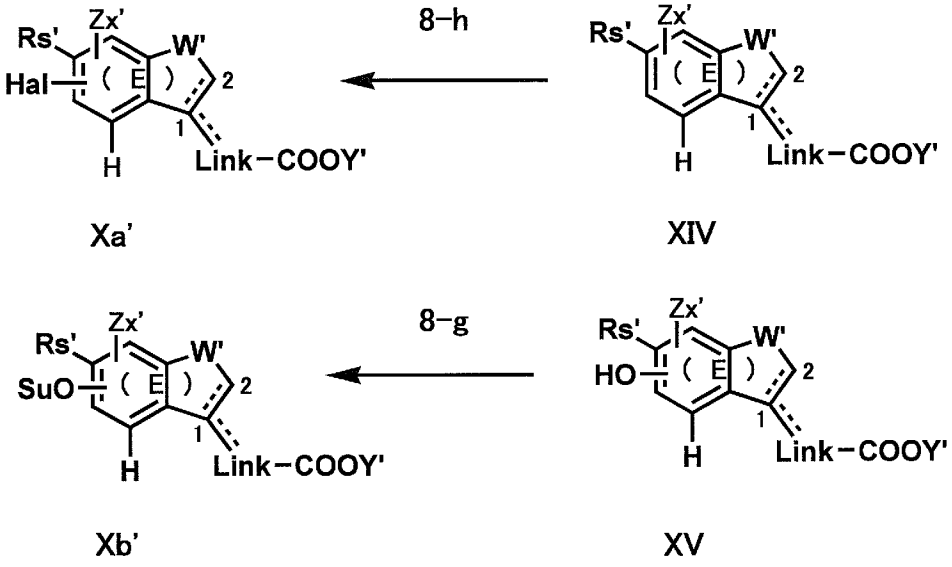
たとえば化合物(XIII)及び化合物(X)をn-ブチルリチウム、t-ブチルリチウムなどのアルキルリチウムでリチオ化せしめた後、トリアルキルボレイトと反応、塩酸、硫酸、リン酸などの鉱酸で処理することで化合物(XII)及び化合物(XI)を調製する方法、化合物(XIII)及び化合物(X)と(アルコキシ)ジボロンをパラジウム触媒、塩基存在下、クロスカップリング反応を行うことにより化合物(XII)及び化合物(XI)を調製する

方法などが挙げられる。

[0153] 〔製造法8〕(工程d)

次Scheme8;

[化11]



Scheme 8

で表されるように、化合物(X)のうちGが塩素原子、臭素原子あるいはヨウ素原子などのハロゲン原子を示す一般式(Xa')(式中、Rs'、Zx'、W'、Link、Y'、及び基Halは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(Xa')」と称する〕及び化合物(X)のうちGがメシラート基、トリフラート基あるいはアレーンスルホネート基などのスルホン酸エステル基を示す一般式(Xb')(式中、Rs'、Zx'、W'、Link、Y'、及び基SuOは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(Xb')」と称する〕は以下の方法で製造することができる。また、基Rs、Zx、又は環(E)中のWに下記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基等が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

[0154] 〔製造法8〕(工程h)

化合物(Xa')は、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XIV)で表される化合物(式中、Rs'、Zx'、W'、Link、Y'、及びHは前記と同義である)〔以下、単に「化合物(XIV)」と称する〕を製造法4の工程hの方法に準

じてハロゲン化することにより製造することもできる。

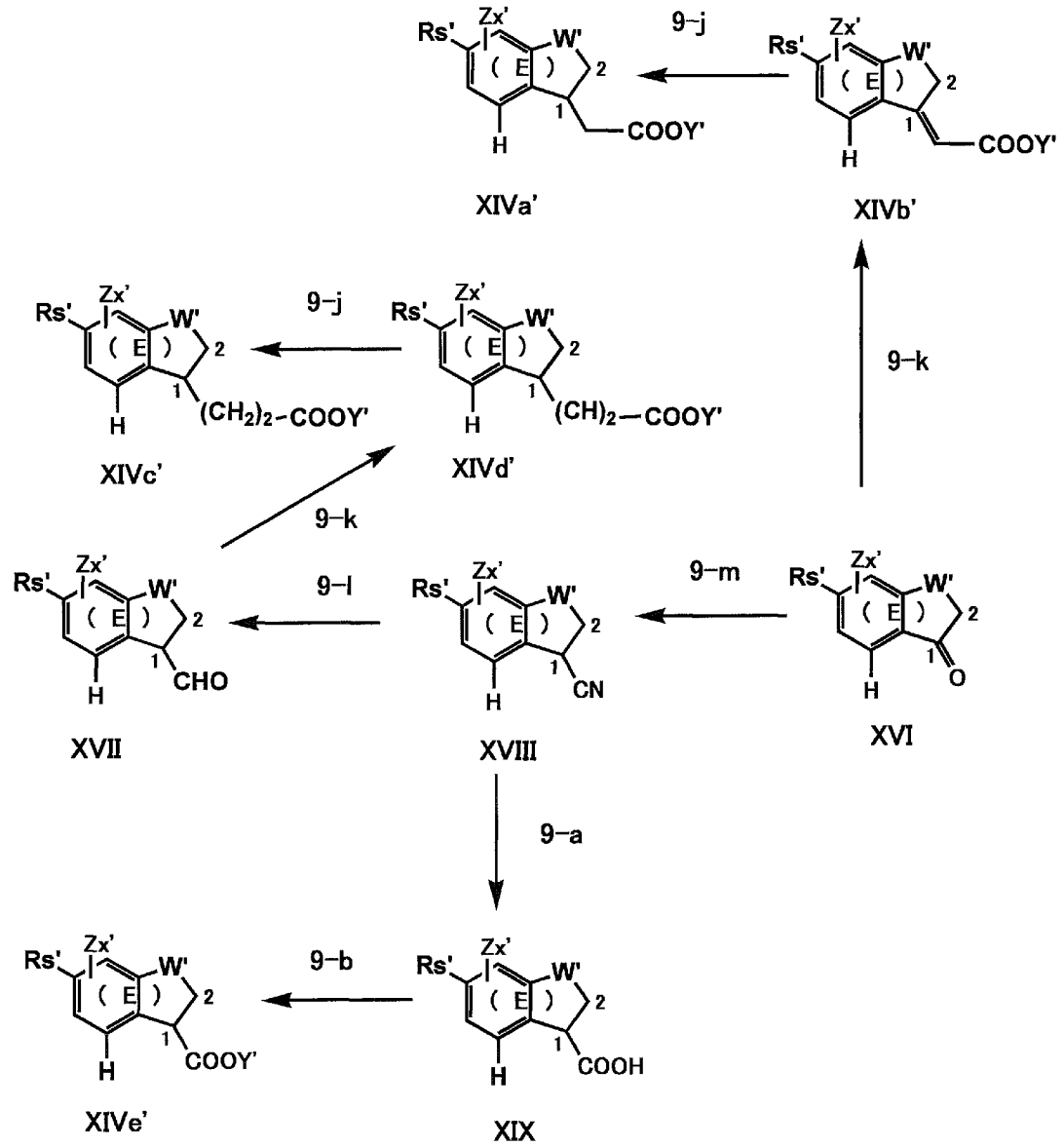
〔製造法8〕(工程g)

化合物(Xb')は、市販の又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XV)で表される化合物(式中、Rs'、Zx'、W'、Link、Y'、及びHは前記と同義であり、基OHは水酸基を示す)〔以下、単に「化合物(XV)」と称する〕を製造法5の工程gの方法に準じてスルホン酸エステル化することにより製造することもできる。

[0155] 〔製造法9〕

次Scheme9;

[化12]



Scheme 9

で表されるように、前述の化合物(XIV)のうちLinkが炭素数1個の飽和炭化水素を示す一般式(XIVa')(式中、Rs'、Zx'、W'、Y'、及びHは前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(XIVa')」と称する]、Linkが炭素数1個の不飽和炭化水素を示す一般式(XIVb')(式中、Rs'、Zx'、W'、Y'、及びHは前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(XIVb')」と称する]、Linkが炭素数2個の飽和炭化水素を示す一般式(XIVc')(式中、Rs'、Zx'、W'、Y'、及びHは前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(XIVc')」と称する]、Linkが炭素数2個の不飽和炭化水素を示す一般式(XIVd')(式中、Rs'、Zx'、W'、Y'、

及びHは前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(XIVd')」と称する]、及びLinkが単結合を示す一般式(XIVe')(式中、Rs'、Zx'、W'、Y'、及びHは前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(XIVe')」と称する]は以下に示す方法を組み合わせることでも製造することができる。また、基Rs、Zx又は環(E)中のW中に下記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基等が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

[0156] 〔製造法9〕(工程j)

化合物(XIVa')及び化合物(XIVc')は化合物(XIVb')及び化合物(XIVd')の二重結合を通常の化学文献記載の還元反応を用いて単結合とすることで製造できる。たとえば、メタノール、エタノールなどアルコール系溶媒や酢酸エチルなどエステル系溶媒等の単独又は混合溶媒中、パラジウム炭素粉末、酸化白金(PtO_2)、活性化ニッケルなどの触媒存在下、水素ガス、ギ酸アンモニウム、ヒドラジン水和物などの水素源を用いて水素添加し、化合物(XIVb')及び化合物(XIVd')の二重結合を単結合に変化する方法などがある。

〔製造法9〕(工程k)

化合物(XIVb')及び化合物(XIVd')は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XVI)(式中、Rs'、Zx'W'、及びHは前記と同義であり、Oは酸素原子を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XVI)」と称する〕及び一般式(XVII)で表される化合物(式中、Rs'、Zx'W'、及びHは前記と同義であり、基CHOはアルデヒド基を示す)〔以下、単に「化合物(XVII)」と称する〕から以下に示すいずれかの方法で製造することができる。

[0157] 〔製造法9〕(工程k－1)

たとえば、新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、238頁に記載のホーナー・エモンズ反応により製造する方法が挙げられる。すなわち、化合物(XVI)または化合物(XVII)をメタノール、エタノールなどのアルコール系溶媒やテトラヒドロフラン、ジメトキシエタンなどのエーテル系溶媒などの不活性溶媒中、水素化ナトリウム、ナトリウムアルコキシドなどの塩基の存在下、市販、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できるジアルキルホスホノ酢酸エステルと反応すること

により得ることができる。

〔製造法9〕(工程k－2)

一方、実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、第4版、25巻、73頁に記載のReformatsky反応により製造する方法も挙げられる。すなわち、化合物(XVI)または化合物(XVII)をベンゼン、トルエン、キシレン等のベンゼン類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類などの不活性溶媒中、亜鉛粉末存在下、市販、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できるα－ハロエステルと反応することにより得ることができる。また必要に応じてヨウ素片、塩化銅を加える方法や、超音波処理する方法も例示される。

[0158] 〔製造法9〕(工程k－3)

あるいは、新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、1045頁に記載のWittig反応により製造する方法も挙げられる。すなわち化合物(XVI)または化合物(XVII)をベンゼン、トルエン、キシレン等のベンゼン類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類などの不活性溶媒中、市販、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できるカルボアルコキシトリフェニルホスホランと反応することにより得ることができる。

〔製造法9〕(工程l)

化合物(XVII)は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XVIII)(式中、Rs'、Zx'、W'、及びHは前記と同義であり、基CNはシアノ基を表す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XVIII)」と称する〕から、たとえば実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、第4版、21巻、89頁に記載の方法により製造することができる。すなわち、化合物(XVIII)にベンゼン、トルエン、キシレン等のベンゼン類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類などの不活性溶媒中、水素化リチウムアルミニウム、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化トリエトキシアルミニウムナトリウム、水素化トリエトキシアルミニウムリチウム、水素化ジエトキシアルミニウムリチウム等の水素化アルミニウム試薬を作用させることにより製造することができる。

[0159] 〔製造法9〕(工程m)

化合物(XVIII)は化合物(XVI)から、以下に示すいずれかの方法で合成することもできる。

〔製造法9〕(工程m－1)

たとえば文献[Dalkoら、Journal of organic chemistry、1998年、8107頁, Crombieら、Journal of chemical society PERKIN TRANSI、1982年、1477頁]記載の方法に従って製造することができる。すなわち化合物(XVI)にテトラヒドロフラン、ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテルなどのエーテル系溶媒中、市販のp－トリルスルホニルメチルイソシアニドをカリウムt－ブトキシド、ナトリウムエトキシド等の塩基存在下反応させることによって製造することもできる。

〔製造法9〕(工程m－2)

一方、化合物(XVI)を第4版実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、20巻、445頁に記載の方法に従って製造することもできる。すなわち、トリメチルシリルシアニドとルイス酸、とくにヨウ化亜鉛を触媒としてテトラヒドロフランなどの不活性溶媒中反応せしめる。その後、第4版実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、26巻、197頁に記載のヒドロシランによる還元反応を行う。還元反応の例としては、ジクロロメタンなどのハロゲン化溶媒中、トリエチルシランなどのヒドロシランとトリフルオロ酢酸などのプロトン酸、あるいはトリフッ化ホウ素などのルイス酸とで還元せしめる方法などがある。

[0160] 〔製造法9〕(工程b)

化合物(XIVe')は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XIX)(式中、Rs'、Zx'、W'、及びHは前記と同義であり、基COOHはカルボキシル基を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XIX)」と称する〕を製造法2の工程bの方法に準じてエステル化することにより製造することができる。

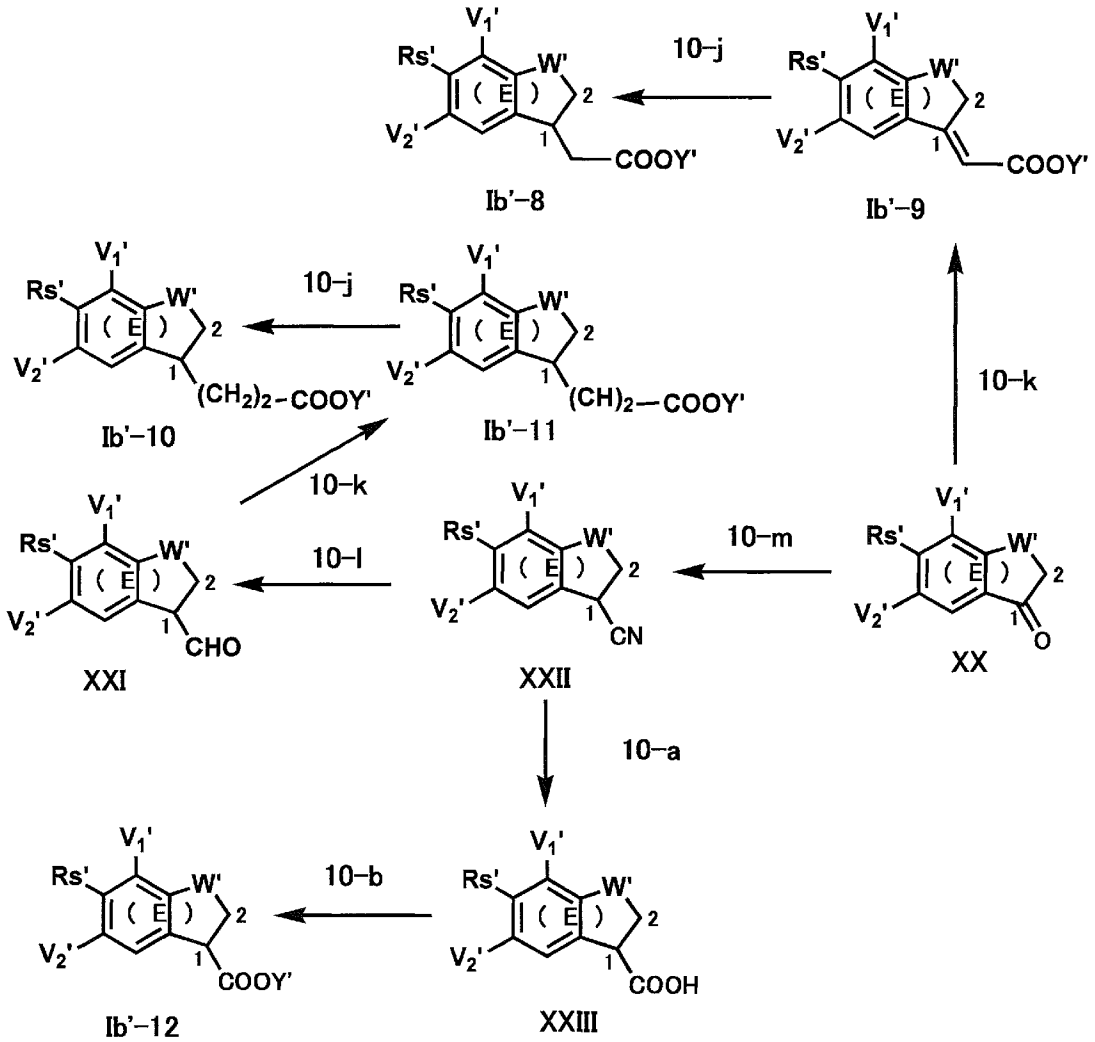
〔製造法9〕(工程a)

化合物(XIX)は化合物(XVIII)から製造法1の工程aの方法に準じて加水分解することにより製造することができる。

[0161] 〔製造法10〕

次Scheme10;

[化13]



Scheme 10

で表されるように、本発明化合物(I)の一部であって、Linkが炭素数1個の飽和炭化水素を示す一般式(Ib'－8)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'、及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'－8)」と称する]、Linkが炭素数1個の不飽和炭化水素を示す一般式(Ib'－9)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'、及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'－9)」と称する]、Linkが炭素数2個の飽和炭化水素を示す一般式(Ib'－10)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'、及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'－10)」と称する]、Linkが炭素数2個の不飽和炭化水素を示す一般式(Ib'－11)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'、及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'－11)」と称する]、及びLinkが単結合を示す一般式(Ib'－12)(式中、Rs'

、V1'、V2'、W'、及びY'は前記と同義である)で表される化合物[以下単に「化合物(Ib'－12)」と称する]は以下に示す方法を組み合わせることでも製造することができる。また、基V1、V2又は環(E)中のWに下記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基等が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

[0162] 〔製造法10〕(工程j)

化合物(Ib'－8)及び化合物(Ib'－10)は化合物(Ib'－9)及び化合物(Ib'－11)の二重結合を製造法9の工程jの方法に準じて還元することで製造できる。

〔製造法10〕(工程k)

化合物(Ib'－9)及び化合物(Ib'－11)は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XX)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'及びOは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XX)」と称する〕、及び一般式(XXI)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'及び基CHOは前記と同義である)で表される化合物(〔以下、単に「化合物(XXI)」と称する〕から製造法9の工程kの方法に準じて製造することができる。

〔製造法10〕(工程l)

化合物(XXI)は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XXII)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'及び基CNは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXII)」と称する〕から製造法9の工程lの方法に準じて製造することができる。

[0163] 〔製造法10〕(工程m)

化合物(XXII)は化合物(XX)から製造法9の工程mの方法に準じて製造することができる。

〔製造法10〕(工程b)化合物(Ib'－12)は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XXIII)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'及び基COOHは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXIII)」と称する〕を製造法2の工程bの方法に準じてエステル化することにより製造することができる。

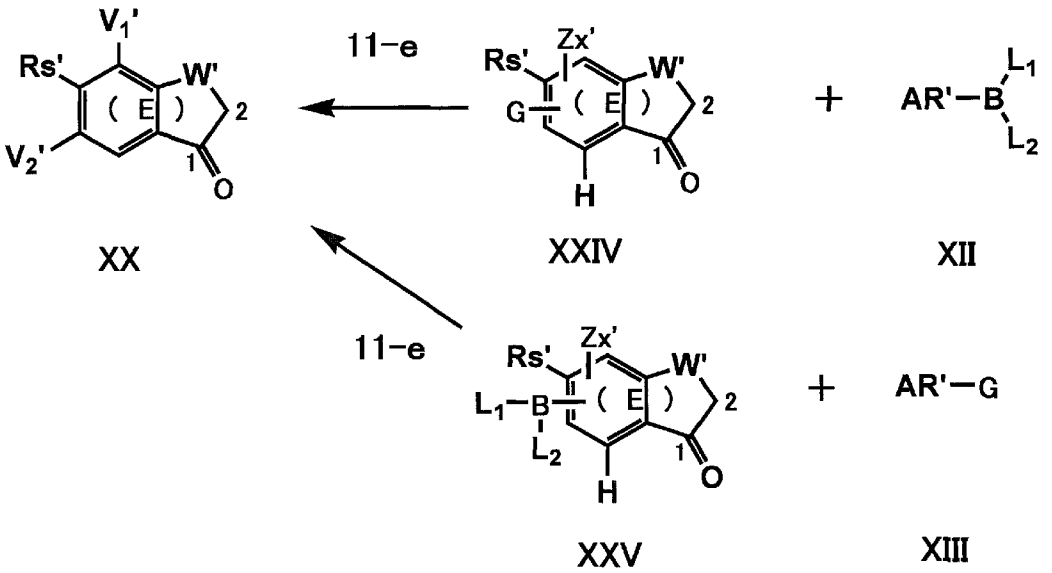
〔製造法10〕(工程a)

化合物(XXIII)は化合物(XXII)から製造法1の工程aの方法に準じて加水分解することにより製造することができる。

[0164] 〔製造法11〕(工程e)

次Scheme11;

[化14]



Scheme 11

で表されるように、化合物(XX)は、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XXIV)(式中、Rs'、Zx'、G、W'、H、及びOは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXIV)」と称する〕と化合物(XII)とを反応せしめることにより製造することができる。

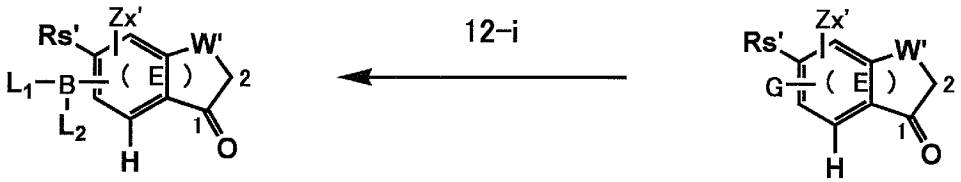
[0165] また化合物(XX)の製造方法としては、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XXV)(式中、Rs'、Zx'B、L1'、L2'、W'、H、及びOは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXV)」と称する〕と化合物(XIII)との組み合わせで反応せしめる方法も挙げられる。

すなわちScheme6で表される双方あるいはいずれかの組み合わせで、製造法4の工程eで示した方法に従って製造することができる。

[0166] 〔製造法12〕(工程i)

次Scheme12;

[化15]



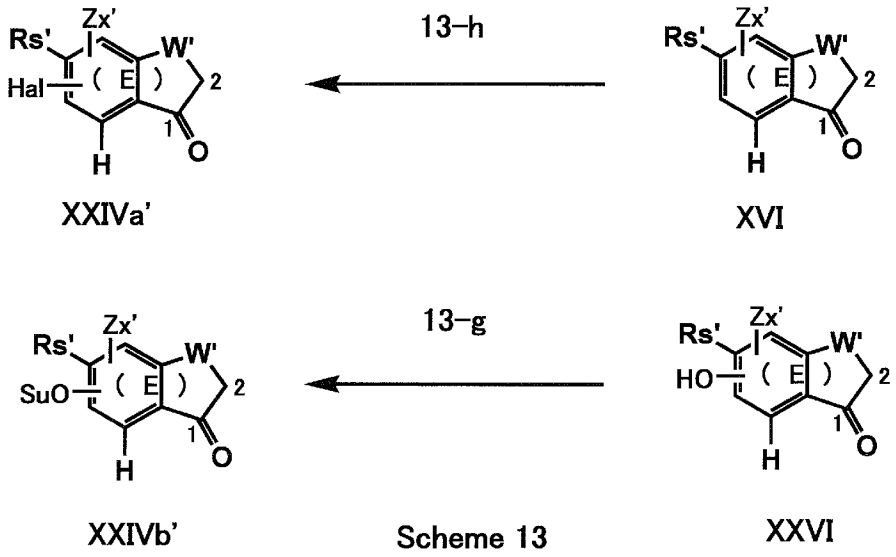
XXV Scheme 12 XXIV

で表されるように、化合物(XXV)は化合物(XXIV)から前述の製造法7の工程iの方法に準じて製造することができる。

[0167] 〔製造法13〕

次Scheme13;

[化16]



XXIVa' XVI

XXIVb' Scheme 13 XXVI

で表されるように化合物(XXIV)のうちGが塩素原子、臭素原子あるいはヨウ素原子などのハロゲン原子を示す一般式(XXIVa')(式中、Rs'、Zx'、W'、H、O、及び基Halは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXIVa')」と称する〕、及び化合物(XXIV)のうちGがメシラート基、トリフラート基あるいはアレーンスルホネート基などのスルホン酸エステル基を示す一般式(XXIVb')(式中、Rs'、Zx'、W'、H、O、及び基SuOは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXIVb')」と称する〕は以下の方法で製造することができる。また、基Rs、Zx又は環(E)中のWに下記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水

酸基又はアミノ基等が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

[0168] 〔製造法13〕(工程h)

化合物(XXIVa')は、化合物(XVI)を前述の製造法4の工程hの方法に準じてハロゲン化することにより製造することができる。

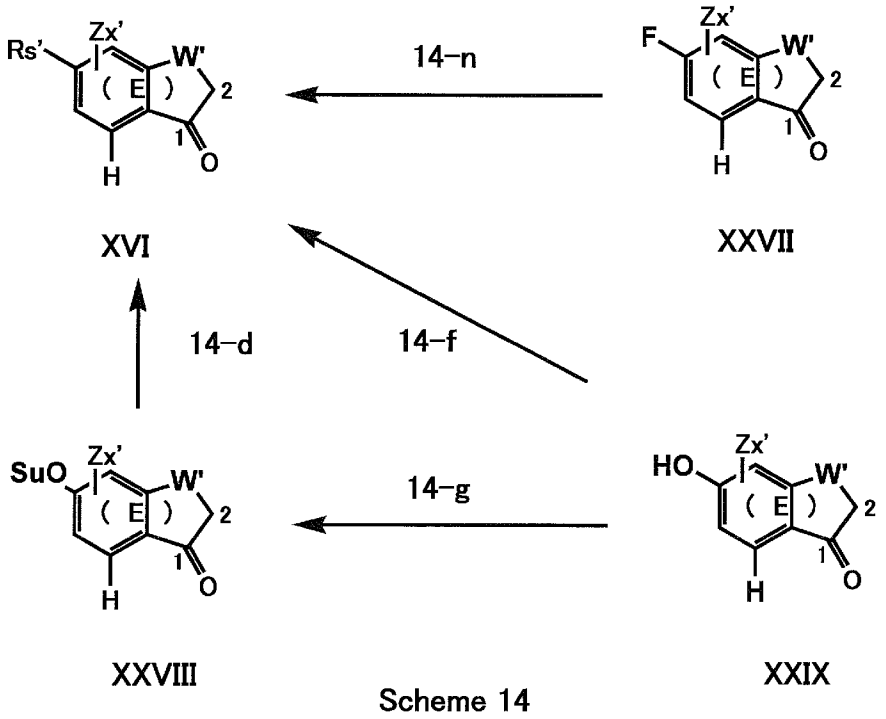
〔製造法13〕(工程g)

化合物(XXIVb')は、市販の又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XXVI)(式中、Rs'、Zx'、W'、H、O、及び基OHは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXVI)」と称する〕は前述の製造法5の工程gの方法に準じてスルホン酸エステル化することにより製造することができる。

[0169] 〔製造法14〕

次Scheme14;

[化17]



Scheme 14

で表されるように、化合物(XVI)は以下に示す方法を組み合わせることでも製造することができる。

[0170] 〔製造法14〕(工程n－1)

化合物(XVI)のうちRsが保護されていてもよい前記の[－N(Ry)(Rz)]または、R

sが保護されていてもよい前記の[Rb中A1が単結合をA2が－N(R4)を示す]か、もしくはRsが[－S－Rx]を示す場合、例えば新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、1346頁に記載の方法、もしくは新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、1716頁に記載の方法に従って製造することができる。すなわち市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XXVII)(式中、Zx'、W'、基SuO、H、及びOは前記と同義であり、Fはフッ素原子を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXVII)」と称する〕に前述の置換基Rsとなる市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能なアミン誘導体もしくはチオール誘導体をジクロロメタン、クロロホルム、1，2－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、N，N－ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒等の不活性溶媒中、炭酸カリウム、炭酸ナトリウムなどの塩基存在下反応することにより製造することができる。

[0171] 〔製造法14〕(工程n－2)

一方、化合物(XVI)のうちRsが保護されていてもよい前記の[－N(Ry)(Rz)]または、Rsが保護されていてもよい前記の[Rb中A1が単結合をA2が－N(R4)を示す]である場合、製造法14の工程n－1の方法に従って、保護されていてもよい[NH(Rz)]、または[NH(Ry)]、もしくは保護されていてもよい前記の[Rb中A1が単結合でありA2がNHを示す一級アミン]などを導入した後、新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、1385頁に記載の還元的アルキル化により製造することができる。すなわち市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XXVII)(式中、Zx'、W'、基SuO、H、及びOは前記と同義であり、Fはフッ素原子を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXVII)」と称する〕に前述の保護されていてもよい[NH(Rz)]、または保護されていてもよい[NH(Ry)]、もしくは、保護されていてもよい前記の[Rb中A1が単結合でありA2が－NHである一級アミン]などを製造法14の工程n－1の方法に従って導入した後、必要に応じて脱保護を行い、Ry、またはRz、もしくはR4となる市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能なアルデヒド、もしくはケトンをジクロロメタン、クロロホルム、1，2－ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、メタノール、エタノール等のアルコ

ール系溶媒等の有機溶媒中反応させ、同時に、もしくは段階的に水素化シアノホウ酸ナトリウム、トリアセトキシ水素化ホウ酸ナトリウム、水素化ホウ酸ナトリウムなどの還元剤存在下、還元反応を行うことにより製造することができる。

[0172] 〔製造法14〕(工程f)

化合物(XVI)のうちRsが保護されていてもよい前記の[－O－Rx]を示す場合、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式(XXIX)(式中、Zx'、W'、O、H、及び基OHは前記と同義である)で表される化合物(〔以下、単に「化合物(XXIX)」と称する〕から製造法4の工程fの方法に準じて製造することができる。一方、化合物(XXIV)は以下の公知文献の方法を参考にして製造することもできる。化合物(XXIV)のうち環(E)上のWが炭素原子を表す場合、(Ingoldら、Journal of chemical society、1923年、1508頁、Johnsonら、Journal of american chemical society、1944年、218頁、Heinzelmannら、Journal of american chemical society、1948年、1386頁、及びHartmannら、Journal of medicinal chemistry、1994年、1275頁)などやこれら文献記載の参考文献を参考に製造することもできる。化合物(XXIV)のうち環(E)上のWが酸素原子を表す場合、(Slaterら、Journal of chemical society、1920年、314頁)などやこれら文献記載の参考文献を参考に製造することもできる。また化合物(XXIV)のうち環(E)上のWが窒素原子を表す場合、(Nimitzら、Liebigs of annnual chemistry、1987年、765頁)などやこれら文献記載の参考文献を参考に製造することもできる。

[0173] 〔製造法14〕(工程d)

一方、化合物(XVI)のうちRsが保護されていてもよい前記の[－N(Ry)(Rz)]または、保護されていてもよい前記の[Rb中A1が単結合をA2が－N(R4)を示す]である場合、化合物(XXVII)から製造法4の工程dで示した方法で置換基Rs'となる市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能な置換アミンを導入することにより製造することができる。

〔製造法14〕(工程g)

化合物(XXVIII)は化合物(XXIX)を製造法5の工程gの方法に準じてスルホン酸エステル化することにより製造することができる。

[0174] 本発明化合物(I)の製造方法はここに記載された方法に限定されるものではない。例えば本発明化合物は、その前駆体となる化合物の置換基を通常の化学文献等に記載の反応を一つ又は複数を組み合わせ、修飾・変換することにより製造することができる。

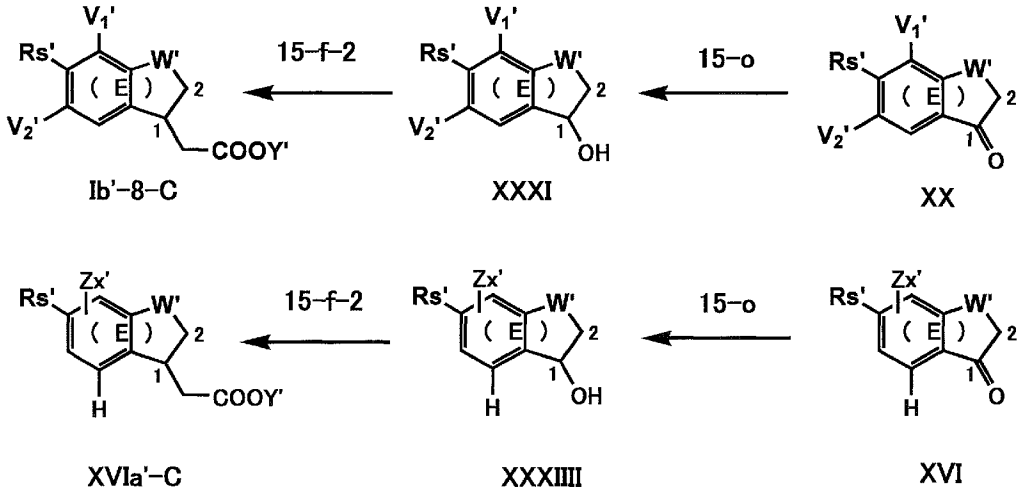
本発明化合物(I)のうちRsもしくは環(E)上の一方に不斉炭素を含むものの製造法の例としては、Rsもしくは環(E)上の不斉炭素にあたる部分があらかじめ光学活性である市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能な原料化合物を用いる方法が挙げられる。また本発明化合物又はその前駆体を常法により光学的に活性な異性体として分離する方法もある。その方法としては、たとえば光学活性カラムを用いた高速液体クロマトグラフィー(HPLC)によるもの、光学活性な酸、もしくは塩基と塩を形成し、生成した塩を分離精製後、中和することにより再び遊離の本発明化合物又はその前駆体として取得する方法、及び光学活性な試薬と縮合し生成するジアステレオマーを分離精製後、再び分解する方法などがある。一方、本発明化合物(I)のうちRs及び環(E)上両方に不斉炭素を含むものの製造法の例としては、Rs及び環(E)上の不斉炭素にあたる部分があらかじめ光学活性である市販の、あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能な原料化合物を用いる方法が挙げられる。また本発明化合物又はその前駆体を常法によりジアステレオマー分離精製する方法もある。前駆体を分離し光学活性体とした場合、その後に先に示した製造法を実施することにより光学的に活性な本発明化合物(I)を製造することができる。

[0175] 光学的に活性な本発明化合物(I)又はその前駆体の製造法として以下の方法などが挙げられる。

〔製造法15〕

次Scheme15;

[化18]



Scheme 15

で表されるように、化合物(Ib'－8)の一部であって環(E)上の1位炭素が光学的に活性であり、一方の立体異性体を示す化合物一般式(Ib'－8－C)(式中Rs'、V1'、V2'、W'、及びY'は前記と同義であり、Linkが炭素数1個の飽和炭化水素を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(Ib'－8－C)」と称する〕、及び化合物(XVIa')の一部であって環(E)上の1位炭素が光学的に活性であり、一方の立体異性体を示す化合物一般式(XVIa'－C)(式中Rs'、Zx'、W'、Y'、及びHは前記と同義であり、Linkが炭素数1個の飽和炭化水素を示す)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XVIa'－C)」と称する〕は以下に示す方法を組み合わせることでも製造することができる。

[0176] 〔製造法15〕(工程f－2)

化合物(Ib'－8－C)及び化合物(XVIa'－C)は市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる光学活性であり、一方の立体異性体を示す、一般式(XXXI)(式中、Rs'、V1'、V2'、W'、及び基OHは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXXI)」と称する〕、及び一般式(XXXIII)(式中、Rs'、Zx'、W'、Y'、及び基OHは前記と同義である)で表される化合物〔以下、単に「化合物(XXXIII)」と称する〕にメタントリカルボン酸トリエチルなどのメタントリカルボン酸トリエステルを製造法4の工程f－2の方法に準じて反応させた後、製造法1の工程aの方法に準じて加水分解を行い、さらに生成したトリカルボン酸から通常の化学文献記載の方法に従って、酸性条件下脱炭酸を行なった後、製造法2の工程bの方法

に従ってカルボン酸をエステル化することにより製造することができる。反応条件については、公知の文献(Hillierら、Orgamic letters、2004年、573頁など)やこれら文献記載の参考文献を参照することができる。前記反応において立体選択性が不十分な場合は、光学活性な化合物(Ib'－8－C)及び化合物(XVIa'－C)とα―メチルベンジルアミンなどの光学活性な塩基と塩を形成させ、生成した塩を、有機溶媒中結晶化などにより分離精製後、中和することにより、遊離の単一立体異性体である化合物(Ib'－8－C)及び化合物(XVIa'－C)を製造することができる。

[0177] 〔製造法15〕(工程o)

光学活性な化合物(XXXI)、及び化合物(XXXIII)は化合物(XX)及び化合物(XVI)から公知の文献(Hashiguchiら、Journal of american chemical society、1995年、7562頁、Fujiiら、Journal of american chemical society、1996年、2521頁、及びLiuら、Orgamic letters、2004年、169頁など)やこれら文献記載の参考文献記載の方法に準じて製造することができる。すなわち化合物(XX)及び化合物(XVI)をギ酸及びトリエチルアミンの混合液中、ルテニウムクロライド[(S, S)－N－(p－トルエンスルホニル)－1, 2－ジフェニルエチレンジアミン](p－シメン)もしくは、ルテニウムクロライド[(R, R)－N－(p－トルエンスルホニル)－1, 2－ジフェニルエチレンジアミン](p－シメン)、及びルテニウムクロライド[(S, S)－N－(p－メタンスルホニル)－1, 2－ジフェニルエチレンジアミン](p－シメン)もしくは、ルテニウムクロライド[(R, R)－N－(p－メタンスルホニル)－1, 2－ジフェニルエチレンジアミン](p－シメン)などのルテニウム触媒と配位子の組み合わせを作用させることで、目的の立体を有する光学活性な化合物(XXXI)、及び化合物(XXXIII)を製造することができる。

[0178] 本発明化合物(I)のうち、化合物中にカルボキシル基、フェノール性水酸基などの酸性官能基を含む場合、公知の手段によって薬学上許容される塩(たとえばナトリウム、アンモニア等との無機塩又はトリエチルアミン等との有機塩)とすることも可能である。たとえば、無機塩を得る場合、本発明化合物(I)を所望の無機塩に対応する少なくとも1当量の水酸化物、炭酸塩、重炭酸塩などを含有する水溶液中に溶解することが好ましい。該反応には、メタノール、エタノール、アセトン、ジオキサンなどの水混和

性の不活性有機溶媒を混和してもよい。たとえば、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム又は重炭酸ナトリウムを用いることによりナトリウム塩の溶液が得られる。

また本発明化合物(I)のうち、化合物中にアミノ基など塩基性官能基を含む場合、又はそれ自体塩基性の性質を持つ芳香環(例えばピリジン環など)を含む場合、公知の手段によって薬学上許容される塩(たとえば塩酸、硫酸等の無機酸との塩又は酢酸、クエン酸等の有機酸との塩)とすることも可能である。たとえば、無機塩を得る場合、本発明化合物(I)を所望の少なくとも1当量の無機酸を含有する水溶液中に溶解することが好ましい。該反応には、メタノール、エタノール、アセトン、ジオキサンなどの水混和性の不活性有機溶媒を混和してもよい。たとえば、塩酸を用いることにより塩酸塩の溶液が得られる。

固形塩が所望の場合、該溶液を蒸発させるか、又はさらにブタノール、エチルメチルケトンなどのようなある程度極性のある水混和性有機溶媒を加え、その固形塩を得ればよい。

本発明の種々の化合物は、公知の方法、たとえば、再結晶化、各種クロマトグラフィー(カラム、フラッシュカラム、薄層、高速液体)により精製を行うことができる。

[0179] 本発明化合物(I)及び薬理学的に許容されるその塩は、プロスタグランジン及びロイコトリエンの両者の産生に対して抑制作用を有する。プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生に対する抑制作用としては、例えば化合物の濃度が細胞障害の認められない濃度で、培養ヒト骨肉腫細胞株であるMG－63細胞をIL－1βで刺激したときのPGE_2産生を、及び／又は培養ラットマストサイトーマ株であるRBL－2H3細胞をIgEで刺激したときのPGD_2及びLTB_4産生を、陽性コントロールに対して10%以上、好ましくは30%以上、特に好ましくは50%以上抑制する作用が例示される。その分子作用的機序としてはプロスタグランジンを産生するCOX－1及び／又はCOX－2ならびにロイコトリエンを産生する5－LOの両者を阻害することが考えられる。あるいはプロスタグランジン及びロイコトリエンの産生にかかわる2A型、4型あるいは5型のPLA_2の酵素活性を本発明化合物が阻害してアラキドン酸の産生を抑制することが考えられる。

[0180] これらの分子作用的機序の中で、本発明化合物(I)は4型PLA_2の酵素活性を阻害

すると考えられる。例えば、その判断に際しては、4型PLA_2の酵素活性に対する阻害作用を調べればよく、公知の4型PLA_2の酵素活性測定方法を利用することも好ましい[Clarkら、プロシーディング・オブ・ナショナル・アカデミー・オブ・サイエンス・USA(Proc. Natl. Acad. Sci. USA)、1990年、87巻、7708頁]、[Gronichら、バイオケミカル・ジャーナル(Biochem. J.)、1990年、271巻、37頁]、[Clarkら、セル(Cell)、1991年、65巻、1043頁]、[Kramerら、ジャーナル・オブ・バイオロジカル・ケミストリー(J. Biol. Chem)、1991年、266巻、5268頁]。これらの方法を用いて本発明化合物の4型PLA_2阻害活性を明らかにすることができる。

[0181] 本発明化合物(I)及び薬理学的に許容されるその塩は、マウスの炎症性浮腫、アレルギー性浮腫、酢酸ライジング反応及びラットアジュバント関節炎を0.1～500mg／kgの経口投与で抑制すること、一方マウスに500mg／kg／日を3日間経口投与しても死亡例が認められなかったことから、哺乳動物、好ましくはヒト、イヌやネコなどのペット又はコンパニオンアニマルあるいは家畜における医薬として安全な化合物であり、医薬の有効成分として有用な物質である。そのような医薬としては、たとえば哺乳動物、好ましくはヒト、イヌやネコなどのペット又はコンパニオンアニマルあるいは家畜における医薬としてはプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生を起因とする各種の急性又は慢性の炎症反応が認められる状態、各種疾患あるいは病態、すなわち炎症性疾患、アレルギー性疾患、自己免疫疾患、疼痛に対する予防及び／又は治療のための医薬のいずれかが好ましい例として挙げられる。

[0182] 本発明の医薬を適用可能な症状又は疾患として、さらに具体的には関節炎、慢性関節リウマチ、悪性関節リウマチ、若年性関節リウマチ、フェルティ症候群、成人スティル病、変形性関節炎、滑膜炎、痛風、人工関節インプラントのゆるみ、発熱、一般的な感冒、痛覚過敏、火傷、熱傷、ケロイド形成、月経痛、月経困難、月経痙攣、アレルギー反応、アレルギー性接触過敏症、アレルギー性鼻炎、花粉症、アレルギー性結膜炎、過敏性肺臓炎、アレルギー性気管支肺真菌症、気腫、急性呼吸促迫症候群、喘息、気管支炎、慢性閉塞性肺疾患、慢性気管支炎、肺気腫、びまん性汎細気管支炎、気道閉塞症、移植片対宿主症候群、蕁麻疹、紫外線皮膚炎、アトピー性皮膚炎、癌、骨髄性白血病、肉腫、脳腫瘍、悪液質、組織潰瘍、消化性潰瘍、胃炎

、急性及び慢性膵炎、限局性腸炎、潰瘍性大腸炎、憩室炎、再発性胃腸病変、胃腸出血、炎症性腸疾患、クローン病、腸管型ベーチェット病、感染性腸炎、虚血性腸炎、放射線腸炎、薬剤性腸炎、過敏性腸症候、急性肝炎、劇症性肝炎、慢性肝炎、肝硬変、脂肪肝、アルコール性肝障害、薬剤性肝障害(薬物中毒肝炎)、うっ血性肝炎、自己免疫性肝炎、原発性胆汁性肝硬変、肝性ポルフィリン症等の肝疾患(肝障害、肝不全)、凝固、貧血、強直性脊椎炎、再狭窄、歯周病、表皮水泡症、アテローム性硬化症、大動脈瘤、結節性動脈周囲炎、うっ血性心不全、不整脈、心筋梗塞、脳梗塞、発作、大脳虚血、頭部外傷、脊髄損傷、脊髄性筋萎縮症、神経痛、神経変性疾患、アルツハイマー病、ルーウィボディ病、シャイドレイガー症候群、ライ症候群、進行性核上性麻痺、進行性多巣性白質脳症、正常圧水頭症、亜急性硬化性全脳炎、前頭葉型痴呆、急性灰白髄炎(ポリオ)、ポリオ神経症、ウイルス性脳炎、クロイツフェルトーヤコブ病、クールー病、牛海綿状脳症(狂牛病)、スクレイピー、てんかん、大脳アミロイド血管障害、自己免疫疾患、ハンティングトン病、パーキンソン病、片頭痛、うつ病、躁病、躁うつ病、遺伝性小脳性運動失調、末梢神経障害、緑内障、疼痛、歯肉炎、手術後の痛み、筋萎縮性側策硬化症、骨粗鬆症、多発性硬化症、目の脈管形成、角膜損傷、黄斑変性、結膜炎、異常創傷治癒、筋肉もしくは関節の捻挫又は緊張、腱炎、皮膚疾患、尋常性乾癬、膿疱性乾癬、乾癬性紅皮症、関節症性乾癬、重症筋無力症、多発性筋炎、筋炎、滑液包炎、糖尿病、腫瘍浸潤、腫瘍成長、腫瘍転移、角膜傷跡、強膜炎、免疫不全疾患、強皮症、好酸球性筋膜炎、敗血症、エンドトキシンショック、早産、低プロトロンビン血症、血友病、甲状腺炎、サルコイドーシス、ベーチェット症候群、過敏症、腎臓疾患、リケッチア感染症、原虫症、生殖疾患又は敗血症ショックなどが挙げられる。またその他の具体的な症状又は疾患として歯痛、抜歯後の痛み、背腰痛、肩関節周囲炎、頚肩腕症候群、腱鞘炎、急性上気道炎、帯状疱疹、線維症、肺線維症、薬剤誘起性肺線維症、塵肺症、慢性間質性肺炎、肉芽腫性間質性肺炎、線維化性間質性肺炎、腎線維症、腎盂腎炎、各種続発性萎縮腎、糸球体腎炎、慢性腎炎、糸球体硬化、肝線維症、心筋梗塞後の心線維症、特発性心筋症、膵硬化症、膵線維症、膵石症、高安動脈炎、慢性甲状腺炎、皮膚筋炎、多発性筋炎、骨髄線維症、Banti病、後腹膜線維症、各種放射線傷害なども挙

げられる。また本発明化合物(I)を有効成分として含む医薬は哺乳動物、好ましくはヒト、イヌやネコなどのペット又はコンパニオンアニマルあるいは家畜における上記症状又は疾患に対して他の一種類以上の予防又は治療薬と併用又は組み合わせて使用することができる。

[0183] 本発明の医薬と併用または組み合わせることができる薬剤としては、たとえば以下のようなものが例示できる。慢性関節リウマチの治療薬として使われる免疫修飾型抗リウマチ薬や代謝拮抗薬、具体的には金製剤、ブシラミン、ロベンザリット、サラゾスルファピリジン、メトトレキセート、アザチオプリン、ミゾリビン、レフルノミド、タクロリムス、シクロスポリン等やそれらを含む製剤;生物学的製剤であるインターロイキン(IL)－1、IL－6または腫瘍壊死因子(TNF)－αなどのサイトカインに対する抗サイトカイン抗体製剤、若しくはそれらサイトカインに対する可溶性受容体製剤、具体的にはインフリキシマブやエタネルセプト等やそれらを含む製剤;ステロイド製剤、具体的にはデキサメタゾン、ベタメタゾン、プレドニゾロン、フルチカゾンやベクロメタゾン等やそれらを含む製剤;慢性気管支喘息の治療薬として使われる気管支拡張薬、具体的にはアドレナリンβ2刺激薬であるサルメテロールやサルブタモール、抗コリン薬であるイプラトロピウム等やそれらを含む製剤;アレルギー性疾患の治療薬、例えばキサンチン類縁薬であるテオフィリン等、抗アレルギー薬であるフェキソキナジン、エピナスタチン、セチリジン、ケトチフェン、クロモグリク酸ナトリウム、ペミロラスト等、あるいは抗ヒスタミン薬であるフェキソキナジンやセチリジン等やそれらを含む製剤;抗腫瘍薬であるイリノテカン、5－フルオロウラシル等やそれらを含む製剤。また放射線療法と併用または組み合わせて本発明化合物(I)を有効成分として含む医薬を使用することも例示される。

[0184] 本発明化合物(I)又は薬学上許容される塩を上記の医薬として用いるには、有効量の本発明化合物(I)又は薬学上許容される塩をそのまま用いてもよく、あるいは薬学上許容される担体と混合して医薬組成物として用いてもよい。担体は、たとえばカルボキシメチルセルロースなどの懸濁化剤や、場合によっては、精製水、生理食塩水などであってもよく、その他の公知の担体も用いることができる。一例を示すと本発明化合物(I)又は薬学上許容される塩を0．5％カルボキシメチルセルロースを含む

精製水に懸濁又は溶解して用いる方法が挙げられる。

上記医薬組成物の形態としては、たとえば錠剤、散剤、顆粒剤、シロップ剤、懸濁剤、カプセル剤、注射剤が挙げられるが、その製造のためには、これらの形態に応じた各種担体が使用される。たとえば、経口剤の担体としては、賦形剤、結合剤、滑沢剤、流動性促進剤、着色剤を挙げることができる。

[0185] 本発明の医薬を注射剤等の非経口剤として調製する場合には、希釈剤として一般に注射用蒸留水、生理食塩水、ブドウ糖水溶液、注射用植物油、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール等を使用することができる。さらに必要に応じて、殺菌剤、防腐剤、安定剤、等張化剤、無痛化剤等を加えてもよい。

本発明の医薬を哺乳類、たとえばヒトに投与する際には、錠剤、散剤、顆粒剤、懸濁剤、カプセル剤の形で経口投与することができ、また、点滴を含む注射剤、さらには吸入剤、坐剤、ゲル剤、ローション剤、軟膏剤、クリーム又はスプレーの形で非経口投与することができる。その投与量は、適用症、投与形態、患者の年齢、体重、症状の度合いなどによって異なるが、一般的には成人1日当たり1～1000mgを1～3回に分けて投与することが例示される。投与期間は数日～2カ月の連日投与が一般的であるが、患者の症状により1日投与量、投与期間共に増減することができる。

実施例

[0186] 以下、実施例及び試験例等により本発明をさらに具体的に説明するが、本発明の範囲は下記の実施例等に限定されることはない。

実施例中、薄層クロマトグラフィー(TLC)はPrecoated silica gel 60 F254(メルク社製、製品番号5715－1M)を使用した。クロロホルム:メタノール(1:0～1:1)、アセトニトリル:酢酸:水(200:1:1～100:4:4)、または、酢酸エチル:ヘキサン(1:0～0:1)により展開後、UV(254nm)照射、ニンヒドリンまたはジニトロフェニルヒドラジン塩酸溶液による呈色により確認した。有機溶媒の乾燥には無水硫酸マグネシウムあるいは無水硫酸ナトリウムを使用した。カラムクロマトグラフィーのうち「Quad」と記載したものについてはQuad1分取システム(Biotage社製)を用い、カラムは同社製KP－Sil－12M、40Sまたは40Mのいずれかのカートリッジカラムを試料の量に応じて1本または数本使用した。フラッシュカラムクロマトグラフィーはシリカゲル60N(

球状、中性、40～100μm、関東化学社製)を使用した。分取薄層クロマトグラフィー(以下、「PTLC」と略す)はPLCプレートsilica gel 60 F254、20×20cm、層厚2mm、濃縮ゾーン(4cm)付(メルク社製、製品番号13793－1M)を試料の量に応じて1枚または数枚使用して行った。

[0187] 「LCMS」については液体クロマトグラフ質量分析スペクトル(LC－MS)にてマススペクトルを測定した。質量分析装置としてPlatform－LC型質量分析装置[マイクロマス(Micromass)社製]を用いエレクトロスプレー(ESI)法により測定した。液体クロマト装置はギルソン(GILSON)社製の装置を使用した。分離カラムはDevelosil C30－UG－5(50×4．6mm)(野村化学社製)を用いた。溶出は一般には、流速2ml／分、溶媒としてA液＝水[0．1％(v／v)酢酸含有]、B液＝アセトニトリル[0．1％(v／v)酢酸含有]を用いた。

後述の表中に示した「LCMS」とは、液体クロマトグラフ質量分析スペクトルのデータを示す。「Mass」の欄にはマススペクトルのデータを示した(ただし「N．D」と記したものについては分子イオンピークが検出できなかったことを意味する)。「method」の欄には液体クロマトの溶出条件を記した。「RTime」の欄には液体クロマトの保持時間を記した。液体クロマトの保持時間を示す場合、溶出条件を「A」と記載したものは、0分から5分までB液を5～100％(v／v)直線グラジェントしたのち9分までB液を98％(v／v)で溶出した条件で測定したことを示す。同様に溶出条件を「B」と記載したものは、0分から4分までB液を5～98％(v／v)直線グラジェントしたのち6分までB液を98％(v／v)で溶出した条件で測定したことを示す。また溶出条件の欄に「C」と示したものについては、「Mass」の欄にJEOL－JMS－SX102(日本電子社製)を用い、高速原子衝突マススペクトラム(FAB－MS)により測定したマススペクトルのデータを記した。また溶出条件を「D」と記載したものについては液体クロマト装置としてWaters社製の装置を使用した。分離カラムはDevelosil C30－UG－5(50×4．6mm)(野村化学社製)を用いた。溶出は0分から4分までB液を5～98％(v／v)直線グラジェントしたのち6分までB液を98％で溶出した条件で測定したことを示す。

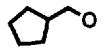
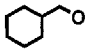
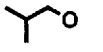
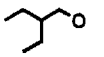
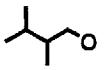
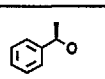
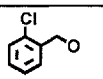
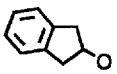
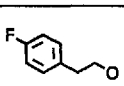
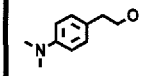
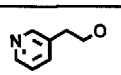
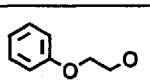
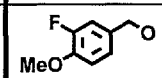
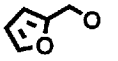
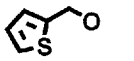
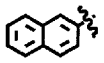
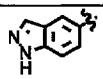
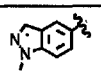
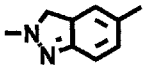
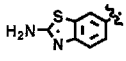
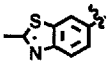
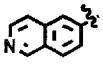
[0188] 「キラル体の分取」における液体装置は島津LC6Aシステム(島津製作所製)を使用した。分離カラムはChiralcel OJ－RH(20mmI．D×250mm)(ダイセル社製)

を用いた。溶出は流速10ml／分、溶媒としてA液＝水、B液＝アセトニトリルを用い、B液70%の条件で行った。

後述の表中に示した、「Exp.」と記す欄には化合物番号を記入した。またInt.と記したものは中間体番号を示す。さらに表中の略号は下記の意味を示す。n:ノルマル、i:イソ、s:セカンダリー、t:ターシャリー、c:シクロ、D:ジ、Me:メチル、Et:エチル、Pr:プロピル、Bu:ブチル、Pen:ペンチル、Hex:ヘキシル、Hep:ヘプチル、Ph:フェニル、Bn:ベンジル、Py:ピリジル、Indan:インダニル、Ac:アセチル、CHO:ホルミル、COOH:カルボキシル、NO2:ニトロ、DMA:ジメチルアミノ、NH2:アミノ、CF3:トリフルオロメチル、F:フルオロ、Cl:クロロ、Br:ブロモ、OMe:メトキシ、OH:ヒドロキシ、TFA:トリフルオロアセチル、SO2:スルホニル、CO:カルボニル、Nap:ナフチル、Ind:1H－インドリル、1HIdz:1H－インダゾリル、2HIdz:2H－インダゾリル、Bzt:ベンゾチアゾール、2ABzt:2－アミノベンゾチアゾール、BF:ベンゾフラニル、BT:ベンゾ[b]チエニル、Qu:キノリル、IQ:イソキノリル。

各置換基の前に付与した数字は置換位置を示す。また芳香環の略号の前にハイフンで付与した数字はその芳香環の置換位置を表す。(S)は光学活性のS体を(R)はR体を示す。表中の置換基のうち略号で示したものの代表例を下記表1に示す。

[0189] [表1]

Structure	abbreviation	Structure	abbreviation	Structure	abbreviation
	cPenMeO		cHexMeO		iBuO
	2EtBuO		2,3DMeBuO		cPenO
	cHexO		cHepO		BnO
	(R)1PhEtO		2ClBnO		4FBnO
	2-IndanO		2(4FPh)EtO		2(4DMAPh)EtO
	2(3-Py)EtO		2(PhO)EtO		3F,4(OMe)BnO
	2FRMeO		2TPMeO		
	2-Nap		1-Nap		5-Ind
	1Me-5-Ind		5-1Idz		1Me-5-1Idz
	2Me-5-1Idz		5-Bzt		5-2ABzt
	2Me-5-Bzt		5-BT		5-BF
	3-Qu		6-IQ		

使用した試薬の製造元については以下の略号で示す場合がある。東京化成社製;「TCI」、アルドリッチ社製;「Ald」、関東化学社製;「KANTO」、和光純薬社製;「WAKO」、ランカスター社製;「LANC」、Maybridge社製;「MAYB」。

[0190] 参考例1

5－シクロペンチルオキシ－2，3－ジヒドロインダン－1－オン(中間体A－1)の合成(製造法14工程f－2)

5－ヒドロキシ－1－インダノン(741mg、TCI)の無水テトラヒドロフラン(以下THFと略す)(25ml)溶液にジターシャリーブチルアゾジカルボキシレート(1．42g、Ald)、トリフェニルホスフィン(1．61g、WAKO)、シクロペンタノール(500ul、WAKO)を加え、12時間撹拌した。反応混合液に水(100ml)および酢酸エチル(20ml×2)を

加え抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄後、有機層を乾燥、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝6:1)で精製し標記化合物(中間体A－1;1．13g)を得た。Mass(LCMS):217(M^+＋1)、保持時間;4．20分(溶出条件:B)。

[0191] 2－(5－シクロペンチルオキシ－2，3－ジヒドロインデン－1－イリデン)酢酸エチル(中間体A－2)の合成(製造法9工程k－1)

水素化ナトリウム(306．4mg、WAKO)の無水ジメトキシエタン(以下DMEと略す)(30mL)溶液に氷冷下、ジエチルホスホノ酢酸エチル(7．6ml、TCI)の無水DME(15ml)溶液を滴下し3分間攪拌後、中間体A－1(1．13g)の無水DME溶液を滴下した。5分攪拌後加熱還流下にて20時間攪拌した。反応液を濃縮後、水(30ml)を加え酢酸エチル(30ml×3)で抽出した。有機層を水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝8:1)で精製し標記化合物(中間体A－2;1．21g)を得た。Mass(LCMS):287(M^+＋1)、保持時間;6．07分(溶出条件:B)。

[0192] 2－(5－シクロペンチルオキシ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体A－3)の合成(製造法9工程j)

中間体A－2(591mg)のメタノール(10ml)溶液に10%パラジウム炭素(33mg、Merck社製)を加え、水素雰囲気下室温にて1時間半撹拌した。反応混合液を濾過し濾液の溶媒を減圧下留去することで標記化合物(中間体A－3;563．2mg)を得た。Mass(LCMS):N．D(M^+＋1)、保持時間;5．77分(溶出条件:B)。

[0193] 2－(6－ブロモ－5－シクロペンチルオキシ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体A－4)の合成(製造法8工程h)

中間体A－3(563．2mg)のアセトニトリル(6ml)溶液に、氷冷下N－ブロモスクシンイミド(以下、「NBS」と略す)(344mg、WAKO)を加え、10分攪拌後室温にて1時間撹拌した。減圧下濃縮した後、酢酸エチル(200ml)を加え、飽和塩化アンモニウム水溶液、5%亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水および飽和食塩水で順次洗浄、有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝8:1)で精製し標記化合物(中間体A－4;621．3mg)を

得た。Mass(LCMS):N. D(M^++1)、保持時間;6. 17分(溶出条件:B)。

[0194] 参考例2

5−ベンジルオキシ−2, 3−ジヒドロインダン−1−オン(中間体A−5)の合成(製造法14工程f—1)

5−ヒドロキシ−1−インダノン(14. 8g)のDMF(300ml)溶液に炭酸カリウム(16. 59g、WAKO)およびベンジルブロミド(18. 8g、TCI)を加え室温にて8時間撹拌した。減圧濃縮後、水(100ml)および酢酸エチル(200ml×2)を加え抽出し、水(100ml×2)で洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をジエチルエーテル(50ml)、ヘキサン(30ml)を加え、祖結晶をろ取、標記化合物(中間体A−5;20. 1g)を得た。Mass(LCMS):239(M^++1)、保持時間;4. 26分(溶出条件:B)。

[0195] 2−(5−ベンジルオキシ−2, 3−ジヒドロインデン−1−イリデン)酢酸エチル(中間体A−6)の合成(製造法9工程k−1)

参考例1の中間体A−2の合成法(製造法9工程k−1)に記載の手順に従って中間体A−5(30. 01g)およびジエチルホスホノ酢酸エチル(85. 2g、TCI)、水素化ナトリウム(9. 12g、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体A−6;28. 6g)を得た(但し反応は還流条件下28時間行った)。Mass(LCMS):N. D(M^++1)、保持時間;5. 60分(溶出条件:B)。

[0196] 2−(5−ヒドロキシ−2, 3−ジヒドロ−1H−インデン−1−イル)酢酸エチル(中間体A−7)の合成(製造法9工程j)

中間体A−6(28. 7g)のエタノール(500ml)溶液に10%水酸化パラジウム(1. 21g、NEケムキャット社製)を加え、水素雰囲気下室温にて8時間半撹拌した。反応混合液を濾過し濾液の溶媒を減圧下留去することで標記化合物(中間体A−7;16. 3g)を得た。Mass(LCMS):N. D(M^++1)、保持時間;3. 70分(溶出条件:B)。

[0197] 2−(5−ベンジルオキシ−2, 3−ジヒドロ−1H−インデン−1−イル)酢酸エチル(中間体A−8)の合成(製造法4工程f−1)

参考例2の中間体A−5の合成法(製造法14工程f—1)に記載の手順に従って中間体A−7(19. 18g)およびベンジルブロマイド(18. 2g、TCI)、炭酸カリウム(14.

7g、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体A－8;20．4g)を得た(但し反応は室温にて15時間行った)。Mass(LCMS):N．D(M^+＋1)、保持時間;5．59分(溶出条件:B)。

[0198] 2－(5－ベンジルオキシ－6－ブロモ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体A－9)の合成(製造法8工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って中間体A－8(22．2g)およびNBS(12．85g、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体A―9;25．02g)を得た(但し反応は室温にて3時間行った)。Mass(LCMS):N．D(M^+＋1)、保持時間;5．91分(溶出条件:B)。

[0199] 参考例3

2－(5－t－ブチルジフェニルシリルオキシ―2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体A－12)の合成

中間体A－7(1．02g)の無水DMF(10ml)溶液にイミダゾール(368．5mg、TCI)を加え、t－ブチルジフェニルシリルクロリド(1．03g、TCI)のDMF(5ml)溶液を氷冷下滴下し30分撹拌した後、室温に昇温しさらに16時間半撹拌した。反応混合液に水(30ml)を加え酢酸エチル(50ml)で抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル＝9:1)で精製し、標記化合物(中間体A－12;727．5mg)を得た。Mass(LCMS):N．D(M^+＋1)、保持時間;7．69分(溶出条件:A)。

[0200] 2－(6－ブロモ－5－t－ブチルジフェニルシリルオキシ―2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体A－13)の合成(製造法8工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って中間体A－12(726．4mg)およびNBS(273．7mg、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体A－13;769．9mg)を得た(但し反応は室温にて3時間行った)。Mass(LCMS):N．D(M^-－1)、保持時間;8．05分(溶出条件:A)。

[0201] 2－(6－ブロモ－5－ヒドロキシ―2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体A－14)の合成

中間体A－13(768．1mg)のTHF(15ml)溶液に、酢酸(850μl、WAKO)、テト

ラブチルアンモニウムフルオリド／THF1M溶液（13ml、TCI）を加え2時間撹拌した。反応混合液に飽和重曹水（100ml）を加え酢酸エチル（30ml）で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝7：1）で精製し、標記化合物（中間体A－14;629．5mg）を得た。Mass（LCMS）：N．D（M^-－1）、保持時間；4．30分（溶出条件：A）。

[0202] 2－（6－ブロモ－5－シクロヘキシルメチルオキシ―2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル）酢酸エチル（中間体A－15）（製造法4工程f－1）

参考例2の中間体A－5の合成法（製造法4工程f－1）に記載の手順に従って中間体A－14（100mg）、炭酸カリウム（70mg）、シクロヘキシルメチルブロマイド（72μl、東京化成社製）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体A－15；102mg）を得た［但し以下の変更を加えた。反応は23時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝10：1）にて行った］。Mass（LCMS）：395（M^+）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

[0203] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．A－1に示す。ただしTable中、「Exp．」と記す欄には中間体番号を記入した。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal（番号）」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al（番号）」で示すアルコール試薬はTable－Alに示したものである。但し、表中の「Manufacturer」の欄が空欄の試薬については通常の化学文献に記載の方法に準じて合成したものである。

[0204] [表2]

Table-AI

Reagent	The name of reagent	manifacture	Reagent	The name of reagent	manifacture
AI1	Cyclopentanol	TCI	AI19	5-Methoxy-2-indanol	
AI2	Cyclopentanemethanol	Ald	AI20	5,6-Dimethoxy-2-indanol	
AI3	Cyclohexanol	WAKO	AI21	5-Fluoro-2-indanol	
AI4	Cycloheptanol	TCI	AI22	1,2,3,4-Tetrahydro-2-naphthol	Acros
AI5	2-Ethyl-1-butanol	TCI	AI23	1,2,3,4-Tetrahydro-1-naphthol	WAKO
AI6	2-[4-(Dimethylamino)phenyl]ethan	Ald	AI24	2-(2-Methylphenyl)ethyl alcohol	TCI
AI7	2-Phenoxyethanol	TCI	AI25	3-Fluorophenylethyl alcohol	Ald
AI8	Phenethyl Alcohol	TCI	AI26	2-(o-Chlorophenyl)ethanol	WAKO
AI9	2-Fluorophenylethyl alcohol	TCI	AI27	2-Naphthaleneethanol	TCI
AI10	4-Chlorophenylethyl alcohol	Ald	AI28	1-Naphthaleneethanol	Ald
AI11	4-Methylcyclohexanol	WAKO	AI29	2-Hydroxymethyl-1,4-benzodioxan	WAKO
AI12	1-Pheny-2-propanol	TCI	AI30	2-(Phenylthio)ethanol	WAKO
AI13	2-Phenylpropane-1-ol		AI31	(1-Methyl-1H-imidazol-5yl)methanol	MAYB
AI14	1-(2-Fluorophenyl)-2-Propylalcohol		AI32	(1,5-Dimethyl-1H-pyrazol-3-yl)methanol	MAYB
AI15	1-(3-Trifluoromethylphenyl)-2-Propylalcohol		AI33	4-Pyridinemethanol	TCI
AI16	3-Pheny-1-butanol	Ald	AI34	6-Methyl-2-pyridinemethanol	TCI
AI17	1-Indanol	TCI	AI35	2-Quinolinylmethanol	MAYB
AI18	2-Hydroxyindan	TCI	AI36	3-(2-Hydroxyethyl)pyridine	WAKO

[0205] [表3]

Table-HaI

Reagent	試薬名	メーカー
HaI1	Benzyl bromide	TCI
HaI2	Cyclohexylmathyl bromide	TCI
HaI3	n-Propyl bromide	TCI
HaI4	Isopropyl bromide	TCI
HaI5	n-Butyl bromide	TCI
HaI6	Isobutyl bromide	WAKO
HaI7	2-Fluorobenzyl bromide	TCI
HaI8	3-Fluorobenzyl bromide	TCI
HaI9	4-Fluorobenzyl bromide	TCI
HaI10	2-Chlorobenzyl bromide	TCI
HaI11	3-Chlorobenzyl bromide	TCI
HaI12	4-Methylbenzyl chloride	TCI
HaI13	4-(Trifluoromethyl)benzyl bromide	TCI

[0206] [表4]

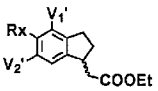


Table-Int.A-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.A-10	4f-2	Int.A-7	AI2	cPenMeO	H	H	C		303 (M^++1)
Int.A-11	4-h	Int.A-10		cPenMeO	H	Br	C		381 (M^+)
Int.A-15	4f-1	Int.A-14	HaI2	cHexMeO	H	Br	C		395 (M^+)
Int.A-16	4f-2	Int.A-14	AI3	cHexO	H	Br	C		381 (M^+)
Int.A-17	4f-2	Int.A-14	AI4	cHepO	H	Br	C		395 (M^+)
Int.A-18	4f-1	Int.A-14	HaI3	nPrO	H	Br	C		341 (M^+)
Int.A-19	4f-1	Int.A-14	HaI4	iPrO	H	Br	C		341 (M^+)
Int.A-20	4f-1	Int.A-14	HaI5	nBuO	H	Br	C		355 (M^+)
Int.A-21	4f-1	Int.A-14	HaI6	iBuO	H	Br	C		355 (M^+)

[0207] 実施例A－a－1

2－[5－シクロペンチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号A－a－1)の合成(製造法4工程e－1)

中間体A－4(100mg)のトルエン(1. 1ml)溶液に2－ナフタレンボロン酸(84. 3mg、TCI)のエタノール溶液(0. 4ml)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0. 3ml)およびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)[以下、「$(Ph_3P)_4Pd$」と略す](34. 7mg、ナカライテスク社製)を加え90℃で18時間撹拌した。反応混合液に水(30ml)、酢酸エチル(30ml×2)を加え抽出後、飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝7:1、)で精製し、標記化合物(化合物番号A－a－1;102mg)を得た。

[0208] 実施例A－a－2

2－[5－シクロペンチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号A－a－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－1(102mg)のメタノール(600ul)－THF(600ul)の混合溶液に2規定水酸化ナトリウム水溶液(600ul)を加え60℃で17時間撹拌した。反応混合液を減圧下濃縮後、氷冷下1規定塩酸水で中和した後、塩化メチレン(2ml×3)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、溶媒を減圧下留去し標記化合物(化合物番号A－a－2;86mg)を得た。

[0209] 実施例A－a－21

2－[6－(ベンゾ[b]チアゾール－5－イル)5－シクロペンチルオキシ－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号A－a－21)の合成(製造法4工程e－2)

文献[宮浦(N. Miyaura)ら、テトラヘドロン レターズ(Tetrahedron. Lett.)、1997年、3447頁]に記載の手順に従って、中間体A－4(354mg)、ビスピナコレートジボロン(471mg、Ald)、[1, 1'－ビス(ジフェニルホスフォノ)フェロセン]パラジウム(II)ジクロリド[以下「$PdCl_2(dppf)$」と略す](87mg、Ald)および酢酸カリウム(216.

5mg、Ald)を1，4－ジオキサン(6ml)に加え、窒素雰囲気下80℃で7時間加熱撹拌した。反応混合液を室温まで降温した後、5－ブロモベンゾ[b]チアゾール(131mg)、$PdCl_2$(dppf)(20mg)および2M炭酸ナトリウム水溶液(0．9ml)を加え、窒素雰囲気下80℃で14時間加熱撹拌した。反応混合液に水(15ml)酢酸エチル(20ml×2)で抽出後、飽和食塩水で洗浄し乾燥、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝5:1)で精製し、標記化合物(化合物番号A－a－21;12mg)を得た。

[0210] 実施例A－a－22

2－[6－(ベンゾ[b]チアゾール－5－イル)5－シクロペンチルオキシ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号A－a－22)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物A－a－21(12mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0．1ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－a－22;9．2mg)を得た(但し反応は2時間行った)。

[0211] 実施例A－a－107

2－[5－ヒドロキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(中間体A－22)の合成

中間体A－7の合成法に記載の手順に従って実施例化合物A－a－29(1．45g)、10%水酸化パラジウム(131．4mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体A－22;1．14g)を得た(但し反応はエタノール(20ml)－THF(20ml)の混合溶媒中12時間行った)。

[0212] 2－[5－(2－フルオロベンジルオキシ)－6－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号A－a－107)の合成(製造法4工程f－1)

参考例2の中間体A－5の合成法(製造法4工程f－1)に記載の手順に従って中間体A－22(116．3mg)、2－フルオロベンジルブロマイド(48．25ul、Ald)、炭酸カリウム(88．2mg)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－a－107

;122．4mg)を得た(但し反応は18時間行った)。

[0213] 実施例A－a－108

2－[5－(2－フルオロベンジルオキシ)－6－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号A－a－108)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物A－a－107(121．2mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0．45ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－a－108;98．9mg)を得た(但し反応は2時間行った)。

[0214] 実施例A－a－153

2－[5－(4－ジメチルアミノフェニルオキシ)－6－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号A－a－153)の合成(製造法4工程f－2)

参考例1の中間体A－1の合成法(製造法4工程f－2)に記載の手順に従って中間体A－22(112．2mg)、2－(4－ジメチルアミノ)ジメチルフェニルアルコール(59．6mg、Ald)、トリフェニルホスフィン(101．2mg)、ジターシャリーブチルアゾジカルボキシレート(97．6mg、Ald)。を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－a－153;110．4mg)を得た(但し反応は28時間行った)。

[0215] 実施例A－a－154

2－[5－(4－ジメチルアミノフェニルオキシ)－6－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号A－a－154)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物A－a－153(110．2mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0．45ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－a－154;99．2mg)を得た(但し反応は5時間行った)。

[0216] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．A－2に示す。なお

「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。但し、表中の「Manufacturer」の欄が空欄の試薬については通常の化学文献に記載の方法に準じて合成したものである。

[0217] [表5]

Table-BRA-1

Reagent	The name of reagent	Manufacture
BRA1	2-Naphthalene boronic acid	TCI
BRA2	5-1H-Indole boronic acid	Frontier
BRA3	1-Methyl-5-Indole boronic acid	Frontier
BRA4	1-Ethyl-5-Indole boronic acid	
BRA5	1-Methyl-4-indiole boronic	
BRA6	1-Methyl-6-indiole boronic acid	
BRA7	5-1H-Indazole boronic acid	
BRA8	1-Methyl-5-1H-Indazole-boronic acid	
BRA9	1-Ethyll-5-1H-Indazole-boronic acid	
BRA10	2-Methyl-5-2H-indazole boronic acid	
BRA11	5-Benzofurane boronic acis	Maybridg
BRA12	5-Benzothiophene boronic	Ald
BRA13	6-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)quinoline	Ald
BRA14	Phenyl boronic acid	Ald
BRA15	2-Methylphenyl boronic acid	Ald
BRA16	3-Methylphenyl boronic acid	Ald
BRA17	4-Methylphenyl boronic acid	Ald
BRA18	2-Ethylphenyl boronic acid	Ald
BRA19	4-Ethylphenyl boronic acid	Ald
BRA20	2-Isopropylphenyl boronic	Ald
BRA21	4-Isopropylphenyl boronic	WAKO
BRA22	1-n-Butylphenyl boronic acid	Ald
BRA23	4-t-Butylphenyl boronic acid	Ald
BRA24	2-Methoxypheny boronic acid	Ald
BRA25	3-Methoxyphenyl boronic acid	Ald
BRA26	4-Methoxypheny boronic acid	Ald
BRA27	2-Ethyloxypheny boronic acid	Ald
BRA28	3-Ethyloxypheny boronic acid	Ald
BRA29	3-Isopropyloxyphenyl boronic acid	Ald
BRA30	4-Isopropyloxyphenyl boronic acid	Ald
BRA31	3-n-Propyloxyphenyl boronic acid	Ald
BRA32	4-n-Propyloxyphenyl boronic acid	Ald
BRA33	3-n-Butyloxyphenyl boronic	Ald
BRA34	4-n-Butyloxyphenyl boronic	Ald
BRA35	3-(Dimethylamino) phenyl boronic acid	Frontier
BRA36	4-(Dimethylamino) phenyl boronic acid	Ald
BRA37	2-Fluoropheny boronic acid	Ald
BRA38	3-Fluoropheny boronic acid	Ald
BRA39	4-Fluoropheny boronic acid	Ald
BRA40	2-Chlorophenyl boronic acid	Ald
BRA41	3-Chlorophenyl boronic acid	Ald
BRA42	4-Chlorophenyl boronic acid	Ald
BRA43	2-(Trifluoromethyl) phenyl boronic acid	TCI
BRA44	3-(Trifluoromethyl) phenyl boronic acid	TCI
BRA45	4-(Trifluoromethyl) phenyl boronic acid	Ald
BRA46	2,3-Difluorophenyl boronic	Ald
BRA47	2,4-Difluorophenyl boronic	Ald
BRA48	2,5-Difluorophenyl boronic	Ald
BRA49	2,6-Difluorophenyl boronic	Ald
BRA50	3,4-Difluorophenyl boronic	Ald
BRA51	3,5-Difluorophenyl boronic	Ald
BRA52	2,4-Dichlorophenyl boronic	Ald
BRA53	3,5-Dichlorophenyl boronic	Ald
BRA54	3,4-Dichlorophenyl boronic	Ald
BRA55	2,3-Dimethylphenyl boronic	Lancaster
BRA56	2,4-Dimethylphenyl boronic	WAKO
BRA57	2,6-Dimethylphenyl boronic	Ald

[0218] [表6]

Table-BRA-2

Reagent	The name of reagent	Manufacture
BRA58	2-Furyl boronic acid	Ald
BRA59	3-Furyl boronic acid	Ald
BRA60	2-Thienyl boronic acid	Ald
BRA61	3-Thienyl boronic acid	Ald
BRA62	Pyridine-3-boronic acid	Ald
BRA63	Pyridine-4-boronic acid	Ald
BRA64	Biphenyl-3-boronic acid	Ald
BRA65	Biphenyl-4-boronic acid	Ald
BRA66	Trans-1-Hexene-1-ylboronic acid	Ald
BRA67	Trans-2-(4-Fluorophenyl)vinylboronic acid	Ald
BRA68	Trans-2-(4-Chlorophenyl)vinylboronic acid	Ald
BRA69	2-Cyclohexylvinylboronic acid	Ald
BRA70	Trans-2-[4(Trifluoromethyl)-phenyl]vinylboronic acid	Ald
BRA71	Trans-2-(4-Methylphenyl)vinylboronic acid	Ald
BRA72	(E)-2-(3-Methoxyphenyl)-4,4,5,5-tetramethyl-(1,3,2)-dioxaborolate	Ald
BRA73	2-(cis-1-ethyl-1-butenyl)benzo-	Ald
BRA74	trans-1-Propen-1-ylboronic acid	Ald
BRA75	Cis-1-Propen-1-ylboronic	Ald
BRA76	1-Pentenylboronic acid	Ald
BRA77	Trimethylboroxine	Ald

[0219] [表7]

Table-Het

Reagent	The name of reagent	manufacture
Het1	5-Bromobenzothiazole	TCI
Het2	3-Bromoquinoline	TCI
Het3	6-Bromoisoquinoline	

[0220] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－A－a－1からTable－A－a－8に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号（例えば「A－a－1」）あるいは中間体番号（例えば「Int. A－1」）の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。製造が複数の工程に渡る場合、該当する化合物番号あるいは中間体番号を併記した。例えば「Syn」の欄に「4e－1」と記載された場合、これは「製造法4の合成法e－1に記載の手順に従って製造した」ということを意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。また「Reagent」の欄に記した記号「Hal（番号）」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al（番号）」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA（番号）」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het（番号）」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。但し、表中の「Manufacturer」の欄が空欄の試薬については通常の化学文献に記載の方法に準じて合成したものである。なお、「Syn」の欄が空欄の場合には、Pd／C、水素を用いた脱保護反応を行った。

[0221] [表8]

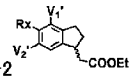


Table-Int.A-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.A-22		A-a-29		HO	H	2-Nap	C		347 (M^++1)
Int.A-23		A-a-31		HO	H	5-Ind	C		336 (M^++1)
Int.A-24		A-a-33		HO	H	1Me-5-Ind	C		350(M^++1)
Int.A-25		A-a-35		HO	H	5-1Idz	C		337(M^++1)
Int.A-26		A-a-37		HO	H	1Me-5-Idz	C		351(M^++1)
Int.A-27		A-a-39		HO	H	1Et-5-Idz	C		365(M^++1)
Int.A-28		A-a-41		HO	H	5-BF	C		337(M^++1)
Int.A-29		A-a-43		HO	H	6-Qu	C		348(M^++1)

[0222] [表9]

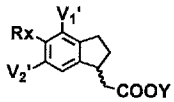


Table-A-a-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-a-1	4e-1	Int.A-4	BRA1	cPenO	Et	H	2-Nap	C		415(M^++1)
A-a-2	1-a	A-a-1		cPenO	H	H	2-Nap	C		387(M^++1)
A-a-3	4e-1	Int.A-4	BRA2	cPenO	Et	H	5-Ind	C		404(M^++1)
A-a-4	1-a	A-a-3		cPenO	H	H	5-Ind	C		376(M^++1)
A-a-5	4e-1	Int.A-4	BRA3	cPenO	Et	H	1Me-5-Ind	C		418(M^++1)
A-a-6	1-a	A-a-5		cPenO	H	H	1Me-5-Ind	C		390(M^++1)
A-a-7	4e-1	Int.A-4	BRA4	cPenO	Et	H	1Et-5-Ind	C		432(M^++1)
A-a-8	1-a	A-a-7		cPenO	H	H	1Et-5-Ind	C		404(M^++1)
A-a-9	4e-1	Int.A-4	BRA7	cPenO	Et	H	5-1Idz	C		405M^++1)
A-a-10	1-a	A-a-9		cPenO	H	H	5-1Idz	C		377(M^++1)
A-a-11	4e-1	Int.A-4	BRA8	cPenO	Et	H	1Me-5-Idz	C		419M^++1)
A-a-12	1-a	A-a-11		cPenO	H	H	1Me-5-Idz	C		391(M^++1)
A-a-13	4e-1	Int.A-4	BRA9	cPenO	Et	H	1Et-5-Idz	C		433(M^++1)
A-a-14	1-a	A-a-13		cPenO	H	H	1Et-5-Idz	C		405(M^++1)
A-a-15	4e-1	Int.A-4	BRA10	cPenO	Et	H	2Me-5-Idz	C		419(M^++1)
A-a-16	1-a	A-a-15		cPenO	H	H	2Me-5-Idz	C		391(M^++1)
A-a-17	4e-1	Int.A-4	BRA11	cPenO	Et	H	5-BF	C		405(M^++1)
A-a-18	1-a	A-a-17		cPenO	H	H	5-BF	C		377(M^++1)
A-a-19	4e-1	Int.A-4	BRA12	cPenO	Et	H	5-BT	C		421(M^++1)
A-a-20	1-a	A-a-19		cPenO	H	H	5-BT	C		393(M^++1)
A-a-21	4e-2	Int.A-4	Het1	cPenO	Et	H	5-Bzt	C		422(M^++1)
A-a-22	1-a	A-a-21		cPenO	H	H	5-Bzt	C		394(M^++1)
A-a-23	4e-2	Int.A-4	Het2	cPenO	Et	H	3-Qu	C		416(M^++1)
A-a-24	1-a	A-a-23		cPenO	H	H	3-Qu	C		388(M^++1)
A-a-25	4e-1	Int.A-4	BRA13	cPenO	Et	H	6-Qu	C		416(M^++1)
A-a-26	1-a	A-a-25		cPenO	H	H	6-Qu	C		388(M^++1)
A-a-27	4e-2	Int.A-4	Het3	cPenO	Et	H	6-IQ	C		416(M^++1)
A-a-28	1-a	A-a-27		cPenO	H	H	6-IQ	C		388(M^++1)
A-a-29	4e-1	Int.A-9	BRA1	BnO	Et	H	2-Nap	C		437(M^++1)
A-a-30	1-a	A-a-29		BnO	H	H	2-Nap	C		409(M^++1)
A-a-31	4e-1	Int.A-9	BRA2	BnO	Et	H	5-Ind	C		426(M^++1)
A-a-32	1-a	A-a-31		BnO	H	H	5-Ind	C		398(M^++1)
A-a-33	4e-1	Int.A-9	BRA3	BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-a-34	1-a	A-a-33		BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		412(M^++1)
A-a-35	4e-1	Int.A-9	BRA7	BnO	Et	H	5-1Idz	C		427(M^++1)
A-a-36	1-a	A-a-35		BnO	H	H	5-1Idz	C		399(M^++1)
A-a-37	4e-1	Int.A-9	BRA8	BnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
A-a-38	1-a	A-a-37		BnO	H	H	1Me-5-Idz	C		413(M^++1)
A-a-39	4e-1	Int.A-9	BRA9	BnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)
A-a-40	1-a	A-a-39		BnO	H	H	1Et-5-Idz	C		427(M^++1)
A-a-41	4e-1	Int.A-9	BRA11	BnO	Et	H	5-BF	C		427(M^++1)
A-a-42	1-a	A-a-41		BnO	H	H	5-BF	C		399(M^++1)
A-a-43	4e-2	Int.A-9	BRA13	BnO	Et	H	6-Qu	C		438(M^++1)
A-a-44	1-a	A-a-43		BnO	H	H	6-Qu	C		410(M^++1)
A-a-45	4e-1	Int.A-11	BRA2	cPenMeO	Et	H	5-Ind	C		418(M^++1)
A-a-46	1-a	A-a-45		cPenMeO	H	H	5-Ind	C		390(M^++1)

[0223] [表10]

Table-A-a-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-a-47	4e-1	Int.A-11	BRA4	cPenMeO	Et	H	1Et-5-Ind	C		446(M^++1)
A-a-48	1-a	A-a-47		cPenMeO	H	H	1Et-5-Ind	C		418M^++1)
A-a-49	4e-1	Int.A-11	BRA8	cPenMeO	Et	H	1Me-5-Idz	C		433(M^++1)
A-a-50	1-a	A-a-49		cPenMeO	H	H	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)
A-a-51	4e-2	Int.A-11	Het2	cPenMeO	Et	H	3-Qu	C		430(M^++1)
A-a-52	1-a	A-a-51		cPenMeO	H	H	3-Qu	C		402(M^++1)
A-a-53	4e-1	Int.A-15	BRA1	cHexMeO	Et	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-a-54	1-a	A-a-53		cHexMeO	H	H	2-Nap	C		415(M^++1)
A-a-55	4e-1	Int.A-15	BRA3	cHexMeO	Et	H	1Me-5-Ind	C		446(M^++1)
A-a-56	1-a	A-a-55		cHexMeO	H	H	1Me-5-Ind	C		418(M^++1)
A-a-57	4e-1	Int.A-15	BRA7	cHexMeO	Et	H	5-1Idz	C		433(M^++1)
A-a-58	1-a	A-a-57		cHexMeO	H	H	5-1Idz	C		405(M^++1)
A-a-59	4e-2	Int.A-15	Het3	cHexMeO	Et	H	6-IQ	C		444(M^++1)
A-a-60	1-a	A-a-59		cHexMeO	H	H	6-IQ	C		416(M^++1)
A-a-61	4e-1	Int.A-16	BRA3	cHexO	Et	H	1Me-5-Ind	C		432(M^++1)
A-a-62	1-a	A-a-61		cHexO	H	H	1Me-5-Ind	C		404(M^++1)
A-a-63	4e-1	Int.A-16	BRA8	cHexO	Et	H	1Me-5-Idz	C		433(M^++1)
A-a-64	1-a	A-a-63		cHexO	H	H	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)
A-a-65	4e-2	Int.A-16	Het2	cHexO	Et	H	3-Qu	C		430(M^++1)
A-a-66	1-a	A-a-65		cHexO	H	H	3-Qu	C		402(M^++1)
A-a-67	4e-1	Int.A-16	BRA13	cHexO	Et	H	6-Qu	C		430(M^++1)
A-a-68	1-a	A-a-67		cHexO	H	H	6-Qu	C		402(M^++1)
A-a-69	4e-1	Int.A-17	BRA1	cHepO	Et	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-a-70	1-a	A-a-69		cHepO	H	H	2-Nap	C		415(M^++1)
A-a-71	4e-1	Int.A-17	BRA2	cHepO	Et	H	5-Ind	C		432(M^++1)
A-a-72	1-a	A-a-71		cHepO	H	H	5-Ind	C		404(M^++1)
A-a-73	4e-1	Int.A-17	BRA8	cHepO	Et	H	1Me-5-Idz	C		447(M^++1)
A-a-74	1-a	A-a-73		cHepO	H	H	1Me-5-Idz	C		419(M^++1)
A-a-75	4e-1	Int.A-17	BRA13	cHepO	Et	H	6-Qu	C		444(M^++1)
A-a-76	1-a	A-a-75		cHepO	H	H	6-Qu	C		416(M^++1)
A-a-77	4e-1	Int.A-18	BRA2	nPrO	Et	H	5-Ind	C		378(M^++1)
A-a-78	1-a	A-a-77		nPrO	H	H	5-Ind	C		350(M^++1)
A-a-79	4e-1	Int.A-18	BRA3	nPrO	Et	H	1Me-5-Ind	C		392(M^++1)
A-a-80	1-a	A-a-79		nPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		364(M^++1)
A-a-81	4e-1	Int.A-18	BRA7	nPrO	Et	H	5-1Idz	C		379(M^++1)
A-a-82	1-a	A-a-81		nPrO	H	H	5-1Idz	C		351(M^++1)
A-a-83	4e-1	Int.A-18	BRA8	nPrO	Et	H	1Me-5-Idz	C		393(M^++1)
A-a-84	1-a	A-a-83		nPrO	H	H	1Me-5-Idz	C		365(M^++1)
A-a-85	4e-1	Int.A-19	BRA1	iPrO	Et	H	2-Nap	C		389(M^++1)
A-a-86	1-a	A-a-85		iPrO	H	H	2-Nap	C		361(M^++1)
A-a-87	4e-1	Int.A-19	BRA3	iPrO	Et	H	1Me-5-Ind	C		392(M^++1)
A-a-88	1-a	A-a-87		iPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		364(M^++1)
A-a-89	4e-1	Int.A-19	BRA8	iPrO	Et	H	1Me-5-Idz	C		393(M^++1)
A-a-90	1-a	A-a-89		iPrO	H	H	1Me-5-Idz	C		365(M^++1)
A-a-91	4e-1	Int.A-19	BRA13	iPrO	Et	H	6-Qu	C		390(M^++1)
A-a-92	1-a	A-a-91		iPrO	H	H	6-Qu	C		362(M^++1)
A-a-93	4e-1	Int.A-20	BRA2	nBuO	Et	H	5-Ind	C		392(M^++1)
A-a-94	1-a	A-a-93		nBuO	H	H	5-Ind	C		364(M^++1)

[0224] [表11]

Table-A-a-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-a-95	4e-1	Int.A-20	BRA3	nBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		406(M^++1)
A-a-96	1-a	A-a-95		nBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		378(M^++1)
A-a-97	4e-1	Int.A-20	BRA8	nBuO	Et	H	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-a-98	1-a	A-a-97		nBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		379(M^++1)
A-a-99	4e-1	Int.A-21	BRA1	iBuO	Et	H	2-Nap	C		403(M^++1)
A-a-100	1-a	A-a-99		iBuO	H	H	2-Nap	C		375(M^++1)
A-a-101	4e-1	Int.A-21	BRA3	iBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		406(M^++1)
A-a-102	1-a	A-a-101		iBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		378(M^++1)
A-a-103	4e-1	Int.A-21	BRA7	iBuO	Et	H	5-1Idz	C		393(M^++1)
A-a-104	1-a	A-a-103		iBuO	H	H	5-1Idz	C		365(M^++1)
A-a-105	4e-2	Int.A-21	Het3	iBuO	Et	H	6-IQ	C		404(M^++1)
A-a-106	1-a	A-a-105		iBuO	H	H	6-IQ	C		376(M^++1)
A-a-107	4f-1	Int.A-22	Hal7	2FBnO	Et	H	2-Nap	C		455(M^++1)
A-a-108	1-a	A-a-107		2FBnO	H	H	2-Nap	C		427(M^++1)
A-a-109	4f-1	Int.A-23	Hal7	2FBnO	Et	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-a-110	1-a	A-a-109		2FBnO	H	H	5-Ind	C		416(M^++1)
A-a-111	4f-1	Int.A-26	Hal7	2FBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		459(M^++1)
A-a-112	1-a	A-a-111		2FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		430(M^++1)
A-a-113	4f-1	Int.A-24	Hal8	3FBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		458(M^++1)
A-a-114	1-a	A-a-113		3FBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		430(M^++1)
A-a-115	4f-1	Int.A-26	Hal8	3FBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		459(M^++1)
A-a-116	1-a	A-a-115		3FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		431(M^++1)
A-a-117	4f-1	Int.A-29	Hal8	3FBnO	Et	H	6-Qu	C		456(M^++1)
A-a-118	1-a	A-a-117		3FBnO	H	H	6-Qu	C		428(M^++1)
A-a-119	4f-1	Int.A-22	Hal9	4FBnO	Et	H	2-Nap	C		455(M^++1)
A-a-120	1-a	A-a-119		4FBnO	H	H	2-Nap	C		427(M^++1)
A-a-121	4f-1	Int.A-27	Hal9	4FBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		473(M^++1)
A-a-122	1-a	A-a-121		4FBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		445(M^++1)
A-a-123	4f-1	Int.A-28	Hal9	4FBnO	Et	H	5-BF	C		445(M^++1)
A-a-124	1-a	A-a-123		4FBnO	H	H	5-BF	C		417(M^++1)
A-a-125	4f-1	Int.A-29	Hal9	4FBnO	Et	H	6-Qu	C		456(M^++1)
A-a-126	1-a	A-a-125		4FBnO	H	H	6-Qu	C		428(M^++1)
A-a-127	4f-1	Int.A-22	Hal10	2ClBnO	Et	H	2-Nap	C		471(M^++1)
A-a-128	1-a	A-a-127		2ClBnO	H	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-a-129	4f-1	Int.A-27	Hal10	2ClBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		489(M^++1)
A-a-130	1-a	A-a-129		2ClBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		461(M^++1)
A-a-131	4f-1	Int.A-28	Hal10	2ClBnO	Et	H	5-BF	C		461(M^++1)
A-a-132	1-a	A-a-131		2ClBnO	H	H	5-BF	C		433(M^++1)
A-a-133	4f-1	Int.A-22	Hal11	3ClBnO	Et	H	2-Nap	C		471(M^++1)
A-a-134	1-a	A-a-133		3ClBnO	H	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-a-135	4f-1	Int.A-23	Hal11	3ClBnO	Et	H	5-Ind	C		460(M^++1)
A-a-136	1-a	A-a-135		3ClBnO	H	H	5-Ind	C		432(M^++1)
A-a-137	4f-1	Int.A-24	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		474(M^++1)
A-a-138	1-a	A-a-137		3ClBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		446(M^++1)
A-a-139	4f-1	Int.A-26	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		475(M^++1)
A-a-140	1-a	A-a-139		3ClBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		447(M^++1)
A-a-141	4f-1	Int.A-23	Hal12	4MeBnO	Et	H	5-Ind	C		440(M^++1)
A-a-142	1-a	A-a-141		4MeBnO	H	H	5-Ind	C		412(M^++1)

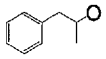
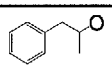
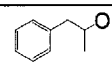
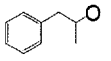
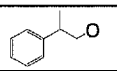
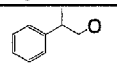
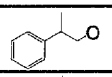
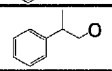
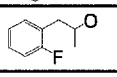
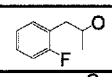
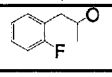
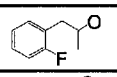
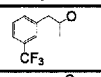
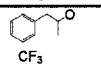
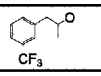
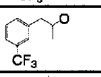
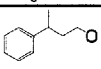
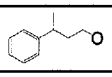
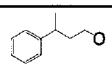
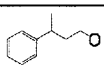
[0225] [表12]

Table-A-a-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-a-143	4f-1	Int.A-24	Hal12	4MeBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		454(M^++1)
A-a-144	1-a	A-a-143		4MeBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		426(M^++1)
A-a-145	4f-1	Int.A-26	Hal12	4MeBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		455(M^++1)
A-a-146	1-a	A-a-145		4MeBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		427(M^++1)
A-a-147	4f-1	Int.A-22	Hal13	4CF3BnO	Et	H	2-Nap	C		505(M^++1)
A-a-148	1-a	A-a-147		4CF3BnO	H	H	2-Nap	C		477(M^++1)
A-a-149	4f-1	Int.A-24	Hal13	4CF3BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		508(M^++1)
A-a-150	1-a	A-a-149		4CF3BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		480(M^++1)
A-a-151	4f-1	Int.A-25	Hal13	4CF3BnO	Et	H	5-1Idz	C		495(M^++1)
A-a-152	1-a	A-a-151		4CF3BnO	H	H	5-1Idz	C		467(M^++1)
A-a-153	4f-2	Int.A-22	Al5	2EtBuO	Et	H	2-Nap	C		431(M^++1)
A-a-154	1-a	A-a-153		2EtBuO	H	H	2-Nap	C		403(M^++1)
A-a-155	4f-2	Int.A-23	Al5	2EtBuO	Et	H	5-Ind	C		420(M^++1)
A-a-156	1-a	A-a-155		2EtBuO	H	H	5-Ind	C		392(M^++1)
A-a-157	4f-2	Int.A-26	Al5	2EtBuO	Et	H	1Me-5-Idz	C		435(M^++1)
A-a-158	1-a	A-a-157		2EtBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-a-159	4f-2	Int.A-23	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		483(M^++1)
A-a-160	1-a	A-a-159		2(4DMAPh)EtO	H	H	5-Ind	C		455(M^++1)
A-a-161	4f-2	Int.A-24	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		497(M^++1)
A-a-162	1-a	A-a-161		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		469(M^++1)
A-a-163	4f-2	Int.A-27	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		512(M^++1)
A-a-164	1-a	A-a-163		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		484(M^++1)
A-a-165	4f-2	Int.A-22	Al7	2(PhO)EtO	Et	H	2-Nap	C		467(M^++1)
A-a-166	1-a	A-a-165		2(PhO)EtO	H	H	2-Nap	C		439(M^++1)
A-a-167	4f-2	Int.A-24	Al7	2(PhO)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		470(M^++1)
A-a-168	1-a	A-a-167		2(PhO)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		442(M^++1)
A-a-169	4f-2	Int.A-29	Al7	2(PhO)EtO	Et	H	6-Qu	C		468(M^++1)
A-a-170	1-a	A-a-169		2(PhO)EtO	H	H	6-Qu	C		440(M^++1)
A-a-171	4f-2	Int.A-22	Al8	1PhEtO	Et	H	2-Nap	C		451(M^++1)
A-a-172	1-a	A-a-171		1PhEtO	H	H	2-Nap	C		423(M^++1)
A-a-173	4f-2	Int.A-24	Al8	1PhEtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		454(M^++1)
A-a-174	1-a	A-a-173		1PhEtO	H	H	1Me-5-Ind	C		426(M^++1)
A-a-175	4f-2	Int.A-25	Al8	1PhEtO	Et	H	5-1Idz	C		441(M^++1)
A-a-176	1-a	A-a-175		1PhEtO	H	H	5-1Idz	C		413(M^++1)
A-a-177	4f-2	Int.A-23	Al9	1(2FPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		458(M^++1)
A-a-178	1-a	A-a-177		1(2FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		430(M^++1)
A-a-179	4f-2	Int.A-27	Al9	1(2FPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		487(M^++1)
A-a-180	1-a	A-a-179		1(2FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		459(M^++1)
A-a-181	4f-2	Int.A-29	Al9	1(2FPh)EtO	Et	H	6-Qu	C		470(M^++1)
A-a-182	1-a	A-a-181		1(2FPh)EtO	H	H	6-Qu	C		442(M^++1)
A-a-183	4f-2	Int.A-23	Al10	1(4ClPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		475(M^++1)
A-a-184	1-a	A-a-183		1(4ClPh)EtO	H	H	5-Ind	C		446(M^++1)
A-a-185	4f-2	Int.A-24	Al10	1(4ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		489(M^++1)
A-a-186	1-a	A-a-185		1(4ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		460(M^++1)
A-a-187	4f-2	Int.A-27	Al10	1(4ClPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		504(M^++1)
A-a-188	1-a	A-a-187		1(4ClPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		476(M^++1)
A-a-189	4f-2	Int.A-22	Al11	4Me,cHexO	Et	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-a-190	1-a	A-a-189		4Me,cHexO	H	H	2-Nap	C		415(M^++1)

[0226] [表13]

Table-A-a-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-a-191	4f-2	Int.A-24	AI11	4Me,cHexO	Et	H	1Me-5-Ind	C		446(M^++1)
A-a-192	1-a	A-a-191		4Me,cHexO	H	H	1Me-5-Ind	C		418(M^++1)
A-a-193	4f-2	Int.A-23	AI12		Et	H	5-Ind	C		454(M^++1)
A-a-194	1-a	A-a-193			H	H	5-Ind	C		426(M^++1)
A-a-195	4f-2	Int.A-26	AI12		Et	H	1Me-5-Idz	C		469(M^++1)
A-a-196	1-a	A-a-195			H	H	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
A-a-197	4f-2	Int.A-22	AI13		Et	H	2-Nap	C		465(M^++1)
A-a-198	1-a	A-a-197			H	H	2-Nap	C		437(M^++1)
A-a-199	4f-2	Int.A-27	AI13		Et	H	1Et-5-Idz	C		483(M^++1)
A-a-200	1-a	A-a-199			H	H	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)
A-a-201	4f-2	Int.A-23	AI14		Et	H	5-Ind	C		472(M^++1)
A-a-202	1-a	A-a-201			H	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-a-203	4f-2	Int.A-24	AI14		Et	H	1Me-5-Ind	C		486(M^++1)
A-a-204	1-a	A-a-203			H	H	1Me-5-Ind	C		458(M^++1)
A-a-205	4f-2	Int.A-23	AI15		Et	H	5-Ind	C		522(M^++1)
A-a-206	1-a	A-a-205			H	H	5-Ind	C		494(M^++1)
A-a-207	4f-2	Int.A-24	AI15		Et	H	1Me-5-Ind	C		536(M^++1)
A-a-208	1-a	A-a-207			H	H	1Me-5-Ind	C		508(M^++1)
A-a-209	4f-2	Int.A-24	AI16		Et	H	1Me-5-Ind	C		482(M^++1)
A-a-210	1-a	A-a-209			H	H	1Me-5-Ind	C		454(M^++1)
A-a-211	4f-2	Int.A-26	AI16		Et	H	1Me-5-Idz	C		483(M^++1)
A-a-212	1-a	A-a-211			H	H	1Me-5-Idz	C		455(M^++1)
A-a-213	4f-2	Int.A-22	AI17	1IndanO	Et	H	2-Nap	C		463(M^++1)
A-a-214	1-a	A-a-213		1IndanO	H	H	2-Nap	C		435(M^++1)
A-a-215	4f-2	Int.A-24	AI17	1IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		466(M^++1)
A-a-216	1-a	A-a-215		1IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		438(M^++1)
A-a-217	4f-2	Int.A-25	AI17	1IndanO	Et	H	5-1Idz	C		453(M^++1)
A-a-218	1-a	A-a-217		1IndanO	H	H	5-1Idz	C		425(M^++1)

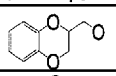
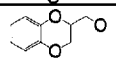
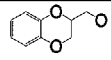
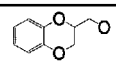
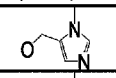
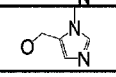
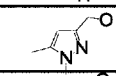
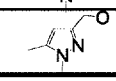
[0227] [表14]

Table-A-a-6

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-a-219	4f-2	Int.A-22	AI18	2IndanO	Et	H	2-Nap	C		463(M^++1)
A-a-220	1-a	A-a-219		2IndanO	H	H	2-Nap	C		435(M^++1)
A-a-221	4f-2	Int.A-23	AI18	2IndanO	Et	H	5-Ind	C		452(M^++1)
A-a-222	1-a	A-a-221		2IndanO	H	H	5-Ind	C		424(M^++1)
A-a-223	4f-2	Int.A-26	AI18	2IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		467(M^++1)
A-a-224	1-a	A-a-223		2IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		439(M^++1)
A-a-225	4f-2	Int.A-24	AI19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		496(M^++1)
A-a-226	1-a	A-a-225		5OMe-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		468(M^++1)
A-a-227	4f-2	Int.A-25	AI19	5OMe-2-IndanO	Et	H	5-1Idz	C		483(M^++1)
A-a-228	1-a	A-a-227		5OMe-2-IndanO	H	H	5-1Idz	C		455(M^++1)
A-a-229	4f-2	Int.A-27	AI19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		511(M^++1)
A-a-230	1-a	A-a-229		5OMe-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		483(M^++1)
A-a-231	4f-2	Int.A-22	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	H	2-Nap	C		523(M^++1)
A-a-232	1-a	A-a-231		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		495(M^++1)
A-a-233	4f-2	Int.A-23	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	H	5-Ind	C		512(M^++1)
A-a-234	1-a	A-a-233		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	5-Ind	C		484(M^++1)
A-a-235	4f-2	Int.A-22	AI21	5F-2-IndanO	Et	H	2-Nap	C		481(M^++1)
A-a-236	1-a	A-a-235		5F-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		453(M^++1)
A-a-237	4f-2	Int.A-24	AI21	5F-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		484(M^++1)
A-a-238	1-a	A-a-237		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		456(M^++1)
A-a-239	4f-2	Int.A-26	AI21	5F-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		485(M^++1)
A-a-240	1-a	A-a-239		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		457(M^++1)
A-a-241	4f-2	Int.A-27	AI21	5F-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		499(M^++1)
A-a-242	1-a	A-a-241		5F-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		471(M^++1)
A-a-243	4f-2	Int.A-23	AI22		Et	H	5-Ind	C		466(M^++1)
A-a-244	1-a	A-a-243			H	H	5-Ind	C		438(M^++1)
A-a-245	4f-2	Int.A-24	AI22		Et	H	1Me-5-Ind	C		480(M^++1)
A-a-246	1-a	A-a-245			H	H	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-a-247	4f-2	Int.A-22	AI23		Et	H	2-Nap	C		477(M^++1)
A-a-248	1-a	A-a-247			H	H	2-Nap	C		449(M^++1)
A-a-249	4f-2	Int.A-25	AI23		Et	H	5-1Idz	C		467(M^++1)
A-a-250	1-a	A-a-249			H	H	5-1Idz	C		439(M^++1)
A-a-251	4f-2	Int.A-24	AI24	2(2MePh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		468(M^++1)
A-a-252	1-a	A-a-251		2(2MePh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-a-253	4f-2	Int.A-29	AI24	2(2MePh)EtO	Et	H	6-Qu	C		466(M^++1)
A-a-254	1-a	A-a-253		2(2MePh)EtO	H	H	6-Qu	C		438(M^++1)

[0228] [表15]

Table-A-a-7

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-a-255	4f-2	Int.A-22	AI25	2(3FPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		469(M^++1)
A-a-256	1-a	A-a-255		2(3FPh)EtO	H	H	2-Nap	C		441(M^++1)
A-a-257	4f-2	Int.A-23	AI25	2(3FPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		458(M^++1)
A-a-258	1-a	A-a-257		2(3FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		430(M^++1)
A-a-259	4f-2	Int.A-26	AI26	2(2ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		490(M^++1)
A-a-260	1-a	A-a-259		2(2ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		461(M^++1)
A-a-261	4f-2	Int.A-29	AI26	2(2ClPh)EtO	Et	H	6-Qu	C		487(M^++1)
A-a-262	1-a	A-a-261		2(2ClPh)EtO	H	H	6-Qu	C		458(M^++1)
A-a-263	4f-2	Int.A-22	AI28	2(1-Nap)EtO	Et	H	2-Nap	C		501(M^++1)
A-a-264	1-a	A-a-263		2(1-Nap)EtO	H	H	2-Nap	C		473(M^++1)
A-a-265	4f-2	Int.A-23	AI28	2(1-Nap)EtO	Et	H	5-Ind	C		490(M^++1)
A-a-266	1-a	A-a-265		2(1-Nap)EtO	H	H	5-Ind	C		462(M^++1)
A-a-267	4f-2	Int.A-24	AI27	2(2-Nap)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		504(M^++1)
A-a-268	1-a	A-a-267		2(2-Nap)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		476(M^++1)
A-a-269	4f-2	Int.A-25	AI27	2(2-Nap)EtO	Et	H	5-1Idz	C		491(M^++1)
A-a-270	1-a	A-a-269		2(2-Nap)EtO	H	H	5-1Idz	C		463(M^++1)
A-a-271	4f-2	Int.A-22	AI29		Et	H	2-Nap	C		495(M^++1)
A-a-272	1-a	A-a-271			H	H	2-Nap	C		467(M^++1)
A-a-273	4f-2	Int.A-23	AI29		Et	H	5-Ind	C		484(M^++1)
A-a-274	1-a	A-a-273			H	H	5-Ind	C		456(M^++1)
A-a-275	4f-2	Int.A-22	AI30	2(PhS)EtO	Et	H	2-Nap	C		483(M^++1)
A-a-276	1-a	A-a-275		2(PhS)EtO	H	H	2-Nap	C		454(M^++1)
A-a-277	4f-2	Int.A-23	AI30	2(PhS)EtO	Et	H	5-Ind	C		472(M^++1)
A-a-278	1-a	A-a-277		2(PhS)EtO	H	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-a-279	4f-2	Int.A-24	AI31		Et	H	1Me-5-Ind	C		444(M^++1)
A-a-280	1-a	A-a-279			H	H	1Me-5-Ind	C		416(M^++1)
A-a-281	4f-2	Int.A-27	AI32		Et	H	1Et-5-Idz	C		458(M^++1)
A-a-282	1-a	A-a-281			H	H	1Et-5-Idz	C		430(M^++1)

[0229] [表16]

Table-A-a-8

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-a-283	4f-2	Int.A-22	AI33		Et	H	2-Nap	C		438(M^++1)
A-a-284	1-a	A-a-283			H	H	2-Nap	C		410(M^++1)
A-a-285	4f-2	Int.A-23	AI34		Et	H	5-Ind	C		441(M^++1)
A-a-286	1-a	A-a-285			H	H	5-Ind	C		413(M^++1)
A-a-287	4f-2	Int.A-23	AI35		Et	H	5-Ind	C		477(M^++1)
A-a-288	1-a	A-a-287			H	H	5-Ind	C		449(M^++1)
A-a-289	4f-2	Int.A-26	AI36		Et	H	1Me-5-Idz	C		456(M^++1)
A-a-290	1-a	A-a-289			H	H	1Me-5-Idz	C		428(M^++1)
A-a-291	4e-1	Int.A-4	BRA5	cPen	Et	H	1Me-4-Ind	C		402(M^++1)
A-a-292	1-a	A-a-291		cPen	H	H	1Me-4-Ind	C		374(M^++1)
A-a-293	4e-1	Int.A-4	BRA6	cPen	Et	H	1Me-6-Ind	C		402(M^++1)
A-a-294	1-a	A-a-293		cPen	H	H	1Me-6-Ind	C		374(M^++1)

[0230] 参考例4

2－[4－クロロ－5－ヒドロキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(中間体A－30)の合成(製造法4工程h－1)

中間体A－22(117. 7mg)のクロロホルム(3ml)溶液に、氷冷下スルフリルクロライド(41ul、Ald)を加え、10分攪拌後室温にて17時間撹拌した。減圧下濃縮した後、水(10ml)、クロロホルム(20ml)を加え抽出後、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和重曹水および飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去することで、標記化合物(中間体A－30;119. 2mg)を得た。Mass(LCMS):381(M^+＋1)、保持時間;N. D(溶出条件:C)。

[0231] 参考例5

2－[4－ブロモ－5－ヒドロキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(中間体A－34)の合成(製造法4工程h－2)

中間体A－22(702. 3mg)のアセトニトリル(10ml)溶液に、氷冷下NBS(370. 6mg)を加え、10分攪拌後室温にて17時間撹拌した。減圧下濃縮した後、水(30ml)、酢酸エチル(50ml)を加え抽出後、有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、5%亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水および飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝8:1)で精製し標記化合物(中間体A－34;813. 3mg)を得た。Mass(

LCMS):425(M^+)、保持時間;N. D(溶出条件:C)。

[0232] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int. A－3に示す。ただしTable中、「Exp. 」と記す欄には中間体番号を記入した。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。

[0233] [表17]

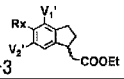


Table-Int.A-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.A-31	4h-1	A-a-24		HO	Cl	1Me-5-Ind	C		384(M^++1)
Int.A-32	4h-1	A-a-26		HO	Cl	1Me-5-Idz	C		385(M^++1)
Int.A-33	4h-1	A-a-27		HO	Cl	1Et-5-Idz	C		399(M^++1)
Int.A-35	4h-2	A-a-24		HO	Br	1Me-5-Ind	C		427(M^+)
Int.A-36	4h-2	A-a-26		HO	Br	1Me-5-Idz	C		428(M^+)
Int.A-37	4h-2	A-a-27		HO	Br	1Et-5-Idz	C		442(M^+)

[0234] 実施例A－b－1

2－[4－クロロ－5－シクロペンチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチルの合成(化合物番号A－b－1)の合成(製造法4工程f－2)

参考例1の中間体A－1の合成法(製造法4工程f－2)に記載の手順に従って中間体A－30(115. 6mg)、シクロペンタノール(64. 5ul、Ald)、トリフェニルホスフィン(210. 3mg)、ジターシャリーブチルアゾジカルボキシレート(221. 4mg、Ald)。を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－b－1;134. 7mg)を得た(但し反応は12時間行った)。

[0235] 実施例A－b－2

2－[4－クロロ－5－シクロペンチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号A－b－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物A－b－1(134. 5mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0. 65ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－b－2;121. 3mg)を得た(但し反

応は13時間行った)。

[0236] 実施例A－b－243

2－[4－ブロモ－5－シクロペンチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2,3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号A－b－243)の合成(製造法4工程f－2)

参考例1の中間体A－1の合成法(製造法4工程f－2)に記載の手順に従って中間体A－34(813.3mg)、シクロペンタノール(200ul、Ald)、トリフェニルホスフィン(561.4mg)、ジターシャリーブチルアゾジカルボキシレート(611.3mg、Ald)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－b－243;1.02g)を得た(但し反応は12時間行った)。

[0237] 実施例A－b－244

2－[4－ブロモ－5－シクロペンチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2,3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号A－b－244)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物A－b－243(142.3mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0.65ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－b－244;118.8mg)を得た(但し反応は3時間行った)。

[0238] 実施例A－b－445

2－[5－シクロペンチルオキシ－4－メチル－6－(ナフタレン－2－イル)－2,3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチルの合成(化合物番号A－b－445)の合成(製造法4工程e－1)

実施例化合物A－a－1の合成法(製造法4工程e－1)に記載の手順に従って実施例化合物A－a－243(356.6mg)、トリメチルボロキシン(600ul、Ald)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0.8ml)および$(Ph_3P)_4Pd$(115.5mg、ナカライテスク社製)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－b－445;101.3mg)を得た(但し反応は16時間行った)。

[0239] 実施例A－b－446

2－[5－シクロペンチルオキシ－4－メチル－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号A－b－446)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物A－b－445(98. 6mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0. 65ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－b－446;73. 4mg)を得た(但し反応は15時間行った)。

[0240] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－A－b－1からTable－A－b－14に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。また、「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに示したものである。但し、表中の「Manufacturer」の欄が空欄の試薬については通常の化学文献に記載の方法に準じて合成したものである。

[0241] [表18]

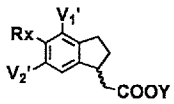


Table-A-b-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-1	4f-2	Int.A-30	Al1	cPenO	Et	Cl	2-Nap	C		449(M^++1)
A-b-2	1-a	A-b-1		cPenO	H	Cl	2-Nap	C		421(M^++1)
A-b-3	4f-2	Int.A-30	Al2	cPenMeO	Et	Cl	2-Nap	C		463(M^++1)
A-b-4	1-a	A-b-3		cPenMeO	H	Cl	2-Nap	C		431(M^++1)
A-b-5	4f-1	Int.A-30	Hal2	cHexMeO	Et	Cl	2-Nap	C		477(M^++1)
A-b-6	1-a	A-b-5		cHexMeO	H	Cl	2-Nap	C		449(M^++1)
A-b-7	4f-2	Int.A-30	Al3	cHexO	Et	Cl	2-Nap	C		463(M^++1)
A-b-8	1-a	A-b-7		cHexO	H	Cl	2-Nap	C		435(M^++1)
A-b-9	4f-2	Int.A-30	Al4	cHepO	Et	Cl	2-Nap	C		477(M^++1)
A-b-10	1-a	A-b-9		cHepO	H	Cl	2-Nap	C		449(M^++1)
A-b-11	4f-1	Int.A-30	Hal3	nPrO	Et	Cl	2-Nap	C		422(M^++1)
A-b-12	1-a	A-b-11		nPrO	H	Cl	2-Nap	C		394(M^++1)
A-b-13	4f-1	Int.A-30	Hal4	iPrO	Et	Cl	2-Nap	C		422(M^++1)
A-b-14	1-a	A-b-13		iPrO	H	Cl	2-Nap	C		394(M^++1)
A-b-15	4f-1	Int.A-30	Hal5	nBuO	Et	Cl	2-Nap	C		437(M^++1)
A-b-16	1-a	A-b-15		nBuO	H	Cl	2-Nap	C		409(M^++1)
A-b-17	4f-1	Int.A-30	Hal6	iBuO	Et	Cl	2-Nap	C		437(M^++1)
A-b-18	1-a	A-b-17		iBuO	H	Cl	2-Nap	C		409(M^++1)
A-b-19	4f-1	Int.A-30	Hal1	BnO	Et	Cl	2-Nap	C		471(M^++1)
A-b-20	1-a	A-b-19		BnO	H	Cl	2-Nap	C		443(M^++1)
A-b-21	4f-1	Int.A-30	Hal7	2FBnO	Et	Cl	2-Nap	C		489(M^++1)
A-b-22	1-a	A-b-21		2FBnO	H	Cl	2-Nap	C		461(M^++1)
A-b-23	4f-1	Int.A-30	Hal8	3FBnO	Et	Cl	2-Nap	C		489(M^++1)
A-b-24	1-a	A-b-23		3FBnO	H	Cl	2-Nap	C		461(M^++1)
A-b-25	4f-1	Int.A-30	Hal9	4FBnO	Et	Cl	2-Nap	C		489(M^++1)
A-b-26	1-a	A-b-25		4FBnO	H	Cl	2-Nap	C		461(M^++1)
A-b-27	4f-1	Int.A-30	Hal10	2ClBnO	Et	Cl	2-Nap	C		505(M^++1)
A-b-28	1-a	A-b-27		2ClBnO	H	Cl	2-Nap	C		487(M^++1)
A-b-29	4f-1	Int.A-30	Hal11	3ClBnO	Et	Cl	2-Nap	C		505(M^++1)
A-b-30	1-a	A-b-29		3ClBnO	H	Cl	2-Nap	C		487(M^++1)
A-b-31	4f-1	Int.A-30	Hal12	4MeBnO	Et	Cl	2-Nap	C		485(M^++1)
A-b-32	1-a	A-b-31		4MeBnO	H	Cl	2-Nap	C		457(M^++1)
A-b-33	4f-1	Int.A-30	Hal13	4CF3BnO	Et	Cl	2-Nap	C		538(M^++1)
A-b-34	1-a	A-b-33		4CF3BnO	H	Cl	2-Nap	C		510(M^++1)
A-b-35	4f-2	Int.A-30	Al5	2EtBuO	Et	Cl	2-Nap	C		465(M^++1)
A-b-36	1-a	A-b-35		2EtBuO	H	Cl	2-Nap	C		437(M^++1)
A-b-37	4f-2	Int.A-30	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	Cl	2-Nap	C		528(M^++1)
A-b-38	1-a	A-b-37		2(4DMAPh)EtO	H	Cl	2-Nap	C		500(M^++1)
A-b-39	4f-2	Int.A-30	Al7	2(PhO)EtO	Et	Cl	2-Nap	C		501(M^++1)
A-b-40	1-a	A-b-39		2(PhO)EtO	H	Cl	2-Nap	C		473(M^++1)
A-b-41	4f-2	Int.A-30	Al8	1PhEtO	Et	Cl	2-Nap	C		485(M^++1)
A-b-42	1-a	A-b-41		1PhEtO	H	Cl	2-Nap	C		457(M^++1)
A-b-43	4f-2	Int.A-30	Al11	4Me,cHexO	Et	Cl	2-Nap	C		477(M^++1)
A-b-44	1-a	A-b-43		4Me,cHexO	H	Cl	2-Nap	C		449(M^++1)

[0242] [表19]

Table-A-b-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-45	4f-2	Int.A-30	Al17	1IndanO	Et	Cl	2-Nap	C		497(M^++1)
A-b-46	1-a	A-b-45		1IndanO	H	Cl	2-Nap	C		469(M^++1)
A-b-47	4f-2	Int.A-30	Al18	2IndanO	Et	Cl	2-Nap	C		497(M^++1)
A-b-48	1-a	A-b-47		2IndanO	H	Cl	2-Nap	C		469(M^++1)
A-b-49	4f-2	Int.A-30	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	Cl	2-Nap	C		527(M^++1)
A-b-50	1-a	A-b-49		5OMe-2-IndanO	H	Cl	2-Nap	C		499(M^++1)
A-b-51	4f-2	Int.A-30	Al20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Cl	2-Nap	C		557(M^++1)
A-b-52	1-a	A-b-51		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Cl	2-Nap	C		529(M^++1)
A-b-53	4f-2	Int.A-30	Al21	5F-2-IndanO	Et	Cl	2-Nap	C		515(M^++1)
A-b-54	1-a	A-b-53		5F-2-IndanO	H	Cl	2-Nap	C		487(M^++1)
A-b-55	4f-2	Int.A-30	Al22		Et	Cl	2-Nap	C		511(M^++1)
A-b-56	1-a	A-b-55			H	Cl	2-Nap	C		483(M^++1)
A-b-57	4f-2	Int.A-30	Al23		Et	Cl	2-Nap	C		511(M^++1)
A-b-58	1-a	A-b-57			H	Cl	2-Nap	C		483(M^++1)
A-b-59	4f-2	Int.A-30	Al25	2(3FPh)EtO	Et	Cl	2-Nap	C		503(M^++1)
A-b-60	1-a	A-b-59		2(3FPh)EtO	H	Cl	2-Nap	C		475(M^++1)
A-b-61	4f-2	Int.A-30	Al27	2(2-Nap)EtO	Et	Cl	2-Nap	C		535(M^++1)
A-b-62	1-a	A-b-61		2(2-Nap)EtO	H	Cl	2-Nap	C		507(M^++1)
A-b-63	4f-2	Int.A-31	Al1	cPenO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-b-64	1-a	A-b-63		cPenO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		424(M^++1)
A-b-65	4f-2	Int.A-31	Al2	cPenMeO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		466(M^++1)
A-b-66	1-a	A-b-65		cPenMeO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		438(M^++1)
A-b-67	4f-1	Int.A-31	Hal2	cHexMeO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		480(M^++1)
A-b-68	1-a	A-b-67		cHexMeO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-b-69	4f-2	Int.A-31	Al3	cHexO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		466(M^++1)
A-b-70	1-a	A-b-69		cHexO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		438(M^++1)
A-b-71	4f-2	Int.A-31	Al4	cHepO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		480(M^++1)
A-b-72	1-a	A-b-71		cHepO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-b-73	4f-1	Int.A-31	Hal3	nPrO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		425(M^++1)
A-b-74	1-a	A-b-73		nPrO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		397(M^++1)
A-b-75	4f-1	Int.A-31	Hal4	iPrO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		425(M^++1)
A-b-76	1-a	A-b-75		iPrO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		397(M^++1)
A-b-77	4f-1	Int.A-31	Hal5	nBuO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-b-78	1-a	A-b-77		nBuO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		412(M^++1)
A-b-79	4f-1	Int.A-31	Hal6	iBuO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-b-80	1-a	A-b-79		iBuO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		412(M^++1)
A-b-81	4f-1	Int.A-31	Hal1	BnO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		474(M^++1)
A-b-82	1-a	A-b-81		BnO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		446(M^++1)
A-b-83	4f-1	Int.A-31	Hal7	2FBnO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		492(M^++1)
A-b-84	1-a	A-b-83		2FBnO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		464(M^++1)
A-b-85	4f-1	Int.A-31	Hal9	4FBnO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		492(M^++1)
A-b-86	1-a	A-b-85		4FBnO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		464(M^++1)
A-b-87	4f-1	Int.A-31	Hal11	3ClBnO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		508(M^++1)
A-b-88	1-a	A-b-87		3ClBnO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		480(M^++1)

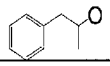
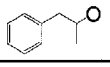
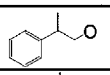
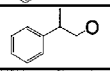
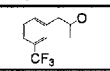
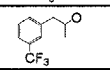
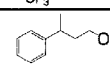
[0243] [表20]

Table-A-b-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-89	4f-1	Int.A-31	Hal12	4MeBnO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		488(M^++1)
A-b-90	1-a	A-b-89		4MeBnO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		460(M^++1)
A-b-91	4f-1	Int.A-31	Hal13	4CF3BnO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		541(M^++1)
A-b-92	1-a	A-b-91		4CF3BnO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		513(M^++1)
A-b-93	4f-2	Int.A-31	Al5	2EtBuO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		468(M^++1)
A-b-94	1-a	A-b-93		2EtBuO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-b-95	4f-2	Int.A-31	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		531(M^++1)
A-b-96	1-a	A-b-95		2(4DMAPh)EtO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		503(M^++1)
A-b-97	4f-2	Int.A-31	Al8	1PhEtO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		488(M^++1)
A-b-98	1-a	A-b-97		1PhEtO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		460(M^++1)
A-b-99	4f-2	Int.A-31	Al11	4Me,cHexO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		480(M^++1)
A-b-100	1-a	A-b-99		4Me,cHexO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-b-101	4f-2	Int.A-31	Al17	1IndanO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		500(M^++1)
A-b-102	1-a	A-b-101		1IndanO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		472(M^++1)
A-b-103	4f-2	Int.A-31	Al18	2IndanO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		500(M^++1)
A-b-104	1-a	A-b-103		2IndanO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		472(M^++1)
A-b-105	4f-2	Int.A-31	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		530(M^++1)
A-b-106	1-a	A-b-105		5OMe-2-IndanO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		502(M^++1)
A-b-107	4f-2	Int.A-31	Al20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		560(M^++1)
A-b-108	1-a	A-b-107		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		532(M^++1)
A-b-109	4f-2	Int.A-31	Al21	5F-2-IndanO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		518(M^++1)
A-b-110	1-a	A-b-109		5F-2-IndanO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		490(M^++1)
A-b-111	4f-2	Int.A-31	Al22		Et	Cl	1Me-5-Ind	C		514(M^++1)
A-b-112	1-a	A-b-111			H	Cl	1Me-5-Ind	C		486(M^++1)
A-b-113	4f-2	Int.A-31	Al23		Et	Cl	1Me-5-Ind	C		514(M^++1)
A-b-114	1-a	A-b-113			H	Cl	1Me-5-Ind	C		486(M^++1)
A-b-115	4f-2	Int.A-31	A25	2(3FPh)EtO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		506(M^++1)
A-b-116	1-a	A-b-115		2(3FPh)EtO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		478(M^++1)
A-b-117	4f-2	Int.A-31	Al27	2(2-Nap)EtO	Et	Cl	1Me-5-Ind	C		538(M^++1)
A-b-118	1-a	A-b-117		2(2-Nap)EtO	H	Cl	1Me-5-Ind	C		510(M^++1)
A-b-119	4f-2	Int.A-32	Al1	cPenO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		453(M^++1)
A-b-120	1-a	A-b-119		cPenO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		425(M^++1)
A-b-121	4f-2	Int.A-32	Al2	cPenMeO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		467(M^++1)
A-b-122	1-a	A-b-121		cPenMeO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		439(M^++1)
A-b-123	4f-1	Int.A-32	Hal2	cHexMeO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-124	1-a	A-b-123		cHexMeO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		453(M^++1)
A-b-125	4f-2	Int.A-32	Al3	cHexO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		467(M^++1)
A-b-126	1-a	A-b-125		cHexO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		439(M^++1)
A-b-127	4f-2	Int.A-32	Al4	cHepO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-128	1-a	A-b-127		cHepO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		453(M^++1)
A-b-129	4f-1	Int.A-32	Hal3	nPrO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		426(M^++1)
A-b-130	1-a	A-b-129		nPrO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		398(M^++1)
A-b-131	4f-1	Int.A-32	Hal4	iPrO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		426(M^++1)
A-b-132	1-a	A-b-131		iPrO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		398(M^++1)

[0244] [表21]

Table-A-b-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-133	4f-1	Int.A-32	Hal5	nBuO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		440(M^++1)
A-b-134	1-a	A-b-133		nBuO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		412(M^++1)
A-b-135	4f-1	Int.A-32	Hal6	iBuO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		440(M^++1)
A-b-136	1-a	A-b-135		iBuO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		412(M^++1)
A-b-137	4f-1	Int.A-32	Hal1	BnO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		475(M^++1)
A-b-138	1-a	A-b-137		BnO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		447(M^++1)
A-b-139	4f-1	Int.A-32	Hal7	2FBnO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		493(M^++1)
A-b-140	1-a	A-b-139		2FBnO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		465(M^++1)
A-b-141	4f-1	Int.A-32	Hal8	3FBnO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		493(M^++1)
A-b-142	1-a	A-b-141		3FBnO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		465(M^++1)
A-b-143	4f-1	Int.A-32	Hal9	4FBnO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		492(M^++1)
A-b-144	1-a	A-b-143		4FBnO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		464(M^++1)
A-b-145	4f-1	Int.A-32	Hal10	2ClBnO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		509(M^++1)
A-b-146	1-a	A-b-145		2ClBnO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-147	4f-1	Int.A-32	Hal11	3ClBnO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		509(M^++1)
A-b-148	1-a	A-b-147		3ClBnO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-149	4f-1	Int.A-32	Hal12	4MeBnO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		489(M^++1)
A-b-150	1-a	A-b-149		4MeBnO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		461(M^++1)
A-b-151	4f-1	Int.A-32	Hal13	4CF3BnO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		542(M^++1)
A-b-152	1-a	A-b-151		4CF3BnO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		514(M^++1)
A-b-153	4f-2	Int.A-32	Al5	2EtBuO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		469(M^++1)
A-b-154	1-a	A-b-153		2EtBuO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
A-b-155	4f-2	Int.A-32	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		533(M^++1)
A-b-156	1-a	A-b-155		2(4DMAPh)EtO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		505(M^++1)
A-b-157	4f-2	Int.A-32	Al7	2(PhO)EtO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		505(M^++1)
A-b-158	1-a	A-b-157		2(PhO)EtO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		477(M^++1)
A-b-159	4f-2	Int.A-32	Al8	1PhEtO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		489(M^++1)
A-b-160	1-a	A-b-159		1PhEtO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		461(M^++1)
A-b-161	4f-2	Int.A-32	Al9	1(2FPh)EtO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		507(M^++1)
A-b-162	1-a	A-b-161		1(2FPh)EtO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		479(M^++1)
A-b-163	4f-2	Int.A-32	Al10	1(4ClPh)EtO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		524(M^++1)
A-b-164	1-a	A-b-163		1(4ClPh)EtO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		496(M^++1)
A-b-165	4f-2	Int.A-32	Al11	4Me,cHexO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-166	1-a	A-b-165		4Me,cHexO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		453(M^++1)
A-b-167	4f-2	Int.A-32	Al12		Et	Cl	1Me-5-Idz	C		517(M^++1)
A-b-168	1-a	A-b-167			H	Cl	1Me-5-Idz	C		489(M^++1)
A-b-169	4f-2	Int.A-32	Al13		Et	Cl	1Me-5-Idz	C		517(M^++1)
A-b-170	1-a	A-b-169			H	Cl	1Me-5-Idz	C		489(M^++1)
A-b-171	4f-2	Int.A-32	Al15		Et	Cl	1Me-5-Idz	C		585(M^++1)
A-b-172	1-a	A-b-171			H	Cl	1Me-5-Idz	C		557(M^++1)
A-b-173	4f-2	Int.A-32	Al16		Et	Cl	1Me-5-Idz	C		517(M^++1)

[0245] [表22]

Table-A-b-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-174	1-a	A-b-173			H	Cl	1Me-5-Idz	C		489(M^++1)
A-b-175	4f-2	Int.A-32	AI17	1IndanO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		501(M^++1)
A-b-176	1-a	A-b-175		1IndanO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		473(M^++1)
A-b-177	4f-2	Int.A-32	AI18	2IndanO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		501(M^++1)
A-b-178	1-a	A-b-177		2IndanO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		473(M^++1)
A-b-179	4f-2	Int.A-32	AI19	5OMe-2-IndanO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		531(M^++1)
A-b-180	1-a	A-b-179		5OMe-2-IndanO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		503(M^++1)
A-b-181	4f-2	Int.A-32	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		561(M^++1)
A-b-182	1-a	A-b-181		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		533(M^++1)
A-b-183	4f-2	Int.A-32	AI21	5F-2-IndanO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		519(M^++1)
A-b-184	1-a	A-b-183		5F-2-IndanO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		491(M^++1)
A-b-185	4f-2	Int.A-32	AI22		Et	Cl	1Me-5-Idz	C		515(M^++1)
A-b-186	1-a	A-b-185			H	Cl	1Me-5-Idz	C		587(M^++1)
A-b-187	4f-2	Int.A-32	AI23		Et	Cl	1Me-5-Idz	C		515(M^++1)
A-b-188	1-a	A-b-187			H	Cl	1Me-5-Idz	C		587(M^++1)
A-b-189	4f-2	Int.A-32	AI25	2(3FPh)EtO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		507(M^++1)
A-b-190	1-a	A-b-141		2(3FPh)EtO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		479(M^++1)
A-b-191	4f-2	Int.A-32	AI27	2(2-Nap)EtO	Et	Cl	1Me-5-Idz	C		539(M^++1)
A-b-192	1-a	A-b-143		2(2-Nap)EtO	H	Cl	1Me-5-Idz	C		511(M^++1)
A-b-193	4f-2	Int.A-33	AI1	cPenO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		467(M^++1)
A-b-194	1-a	A-b-145		cPenO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		439(M^++1)
A-b-195	4f-2	Int.A-33	AI2	cPenMeO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-196	1-a	A-b-147		cPenMeO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		453(M^++1)
A-b-197	4f-2	Int.A-33	AI3	cHexO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-198	1-a	A-b-149		cHexO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		553(M^++1)
A-b-199	4f-1	Int.A-33	Hal3	nPrO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		441(M^++1)
A-b-200	1-a	A-b-151		nPrO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		413(M^++1)
A-b-201	4f-1	Int.A-33	Hal4	iPrO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		441(M^++1)
A-b-202	1-a	A-b-153		iPrO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		413(M^++1)
A-b-203	4f-1	Int.A-33	Hal5	nBuO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)
A-b-204	1-a	A-b-155		nBuO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		427(M^++1)
A-b-205	4f-1	Int.A-33	Hal6	iBuO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)
A-b-206	1-a	A-b-157		iBuO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		427(M^++1)
A-b-207	4f-1	Int.A-33	Hal1	BnO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		489(M^++1)
A-b-208	1-a	A-b-159		BnO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		461(M^++1)
A-b-209	4f-1	Int.A-33	Hal7	2FBnO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		507(M^++1)
A-b-210	1-a	A-b-161		2FBnO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		479(M^++1)
A-b-211	4f-1	Int.A-33	Hal9	4FBnO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		507(M^++1)
A-b-212	1-a	A-b-163		4FBnO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		479(M^++1)
A-b-213	4f-1	Int.A-33	Hal11	3ClBnO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		523(M^++1)
A-b-214	1-a	A-b-165		3ClBnO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		495(M^++1)
A-b-215	4f-1	Int.A-33	Hal12	4MeBnO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		503(M^++1)
A-b-216	1-a	A-b-167		4MeBnO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		475(M^++1)
A-b-217	4f-2	Int.A-33	AI5	2EtBuO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		483(M^++1)

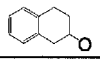
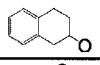
[0246] [表23]

Table-A-b-6

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-218	1-a	A-b-169		2EtBuO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		456(M^++1)
A-b-219	4f-2	Int.A-33	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		547(M^++1)
A-b-220	1-a	A-b-171		2(4DMAPh)EtO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		519(M^++1)
A-b-221	4f-2	Int.A-33	Al8	1PhEtO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		503(M^++1)
A-b-222	1-a	A-b-173		1PhEtO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		475(M^++1)
A-b-223	4f-2	Int.A-33	Al11	4Me,cHexO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		495(M^++1)
A-b-224	1-a	A-b-175		4Me,cHexO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		467(M^++1)
A-b-225	4f-2	Int.A-33	Al17	1IndanO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		515(M^++1)
A-b-226	1-a	A-b-177		1IndanO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		487(M^++1)
A-b-227	4f-2	Int.A-33	Al18	2IndanO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		515(M^++1)
A-b-228	1-a	A-b-179		2IndanO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		487(M^++1)
A-b-229	4f-2	Int.A-33	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		545(M^++1)
A-b-230	1-a	A-b-181		5OMe-2-IndanO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		517(M^++1)
A-b-231	4f-2	Int.A-33	Al20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		575(M^++1)
A-b-232	1-a	A-b-183		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		547(M^++1)
A-b-233	4f-2	Int.A-33	Al21	5F-2-IndanO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		533(M^++1)
A-b-234	1-a	A-b-185		5F-2-IndanO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		505(M^++1)
A-b-235	4f-2	Int.A-33	Al22		Et	Cl	1Et-5-Idz	C		529(M^++1)
A-b-236	1-a	A-b-187			H	Cl	1Et-5-Idz	C		501(M^++1)
A-b-237	4f-2	Int.A-33	Al23		Et	Cl	1Et-5-Idz	C		529(M^++1)
A-b-238	1-a	A-b-153			H	Cl	1Et-5-Idz	C		501(M^++1)
A-b-239	4f-2	Int.A-33	Al25	2(3FPh)EtO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		521(M^++1)
A-b-240	1-a	A-b-155		2(3FPh)EtO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		493(M^++1)
A-b-241	4f-2	Int.A-33	Al27	2(2-Nap)EtO	Et	Cl	1Et-5-Idz	C		553(M^++1)
A-b-242	1-a	A-b-157		2(2-Nap)EtO	H	Cl	1Et-5-Idz	C		525(M^++1)
A-b-243	4f-2	Int.A-34	Al1	cPenO	Et	Br	2-Nap	C		492(M^+)
A-b-244	1-a	A-b-159		cPenO	H	Br	2-Nap	C		464(M^+)
A-b-245	4f-2	Int.A-34	Al2	cPenMeO	Et	Br	2-Nap	C		506(M^+)
A-b-246	1-a	A-b-161		cPenMeO	H	Br	2-Nap	C		478(M^+)
A-b-247	4f-1	Int.A-34	Hal2	cHexMeO	Et	Br	2-Nap	C		520(M^+)
A-b-248	1-a	A-b-163		cHexMeO	H	Br	2-Nap	C		492(M^+)
A-b-249	4f-2	Int.A-34	Al3	cHexO	Et	Br	2-Nap	C		506(M^+)
A-b-250	1-a	A-b-165		cHexO	H	Br	2-Nap	C		478(M^+)
A-b-251	4f-2	Int.A-34	Al4	cHepO	Et	Br	2-Nap	C		520(M^+)
A-b-252	1-a	A-b-167		cHepO	H	Br	2-Nap	C		492(M^+)
A-b-253	4f-1	Int.A-34	Hal3	nPrO	Et	Br	2-Nap	C		466(M^+)
A-b-254	1-a	A-b-169		nPrO	H	Br	2-Nap	C		438(M^+)
A-b-255	4f-1	Int.A-34	Hal4	iPrO	Et	Br	2-Nap	C		466(M^+)
A-b-256	1-a	A-b-171		iPrO	H	Br	2-Nap	C		438(M^+)
A-b-257	4f-1	Int.A-34	Hal5	nBuO	Et	Br	2-Nap	C		480(M^+)
A-b-258	1-a	A-b-173		nBuO	H	Br	2-Nap	C		452(M^+)
A-b-259	4f-1	Int.A-34	Hal6	iBuO	Et	Br	2-Nap	C		480(M^+)
A-b-260	1-a	A-b-175		iBuO	H	Br	2-Nap	C		452(M^+)
A-b-261	4f-1	Int.A-34	Hal1	BnO	Et	Br	2-Nap	C		514(M^+)
A-b-262	1-a	A-b-177		BnO	H	Br	2-Nap	C		486(M^+)

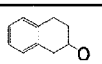
[0247] [表24]

Table-A-b-7

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-263	4f-1	Int.A-34	Hal7	2FBnO	Et	Br	2-Nap	C		532(M^+)
A-b-264	1-a	A-b-263		2FBnO	H	Br	2-Nap	C		504(M^+)
A-b-265	4f-1	Int.A-34	Hal8	3FBnO	Et	Br	2-Nap	C		532(M^+)
A-b-266	1-a	A-b-265		3FBnO	H	Br	2-Nap	C		504(M^+)
A-b-267	4f-1	Int.A-34	Hal9	4FBnO	Et	Br	2-Nap	C		532(M^+)
A-b-268	1-a	A-b-267		4FBnO	H	Br	2-Nap	C		504(M^+)
A-b-269	4f-1	Int.A-34	Hal10	2ClBnO	Et	Br	2-Nap	C		548(M^+)
A-b-270	1-a	A-b-269		2ClBnO	H	Br	2-Nap	C		520(M^+)
A-b-271	4f-1	Int.A-34	Hal11	3ClBnO	Et	Br	2-Nap	C		548(M^+)
A-b-272	1-a	A-b-271		3ClBnO	H	Br	2-Nap	C		520(M^+)
A-b-273	4f-1	Int.A-34	Hal12	4MeBnO	Et	Br	2-Nap	C		528(M^+)
A-b-274	1-a	A-b-273		4MeBnO	H	Br	2-Nap	C		500(M^+)
A-b-275	4f-1	Int.A-34	Hal13	4CF3BnO	Et	Br	2-Nap	C		582(M^+)
A-b-276	1-a	A-b-275		4CF3BnO	H	Br	2-Nap	C		554(M^+)
A-b-277	4f-2	Int.A-34	Al5	2EtBuO	Et	Br	2-Nap	C		508(M^+)
A-b-278	1-a	A-b-277		2EtBuO	H	Br	2-Nap	C		480(M^+)
A-b-279	4f-2	Int.A-34	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	Br	2-Nap	C		572(M^+)
A-b-280	1-a	A-b-279		2(4DMAPh)EtO	H	Br	2-Nap	C		544(M^+)
A-b-281	4f-2	Int.A-34	Al7	2(PhO)EtO	Et	Br	2-Nap	C		544(M^+)
A-b-282	1-a	A-b-281		2(PhO)EtO	H	Br	2-Nap	C		516(M^+)
A-b-283	4f-2	Int.A-34	Al8	1PhEtO	Et	Br	2-Nap	C		528(M^+)
A-b-284	1-a	A-b-283		1PhEtO	H	Br	2-Nap	C		500(M^+)
A-b-285	4f-2	Int.A-34	Al11	4Me,cHexO	Et	Br	2-Nap	C		520(M^+)
A-b-286	1-a	A-b-285		4Me,cHexO	H	Br	2-Nap	C		492(M^+)
A-b-287	4f-2	Int.A-34	Al17	1IndanO	Et	Br	2-Nap	C		540(M^+)
A-b-288	1-a	A-b-287		1IndanO	H	Br	2-Nap	C		512(M^+)
A-b-289	4f-2	Int.A-34	Al18	2IndanO	Et	Br	2-Nap	C		540(M^+)
A-b-290	1-a	A-b-289		2IndanO	H	Br	2-Nap	C		512(M^+)
A-b-291	4f-2	Int.A-34	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	Br	2-Nap	C		570(M^+)
A-b-292	1-a	A-b-291		5OMe-2-IndanO	H	Br	2-Nap	C		542(M^+)
A-b-293	4f-2	Int.A-34	Al20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Br	2-Nap	C		600(M^+)
A-b-294	1-a	A-b-293		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Br	2-Nap	C		572(M^+)
A-b-295	4f-2	Int.A-34	Al21	5F-2-IndanO	Et	Br	2-Nap	C		558(M^+)
A-b-296	1-a	A-b-295		5F-2-IndanO	H	Br	2-Nap	C		530(M^+)
A-b-297	4f-2	Int.A-34	Al22		Et	Br	2-Nap	C		554(M^+)
A-b-298	1-a	A-b-297			H	Br	2-Nap	C		526(M^+)
A-b-299	4f-2	Int.A-34	Al23		Et	Br	2-Nap	C		554(M^+)
A-b-300	1-a	A-b-299			H	Br	2-Nap	C		526(M^+)
A-b-301	4f-2	Int.A-34	Al25	2(3FPh)EtO	Et	Br	2-Nap	C		546(M^+)
A-b-302	1-a	A-b-301		2(3FPh)EtO	H	Br	2-Nap	C		518(M^+)
A-b-303	4f-2	Int.A-34	Al27	2(2-Nap)EtO	Et	Br	2-Nap	C		578(M^+)
A-b-304	1-a	A-b-303		2(2-Nap)EtO	H	Br	2-Nap	C		550(M^+)
A-b-305	4f-2	Int.A-35	Al1	cPenO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		495(M^+)
A-b-306	1-a	A-b-305		cPenO	H	Br	1Me-5-Ind	C		467(M^+)

[0248] [表25]

Table-A-b-8

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-307	4f-1	Int.A-35	Hal2	cHexMeO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		523(M^+)
A-b-308	1-a	A-b-307		cHexMeO	H	Br	1Me-5-Ind	C		495(M^+)
A-b-309	4f-2	Int.A-35	Al3	cHexO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		509(M^+)
A-b-310	1-a	A-b-309		cHexO	H	Br	1Me-5-Ind	C		481(M^+)
A-b-311	4f-1	Int.A-35	Hal3	nPrO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		469(M^+)
A-b-312	1-a	A-b-311		nPrO	H	Br	1Me-5-Ind	C		441(M^+)
A-b-313	4f-1	Int.A-35	Hal4	iPrO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		469(M^+)
A-b-314	1-a	A-b-313		iPrO	H	Br	1Me-5-Ind	C		441(M^+)
A-b-315	4f-1	Int.A-35	Hal5	nBuO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		483(M^+)
A-b-316	1-a	A-b-315		nBuO	H	Br	1Me-5-Ind	C		455(M^+)
A-b-317	4f-1	Int.A-35	Hal6	iBuO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		483(M^+)
A-b-318	1-a	A-b-317		iBuO	H	Br	1Me-5-Ind	C		455(M^+)
A-b-319	4f-1	Int.A-35	Hal1	BnO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		517(M^+)
A-b-320	1-a	A-b-319		BnO	H	Br	1Me-5-Ind	C		489(M^+)
A-b-321	4f-1	Int.A-35	Hal7	2FBnO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		535(M^+)
A-b-322	1-a	A-b-321		2FBnO	H	Br	1Me-5-Ind	C		507(M^+)
A-b-323	4f-1	Int.A-35	Hal8	3FBnO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		535(M^+)
A-b-324	1-a	A-b-323		3FBnO	H	Br	1Me-5-Ind	C		507(M^+)
A-b-325	4f-1	Int.A-35	Hal9	4FBnO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		535(M^+)
A-b-326	1-a	A-b-325		4FBnO	H	Br	1Me-5-Ind	C		507(M^+)
A-b-327	4f-1	Int.A-35	Hal11	3ClBnO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		551(M^+)
A-b-328	1-a	A-b-327		3ClBnO	H	Br	1Me-5-Ind	C		523(M^+)
A-b-329	4f-1	Int.A-35	Hal12	4MeBnO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		531(M^+)
A-b-330	1-a	A-b-329		4MeBnO	H	Br	1Me-5-Ind	C		503(M^+)
A-b-331	4f-2	Int.A-35	Al5	2EtBuO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		511(M^+)
A-b-332	1-a	A-b-331		2EtBuO	H	Br	1Me-5-Ind	C		483(M^+)
A-b-333	4f-2	Int.A-35	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		574(M^+)
A-b-334	1-a	A-b-333		2(4DMAPh)EtO	H	Br	1Me-5-Ind	C		546(M^+)
A-b-335	4f-2	Int.A-35	Al8	1PhEtO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		531(M^+)
A-b-336	1-a	A-b-335		1PhEtO	H	Br	1Me-5-Ind	C		503(M^+)
A-b-337	4f-2	Int.A-35	Al11	4Me,cHexO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		523(M^+)
A-b-338	1-a	A-b-337		4Me,cHexO	H	Br	1Me-5-Ind	C		495(M^+)
A-b-339	4f-2	Int.A-35	Al17	1IndanO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		543(M^+)
A-b-340	1-a	A-b-339		1IndanO	H	Br	1Me-5-Ind	C		515(M^+)
A-b-341	4f-2	Int.A-35	Al18	2IndanO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		543(M^+)
A-b-342	1-a	A-b-341		2IndanO	H	Br	1Me-5-Ind	C		515(M^+)
A-b-343	4f-2	Int.A-35	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		573(M^+)
A-b-344	1-a	A-b-343		5OMe-2-IndanO	H	Br	1Me-5-Ind	C		545(M^+)
A-b-345	4f-2	Int.A-35	Al20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		603(M^+)
A-b-346	1-a	A-b-345		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Br	1Me-5-Ind	C		575(M^+)
A-b-347	4f-2	Int.A-35	Al21	5F-2-IndanO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		561(M^+)
A-b-348	1-a	A-b-347		5F-2-IndanO	H	Br	1Me-5-Ind	C		533(M^+)
A-b-349	4f-2	Int.A-35	Al22		Et	Br	1Me-5-Ind	C		557(M^+)
A-b-350	1-a	A-b-349			H	Br	1Me-5-Ind	C		529(M^+)

[0249] [表26]

Table-A-b-9

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-351	4f-2	Int.A-35	Al23		Et	Br	1Me-5-Ind	C		557(M^+)
A-b-352	1a	A-b-351			H	Br	1Me-5-Ind	C		529(M^+)
A-b-353	4f-2	Int.A-35	Al27	2(2-Nap)EtO	Et	Br	1Me-5-Ind	C		581(M^+)
A-b-354	1a	A-b-353		2(2-Nap)EtO	H	Br	1Me-5-Ind	C		553M^+)
A-b-355	4f-2	Int.A-36	Al1	cPenO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		496(M^+)
A-b-356	1a	A-b-355		cPenO	H	Br	1Me-5-Idz	C		468(M^+)
A-b-357	4f-2	Int.A-36	Al2	cPenMeO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		510(M^+)
A-b-358	1a	A-b-357		cPenMeO	H	Br	1Me-5-Idz	C		482(M^+)
A-b-359	4f-2	Int.A-36	Al3	cHexO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		510(M^+)
A-b-360	1a	A-b-359		cHexO	H	Br	1Me-5-Idz	C		482(M^+)
A-b-361	4f-2	Int.A-36	Al4	cHepO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		524(M^+)
A-b-362	1a	A-b-361		cHepO	H	Br	1Me-5-Idz	C		496(M^+)
A-b-363	4f-1	Int.A-36	Hal3	nPrO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		470(M^+)
A-b-364	1a	A-b-363		nPrO	H	Br	1Me-5-Idz	C		442(M^+)
A-b-365	4f-1	Int.A-36	Hal4	iPrO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		470(M^+)
A-b-366	1a	A-b-365		iPrO	H	Br	1Me-5-Idz	C		442(M^+)
A-b-367	4f-1	Int.A-36	Hal5	nBuO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		484(M^+)
A-b-368	1a	A-b-367		nBuO	H	Br	1Me-5-Idz	C		456(M^+)
A-b-369	4f-1	Int.A-36	Hal6	iBuO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		484(M^+)
A-b-370	1a	A-b-369		iBuO	H	Br	1Me-5-Idz	C		456(M^+)
A-b-371	4f-1	Int.A-36	Hal1	BnO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		518(M^+)
A-b-372	1a	A-b-371		BnO	H	Br	1Me-5-Idz	C		490(M^+)
A-b-373	4f-1	Int.A-36	Hal7	2FBnO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		536(M^+)
A-b-374	1a	A-b-373		2FBnO	H	Br	1Me-5-Idz	C		508(M^+)
A-b-375	4f-1	Int.A-36	Hal9	4FBnO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		536(M^+)
A-b-376	1a	A-b-375		4FBnO	H	Br	1Me-5-Idz	C		508(M^+)
A-b-377	4f-1	Int.A-36	Hal11	3ClBnO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		552(M^+)
A-b-378	1a	A-b-377		3ClBnO	H	Br	1Me-5-Idz	C		524(M^+)
A-b-379	4f-1	Int.A-36	Hal13	4CF3BnO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		586(M^+)
A-b-380	1a	A-b-379		4CF3BnO	H	Br	1Me-5-Idz	C		558(M^+)
A-b-381	4f-2	Int.A-36	Al5	2EtBuO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		512(M^+)
A-b-382	1a	A-b-381		2EtBuO	H	Br	1Me-5-Idz	C		484(M^+)
A-b-383	4f-2	Int.A-36	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		575(M^+)
A-b-384	1a	A-b-383		2(4DMAPh)EtO	H	Br	1Me-5-Idz	C		547(M^+)
A-b-385	4f-2	Int.A-36	Al8	1PhEtO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		532(M^+)
A-b-386	1a	A-b-385		1PhEtO	H	Br	1Me-5-Idz	C		504(M^+)
A-b-387	4f-2	Int.A-36	Al11	4Me,cHexO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		524(M^+)
A-b-388	1a	A-b-387		4Me,cHexO	H	Br	1Me-5-Idz	C		496(M^+)
A-b-389	4f-2	Int.A-36	Al17	1IndanO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		544(M^+)
A-b-390	1a	A-b-389		1IndanO	H	Br	1Me-5-Idz	C		516(M^+)
A-b-391	4f-2	Int.A-36	Al18	2IndanO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		544(M^+)
A-b-392	1a	A-b-391		2IndanO	H	Br	1Me-5-Idz	C		516(M^+)
A-b-393	4f-2	Int.A-36	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		574(M^+)
A-b-394	1a	A-b-393		5OMe-2-IndanO	H	Br	1Me-5-Idz	C		546(M^+)
A-b-395	4f-2	Int.A-36	Al20	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		604(M^+)
A-b-396	1a	A-b-395		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Br	1Me-5-Idz	C		576(M^+)

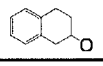
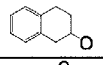
[0250] [表27]

Table-A-b-10

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-397	4f-2	Int.A-36	Al21	5F-2-IndanO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		562(M^+)
A-b-398	1a	A-b-397		5F-2-IndanO	H	Br	1Me-5-Idz	C		534(M^+)
A-b-399	4f-2	Int.A-36	Al22		Et	Br	1Me-5-Idz	C		558(M^+)
A-b-400	1a	A-b-399			H	Br	1Me-5-Idz	C		530(M^+)
A-b-401	4f-2	Int.A-36	Al23		Et	Br	1Me-5-Idz	C		558(M^+)
A-b-402	1a	A-b-401			H	Br	1Me-5-Idz	C		530(M^+)
A-b-403	4f-2	Int.A-36	Al25	2(3FPh)EtO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		550(M^+)
A-b-404	1a	A-b-403		2(3FPh)EtO	H	Br	1Me-5-Idz	C		522(M^+)
A-b-405	4f-2	Int.A-36	Al27	2(2-Nap)EtO	Et	Br	1Me-5-Idz	C		582(M^+)
A-b-406	1a	A-b-405		2(2-Nap)EtO	H	Br	1Me-5-Idz	C		554(M^+)
A-b-407	4f-2	Int.A-37	Al1	cPenO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		510(M^+)
A-b-408	1a	A-b-407		cPenO	H	Br	1Et-5-Idz	C		482(M^+)
A-b-409	4f-2	Int.A-37	Al3	cHexO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		524(M^+)
A-b-410	1a	A-b-409		cHexO	H	Br	1Et-5-Idz	C		496(M^+)
A-b-411	4f-1	Int.A-37	Hal3	nPrO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		484(M^+)
A-b-412	1a	A-b-411		nPrO	H	Br	1Et-5-Idz	C		456(M^+)
A-b-413	4f-1	Int.A-37	Hal4	iPrO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		484(M^+)
A-b-414	1a	A-b-413		iPrO	H	Br	1Et-5-Idz	C		456(M^+)
A-b-415	4f-1	Int.A-37	Hal5	nBuO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		498(M^+)
A-b-416	1a	A-b-415		nBuO	H	Br	1Et-5-Idz	C		470(M^+)
A-b-417	4f-1	Int.A-37	Hal6	iBuO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		498(M^+)
A-b-418	1a	A-b-417		iBuO	H	Br	1Et-5-Idz	C		470(M^+)
A-b-419	4f-1	Int.A-37	Hal8	3FBnO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		550(M^+)
A-b-420	1a	A-b-419		3FBnO	H	Br	1Et-5-Idz	C		522(M^+)
A-b-421	4f-1	Int.A-37	Hal9	4FBnO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		550(M^+)
A-b-422	1a	A-b-421		4FBnO	H	Br	1Et-5-Idz	C		522(M^+)
A-b-423	4f-1	Int.A-37	Hal12	4MeBnO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		546(M^+)
A-b-424	1a	A-b-423		4MeBnO	H	Br	1Et-5-Idz	C		518(M^+)
A-b-425	4f-1	Int.A-37	Hal13	4CF3BnO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		600(M^+)
A-b-426	1a	A-b-425		4CF3BnO	H	Br	1Et-5-Idz	C		572(M^+)
A-b-427	4f-2	Int.A-37	Al5	2EtBuO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		526(M^+)
A-b-428	1a	A-b-427		2EtBuO	H	Br	1Et-5-Idz	C		498(M^+)
A-b-429	4f-2	Int.A-37	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		589(M^+)
A-b-430	1a	A-b-429		2(4DMAPh)EtO	H	Br	1Et-5-Idz	C		561(M^+)
A-b-431	4f-2	Int.A-37	Al7	2(PhO)EtO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		562(M^+)
A-b-432	1a	A-b-431		2(PhO)EtO	H	Br	1Et-5-Idz	C		534(M^+)
A-b-433	4f-2	Int.A-37	Al17	1IndanO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		558(M^+)
A-b-434	1a	A-b-433		1IndanO	H	Br	1Et-5-Idz	C		530(M^+)
A-b-435	4f-2	Int.A-37	Al18	2IndanO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		558(M^+)
A-b-436	1a	A-b-435		2IndanO	H	Br	1Et-5-Idz	C		530(M^+)
A-b-437	4f-2	Int.A-37	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		588(M^+)
A-b-438	1a	A-b-437		5OMe-2-IndanO	H	Br	1Et-5-Idz	C		560(M^+)
A-b-439	4f-2	Int.A-37	Al21	5F-2-IndanO	Et	Br	1Et-5-Idz	C		576(M^+)
A-b-440	1a	A-b-439		5F-2-IndanO	H	Br	1Et-5-Idz	C		548(M^+)

[0251] [表28]

Table-A-b-11

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-441	4f-2	Int.A-37	AI22		Et	Br	1Et-5-Idz	C		572(M^+)
A-b-442	1-a	A-b-441			H	Br	1Et-5-Idz	C		544(M^+)
A-b-443	4f-2	Int.A-37	AI23		Et	Br	1Et-5-Idz	C		572(M^+)
A-b-444	1-a	A-b-443			H	Br	1Et-5-Idz	C		544(M^+)
A-b-445	4e-1	A-b-243	BRA77	cPenO	Et	Me	2-Nap	C		429(M^++1)
A-b-446	1-a	A-b-445		cPenO	H	Me	2-Nap	C		401(M^++1)
A-b-447	4e-1	A-b-245	BRA77	cPenMeO	Et	Me	2-Nap	C		443(M^++1)
A-b-448	1-a	A-b-447		cPenMeO	H	Me	2-Nap	C		415(M^++1)
A-b-449	4e-1	A-b-247	BRA77	cHexMeO	Et	Me	2-Nap	C		457(M^++1)
A-b-450	1-a	A-b-449		cHexMeO	H	Me	2-Nap	C		429(M^++1)
A-b-451	4e-1	A-b-249	BRA77	cHexO	Et	Me	2-Nap	C		443(M^++1)
A-b-452	1-a	A-b-451		cHexO	H	Me	2-Nap	C		415(M^++1)
A-b-453	4e-1	A-b-253	BRA77	nPrO	Et	Me	2-Nap	C		403(M^++1)
A-b-454	1-a	A-b-453		nPrO	H	Me	2-Nap	C		375(M^++1)
A-b-455	4e-1	A-b-255	BRA77	iPrO	Et	Me	2-Nap	C		403(M^++1)
A-b-456	1-a	A-b-455		iPrO	H	Me	2-Nap	C		375(M^++1)
A-b-457	4e-1	A-b-257	BRA77	nBuO	Et	Me	2-Nap	C		417(M^++1)
A-b-458	1-a	A-b-457		nBuO	H	Me	2-Nap	C		389(M^++1)
A-b-459	4e-1	A-b-259	BRA77	iBuO	Et	Me	2-Nap	C		417(M^++1)
A-b-460	1-a	A-b-459		iBuO	H	Me	2-Nap	C		389(M^++1)
A-b-461	4e-1	A-b-263	BRA77	2FBnO	Et	Me	2-Nap	C		469(M^++1)
A-b-462	1-a	A-b-461		2FBnO	H	Me	2-Nap	C		4413(M^++
A-b-463	4e-1	A-b-265	BRA77	3FBnO	Et	Me	2-Nap	C		469(M^++1)
A-b-464	1-a	A-b-463		3FBnO	H	Me	2-Nap	C		441(M^++1)
A-b-465	4e-1	A-b-269	BRA77	2ClBnO	Et	Me	2-Nap	C		484(M^++1)
A-b-466	1-a	A-b-465		2ClBnO	H	Me	2-Nap	C		457(M^++1)
A-b-467	4e-1	A-b-271	BRA77	3ClBnO	Et	Me	2-Nap	C		485(M^++1)
A-b-468	1-a	A-b-467		3ClBnO	H	Me	2-Nap	C		457(M^++1)
A-b-469	4e-1	A-b-273	BRA77	4MeBnO	Et	Me	2-Nap	C		465(M^++1)
A-b-470	1-a	A-b-469		4MeBnO	H	Me	2-Nap	C		437(M^++1)
A-b-471	4e-1	A-b-277	BRA77	2EtBuO	Et	Me	2-Nap	C		445(M^++1)
A-b-472	1-a	A-b-471		2EtBuO	H	Me	2-Nap	C		417(M^++1)
A-b-473	4e-1	A-b-281	BRA77	2(PhO)EtO	Et	Me	2-Nap	C		481(M^++1)
A-b-474	1-a	A-b-473		2(PhO)EtO	H	Me	2-Nap	C		453(M^++1)
A-b-475	4e-1	A-b-285	BRA77	4Me,cHexO	Et	Me	2-Nap	C		457(M^++1)
A-b-476	1-a	A-b-475		4Me,cHexO	H	Me	2-Nap	C		429(M^++1)
A-b-477	4e-1	A-b-287	BRA77	1IndanO	Et	Me	2-Nap	C		477(M^++1)
A-b-478	1-a	A-b-477		1IndanO	H	Me	2-Nap	C		449(M^++1)
A-b-479	4e-1	A-b-289	BRA77	2IndanO	Et	Me	2-Nap	C		429(M^++1)
A-b-480	1-a	A-b-479		2IndanO	H	Me	2-Nap	C		449(M^++1)
A-b-481	4e-1	A-b-291	BRA77	5OMe-2-IndanO	Et	Me	2-Nap	C		507(M^++1)
A-b-482	1-a	A-b-481		5OMe-2-IndanO	H	Me	2-Nap	C		479(M^++1)
A-b-483	4e-1	A-b-295	BRA77	5F-2-IndanO	Et	Me	2-Nap	C		495(M^++1)
A-b-484	1-a	A-b-483		5F-2-IndanO	H	Me	2-Nap	C		467(M^++1)

[0252] [表29]

Table-A-b-12

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-485	4e-1	A-b-297	BRA77		Et	Me	2-Nap	C		491(M^++1)
A-b-486	1-a	A-b-485			H	Me	2-Nap	C		463(M^++1)
A-b-487	4e-1	A-b-299	BRA77		Et	Me	2-Nap	C		491(M^++1)
A-b-488	1-a	A-b-487			H	Me	2-Nap	C		463(M^++1)
A-b-489	4e-1	A-b-305	BRA77	cPenO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		432(M^++1)
A-b-490	1-a	A-b-489		cPenO	H	Me	1Me-5-Ind	C		404(M^++1)
A-b-491	4e-1	A-b-307	BRA77	cHexMeO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		460(M^++1)
A-b-492	1-a	A-b-491		cHexMeO	H	Me	1Me-5-Ind	C		432(M^++1)
A-b-493	4e-1	A-b-309	BRA77	cHexO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		446(M^++1)
A-b-494	1-a	A-b-493		cHexO	H	Me	1Me-5-Ind	C		418(M^++1)
A-b-495	4e-1	A-b-311	BRA77	nPrO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		406(M^++1)
A-b-496	1-a	A-b-495		nPrO	H	Me	1Me-5-Ind	C		378(M^++1)
A-b-497	4e-1	A-b-313	BRA77	iPrO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		406(M^++1)
A-b-498	1-a	A-b-497		iPrO	H	Me	1Me-5-Ind	C		378(M^++1)
A-b-499	4e-1	A-b-315	BRA77	nBuO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		420(M^++1)
A-b-500	1-a	A-b-499		nBuO	H	Me	1Me-5-Ind	C		392(M^++1)
A-b-501	4e-1	A-b-317	BRA77	iBuO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		420(M^++1)
A-b-502	1-a	A-b-501		iBuO	H	Me	1Me-5-Ind	C		392(M^++1)
A-b-503	4e-1	A-b-319	BRA77	BnO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		454(M^++1)
A-b-504	1-a	A-b-503		BnO	H	Me	1Me-5-Ind	C		426(M^++1)
A-b-505	4e-1	A-b-321	BRA77	2FBnO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		472(M^++1)
A-b-506	1-a	A-b-505		2FBnO	H	Me	1Me-5-Ind	C		444(M^++1)
A-b-507	4e-1	A-b-323	BRA77	3FBnO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		472(M^++1)
A-b-508	1-a	A-b-507		3FBnO	H	Me	1Me-5-Ind	C		444(M^++1)
A-b-509	4e-1	A-b-327	BRA77	3ClBnO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		488(M^++1)
A-b-510	1-a	A-b-509		3ClBnO	H	Me	1Me-5-Ind	C		460(M^++1)
A-b-511	4e-1	A-b-329	BRA77	4MeBnO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		468(M^++1)
A-b-512	1-a	A-b-511		4MeBnO	H	Me	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-b-513	4e-1	A-b-331	BRA77	2EtBuO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		448(M^++1)
A-b-514	1-a	A-b-513		2EtBuO	H	Me	1Me-5-Ind	C		420(M^++1)
A-b-515	4e-1	A-b-333	BRA77	2(4DMAPh)EtO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		511(M^++1)
A-b-516	1-a	A-b-515		2(4DMAPh)EtO	H	Me	1Me-5-Ind	C		483(M^++1)
A-b-517	4e-1	A-b-337	BRA77	4Me,cHexO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		460(M^++1)
A-b-518	1-a	A-b-517		4Me,cHexO	H	Me	1Me-5-Ind	C		432(M^++1)
A-b-519	4e-1	A-b-339	BRA77	1IndanO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		480(M^++1)
A-b-520	1-a	A-b-519		1IndanO	H	Me	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-b-521	4e-1	A-b-341	BRA77	2IndanO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		480(M^++1)
A-b-522	1-a	A-b-521		2IndanO	H	Me	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-b-523	4e-1	A-b-343	BRA77	5OMe-2-IndanO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		510(M^++1)
A-b-524	1-a	A-b-523		5OMe-2-IndanO	H	Me	1Me-5-Ind	C		482(M^++1)
A-b-525	4e-1	A-b-345	BRA77	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		540(M^++1)
A-b-526	1-a	A-b-525		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Me	1Me-5-Ind	C		512(M^++1)
A-b-527	4e-1	A-b-347	BRA77	5F-2-IndanO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		498(M^++1)
A-b-528	1-a	A-b-527		5F-2-IndanO	H	Me	1Me-5-Ind	C		470(M^++1)

[0253] [表30]

Table-A-b-13

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-529	4e-1	A-b-349	BRA77		Et	Me	1Me-5-Ind	C		494(M^++1)
A-b-530	1-a	A-b-529		2-tetra	H	Me	1Me-5-Ind	C		466(M^++1)
A-b-531	4e-1	A-b-351	BRA77		Et	Me	1Me-5-Ind	C		494(M^++1)
A-b-532	1-a	A-b-531			H	Me	1Me-5-Ind	C		466(M^++1)
A-b-533	4e-1	A-b-353	BRA77	2(2-Nap)EtO	Et	Me	1Me-5-Ind	C		518(M^++1)
A-b-534	1-a	A-b-533		2(2-Nap)EtO	H	Me	1Me-5-Ind	C		490(M^++1)
A-b-535	4e-1	A-b-355	BRA77	cPenO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		433(M^++1)
A-b-536	1-a	A-b-535		cPenO	H	Me	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)
A-b-537	4e-1	A-b-357	BRA77	cPenMeO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		447(M^++1)
A-b-538	1-a	A-b-537		cPenMeO	H	Me	1Me-5-Idz	C		419(M^++1)
A-b-539	4e-1	A-b-359	BRA77	cHexO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		447(M^++1)
A-b-540	1-a	A-b-539		cHexO	H	Me	1Me-5-Idz	C		419(M^++1)
A-b-541	4e-1	A-b-363	BRA77	nPrO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-b-542	1-a	A-b-541		nPrO	H	Me	1Me-5-Idz	C		379(M^++1)
A-b-543	4e-1	A-b-365	BRA77	iPrO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-b-544	1-a	A-b-543		iPrO	H	Me	1Me-5-Idz	C		379(M^++1)
A-b-545	4e-1	A-b-367	BRA77	nBuO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		421(M^++1)
A-b-546	1-a	A-b-545		nBuO	H	Me	1Me-5-Idz	C		393(M^++1)
A-b-547	4e-1	A-b-369	BRA77	iBuO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		421(M^++1)
A-b-548	1-a	A-b-547		iBuO	H	Me	1Me-5-Idz	C		393(M^++1)
A-b-549	4e-1	A-b-371	BRA77	BnO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		455(M^++1)
A-b-550	1-a	A-b-549		BnO	H	Me	1Me-5-Idz	C		427(M^++1)
A-b-551	4e-1	A-b-373	BRA77	2FBnO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		473(M^++1)
A-b-552	1-a	A-b-551		2FBnO	H	Me	1Me-5-Idz	C		445(M^++1)
A-b-553	4e-1	A-b-375	BRA77	4FBnO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		473(M^++1)
A-b-554	1-a	A-b-553		4FBnO	H	Me	1Me-5-Idz	C		445(M^++1)
A-b-555	4e-1	A-b-377	BRA77	3ClBnO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		489(M^++1)
A-b-556	1-a	A-b-555		3ClBnO	H	Me	1Me-5-Idz	C		461(M^++1)
A-b-557	4e-1	A-b-379	BRA77	4CF3BnO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		522(M^++1)
A-b-558	1-a	A-b-557		4CF3BnO	H	Me	1Me-5-Idz	C		494(M^++1)
A-b-559	4e-1	A-b-381	BRA77	2EtBuO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		449(M^++1)
A-b-560	1-a	A-b-559		2EtBuO	H	Me	1Me-5-Idz	C		421(M^++1)
A-b-561	4e-1	A-b-383	BRA77	2(4DMAPh)EtO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		512(M^++1)
A-b-562	1-a	A-b-561		2(4DMAPh)EtO	H	Me	1Me-5-Idz	C		484(M^++1)
A-b-563	4e-1	A-b-387	BRA77	4Me,cHexO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		461(M^++1)
A-b-564	1-a	A-b-563		4Me,cHexO	H	Me	1Me-5-Idz	C		433(M^++1)
A-b-565	4e-1	A-b-389	BRA77	1IndanO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-566	1-a	A-b-565		1IndanO	H	Me	1Me-5-Idz	C		453(M^++1)
A-b-567	4e-1	A-b-391	BRA77	2IndanO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		481(M^++1)
A-b-568	1-a	A-b-567		2IndanO	H	Me	1Me-5-Idz	C		453(M^++1)
A-b-569	4e-1	A-b-393	BRA77	5OMe-2-IndanO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		511(M^++1)
A-b-570	1-a	A-b-569		5OMe-2-IndanO	H	Me	1Me-5-Idz	C		483(M^++1)
A-b-571	4e-1	A-b-395	BRA77	5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		541(M^++1)
A-b-572	1-a	A-b-571		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Me	1Me-5-Idz	C		513(M^++1)

[0254] [表31]

Table-A-b-14

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-b-573	4e-1	A-b-397	BRA77	5F-2-IndanO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		499(M^++1)
A-b-574	1-a	A-b-573		5F-2-IndanO	H	Me	1Me-5-Idz	C		471(M^++1)
A-b-575	4e-1	A-b-399	BRA77		Et	Me	1Me-5-Idz	C		495(M^++1)
A-b-576	1-a	A-b-575			H	Me	1Me-5-Idz	C		467(M^++1)
A-b-577	4e-1	A-b-401	BRA77		Et	Me	1Me-5-Idz	C		495(M^++1)
A-b-578	1-a	A-b-577			H	Me	1Me-5-Idz	C		467(M^++1)
A-b-579	4e-1	A-b-403	BRA77	2(3FPh)EtO	Et	Me	1Me-5-Idz	C		487(M^++1)
A-b-580	1-a	A-b-579		2(3FPh)EtO	H	Me	1Me-5-Idz	C		459(M^++1)
A-b-581	4e-1	A-b-407	BRA77	cPenO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		447(M^++1)
A-b-582	1-a	A-b-581		cPenO	H	Me	1Et-5-Idz	C		419(M^++1)
A-b-583	4e-1	A-b-409	BRA77	cHexO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		461(M^++1)
A-b-584	1-a	A-b-583		cHexO	H	Me	1Et-5-Idz	C		433(M^++1)
A-b-585	4e-1	A-b-411	BRA77	nPrO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		421(M^++1)
A-b-586	1-a	A-b-585		nPrO	H	Me	1Et-5-Idz	C		393(M^++1)
A-b-587	4e-1	A-b-413	BRA77	iPrO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		421(M^++1)
A-b-588	1-a	A-b-587		iPrO	H	Me	1Et-5-Idz	C		393(M^++1)
A-b-589	4e-1	A-b-415	BRA77	nBuO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		435(M^++1)
A-b-590	1-a	A-b-589		nBuO	H	Me	1Et-5-Idz	C		407(M^++1)
A-b-591	4e-1	A-b-417	BRA77	iBuO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		435(M^++1)
A-b-592	1-a	A-b-591		iBuO	H	Me	1Et-5-Idz	C		407(M^++1)
A-b-593	4e-1	A-b-419	BRA77	3FBnO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		487(M^++1)
A-b-594	1-a	A-b-593		3FBnO	H	Me	1Et-5-Idz	C		459(M^++1)
A-b-595	4e-1	A-b-423	BRA77	4MeBnO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		483(M^++1)
A-b-596	1-a	A-b-595		4MeBnO	H	Me	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)
A-b-597	4e-1	A-b-425	BRA77	4CF3BnO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		536(M^++1)
A-b-598	1-a	A-b-597		4CF3BnO	H	Me	1Et-5-Idz	C		508(M^++1)
A-b-599	4e-1	A-b-427	BRA77	2EtBuO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		463(M^++1)
A-b-600	1-a	A-b-599		2EtBuO	H	Me	1Et-5-Idz	C		435(M^++1)
A-b-601	4e-1	A-b-429	BRA77	2(4DMAPh)EtO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		526(M^++1)
A-b-602	1-a	A-b-601		2(4DMAPh)EtO	H	Me	1Et-5-Idz	C		498(M^++1)
A-b-603	4e-1	A-b-433	BRA77	1IndanO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		495(M^++1)
A-b-604	1-a	A-b-603		1IndanO	H	Me	1Et-5-Idz	C		467(M^++1)
A-b-605	4e-1	A-b-435	BRA77	2IndanO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		495(M^++1)
A-b-606	1-a	A-b-605		2IndanO	H	Me	1Et-5-Idz	C		467(M^++1)
A-b-607	4e-1	A-b-437	BRA77	5OMe-2-IndanO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		525(M^++1)
A-b-608	1-a	A-b-607		5OMe-2-IndanO	H	Me	1Et-5-Idz	C		497(M^++1)
A-b-609	4e-1	A-b-439	BRA77	5F-2-IndanO	Et	Me	1Et-5-Idz	C		513(M^++1)
A-b-610	1-a	A-b-609		5F-2-IndanO	H	Me	1Et-5-Idz	C		485(M^++1)
A-b-611	4e-1	A-b-441	BRA77		Et	Me	1Et-5-Idz	C		509(M^++1)
A-b-612	1-a	A-b-611			H	Me	1Et-5-Idz	C		481(M^++1)

[0255] 参考例6

(R)－5－ベンジルオキシ－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－オール(中間体A－101)の合成(製造法15工程o)

文献[Hashiguchiら、ジャーナル オブ アメリカン ケミカル ソサイエティー(Jour

nal of american chemical society)7562頁、1995年]に記載の手順に従って、中間体A－5(47．7mg)の蟻酸(714ul、WAKO)－トリエチルアミン(226ul、WAKO)溶液に窒素雰囲気下、ルテニウムクロライド[(R, R)-N-(p-メタンスルホニル)-1, 2-ジフェニルエチレンジアミン](p-シメン)(2．2mg)を加え5分間攪拌した後、40℃にて6日間攪拌した。反応液に酢酸エチル(20ml)を加え、飽和重曹水(10ml×2)で抽出し、有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル＝6:1)で精製し、標記化合物(中間体A－101;14．1mg)を得た。Mass(LCMS):241(M^+＋1)、保持時間;4．44分(溶出条件:D)。

[0256] (R)－2－(5－ベンジルオキシ－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル)エタン－1, 1, 1－トリ酢酸エチル(中間体A－102)の合成(製造法15工程f－2)

文献[Michaelら、オーガニック レターズ(Organic lettres)573頁、2004年]に記載の手順に従って、中間体A－101(14．1mg)の無水トルエン溶液(1ml)に窒素雰囲気下－50℃に冷却し、トリメチルホスフィン(12．4ul、KANTO)、トリエチルメタントリカルボキシラート(27．9mg、TCI)を加え5分間攪拌した後、ジエチルアゾジカルボキシレート(以下「DEAD」と略す)の43%トルエン溶液(54．5ul、WAKO)を滴下し、10分攪拌後室温に昇温した。

5時間攪拌後、反応溶液を濃縮し、残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル＝15:1)にて精製し、標記化合物の祖生成物(中間体A－102;65．2mg)を得た。Mass(LCMS):455(M^+＋1)、保持時間;5．86分(溶出条件:D)。

[0257] (R)－2－(5－ベンジルオキシ－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル)エタン－1, 1, 1－トリ酢酸(中間体A－103)の合成(製造法15工程f－2)

文献[Michaelら、オーガニック レターズ(Organic lettres)573頁、2004年]に記載の手順に従って、中間体A－102(65．2mg)のメタノール(2ml)溶液に2規定水酸化ナトリウム水溶液(236ul)を加え70℃で19時間撹拌した後、2規定水酸化ナトリウム水溶液(236ul)を加え110℃で24時間撹拌した後。反応混合液を減圧下濃縮後、水(10ml)、酢酸エチル(5ml×2)で抽出し、水層を氷冷下、2N塩酸水溶液(

500ul)にて中和した後、酢酸エチル(5ml×3)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、溶媒を減圧下留去し、標記化合物(化合物番号中間体A－103;23．8mg)を得た。

[0258] (R)－2－(5－ベンジルオキシ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル)酢酸(中間体A－104)の合成(製造法15工程f－2)

文献[Michaelら、オーガニック レターズ(Organic lettres)573頁、2004年]に記載の手順に従って、中間体A－103(23．8mg)に酢酸(2．5ml)を加え、130℃で26時間撹拌した。反応混合液を減圧下濃縮後、水(10ml)、酢酸エチル(10ml)で抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄し乾燥後、溶媒を減圧下留去し、標記化合物(化合物番号中間体A－104;14．9mg)を得た。Mass(LCMS):283(M^+＋1)、保持時間;4．75分(溶出条件:D)。

[0259] (R)－2－(5－ベンジルオキシ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル)酢酸エチル(中間体A－105)の合成(製造法2工程b)

あらかじめエタノール(30ml)に氷冷下、塩化チオニル(200ul、WAKO)を滴下し混合した溶液に中間体A－104(14．9mg)のメタノール(10ml)溶液を氷冷下滴下し30分撹拌した後、室温まで昇温して、さらに1時間半撹拌した。反応混合液を減圧下濃縮した後、水(20ml)、塩化メチレン(20ml)で抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去し標記化合物(中間体A－105;15．1mg)を得た。Mass(LCMS):311(M^+＋1)、保持時間;5．82分(溶出条件:D)。

[0260] (R)－2－(5－ベンジルオキシ－6－ブロモ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル)酢酸エチル(中間体A－106)の合成(製造法8工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って、中間体A－105(15．1mg)、NBS(8．67mg、WAKO)を反応、処理させることにより標記化合物(中間体A－106;17．69mg)を得た。Mass(LCMS):391(M^+＋1)、保持時間;6．06分(溶出条件:D)。

[0261] 実施例A－c－1

実施例化合物A－a－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物(化合物番号A

－c－1；25mg）を得た。

実施例A－c－15

（R）－2－[5－ベンジルオキシ－6－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸エチル（化合物番号A－c－15）の合成（製造法4工程e－1）

実施例化合物A－a－1の合成法（製造法4工程e－1）に記載の手順に従って中間体A－106（210．3mg）、2－ナフタレンボロン酸（324．2mg、Ald）、2M炭酸ナトリウム水溶液（1．0ml）および$(Ph_3P)_4Pd$（121．3mg、ナカライテスク社製）を反応させ処理することにより標記化合物（化合物番号A－c－15；200．3mg）を得た（但し反応は12時間行った）。

[0262] 実施例A－c－16

（R）－2－[5－ベンジルオキシ－6－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸の合成（化合物番号A－c－16）の合成（製造法1工程a）

実施例化合物A－a－2の合成法（製造法1工程a）に記載の手順に従って実施例化合A－c－15（102．2mg）、2規定水酸化ナトリウム水溶液（0．45ml）を反応させ処理することにより標記化合物（化合物番号A－c－16；91．6mg）を得た（但し反応は2時間行った）。

[0263] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．A－4に、また本発明の化合物の代表例をTable－A－c－1からTable－A－c－5に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。また、「Reagent」の欄に記した記号「Hal（番号）」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al（番号）」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA（番号）」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het（番号）」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。但し、表中の「Manufacturer」の欄が空欄の試薬については通常の化学文献に記載の方法に準じて合成したものである。

なお、Table－Int．A－4のうち、「Syn」の欄が空欄の場合には、Pd／C、水素を用

いた脱保護反応を行った。また、Table－A－c－1からTable－A－c－5のうち「Syn」の欄が空欄の場合には、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。

[0264] [表32]

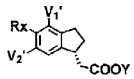


Table-Int.A-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.A-107		A-c-15		HO	Et	H	2-Nap	C		347 (M^++1)
Int.A-108		A-c-17		HO	Et	H	5-Ind	C		336 (M^++1)
Int.A-109		A-c-19		HO	Et	H	1Me-5-Ind	C		350(M^++1)
Int.A-110		A-c-21		HO	Et	H	5-1Idz	C		337(M^++1)
Int.A-111		A-c-23		HO	Et	H	1Me-5-Idz	C		351(M^++1)
Int.A-112		A-c-25		HO	Et	H	1Et-5-Idz	C		365(M^++1)
Int.A-113		A-c-29		HO	Et	H	6-Qu	C		348(M^++1)

[0265] [表33]

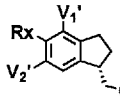


Table-A-c-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-c-1		A-a-2		cPenO	H	H	2-Nap	C		387(M^++1)
A-c-2		A-a-4		cPenO	H	H	5-Ind	C		376(M^++1)
A-c-3		A-a-6		cPenO	H	H	1Me-5-Ind	C		390(M^++1)
A-c-4		A-a-8		cPenO	H	H	1Et-5-Ind	C		404(M^++1)
A-c-5		A-a-10		cPenO	H	H	5-1Idz	C		377(M^++1)
A-c-6		A-a-12		cPenO	H	H	1Me-5-Idz	C		391(M^++1)
A-c-7		A-a-14		cPenO	H	H	1Et-5-Idz	C		405(M^++1)
A-c-8		A-a-16		cPenO	H	H	2Me-5-Idz	C		391(M^++1)
A-c-9		A-a-18		cPenO	H	H	5-BF	C		377(M^++1)
A-c-10		A-a-20		cPenO	H	H	5-BT	C		393(M^++1)
A-c-11		A-a-22		cPenO	H	H	5-Bzt	C		394(M^++1)
A-c-12		A-a-24		cPenO	H	H	3-Qu	C		388(M^++1)
A-c-13		A-a-26		cPenO	H	H	6-Qu	C		388(M^++1)
A-c-14		A-a-28		cPenO	H	H	6-IQ	C		388(M^++1)
A-c-15	4e-1	Int.A-106	BRA1	BnO	Et	H	2-Nap	C		437(M^++1)
A-c-16	1-a	A-c-15		BnO	H	H	2-Nap	C		409(M^++1)
A-c-17	4e-1	Int.A-106	BRA2	BnO	Et	H	5-Ind	C		426(M^++1)
A-c-18	1-a	A-c-17		BnO	H	H	5-Ind	C		398(M^++1)
A-c-19	4e-1	Int.A-106	BRA3	BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-c-20	1-a	A-c-19		BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		412(M^++1)
A-c-21	4e-1	Int.A-106	BRA7	BnO	Et	H	5-1Idz	C		427(M^++1)
A-c-22	1-a	A-c-21		BnO	H	H	5-1Idz	C		399(M^++1)
A-c-23	4e-1	Int.A-106	BRA8	BnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
A-c-24	1-a	A-c-23		BnO	H	H	1Me-5-Idz	C		413(M^++1)
A-c-25	4e-1	Int.A-106	BRA9	BnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)
A-c-26	1-a	A-c-25		BnO	H	H	1Et-5-Idz	C		427(M^++1)
A-c-27	4e-1	Int.A-106	BRA11	BnO	Et	H	5-BF	C		427(M^++1)
A-c-28	1-a	A-c-27		BnO	H	H	5-BF	C		399(M^++1)
A-c-29	4e-2	Int.A-106	Het2	BnO	Et	H	3-Qu	C		438(M^++1)
A-c-30	1-a	A-c-29		BnO	H	H	3-Qu	C		410(M^++1)
A-c-31	4f-2	Int.A-108	Al2	cPenMeO	Et	H	5-Ind	C		418(M^++1)
A-c-32	1-a	A-c-31		cPenMeO	H	H	5-Ind	C		390(M^++1)
A-c-33		A-a-48		cPenMeO	H	H	1Et-5-Ind	C		418(M^++1)
A-c-34	4f-2	Int.A-111	Al2	cPenMeO	Et	H	1Me-5-Idz	C		433(M^++1)
A-c-35	1-a	A-c-34		cPenMeO	H	H	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)
A-c-36		A-a-52		cPenMeO	H	H	3-Qu	C		402(M^++1)
A-c-37	4f-1	Int.A-107	Hal2	cHexMeO	Et	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-c-38	1-a	A-c-37		cHexMeO	H	H	2-Nap	C		415(M^++1)
A-c-39		A-a-56		cHexMeO	H	H	1Me-5-Ind	C		418(M^++1)
A-c-40		A-a-58		cHexMeO	H	H	5-1Idz	C		405(M^++1)
A-c-41		A-a-60		cHexMeO	H	H	6-IQ	C		416(M^++1)
A-c-42	4f-2	Int.A-109	Al3	cHexO	Et	H	1Me-5-Ind	C		432(M^++1)
A-c-43	1-a	A-c-42		cHexO	H	H	1Me-5-Ind	C		404(M^++1)
A-c-44		A-a-64		cHexO	H	H	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)

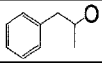
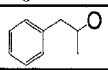
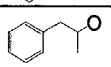
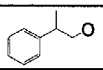
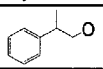
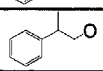
[0266] [表34]

Table-A-c-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-c-45		A-a-66		cHexO	H	H	3-Qu	C		402(M^++1)
A-c-46	4f-2	Int.A-113	Al3	cHexO	Et	H	6-Qu	C		430(M^++1)
A-c-47	1-a	A-c-46		cHexO	H	H	6-Qu	C		402(M^++1)
A-c-48	4f-2	Int.A-107	Al4	cHepO	Et	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-c-49	1-a	A-c-48		cHepO	H	H	2-Nap	C		415(M^++1)
A-c-50	4f-2	Int.A-108	Al4	cHepO	Et	H	5-Ind	C		432(M^++1)
A-c-51	1-a	A-c-50		cHepO	H	H	5-Ind	C		404(M^++1)
A-c-52		A-a-74		cHepO	H	H	1Me-5-Idz	C		419(M^++1)
A-c-53		A-a-76		cHepO	H	H	6-Qu	C		416(M^++1)
A-c-54		A-a-78		nPrO	H	H	5-Ind	C		350(M^++1)
A-c-55	4f-1	Int.A-109	Hal3	nPrO	Et	H	1Me-5-Ind	C		392(M^++1)
A-c-56	1-a	A-c-55		nPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		364(M^++1)
A-c-57		A-a-82		nPrO	H	H	5-1Idz	C		351(M^++1)
A-c-58		A-a-84		nPrO	H	H	1Me-5-Idz	C		365(M^++1)
A-c-59		A-a-86		iPrO	H	H	2-Nap	C		361(M^++1)
A-c-60		A-a-88		iPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		364(M^++1)
A-c-61		A-a-90		iPrO	H	H	1Me-5-Idz	C		365(M^++1)
A-c-62		A-a-92		iPrO	H	H	6-Qu	C		362(M^++1)
A-c-63		A-a-94		nBuO	H	H	5-Ind	C		364(M^++1)
A-c-64		A-a-96		nBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		378(M^++1)
A-c-65	4f-1	Int.A-111	Hal5	nBuO	Et	H	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-c-66	1-a	A-c-65		nBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		379(M^++1)
A-c-67	4f-1	Int.A-107	Hal6	iBuO	Et	H	2-Nap	C		403(M^++1)
A-c-68	1-a	A-c-67		iBuO	H	H	2-Nap	C		375(M^++1)
A-c-69	4f-1	Int.A-109	Hal6	iBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		406(M^++1)
A-c-70	1-a	A-c-69		iBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		378(M^++1)
A-c-71		A-a-104		iBuO	H	H	5-1Idz	C		365(M^++1)
A-c-72		A-a-106		iBuO	H	H	6-IQ	C		376(M^++1)
A-c-73	4f-1	Int.A-107	Hal7	2FBnO	Et	H	2-Nap	C		455(M^++1)
A-c-74	1-a	A-c-73		2FBnO	H	H	2-Nap	C		427(M^++1)
A-c-75	4f-1	Int.A-108	Hal7	2FBnO	Et	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-c-76	1-a	A-c-75		2FBnO	H	H	5-Ind	C		416(M^++1)
A-c-77		A-a-112		2FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		431(M^++1)
A-c-78	4f-1	Int.A-109	Hal8	3FBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		458(M^++1)
A-c-79	1-a	A-c-78		3FBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		430(M^++1)
A-c-80		A-a-116		3FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		431(M^++1)
A-c-81	4f-1	Int.A-113	Hal8	3FBnO	Et	H	6-Qu	C		456(M^++1)
A-c-82	1-a	A-c-81		3FBnO	H	H	6-Qu	C		428(M^++1)
A-c-83		A-a-120		4FBnO	H	H	2-Nap	C		427(M^++1)
A-c-84		A-a-122		4FBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		445(M^++1)
A-c-85		A-a-124		4FBnO	H	H	5-BF	C		417(M^++1)
A-c-86		A-a-126		4FBnO	H	H	6-Qu	C		428(M^++1)
A-c-87		A-a-128		2ClBnO	H	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-c-88		A-a-130		2ClBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		461(M^++1)
A-c-89		A-a-132		2ClBnO	H	H	5-BF	C		433(M^++1)
A-c-90		A-a-134		3ClBnO	H	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-c-91	4f-1	Int.A-108	Hal11	3ClBnO	Et	H	5-Ind	C		460(M^++1)
A-c-92	1-a	A-c-81		3ClBnO	H	H	5-Ind	C		432(M^++1)

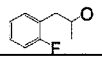
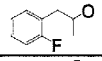
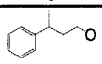
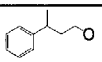
[0267] [表35]

Table-A-c-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-c-93	4f-1	Int.A-109	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		474(M^++1)
A-c-94	1-a	A-c-93		3ClBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		446(M^++1)
A-c-95		A-a-140		3ClBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		447(M^++1)
A-c-96		A-a-142		4MeBnO	H	H	5-Ind	C		412(M^++1)
A-c-97		A-a-144		4MeBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		426(M^++1)
A-c-98		A-a-146		4MeBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		427(M^++1)
A-c-99	4f-1	Int.A-107	Hal13	4CF3BnO	Et	H	2-Nap	C		504(M^++1)
A-c-100	1-a	A-c-99		4CF3BnO	H	H	2-Nap	C		476(M^++1)
A-c-101	4f-1	Int.A-109	Hal13	4CF3BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		507(M^++1)
A-c-102	1-a	A-c-101		4CF3BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		479(M^++1)
A-c-103	4f-1	Int.A-110	Hal13	4CF3BnO	Et	H	5-1Idz	C		494(M^++1)
A-c-104	1-a	A-c-103		4CF3BnO	H	H	5-1Idz	C		466(M^++1)
A-c-105		A-a-154		2EtBuO	H	H	2-Nap	C		403(M^++1)
A-c-106	4f-2	Int.A-108	Al5	2EtBuO	Et	H	5-Ind	C		420(M^++1)
A-c-107	1-a	A-c-106		2EtBuO	H	H	5-Ind	C		392(M^++1)
A-c-108		A-a-158		2EtBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-c-109		A-a-160		2(4DMAPh)EtO	H	H	5-Ind	C		455(M^++1)
A-c-110		A-a-162		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		469(M^++1)
A-c-111	4f-2	Int.A-112	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		512(M^++1)
A-c-112	1-a	A-c-111		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		484(M^++1)
A-c-113	4f-2	Int.A-107	Al7	2(PhO)EtO	Et	H	2-Nap	C		467(M^++1)
A-c-114	1-a	A-c-111		2(PhO)EtO	H	H	2-Nap	C		439(M^++1)
A-c-115		A-a-168		2(PhO)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		442(M^++1)
A-c-116		A-a-170		2(PhO)EtO	H	H	6-Qu	C		440(M^++1)
A-c-117		A-a-172		1PhEtO	H	H	2-Nap	C		423(M^++1)
A-c-118		A-a-174		1PhEtO	H	H	1Me-5-Ind	C		426(M^++1)
A-c-119		A-a-176		1PhEtO	H	H	5-1Idz	C		413(M^++1)
A-c-120		A-a-178		1(2FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		430(M^++1)
A-c-121		A-a-180		1(2FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		459(M^++1)
A-c-122		A-a-182		1(2FPh)EtO	H	H	6-Qu	C		442(M^++1)
A-c-123		A-a-184		1(4ClPh)EtO	H	H	5-Ind	C		446(M^++1)
A-c-124	4f-2	Int.A-109	Al10	1(4ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		489(M^++1)
A-c-125	1-a	A-c-124		1(4ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		460(M^++1)
A-c-126		A-a-188		1(4ClPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		476(M^++1)
A-c-127		A-a-190		4Me,cHexO	H	H	2-Nap	C		415(M^++1)
A-c-128		A-a-192		4Me,cHexO	H	H	1Me-5-Ind	C		418(M^++1)
A-c-129	4f-2	Int.A-108	Al12		Et	H	5-Ind	C		454(M^++1)
A-c-130	1-a	A-c-129			H	H	5-Ind	C		426(M^++1)
A-c-131		A-a-196			H	H	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
A-c-132	4f-2	Int.A-107	Al13		Et	H	2-Nap	C		465(M^++1)
A-c-133	1-a	A-c-132			H	H	2-Nap	C		437(M^++1)
A-c-134		A-a-200			H	H	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)

[0268] [表36]

Table-A-c-4

Exp	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-c-135		A-a-202			H	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-c-136		A-a-204			H	H	1Me-5-Ind	C		458(M^++1)
A-c-137		A-a-206			H	H	5-Ind	C		494(M^++1)
A-c-138		A-a-208			H	H	1Me-5-Ind	C		508(M^++1)
A-c-139		A-a-210			H	H	1Me-5-Ind	C		454(M^++1)
A-c-140		A-a-212			H	H	1Me-5-Idz	C		455(M^++1)
A-c-141	4f-2	Int.A-107	AI17	1IndanO	Et	H	2-Nap	C		464(M^++1)
A-c-142	1-a	A-c-141		1IndanO	H	H	2-Nap	C		436(M^++1)
A-c-143		A-a-216		1IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		438(M^++1)
A-c-144		A-a-218		1IndanO	H	H	5-1Idz	C		425(M^++1)
A-c-145		A-a-220		2IndanO	H	H	2-Nap	C		435(M^++1)
A-c-146	4f-2	Int.A-108	AI18	2IndanO	Et	H	5-Ind	C		452(M^++1)
A-c-147	1-a	A-c-146		2IndanO	H	H	5-Ind	C		424(M^++1)
A-c-148		A-a-224		2IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		439(M^++1)
A-c-149		A-a-226		5OMe-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		468(M^++1)
A-c-150		A-a-228		5OMe-2-IndanO	H	H	5-1Idz	C		455(M^++1)
A-c-151	4f-2	Int.A-112	AI19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		511(M^++1)
A-c-152	1-a	A-c-151		5OMe-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		483(M^++1)
A-c-153		A-a-232		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		495(M^++1)
A-c-154		A-a-234		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	5-Ind	C		484(M^++1)
A-c-155		A-a-236		5F-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		453(M^++1)
A-c-156	4f-2	Int.A-109		5F-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		484(M^++1)
A-c-157	1-a	A-c-156		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		456(M^++1)
A-c-158		A-a-240		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		457(M^++1)
A-c-159	4f-2	Int.A-112	AI21	5F-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		499(M^++1)
A-c-160	1-a	A-c-159		5F-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		471(M^++1)
A-c-161		A-a-244			H	H	5-Ind	C		438(M^++1)
A-c-162		A-a-246			H	H	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-c-163		A-a-248			H	H	2-Nap	C		449(M^++1)
A-c-164		A-a-250			H	H	5-1Idz	C		439(M^++1)
A-c-165		A-a-252		2(2MePh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-c-166	4f-2	Int.A-113	AI24	2(2MePh)EtO	Et	H	6-Qu	C		466(M^++1)
A-c-167	1-a	A-c-166		2(2MePh)EtO	H	H	6-Qu	C		438(M^++1)
A-c-168	4f-2	Int.A-107	AI25	2(3FPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		469(M^++1)
A-c-169	1-a	A-c-168		2(3FPh)EtO	H	H	2-Nap	C		441(M^++1)
A-c-170		A-a-258		2(3FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		430(M^++1)
A-c-171		A-a-260		2(2ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		461(M^++1)
A-c-172		A-a-262		2(2ClPh)EtO	H	H	6-Qu	C		458(M^++1)

[0269] [表37]

Table-A-c-5

A-bxp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-c-173		A-a-264		2(1-Nap)EtO	H	H	2-Nap	C		473(M^++1)
A-c-174		A-a-266		2(1-Nap)EtO	H	H	5-Ind	C		462(M^++1)
A-c-175		A-a-268		2(2-Nap)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		476(M^++1)
A-c-176		A-a-270		2(2-Nap)EtO	H	H	5-1Idz	C		463(M^++1)
A-c-177		A-a-272			H	H	2-Nap	C		467(M^++1)
A-c-178		A-a-274			H	H	5-Ind	C		456(M^++1)
A-c-179		A-a-276		2(PhS)EtO	H	H	2-Nap	C		455(M^++1)
A-c-180		A-a-278		2(PhS)EtO	H	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-c-181		A-a-280			H	H	1Me-5-Ind	C		416(M^++1)

[0270] 参考例7 S体

(S)－5－ベンジルオキシ－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－オール中間体A－201)の合成(製造法15工程o)

参考例6の中間体A－101に記載の手順に従って、中間体A－5(93. 0mg)の蟻酸(13. 92ml)、トリエチルアミン(5. 08ml)、ルテニウムクロライド[(S, S)-N-(p-メタンスルホニル)-1, 2-ジフェニルエチレンジアミン](p-シメン)(109mg)を反応処理させることにより標記化合物(中間体A－201;960. 9mg)を得た。Mass(LCMS):241(M^++1)、保持時間;4. 45分(溶出条件:D)。

(S)－2－(5－ベンジルオキシ－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル)エタン－1, 1, 1－トリ酢酸エチル(中間体A－202)の合成(製造法15工程f－2)

参考例6中間体A－102に記載の手順に従って、中間体A－201(960. 9mg)、トリメチルホスフィン(241. 8ul)、トリエチルメタントリカルボキシラート(544mg)、DEAD(1. 06ml)を反応処理させることにより標記化合物の粗生成物(中間体A－202;1. 363g)を得たMass(LCMS):455(M^++1)、保持時間;5. 83分(溶出条件:D)。

[0271] (S)－2－(5－ベンジルオキシ－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル)エタン－1, 1, 1－トリ酢酸(中間体A－203)の合成(製造法15工程f－2)

参考例6の中間体A－103に記載の手順に従って、中間体A－202(1. 363g)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(11. 15ml)を反応処理させることにより標記化合物(化合物番号中間体A－203;376mg)を得た。(但し反応は130℃で38時間行った)。

(S)－2－(5－ベンジルオキシ－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル)酢酸(中間体A－204)の合成(製造法15工程f－2)

参考例6の中間体A－104に記載の手順に従って、中間体A－203（376mg）、酢酸（50ml）を反応処理させることにより標記化合物（化合物番号中間体A－204；276．2mg）を得た。Mass（LCMS）：283（M^+＋1）、保持時間；4．76分（溶出条件：D）。

[0272] （S）－2－（5－ベンジルオキシ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル）酢酸エチル（中間体A－205）の合成（製造法2工程b）

参考例6の中間体A－105の合成法（製造法2工程b）に記載の手順に従って、中間体A－204（275mg）、塩化チオニル（5ml）を反応処理させることにより標記化合物（化合物番号中間体A－205；281．1mg）を得た。Mass（LCMS）：311（M^+＋1）、保持時間；5．80分（溶出条件：D）。

（S）－2－（5－ベンジルオキシ－6－ブロモ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1イル）酢酸エチル（中間体A－206）の合成（製造法8工程h）

参考例1の中間体A－4の合成法（製造法8工程h）に記載の手順に従って、中間体A－205（281mg）、NBS（161．3mg）を反応、処理させることにより標記化合物（中間体A－206；341．3mg）を得た。Mass（LCMS）：391（M^+＋1）、保持時間；6．04分（溶出条件：D）。

[0273] 実施例A－d－1

実施例化合物A－a－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物（化合物番号A－d－1；30mg）を得た

実施例A－d－15

（S）－2－[5－ベンジルオキシ－6－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸エチル（化合物番号A－d－15）の合成（製造法4工程e－1）

実施例化合物A－a－1の合成法（製造法4工程e－1）に記載の手順に従って中間体A－206（411．2mg）、2－ナフタレンボロン酸（603．2mg、Ald）、2M炭酸ナトリウム水溶液（2．2ml）および$(Ph_3P)_4Pd$（272．3mg、ナカライテスク社製）を反応させ処理することにより標記化合物（化合物番号A－d－15；401．2mg）を得た（但し反応は17時間行った）。

実施例A－d－16

(S)－2－[5－ベンジルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸の合成(化合物番号A－d－16)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合A－d－15(86. 3mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0. 40ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A－d－16;79. 9mg)を得た(但し反応は1時間行った)。

[0274] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int. A－5に、また本発明の化合物の代表例をTable－A－d－1からTable－A－d－5に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。また、「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。但し、表中の「Manufacturer」の欄が空欄の試薬については通常の化学文献に記載の方法に準じて合成したものである。

なお、Table－Int. A－5のうち、「Syn」の欄が空欄の場合には、Pd／C、水素を用いた脱保護反応を行った。また、Table－A－d－1からTable－A－d－5のうち「Syn」の欄が空欄の場合には、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。

[0275] [表38]

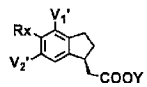


Table-Int.A-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.A-207		A-c-15		HO	Et	H	2-Nap	C		347 (M^++1)
Int.A-208		A-c-17		HO	Et	H	5-Ind	C		336 (M^++1)
Int.A-209		A-c-19		HO	Et	H	1Me-5-Ind	C		350(M^++1)
Int.A-210		A-c-21		HO	Et	H	5-1Idz	C		337(M^++1)
Int.A-211		A-c-23		HO	Et	H	1Me-5-Idz	C		351(M^++1)
Int.A-212		A-c-25		HO	Et	H	1Et-5-Idz	C		365(M^++1)
Int.A-213		A-c-29		HO	Et	H	6-Qu	C		348(M^++1)

[0276] [表39]

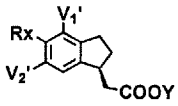


Table-A-d-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-d-1		A-a-2		cPenO	H	H	2-Nap	C		387(M^++1)
A-d-2		A-a-4		cPenO	H	H	5-Ind	C		376(M^++1)
A-d-3		A-a-6		cPenO	H	H	1Me-5-Ind	C		390(M^++1)
A-d-4		A-a-8		cPenO	H	H	1Et-5-Ind	C		404(M^++1)
A-d-5		A-a-10		cPenO	H	H	5-1Idz	C		377(M^++1)
A-d-6		A-a-12		cPenO	H	H	1Me-5-Idz	C		391(M^++1)
A-d-7		A-a-14		cPenO	H	H	1Et-5-Idz	C		405(M^++1)
A-d-8		A-a-16		cPenO	H	H	2Me-5-Idz	C		391(M^++1)
A-d-9		A-a-18		cPenO	H	H	5-BF	C		377(M^++1)
A-d-10		A-a-20		cPenO	H	H	5-BT	C		393(M^++1)
A-d-11		A-a-22		cPenO	H	H	5-Bzt	C		394(M^++1)
A-d-12		A-a-24		cPenO	H	H	3-Qu	C		388(M^++1)
A-d-13		A-a-26		cPenO	H	H	6-Qu	C		388(M^++1)
A-d-14		A-a-28		cPenO	H	H	6-IQ	C		388(M^++1)
A-d-15	4e-1	Int.A-206	BRA1	BnO	Et	H	2-Nap	C		437(M^++1)
A-d-16	1-a	A-d-15		BnO	H	H	2-Nap	C		409(M^++1)
A-d-17	4e-1	Int.A-206	BRA2	BnO	Et	H	5-Ind	C		426(M^++1)
A-d-18	1-a	A-d-17		BnO	H	H	5-Ind	C		398(M^++1)
A-d-19	4e-1	Int.A-206	BRA3	BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-d-20	1-a	A-d-19		BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		412(M^++1)
A-d-21	4e-1	Int.A-206	BRA7	BnO	Et	H	5-1Idz	C		427(M^++1)
A-d-22	1-a	A-d-21		BnO	H	H	5-1Idz	C		399(M^++1)
A-d-23	4e-1	Int.A-206	BRA8	BnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
A-d-24	1-a	A-d-23		BnO	H	H	1Me-5-Idz	C		413(M^++1)
A-d-25	4e-1	Int.A-206	BRA9	BnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)
A-d-26	1-a	A-d-25		BnO	H	H	1Et-5-Idz	C		427(M^++1)
A-d-27	4e-1	Int.A-206	BRA11	BnO	Et	H	5-BF	C		427(M^++1)
A-d-28	1-a	A-d-27		BnO	H	H	5-BF	C		399(M^++1)
A-d-29	4e-2	Int.A-206	Het2	BnO	Et	H	3-Qu	C		438(M^++1)
A-d-30	1-a	A-d-29		BnO	H	H	3-Qu	C		410(M^++1)
A-d-31	4f-2	Int.A-208	Al2	cPenMeO	Et	H	5-Ind	C		418(M^++1)
A-d-32	1-a	A-d-31		cPenMeO	H	H	5-Ind	C		390(M^++1)
A-d-32		A-a-48		cPenMeO	H	H	1Et-5-Ind	C		418(M^++1)
A-d-33	4f-2	Int.A-211	Al2	cPenMeO	Et	H	1Me-5-Idz	C		433(M^++1)
A-d-34	1-a	A-d-33		cPenMeO	H	H	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)
A-d-35		A-a-52		cPenMeO	H	H	3-Qu	C		402(M^++1)
A-d-36	4f-1	Int.A-208	Hal2	cHexMeO	Et	H	5-Ind	C		432(M^++1)
A-d-37	1-a	A-d-33		cHexMeO	H	H	5-Ind	C		404(M^++1)
A-d-38		A-a-56		cHexMeO	H	H	1Me-5-Ind	C		418(M^++1)
A-d-39		A-a-58		cHexMeO	H	H	5-1Idz	C		405(M^++1)
A-d-40		A-a-60		cHexMeO	H	H	6-IQ	C		416(M^++1)
A-d-41	4f-2	Int.A-207	Al3	cHexO	Et	H	2-Nap	C		429(M^++1)
A-d-42	1-a	A-d-41		cHexO	H	H	2-Nap	C		401(M^++1)
A-d-43	4f-2	Int.A-209	Al3	cHexO	Et	H	1Me-5-Ind	C		432(M^++1)

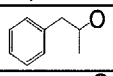
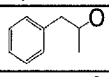
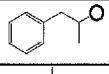
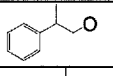
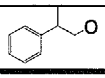
[0277] [表40]

Table-A-d-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-d-44	1-a	A-d-43		cHexO	H	H	1Me-5-Ind	C		404(M^++1)
A-d-45		A-a-64		cHexO	H	H	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)
A-d-46		A-a-66		cHexO	H	H	3-Qu	C		402(M^++1)
A-d-47	4f-2	Int.A-208	Al4	cHepO	Et	H	5-Ind	C		432(M^++1)
A-d-48	1-a	A-d-47		cHepO	H	H	5-Ind	C		404(M^++1)
A-d-49	4f-2	Int.A-210	Al4	cHepO	Et	H	5-1Idz	C		433(M^++1)
A-d-50	1-a	A-d-49		cHepO	H	H	5-1Idz	C		405(M^++1)
A-d-51		A-a-74		cHepO	H	H	1Me-5-Idz	C		419(M^++1)
A-d-52		A-a-76		cHepO	H	H	6-Qu	C		416(M^++1)
A-d-53	4f-1	Int.A-207	Hal3	nPrO	Et	H	2-Nap	C		389(M^++1)
A-d-54	1-a	A-d-53		nPrO	H	H	2-Nap	C		361(M^++1)
A-d-55		A-a-78		nPrO	H	H	5-Ind	C		350(M^++1)
A-d-56		A-a-82		nPrO	H	H	5-1Idz	C		351(M^++1)
A-d-57		A-a-84		nPrO	H	H	1Me-5-Idz	C		365(M^++1)
A-d-58		A-a-86		iPrO	H	H	2-Nap	C		361(M^++1)
A-d-59		A-a-88		iPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		364(M^++1)
A-d-60		A-a-90		iPrO	H	H	1Me-5-Idz	C		365(M^++1)
A-d-61		A-a-92		iPrO	H	H	6-Qu	C		362(M^++1)
A-d-62		A-a-94		nBuO	H	H	5-Ind	C		364(M^++1)
A-d-63		A-a-96		nBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		378(M^++1)
A-d-64	4f-1	Int.A-211	Hal5	nBuO	Et	H	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-d-65	1-a	A-d-64		nBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		379(M^++1)
A-d-66	4f-1	Int.A-207	Hal6	iBuO	Et	H	2-Nap	C		403(M^++1)
A-d-67	1-a	A-d-66		iBuO	H	H	2-Nap	C		375(M^++1)
A-d-68	4f-1	Int.A-207	Hal6	iBuO	Et	H	5-Ind	C		392(M^++1)
A-d-69	1-a	A-d-68		iBuO	H	H	5-Ind	C		364(M^++1)
A-d-70		A-a-104		iBuO	H	H	5-1Idz	C		365(M^++1)
A-d-71	4f-1	Int.A-211		iBuO	Et	H	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-d-72	1-a	A-d-71		iBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		379(M^++1)
A-d-73	4f-1	Int.A-207	Hal7	2FBnO	Et	H	2-Nap	C		455(M^++1)
A-d-74	1-a	A-d-73		2FBnO	H	H	2-Nap	C		427(M^++1)
A-d-75	4f-1	Int.A-208	Hal7	2FBnO	Et	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-d-76	1-a	A-d-75		2FBnO	H	H	5-Ind	C		416(M^++1)
A-d-77		A-a-112		2FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		431(M^++1)
A-d-78	4f-1	Int.A-209	Hal8	3FBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		458(M^++1)
A-d-79	1-a	A-d-78		3FBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		430(M^++1)
A-d-80	4f-1	Int.A-210	Hal8	3FBnO	Et	H	5-1Idz	C		445(M^++1)
A-d-81	1-a	A-d-80		3FBnO	H	H	5-1Idz	C		417(M^++1)
A-d-82		A-a-116		3FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		431(M^++1)
A-d-83		A-a-120		4FBnO	H	H	2-Nap	C		427(M^++1)
A-d-84		A-a-122		4FBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		445(M^++1)
A-d-85		A-a-124		4FBnO	H	H	5-BF	C		417(M^++1)
A-d-86		A-a-126		4FBnO	H	H	6-Qu	C		443(M^++1)
A-d-87		A-a-128		2ClBnO	H	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-d-88		A-a-130		2ClBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		461(M^++1)
A-d-89		A-a-132		2ClBnO	H	H	5-BF	C		433(M^++1)
A-d-90		A-a-134		3ClBnO	H	H	2-Nap	C		443(M^++1)
A-d-91	4f-1	Int.A-209	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		474(M^++1)

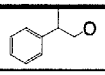
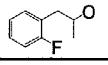
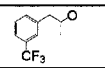
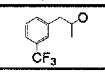
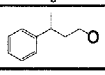
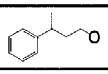
[0278] [表41]

Table-A-d-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-d-92	1-a	A-d-91		3ClBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		446(M^++1)
A-d-93	4f-1	Int.A-210		3ClBnO	Et	H	5-1Idz	C		461(M^++1)
A-d-94	1-a	A-d-93		3ClBnO	H	H	5-1Idz	C		433(M^++1)
A-d-95		A-a-140		3ClBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		447(M^++1)
A-d-96		A-a-142		4MeBnO	H	H	5-Ind	C		412(M^++1)
A-d-97		A-a-144		4MeBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		426(M^++1)
A-d-98		A-a-146		4MeBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		427(M^++1)
A-d-99	4f-1	Int.A-207	Hal13	4CF3BnO	Et	H	2-Nap	C		504(M^++1)
A-d-100	1-a	A-d-99		4CF3BnO	H	H	2-Nap	C		476(M^++1)
A-d-101	4f-1	Int.A-209	Hal13	4CF3BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		507(M^++1)
A-d-102	1-a	A-d-101		4CF3BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		479(M^++1)
A-d-103	4f-1	Int.A-210	Hal13	4CF3BnO	Et	H	5-1Idz	C		494(M^++1)
A-d-104	1-a	A-d-103		4CF3BnO	H	H	5-1Idz	C		466(M^++1)
A-d-105		A-a-154		2EtBuO	H	H	2-Nap	C		403(M^++1)
A-d-106	4f-2	Int.A-209	Al5	2EtBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		434(M^++1)
A-d-107	1-a	A-d-106		2EtBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		406(M^++1)
A-d-108		A-a-158		2EtBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		407(M^++1)
A-d-109		A-a-160		2(4DMAPh)EtO	H	H	5-Ind	C		455(M^++1)
A-d-110		A-a-162		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		469(M^++1)
A-d-111	4f-2	Int.A-212	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		512(M^++1)
A-d-112	1-a	A-d-106		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		484(M^++1)
A-d-113	4f-2	Int.A-207	Al7	2(PhO)EtO	Et	H	2-Nap	C		467(M^++1)
A-d-114	1-a	A-d-106		2(PhO)EtO	H	H	2-Nap	C		439(M^++1)
A-d-115		A-a-168		2(PhO)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		442(M^++1)
A-d-116		A-a-170		2(PhO)EtO	H	H	6-Qu	C		440(M^++1)
A-d-117		A-a-172		1PhEtO	H	H	2-Nap	C		423(M^++1)
A-d-118		A-a-174		1PhEtO	H	H	1Me-5-Ind	C		426(M^++1)
A-d-119		A-a-176		1PhEtO	H	H	5-1Idz	C		413(M^++1)
A-d-120		A-a-178		1(2FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		430(M^++1)
A-d-121		A-a-180		1(2FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		459(M^++1)
A-d-122		A-a-182		1(2FPh)EtO	H	H	6-Qu	C		442(M^++1)
A-d-123	4f-2	Int.A-207	Al10	1(4ClPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		489(M^++1)
A-d-124	1-a	A-d-123		1(4ClPh)EtO	H	H	2-Nap	C		457(M^++1)
A-d-125	4f-2	Int.A-209	Al10	1(4ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		489(M^++1)
A-d-126	1-a	A-d-125		1(4ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		460(M^++1)
A-d-127		A-a-188		1(4ClPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		476(M^++1)
A-d-128		A-a-190		4Me,cHexO	H	H	2-Nap	C		415(M^++1)
A-d-129		A-a-192		4Me,cHexO	H	H	1Me-5-Ind	C		418(M^++1)
A-d-130	4f-2	Int.A-209	Al12		Et	H	1Me-5-Ind	C		468(M^++1)
A-d-131	1-a	A-d-130			H	H	1Me-5-Ind	C		440(M^++1)
A-d-132		A-a-196			H	H	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
A-d-133	4f-2	Int.A-207	Al13		Et	H	2-Nap	C		465(M^++1)
A-d-134	1-a	A-d-133			H	H	2-Nap	C		437(M^++1)

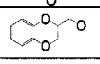
[0279] [表42]

Table-A-d-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-d-135		A-a-200			H	H	1Et-5-Idz	C		455(M^++1)
A-d-136		A-a-202			H	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-d-137		A-a-204			H	H	1Me-5-Ind	C		458(M^++1)
A-d-138		A-a-206			H	H	5-Ind	C		494(M^++1)
A-d-139		A-a-208			H	H	1Me-5-Ind	C		508(M^++1)
A-d-140		A-a-210			H	H	1Me-5-Ind	C		454(M^++1)
A-d-141		A-a-212			H	H	1Me-5-Idz	C		455(M^++1)
A-d-142	4f-2	Int.A-207	AI17	1IndanO	Et	H	2-Nap	C		463(M^++1)
A-d-143	1-a	A-d-142		1IndanO	H	H	2-Nap	C		435(M^++1)
A-d-144		A-a-216		1IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		438(M^++1)
A-d-145		A-a-218		1IndanO	H	H	5-1Idz	C		425(M^++1)
A-d-146		A-a-220		2IndanO	H	H	2-Nap	C		435(M^++1)
A-d-147	4f-2	Int.A-208	AI18	2IndanO	Et	H	5-Ind	C		452(M^++1)
A-d-148	1-a	A-d-147		2IndanO	H	H	5-Ind	C		424(M^++1)
A-d-149	4f-2	Int.A-209	AI18	2IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		466(M^++1)
A-d-150	1-a	A-d-149		2IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		438(M^++1)
A-d-151		A-a-224		2IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		439(M^++1)
A-d-152		A-a-226		5OMe-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		468(M^++1)
A-d-153		A-a-228		5OMe-2-IndanO	H	H	5-1Idz	C		455(M^++1)
A-d-154	4f-2	Int.A-212	AI19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		511(M^++1)
A-d-155	1-a	A-d-154		5OMe-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		483(M^++1)
A-d-156		A-a-232		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		495(M^++1)
A-d-157		A-a-234		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	5-Ind	C		484(M^++1)
A-d-158		A-a-236		5F-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		453(M^++1)
A-d-159	4f-2	Int.A-209	AI21	5F-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		484(M^++1)
A-d-160	1-a	A-d-159		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		456(M^++1)
A-d-161	4f-2	Int.A-210	AI21	5F-2-IndanO	Et	H	5-1Idz	C		471(M^++1)
A-d-162	1-a	A-d-162		5F-2-IndanO	H	H	5-1Idz	C		443(M^++1)
A-d-163		A-a-240		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		457(M^++1)
A-d-164	4f-2	Int.A-212	AI21	5F-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		499(M^++1)
A-d-165	1-a	A-d-164		5F-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		471(M^++1)
A-d-166		A-a-244			H	H	5-Ind	C		438(M^++1)
A-d-167		A-a-246			H	H	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
A-d-168		A-a-248			H	H	2-Nap	C		449(M^++1)
A-d-169		A-a-250			H	H	5-1Idz	C		439(M^++1)
A-d-170	4f-2	Int.A-208	AI24	2(2MePh)EtO	Et	H	5-Ind	C		454(M^++1)
A-d-171	1-a	A-d-170		2(2MePh)EtO	H	H	5-Ind	C		426(M^++1)

[0280] [表43]

Table-A-d-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
A-d-172	4f-2	Int.A-211	Al24	2(2MePh)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		469(M^++1)
A-d-173	1-a	A-d-164		2(2MePh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
A-d-174	4f-2	Int.A-213	Al24	2(2MePh)EtO	Et	H	6-Qu	C		466(M^++1)
A-d-175	1-a	A-d-164		2(2MePh)EtO	H	H	6-Qu	C		438(M^++1)
A-d-176	4f-2	Int.A-207	Al25	2(3FPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		469(M^++1)
A-d-177	1-a	A-d-164		2(3FPh)EtO	H	H	2-Nap	C		441(M^++1)
A-d-178		A-a-258		2(3FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		430(M^++1)
A-d-179		A-a-260		2(2ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		461(M^++1)
A-d-180		A-a-262		2(2ClPh)EtO	H	H	6-Qu	C		458(M^++1)
A-d-181		A-a-264		2(1-Nap)EtO	H	H	2-Nap	C		473(M^++1)
A-d-182		A-a-266		2(1-Nap)EtO	H	H	5-Ind	C		462(M^++1)
A-d-183		A-a-268		2(2-Nap)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		476(M^++1)
A-d-184		A-a-270		2(2-Nap)EtO	H	H	5-1Idz	C		463(M^++1)
A-d-185		A-a-272			H	H	2-Nap	C		467(M^++1)
A-d-186		A-a-274			H	H	5-Ind	C		456(M^++1)
A-d-187		A-a-276		2(PhS)EtO	H	H	2-Nap	C		455(M^++1)
A-d-188		A-a-278		2(PhS)EtO	H	H	5-Ind	C		444(M^++1)
A-d-189		A-a-280			H	H	1Me-5-Ind	C		416(M^++1)

[0281] 参考例8

6－ブロモ－5－シクロペンチルオキシ－2，3－ジヒドロインダン－1－オン（中間体B－1）の合成（製造法13工程h）

参考例1の中間体A－4の合成法（製造法8工程h）に記載の手順に従って、中間体A－1（1．19g）およびNBS（1．08g、WAKO）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体B－1；366．2mg）を得た（但し反応は室温にて1時間行った）。Mass（LCMS）：295（M^+）、保持時間；4．88分（溶出条件：B）。

5－シクロペンチルオキシ－6－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－オン（中間体B－2）の合成（製造法11工程e－1）

実施例化合物A－a－1の合成法（製造法4工程e－1）に記載の手順に従って中間体B－1（363．2mg）、2－ナフタレンボロン酸（311．2mg、TCI）、2M炭酸ナトリウム水溶液（0．8ml）および$(Ph_3P)_4Pd$（88．4mg、ナカライテスク社製）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体B－2；388．5mg）を得た（但し反応は12時間行った）。Mass（LCMS）：343（M^+）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

[0282] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．B－1に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて

行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。

なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。

[0283] [表44]

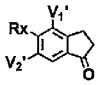


Table-Int.B-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-3	11e-1	Int.B-1	BRA3	cPenO	H	1Me-5-Ind	C		346 (M^++1)
Int.B-4	11e-1	Int.B-1	BRA4	cPenO	H	1Et-5-Ind	C		360 (M^++1)
Int.B-5	11e-1	Int.B-1	BRA5	cPenO	H	1Me-4-Ind	C		346 (M^++1)
Int.B-6	11e-1	Int.B-1	BRA6	cPenO	H	1Me-6-Ind	C		346 (M^++1)
Int.B-7	11e-1	Int.B-1	BRA8	cPenO	H	1Me-5-Idz	C		347 (M^++1)
Int.B-8	11e-1	Int.B-1	BRA9	cPenO	H	1Et-5-Idz	C		361 (M^++1)
Int.B-9	11e-1	Int.B-1	BRA11	cPenO	H	5-BF	C		333 (M^++1)
Int.B-10	11e-1	Int.B-1	BRA13	cPenO	H	6-Qu	C		344 (M^++1)
Int.B-11	11e-2	Int.B-1	Het3	cPenO	H	6-IQ	C		344 (M^++1)
Int.B-12	14f-1		Hal1	BnO	H	H	C		239 (M^++1)
Int.B-13	13h-1	Int.B-12		BnO	H	Br	C		317 (M^+)
Int.B-14	11e-1	Int.B-13	BRA1	BnO	H	2-Nap	C		365(M^++1)
Int.B-15	11e-1	Int.B-13	BRA3	BnO	H	1Me-5-Ind	C		368 (M^++1)
Int.B-16	11e-1	Int.B-13	BRA4	BnO	H	1Et-5-Ind	C		382(M^++1)
Int.B-17	11e-1	Int.B-13	BRA5	BnO	H	1Me-4-Ind	C		368 (M^++1)
Int.B-18	11e-1	Int.B-13	BRA6	BnO	H	1Me-6-Ind	C		368 (M^++1)
Int.B-19	11e-1	Int.B-13	BRA8	BnO	H	1Me-5-Idz	C		369 (M^++1)
Int.B-20	11e-1	Int.B-13	BRA9	BnO	H	1Et-5-Idz	C		383 (M^++1)
Int.B-21	11e-1	Int.B-13	BRA11	BnO	H	5-BF	C		355(M^++1)
Int.B-22	11e-1	Int.B-13	BRA13	BnO	H	6-Qu	C		366 (M^++1)
Int.B-23	11e-2	Int.B-13	Het3	BnO	H	6-IQ	C		366 (M^++1)

[0284] 参考例9

5－ベンジルオキシ－6－ブロモ－2，3－ジヒドロインダン－1－オン(中間体B－13)の合成(製造法13工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って、中間体B－12(4．10g)およびNBS(3．22g、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体B－13;388．5mg)を得た(但し反応は室温にて15時間行った)。Mass(LCMS):317(M^+)、保持時間;4．77分(溶出条件:B)。

5－ベンジルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロインデン－1－オン(中間体B－14)の合成(製造法11工程e－1)

実施例化合物A－a－1の合成法(製造法4工程e－1)に記載の手順に従って中間

体B－13（388．5mg）、2－ナフタレンボロン酸（376．4mg、TCI）、2M炭酸ナトリウム水溶液（0．9ml）および$(Ph_3P)_4Pd$（121．5mg、ナカライテスク社製）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体B－14；395．8mg）を得た（但し反応は12時間行った）。Mass（LCMS）：365（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

[0285] 5－ヒドロキシ－6－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－オン（中間体B－24）の合成

実施例A－a－107の中間体A－22の合成法に記載の手順に従って中間体B－14（391．3mg）、10％水酸化パラジウム（212．2mg、NEケムキャット社製）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体B－24；314．2mg）を得た（但し反応は12時間行った）。Mass（LCMS）：275（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

5－シクロペンチルメチルオキシ－6－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－オン（中間体B－34）の合成 （製造法4工程f－2）

参考例1の中間体A－1の合成法（製造法4工程f－2）に記載の手順に従って中間体B－24（100．0mg）、シクロペンタンメタノール（53．5ul、Ald）、ジターシャリーブチルアゾジカルボキシレート（165．3mg、Ald）、トリフェニルホスフィン（143．3mg、WAKO）、を反応させ処理することにより標記化合物（中間体B－34；110．2mg）を得た（但し反応は12時間行った）。Mass（LCMS）：357（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

[0286] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．B－2からTable－Int．B－6に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal（番号）」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al（番号）」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA（番号）」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het（番号）」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。なお、「Syn」の欄が空欄の場合には、Pd／C、水素を用いた脱保護反応を行った。

[0287] [表45]

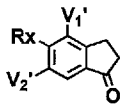


Table-Int.B-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-24		Int.B-14		HO	H	2-Nap	C		275 (M^++1)
Int.B-25		Int.B-15		HO	H	1Me-5-Ind	C		278(M^++1)
Int.B-26		Int.B-16		HO	H	1Et-5-Ind	C		292 (M^++1)
Int.B-27		Int.B-17		HO	H	1Me-4-Ind	C		278 (M^++1)
Int.B-28		Int.B-18		HO	H	1Me-6-Ind	C		278 (M^++1)
Int.B-29		Int.B-19		HO	H	1Me-5-Idz	C		279 (M^++1)
Int.B-30		Int.B-20		HO	H	1Et-5-Idz	C		293 (M^++1)
Int.B-31		Int.B-21		HO	H	5-BF	C		265 (M^++1)
Int.B-32		Int.B-22		HO	H	6-Qu	C		276 (M^++1)
Int.B-33		Int.B-23		HO	H	6-IQ	C		276 (M^++1)
Int.B-34	f-2	Int.B-24	Al2	cPenMeO	H	2-Nap	C		357 (M^++1)
Int.B-35	f-2	Int.B-25	Al2	cPenMeO	H	1Me-5-Ind	C		360 (M^++1)
Int.B-36	f-2	Int.B-27	Al2	cPenMeO	H	1Me-4-Ind	C		360 (M^++1)
Int.B-37	f-2	Int.B-29	Al2	cPenMeO	H	1Me-5-Idz	C		361 (M^++1)
Int.B-38	f-2	Int.B-30	Al2	cPenMeO	H	1Et-5-Idz	C		375(M^++1)
Int.B-39	f-2	Int.B-32	Al2	cPenMeO	H	6-Qu	C		358 (M^++1)
Int.B-40	f-1	Int.B-24	Hal2	cHexMeO	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Int.B-41	f-1	Int.B-26	Hal2	cHexMeO	H	1Et-5-Ind	C		388 (M^++1)
Int.B-42	f-1	Int.B-28	Hal2	cHexMeO	H	1Me-6-Ind	C		374 (M^++1)
Int.B-43	f-1	Int.B-29	Hal2	cHexMeO	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Int.B-44	f-1	Int.B-30	Hal2	cHexMeO	H	1Et-5-Idz	C		389 (M^++1)
Int.B-45	f-1	Int.B-31	Hal2	cHexMeO	H	5-BF	C		361 (M^++1)
Int.B-46	f-1	Int.B-33	Hal2	cHexMeO	H	6-IQ	C		372 (M^++1)
Int.B-47	f-2	Int.B-24	Al3	cHexO	H	2-Nap	C		357 (M^++1)
Int.B-48	f-2	Int.B-25	Al3	cHexO	H	1Me-5-Ind	C		360 (M^++1)
Int.B-49	f-2	Int.B-26	Al3	cHexO	H	1Et-5-Ind	C		374 (M^++1)
Int.B-50	f-2	Int.B-27	Al3	cHexO	H	1Me-4-Ind	C		360 (M^++1)
Int.B-51	f-2	Int.B-29	Al3	cHexO	H	1Me-5-Idz	C		361 (M^++1)
Int.B-52	f-2	Int.B-30	Al3	cHexO	H	1Et-5-Idz	C		375 (M^++1)
Int.B-53	f-2	Int.B-32	Al3	cHexO	H	6-Qu	C		358 (M^++1)
Int.B-54	f-2	Int.B-24	Al4	cHepO	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Int.B-55	f-2	Int.B-25	Al4	cHepO	H	1Me-5-Ind	C		374 (M^++1)
Int.B-56	f-2	Int.B-29	Al4	cHepO	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Int.B-57	f-2	Int.B-33	Al4	cHepO	H	6-IQ	C		372 (M^++1)
Int.B-58	f-1	Int.B-25	Hal3	nPrO	H	1Me-5-Ind	C		320 (M^++1)
Int.B-59	f-1	Int.B-26	Hal3	nPrO	H	1Et-5-Ind	C		334 (M^++1)
Int.B-60	f-1	Int.B-30	Hal3	nPrO	H	1Et-5-Idz	C		335 (M^++1)
Int.B-61	f-1	Int.B-32	Hal3	nPrO	H	6-Qu	C		318(M^++1)
Int.B-62	f-1	Int.B-24	Hal4	iPrO	H	2-Nap	C		317 (M^++1)
Int.B-63	f-1	Int.B-26	Hal4	iPrO	H	1Et-5-Ind	C		334 (M^++1)
Int.B-64	f-1	Int.B-29	Hal4	iPrO	H	1Me-5-Idz	C		321 (M^++1)
Int.B-65	f-1	Int.B-33	Hal4	iPrO	H	6-IQ	C		318 (M^++1)
Int.B-66	f-1	Int.B-24	Hal5	nBuO	H	2-Nap	C		331 (M^++1)
Int.B-67	f-1	Int.B-25	Hal5	nBuO	H	1Me-5-Ind	C		334 (M^++1)
Int.B-68	f-1	Int.B-30	Hal5	nBuO	H	1Et-5-Idz	C		349 (M^++1)
Int.B-69	f-1	Int.B-31	Hal5	nBuO	H	5-BF	C		321 (M^++1)

[0288] [表46]

Table-Int.B-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-70	f-1	Int.B-24	Hal6	iBuO	H	2-Nap	C		331 (M^++1)
Int.B-71	f-1	Int.B-25	Hal6	iBuO	H	1Me-5-Ind	C		334 (M^++1)
Int.B-72	f-1	Int.B-26	Hal6	iBuO	H	1Et-5-Ind	C		348 (M^++1)
Int.B-73	f-1	Int.B-29	Hal6	iBuO	H	1Me-5-Idz	C		335 (M^++1)
Int.B-74	f-1	Int.B-30	Hal6	iBuO	H	1Et-5-Idz	C		349 (M^++1)
Int.B-75	f-1	Int.B-24	Hal7	2FBnO	H	2-Nap	C		383 (M^++1)
Int.B-76	f-1	Int.B-25	Hal7	2FBnO	H	1Me-5-Ind	C		386 (M^++1)
Int.B-77	f-1	Int.B-26	Hal7	2FBnO	H	1Et-5-Ind	C		400 (M^++1)
Int.B-78	f-1	Int.B-29	Hal7	2FBnO	H	1Me-5-Idz	C		387(M^++1)
Int.B-79	f-1	Int.B-30	Hal7	2FBnO	H	1Et-5-Idz	C		401 (M^++1)
Int.B-80	f-1	Int.B-32	Hal7	2FBnO	H	6-Qu	C		384 (M^++1)
Int.B-81	f-1	Int.B-33	Hal7	2FBnO	H	6-IQ	C		384 (M^++1)
Int.B-82	f-1	Int.B-24	Hal8	3FBnO	H	2-Nap	C		383 (M^++1)
Int.B-83	f-1	Int.B-26	Hal8	3FBnO	H	1Et-5-Ind	C		400 (M^++1)
Int.B-84	f-1	Int.B-28	Hal8	3FBnO	H	1Me-6-Ind	C		386 (M^++1)
Int.B-85	f-1	Int.B-29	Hal8	3FBnO	H	1Me-5-Idz	C		387 (M^++1)
Int.B-86	f-1	Int.B-31	Hal8	3FBnO	H	5-BF	C		373 (M^++1)
Int.B-87	f-1	Int.B-32	Hal8	3FBnO	H	6-Qu	C		384 (M^++1)
Int.B-88	f-1	Int.B-25	Hal9	4FBnO	H	1Me-5-Ind	C		386 (M^++1)
Int.B-89	f-1	Int.B-27	Hal9	4FBnO	H	1Me-4-Ind	C		386 (M^++1)
Int.B-90	f-1	Int.B-28	Hal9	4FBnO	H	1Me-6-Ind	C		386 (M^++1)
Int.B-91	f-1	Int.B-30	Hal9	4FBnO	H	1Et-5-Idz	C		401 (M^++1)
Int.B-92	f-1	Int.B-32	Hal9	4FBnO	H	6-Qu	C		384(M^++1)
Int.B-93	f-1	Int.B-24	Hal10	2ClBnO	H	2-Nap	C		399(M^++1)
Int.B-94	f-1	Int.B-26	Hal10	2ClBnO	H	1Et-5-Ind	C		416 (M^++1)
Int.B-95	f-1	Int.B-27	Hal10	2ClBnO	H	1Me-4-Ind	C		402 (M^++1)
Int.B-96	f-1	Int.B-28	Hal10	2ClBnO	H	1Me-6-Ind	C		402 (M^++1)
Int.B-97	f-1	Int.B-30	Hal10	2ClBnO	H	1Et-5-Idz	C		417 (M^++1)
Int.B-98	f-1	Int.B-24	Hal11	3ClBnO	H	2-Nap	C		399 (M^++1)
Int.B-99	f-1	Int.B-25	Hal11	3ClBnO	H	1Me-5-Ind	C		402 (M^++1)
Int.B-100	f-1	Int.B-26	Hal11	3ClBnO	H	1Et-5-Ind	C		416 (M^++1)
Int.B-101	f-1	Int.B-29	Hal11	3ClBnO	H	1Me-5-Idz	C		403 (M^++1)
Int.B-102	f-1	Int.B-30	Hal11	3ClBnO	H	1Et-5-Idz	C		417 (M^++1)
Int.B-103	f-1	Int.B-31	Hal11	3ClBnO	H	5-BF	C		389 (M^++1)
Int.B-104	f-1	Int.B-32	Hal11	3ClBnO	H	6-Qu	C		400 (M^++1)
Int.B-105	f-1	Int.B-24	Hal12	4MeBnO	H	2-Nap	C		379 (M^++1)
Int.B-106	f-1	Int.B-25	Hal12	4MeBnO	H	1Me-5-Ind	C		382 (M^++1)
Int.B-107	f-1	Int.B-26	Hal12	4MeBnO	H	1Et-5-Ind	C		396 (M^++1)
Int.B-108	f-1	Int.B-28	Hal12	4MeBnO	H	1Me-6-Ind	C		382 (M^++1)
Int.B-109	f-1	Int.B-29	Hal12	4MeBnO	H	1Me-5-Idz	C		383 (M^++1)
Int.B-110	f-1	Int.B-33	Hal12	4MeBnO	H	6-IQ	C		380 (M^++1)
Int.B-111	f-1	Int.B-25	Hal13	4CF3BnO	H	1Me-5-Ind	C		435 (M^++1)
Int.B-112	f-1	Int.B-27	Hal13	4CF3BnO	H	1Me-4-Ind	C		435 (M^++1)
Int.B-113	f-1	Int.B-29	Hal13	4CF3BnO	H	1Me-5-Idz	C		436 (M^++1)
Int.B-114	f-1	Int.B-30	Hal13	4CF3BnO	H	1Et-5-Idz	C		450 (M^++1)
Int.B-115	f-1	Int.B-32	Hal13	4CF3BnO	H	6-Qu	C		433 (M^++1)

[0289] [表47]

Table-Int.B-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-116	f-2	Int.B-24	AI5	2EtBuO	H	2-Nap	C		359 (M^++1)
Int.B-117	f-2	Int.B-25	AI5	2EtBuO	H	1Me-5-Ind	C		362 (M^++1)
Int.B-118	f-2	Int.B-26	AI5	2EtBuO	H	1Et-5-Ind	C		376 (M^++1)
Int.B-119	f-2	Int.B-29	AI5	2EtBuO	H	1Me-5-Idz	C		363 (M^++1)
Int.B-120	f-2	Int.B-30	AI5	2EtBuO	H	1Et-5-Idz	C		377 (M^++1)
Int.B-121	f-2	Int.B-32	AI5	2EtBuO	H	6-Qu	C		360 (M^++1)
Int.B-122	f-2	Int.B-33	AI5	2EtBuO	H	6-IQ	C		360 (M^++1)
Int.B-123	f-2	Int.B-24	AI6	2(4DMAPh)EtO	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
Int.B-124	f-2	Int.B-25	AI6	2(4DMAPh)EtO	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
Int.B-125	f-2	Int.B-27	AI6	2(4DMAPh)EtO	H	1Me-4-Ind	C		425 (M^++1)
Int.B-126	f-2	Int.B-30	AI6	2(4DMAPh)EtO	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
Int.B-127	f-2	Int.B-31	AI6	2(4DMAPh)EtO	H	5-BF	C		412 (M^++1)
Int.B-128	f-2	Int.B-32	AI6	2(4DMAPh)EtO	H	6-Qu	C		423 (M^++1)
Int.B-129	f-2	Int.B-26	AI7	2(PhO)EtO	H	1Et-5-Ind	C		412 (M^++1)
Int.B-130	f-2	Int.B-27	AI7	2(PhO)EtO	H	1Me-4-Ind	C		398 (M^++1)
Int.B-131	f-2	Int.B-28	AI7	2(PhO)EtO	H	1Me-6-Ind	C		398 (M^++1)
Int.B-132	f-2	Int.B-29	AI7	2(PhO)EtO	H	1Me-5-Idz	C		399 (M^++1)
Int.B-133	f-2	Int.B-33	AI7	2(PhO)EtO	H	6-IQ	C		306 (M^++1)
Int.B-134	f-2	Int.B-24	AI8	1PhEtO	H	2-Nap	C		379 (M^++1)
Int.B-135	f-2	Int.B-25	AI8	1PhEtO	H	1Me-5-Ind	C		382 (M^++1)
Int.B-136	f-2	Int.B-26	AI8	1PhEtO	H	1Et-5-Ind	C		396 (M^++1)
Int.B-137	f-2	Int.B-29	AI8	1PhEtO	H	1Me-5-Idz	C		383 (M^++1)
Int.B-138	f-2	Int.B-30	AI8	1PhEtO	H	1Et-5-Idz	C		397 (M^++1)
Int.B-139	f-2	Int.B-24	AI9	1(2FPh)EtO	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Int.B-140	f-2	Int.B-26	AI9	1(2FPh)EtO	H	1Et-5-Ind	C		414 (M^++1)
Int.B-141	f-2	Int.B-28	AI9	1(2FPh)EtO	H	1Me-6-Ind	C		400 (M^++1)
Int.B-142	f-2	Int.B-29	AI9	1(2FPh)EtO	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Int.B-143	f-2	Int.B-30	AI9	1(2FPh)EtO	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Int.B-144	f-2	Int.B-33	AI9	1(2FPh)EtO	H	6-IQ	C		398 (M^++1)
Int.B-145	f-2	Int.B-25	AI10	1(4ClPh)EtO	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Int.B-146	f-2	Int.B-27	AI10	1(4ClPh)EtO	H	1Me-4-Ind	C		416 (M^++1)
Int.B-147	f-2	Int.B-28	AI10	1(4ClPh)EtO	H	1Me-6-Ind	C		416 (M^++1)
Int.B-148	f-2	Int.B-29	AI10	1(4ClPh)EtO	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Int.B-149	f-2	Int.B-30	AI10	1(4ClPh)EtO	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Int.B-150	f-2	Int.B-31	AI10	1(4ClPh)EtO	H	5-BF	C		403 (M^++1)
Int.B-151	f-2	Int.B-24	AI11	4Me,cHexO	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Int.B-152	f-2	Int.B-25	AI11	4Me,cHexO	H	1Me-5-Ind	C		374 (M^++1)
Int.B-153	f-2	Int.B-26	AI11	4Me,cHexO	H	1Et-5-Ind	C		388 (M^++1)
Int.B-154	f-2	Int.B-29	AI11	4Me,cHexO	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Int.B-155	f-2	Int.B-30	AI11	4Me,cHexO	H	1Et-5-Idz	C		389 (M^++1)
Int.B-156	f-2	Int.B-32	AI11	4Me,cHexO	H	6-Qu	C		372 (M^++1)
Int.B-157	f-2	Int.B-24	AI17	1IndanO	H	2-Nap	C		391 (M^++1)
Int.B-158	f-2	Int.B-25	AI17	1IndanO	H	1Me-5-Ind	C		394 (M^++1)
Int.B-159	f-2	Int.B-27	AI17	1IndanO	H	1Me-4-Ind	C		394 (M^++1)
Int.B-160	f-2	Int.B-28	AI17	1IndanO	H	1Me-6-Ind	C		394 (M^++1)
Int.B-161	f-2	Int.B-29	AI17	1IndanO	H	1Me-5-Idz	C		395 (M^++1)

[0290] [表48]

Table-Int.B-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-162	f-2	Int.B-30	AI17	1IndanO	H	1Et-5-Idz	C		409 (M^++1)
Int.B-163	f-2	Int.B-31	AI17	1IndanO	H	5-BF	C		381 (M^++1)
Int.B-164	f-2	Int.B-32	AI17	1IndanO	H	6-Qu	C		392 (M^++1)
Int.B-165	f-2	Int.B-24	AI18	2IndanO	H	2-Nap	C		391 (M^++1)
Int.B-166	f-2	Int.B-25	AI18	2IndanO	H	1Me-5-Ind	C		394 (M^++1)
Int.B-167	f-2	Int.B-26	AI18	2IndanO	H	1Et-5-Ind	C		408 (M^++1)
Int.B-168	f-2	Int.B-29	AI18	2IndanO	H	1Me-5-Idz	C		395 (M^++1)
Int.B-169	f-2	Int.B-30	AI18	2IndanO	H	1Et-5-Idz	C		409 (M^++1)
Int.B-170	f-2	Int.B-33	AI18	2IndanO	H	6-IQ	C		392 (M^++1)
Int.B-171	f-2	Int.B-24	AI19	5OMe-2-IndanO	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Int.B-172	f-2	Int.B-26	AI19	5OMe-2-IndanO	H	1Et-5-Ind	C		438 (M^++1)
Int.B-173	f-2	Int.B-29	AI19	5OMe-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Int.B-174	f-2	Int.B-32	AI19	5OMe-2-IndanO	H	6-Qu	C		422 (M^++1)
Int.B-175	f-2	Int.B-25	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
Int.B-176	f-2	Int.B-27	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-4-Ind	C		454 (M^++1)
Int.B-177	f-2	Int.B-28	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-6-Ind	C		454 (M^++1)
Int.B-178	f-2	Int.B-29	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Int.B-179	f-2	Int.B-33	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	6-IQ	C		452 (M^++1)
Int.B-180	f-2	Int.B-24	AI21	5F-2-IndanO	H	2-Nap	C		409 (M^++1)
Int.B-181	f-2	Int.B-25	AI21	5F-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	C		412 (M^++1)
Int.B-182	f-2	Int.B-26	AI21	5F-2-IndanO	H	1Et-5-Ind	C		426 (M^++1)
Int.B-183	f-2	Int.B-29	AI21	5F-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
Int.B-184	f-2	Int.B-30	AI21	5F-2-IndanO	H	1Et-5-Idz	C		427 (M^++1)
Int.B-185	f-2	Int.B-32	AI21	5F-2-IndanO	H	6-Qu	C		410 (M^++1)
Int.B-186	f-2	Int.B-33	AI21	5F-2-IndanO	H	6-IQ	C		410 (M^++1)
Int.B-187	f-2	Int.B-24	AI22		H	2-Nap	C		405 (M^++1)
Int.B-188	f-2	Int.B-25	AI22		H	1Me-5-Ind	C		408 (M^++1)
Int.B-189	f-2	Int.B-28	AI22		H	1Me-6-Ind	C		408 (M^++1)
Int.B-190	f-2	Int.B-29	AI22		H	1Me-5-Idz	C		409 (M^++1)
Int.B-191	f-2	Int.B-32	AI22		H	6-Qu	C		423 (M^++1)
Int.B-192	f-2	Int.B-25	AI23		H	1Me-5-Ind	C		408 (M^++1)
Int.B-193	f-2	Int.B-26	AI23		H	1Et-5-Ind	C		422 (M^++1)
Int.B-194	f-2	Int.B-27	AI23		H	1Me-4-Ind	C		408 (M^++1)
Int.B-195	f-2	Int.B-30	AI23		H	1Et-5-Idz	C		423 (M^++1)
Int.B-196	f-2	Int.B-31	AI23		H	5-BF	C		395 (M^++1)
Int.B-197	f-2	Int.B-24	AI24	2(2MePh)EtO	H	2-Nap	C		393 (M^++1)

[0291] [表49]

Table-Int.B-6

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-198	f-2	Int.B-25	Al24	2(2MePh)EtO	H	1Me-5-Ind	C		396 (M^++1)
Int.B-199	f-2	Int.B-26	Al24	2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Ind	C		410 (M^++1)
Int.B-200	f-2	Int.B-30	Al24	2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Idz	C		410 (M^++1)
Int.B-201	f-2	Int.B-32	Al24	2(2MePh)EtO	H	6-Qu	C		394 (M^++1)
Int.B-202	f-2	Int.B-24	Al25	2(3FPh)EtO	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Int.B-203	f-2	Int.B-25	Al25	2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Int.B-204	f-2	Int.B-27	Al25	2(3FPh)EtO	H	1Me-4-Ind	C		400 (M^++1)
Int.B-205	f-2	Int.B-30	Al25	2(3FPh)EtO	H	1Et-5-Idz	C		414 (M^++1)
Int.B-206	f-2	Int.B-33	Al25	2(3FPh)EtO	H	6-IQ	C		398 (M^++1)
Int.B-207	f-2	Int.B-26	Al26	2(2ClPh)EtO	H	1Et-5-Ind	C		430 (M^++1)
Int.B-208	f-2	Int.B-27	Al26	2(2ClPh)EtO	H	1Me-4-Ind	C		416 (M^++1)
Int.B-209	f-2	Int.B-28	Al26	2(2ClPh)EtO	H	1Me-6-Ind	C		416 (M^++1)
Int.B-210	f-2	Int.B-30	Al26	2(2ClPh)EtO	H	1Et-5-Idz	C		430 (M^++1)
Int.B-211	f-2	Int.B-31	Al26	2(2ClPh)EtO	H	5-BF	C		403 (M^++1)
Int.B-212	f-2	Int.B-24	Al28	2(1-Nap)EtO	H	2-Nap	C		429 (M^++1)
Int.B-213	f-2	Int.B-25	Al28	2(1-Nap)EtO	H	1Me-5-Ind	C		432 (M^++1)
Int.B-214	f-2	Int.B-29	Al28	2(1-Nap)EtO	H	1Me-5-Idz	C		433 (M^++1)
Int.B-215	f-2	Int.B-30	Al28	2(1-Nap)EtO	H	1Et-5-Idz	C		446 (M^++1)
Int.B-216	f-2	Int.B-33	Al28	2(1-Nap)EtO	H	6-IQ	C		430 (M^++1)
Int.B-217	f-2	Int.B-25	Al30	2(PhS)EtO	H	1Me-5-Ind	C		414 (M^++1)
Int.B-218	f-2	Int.B-28	Al30	2(PhS)EtO	H	1Me-6-Ind	C		414 (M^++1)
Int.B-219	f-2	Int.B-30	Al30	2(PhS)EtO	H	1Et-5-Idz	C		428 (M^++1)
Int.B-220	f-2	Int.B-32	Al30	2(PhS)EtO	H	6-Qu	C		412 (M^++1)

[0292] 実施例B－a－1

2－[5－シクロペンチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸エチル(化合物番号B－a－1)の合成(製造法10工程k－1)

参考例1の中間体A－2の合成法(製造法9工程k－1)に記載の手順に従って中間体B－2(68. 1mg)およびジエチルホスホノ酢酸エチル(1. 5ml、TCI)、水素化ナトリウム(152. 2mg、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号B－a－1;26. 7mg)を得た(但し反応は還流条件下18時間半行った)。

実施例B－a－2

2－[5－シクロペンチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸(化合物番号B－a－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合B－a－1(26. 7mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0. 20ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号B－a－2;22. 5mg)を得た(但し反応は3時間行った)。

[0293] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－B－a－1からTable－B－a－10に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示し

た化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。

[0294] [表50]

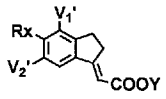


Table-B-a-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-1	10k-1	Int.B-2		cPenO	Et	H	2-Nap	C		413(M^++1)
B-a-2	1-a	B-a-1		cPenO	H	H	2-Nap	C		385(M^++1)
B-a-3	10k-1	Int.B-3		cPenO	Et	H	1Me-5-Ind	C		416(M^++1)
B-a-4	1-a	B-a-3		cPenO	H	H	1Me-5-Ind	C		388(M^++1)
B-a-5	10k-1	Int.B-4		cPenO	Et	H	1Et-5-Ind	C		430(M^++1)
B-a-6	1-a	B-a-5		cPenO	H	H	1Et-5-Ind	C		302(M^++1)
B-a-7	10k-1	Int.B-5		cPenO	Et	H	1Me-4-Ind	C		416(M^++1)
B-a-8	1-a	B-a-7		cPenO	H	H	1Me-4-Ind	C		388(M^++1)
B-a-9	10k-1	Int.B-6		cPenO	Et	H	1Me-6-Ind	C		416(M^++1)
B-a-10	1-a	B-a-9		cPenO	H	H	1Me-6-Ind	C		388(M^++1)
B-a-11	10k-1	Int.B-7		cPenO	Et	H	1Me-5-Idz	C		417M^++1)
B-a-12	1-a	B-a-11		cPenO	H	H	1Me-5-Idz	C		389(M^++1)
B-a-13	10k-1	Int.B-8		cPenO	Et	H	1Et-5-Idz	C		431(M^++1)
B-a-14	1-a	B-a-13		cPenO	H	H	1Et-5-Idz	C		403(M^++1)
B-a-15	10k-1	Int.B-9		cPenO	Et	H	5-BF	C		403(M^++1)
B-a-16	1-a	B-a-15		cPenO	H	H	5-BF	C		375(M^++1)
B-a-17	10k-1	Int.B-10		cPenO	Et	H	6-Qu	C		414(M^++1)
B-a-18	1-a	B-a-17		cPenO	H	H	6-Qu	C		386(M^++1)
B-a-19	10k-1	Int.B-11		cPenO	Et	H	6-IQ	C		414(M^++1)
B-a-20	1-a	B-a-19		cPenO	H	H	6-IQ	C		386(M^++1)
B-a-21	10k-1	Int.B-14		BnO	Et	H	2-Nap	C		435(M^++1)
B-a-22	1-a	B-a-21		BnO	H	H	2-Nap	C		407(M^++1)
B-a-23	10k-1	Int.B-15		BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		438(M^++1)
B-a-24	1-a	B-a-23		BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		410(M^++1)
B-a-25	10k-1	Int.B-16		BnO	Et	H	1Et-5-Ind	C		452(M^++1)
B-a-26	1-a	B-a-25		BnO	H	H	1Et-5-Ind	C		424(M^++1)
B-a-27	10k-1	Int.B-17		BnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		438(M^++1)
B-a-28	1-a	B-a-27		BnO	H	H	1Me-4-Ind	C		410(M^++1)
B-a-29	10k-1	Int.B-18		BnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		438(M^++1)
B-a-30	1-a	B-a-29		BnO	H	H	1Me-6-Ind	C		410(M^++1)
B-a-31	10k-1	Int.B-19		BnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		439(M^++1)
B-a-32	1-a	B-a-31		BnO	H	H	1Me-5-Idz	C		411(M^++1)
B-a-33	10k-1	Int.B-20		BnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		453(M^++1)
B-a-34	1-a	B-a-33		BnO	H	H	1Et-5-Idz	C		425(M^++1)
B-a-35	10k-1	Int.B-21		BnO	Et	H	5-BF	C		425(M^++1)
B-a-36	1-a	B-a-35		BnO	H	H	5-BF	C		397(M^++1)
B-a-37	10k-1	Int.B-22		BnO	Et	H	6-Qu	C		436(M^++1)
B-a-38	1-a	B-a-37		BnO	H	H	6-Qu	C		408(M^++1)
B-a-39	10k-1	Int.B-23		BnO	Et	H	6-IQ	C		436(M^++1)
B-a-40	1-a	B-a-39		BnO	H	H	6-IQ	C		408(M^++1)
B-a-41	10k-1	Int.B-34		cPenMeO	Et	H	2-Nap	C		427(M^++1)
B-a-42	1-a	B-a-41		cPenMeO	H	H	2-Nap	C		399(M^++1)
B-a-43	10k-1	Int.B-35		cPenMeO	Et	H	1Me-5-Ind	C		430(M^++1)
B-a-44	1a	B-a-43		cPenMeO	H	H	1Me-5-Ind	C		402(M^++1)

[0295] [表51]

Table-B-a-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-45	10k-1	Int.B-36		cPenMeO	Et	H	1Me-4-Ind	C		430(M^++1)
B-a-46	1-a	B-a-45		cPenMeO	H	H	1Me-4-Ind	C		402(M^++1)
B-a-47	10k-1	Int.B-37		cPenMeO	Et	H	1Me-5-Idz	C		431(M^++1)
B-a-48	1-a	B-a-47		cPenMeO	H	H	1Me-5-Idz	C		403(M^++1)
B-a-49	10k-1	Int.B-38		cPenMeO	Et	H	1Et-5-Idz	C		445(M^++1)
B-a-50	1-a	B-a-49		cPenMeO	H	H	1Et-5-Idz	C		417(M^++1)
B-a-51	10k-1	Int.B-39		cPenMeO	Et	H	6-Qu	C		428(M^++1)
B-a-52	1-a	B-a-51		cPenMeO	H	H	6-Qu	C		400(M^++1)
B-a-53	10k-1	Int.B-40		cHexMeO	Et	H	2-Nap	C		441(M^++1)
B-a-54	1-a	B-a-53		cHexMeO	H	H	2-Nap	C		413(M^++1)
B-a-55	10k-1	Int.B-41		cHexMeO	Et	H	1Et-5-Ind	C		458M^++1)
B-a-56	1-a	B-a-55		cHexMeO	H	H	1Et-5-Ind	C		430(M^++1)
B-a-57	10k-1	Int.B-42		cHexMeO	Et	H	1Me-6-Ind	C		444(M^++1)
B-a-58	1-a	B-a-57		cHexMeO	H	H	1Me-6-Ind	C		416(M^++1)
B-a-59	10k-1	Int.B-43		cHexMeO	Et	H	1Me-5-Idz	C		445(M^++1)
B-a-60	1-a	B-a-59		cHexMeO	H	H	1Me-5-Idz	C		417(M^++1)
B-a-61	10k-1	Int.B-44		cHexMeO	Et	H	1Et-5-Idz	C		459(M^++1)
B-a-62	1-a	B-a-61		cHexMeO	H	H	1Et-5-Idz	C		431(M^++1)
B-a-63	10k-1	Int.B-45		cHexMeO	Et	H	5-BF	C		431(M^++1)
B-a-64	1-a	B-a-63		cHexMeO	H	H	5-BF	C		403(M^++1)
B-a-65	10k-1	Int.B-46		cHexMeO	Et	H	6-IQ	C		442(M^++1)
B-a-66	1-a	B-a-65		cHexMeO	H	H	6-IQ	C		414(M^++1)
B-a-67	10k-1	Int.B-47		cHexO	Et	H	2-Nap	C		427(M^++1)
B-a-68	1-a	B-a-67		cHexO	H	H	2-Nap	C		399(M^++1)
B-a-69	10k-1	Int.B-48		cHexO	Et	H	1Me-5-Ind	C		430(M^++1)
B-a-70	1-a	B-a-69		cHexO	H	H	1Me-5-Ind	C		402(M^++1)
B-a-71	10k-1	Int.B-49		cHexO	Et	H	1Et-5-Ind	C		444(M^++1)
B-a-72	1-a	B-a-71		cHexO	H	H	1Et-5-Ind	C		416(M^++1)
B-a-73	10k-1	Int.B-50		cHexO	Et	H	1Me-4-Ind	C		430(M^++1)
B-a-74	1-a	B-a-73		cHexO	H	H	1Me-4-Ind	C		402(M^++1)
B-a-75	10k-1	Int.B-51		cHexO	Et	H	1Me-5-Idz	C		431(M^++1)
B-a-76	1-a	B-a-75		cHexO	H	H	1Me-5-Idz	C		403(M^++1)
B-a-77	10k-1	Int.B-52		cHexO	Et	H	1Et-5-Idz	C		445(M^++1)
B-a-78	1-a	B-a-77		cHexO	H	H	1Et-5-Idz	C		417(M^++1)
B-a-79	10k-1	Int.B-53		cHexO	Et	H	6-Qu	C		428(M^++1)
B-a-80	1-a	B-a-79		cHexO	H	H	6-Qu	C		400(M^++1)
B-a-81	10k-1	Int.B-54		cHepO	Et	H	2-Nap	C		441(M^++1)
B-a-82	1-a	B-a-81		cHepO	H	H	2-Nap	C		413(M^++1)
B-a-83	10k-1	Int.B-55		cHepO	Et	H	1Me-5-Ind	C		444(M^++1)
B-a-84	1-a	B-a-83		cHepO	H	H	1Me-5-Ind	C		416(M^++1)
B-a-85	10k-1	Int.B-56		cHepO	Et	H	1Me-5-Idz	C		445(M^++1)
B-a-86	1-a	B-a-85		cHepO	H	H	1Me-5-Idz	C		417(M^++1)
B-a-87	10k-1	Int.B-57		cHepO	Et	H	6-IQ	C		442(M^++1)
B-a-88	1-a	B-a-87		cHepO	H	H	6-IQ	C		414(M^++1)
B-a-89	10k-1	Int.B-58		nPrO	Et	H	1Me-5-Ind	C		390(M^++1)
B-a-90	1-a	B-a-89		nPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		362(M^++1)
B-a-91	10k-1	Int.B-59		nPrO	Et	H	1Et-5-Ind	C		404(M^++1)
B-a-92	1-a	B-a-91		nPrO	H	H	1Et-5-Ind	C		376(M^++1)

[0296] [表52]

Table-B-a-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-93	10k-1	Int.B-60		nPrO	Et	H	1Et-5-Idz	C		405(M^++1)
B-a-94	1-a	B-a-93		nPrO	H	H	1Et-5-Idz	C		377(M^++1)
B-a-95	10k-1	Int.B-61		nPrO	Et	H	6-Qu	C		388(M^++1)
B-a-96	1-a	B-a-95		nPrO	H	H	6-Qu	C		360(M^++1)
B-a-97	10k-1	Int.B-62		iPrO	Et	H	2-Nap	C		387(M^++1)
B-a-98	1-a	B-a-97		iPrO	H	H	2-Nap	C		359(M^++1)
B-a-99	10k-1	Int.B-63		iPrO	Et	H	1Et-5-Ind	C		404(M^++1)
B-a-100	1-a	B-a-99		iPrO	H	H	1Et-5-Ind	C		376(M^++1)
B-a-101	10k-1	Int.B-64		iPrO	Et	H	1Me-5-Idz	C		391(M^++1)
B-a-102	1-a	B-a-101		iPrO	H	H	1Me-5-Idz	C		363(M^++1)
B-a-103	10k-1	Int.B-65		iPrO	Et	H	6-IQ	C		388(M^++1)
B-a-104	1-a	B-a-103		iPrO	H	H	6-IQ	C		360(M^++1)
B-a-105	10k-1	Int.B-66		nBuO	Et	H	2-Nap	C		401(M^++1)
B-a-106	1-a	B-a-105		nBuO	H	H	2-Nap	C		376(M^++1)
B-a-107	10k-1	Int.B-67		nBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		404(M^++1)
B-a-108	1-a	B-a-107		nBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		376(M^++1)
B-a-109	10k-1	Int.B-68		nBuO	Et	H	1Et-5-Idz	C		419(M^++1)
B-a-110	1-a	B-a-109		nBuO	H	H	1Et-5-Idz	C		391(M^++1)
B-a-111	10k-1	Int.B-69		nBuO	Et	H	5-BF	C		391(M^++1)
B-a-112	1-a	B-a-111		nBuO	H	H	5-BF	C		363(M^++1)
B-a-113	10k-1	Int.B-70		iBuO	Et	H	2-Nap	C		401(M^++1)
B-a-114	1-a	B-a-113		iBuO	H	H	2-Nap	C		373(M^++1)
B-a-115	10k-1	Int.B-71		iBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		404(M^++1)
B-a-116	1-a	B-a-115		iBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		376(M^++1)
B-a-117	10k-1	Int.B-72		iBuO	Et	H	1Et-5-Ind	C		418(M^++1)
B-a-118	1-a	B-a-117		iBuO	H	H	1Et-5-Ind	C		390(M^++1)
B-a-119	10k-1	Int.B-73		iBuO	Et	H	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)
B-a-120	1-a	B-a-119		iBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		377(M^++1)
B-a-121	10k-1	Int.B-74		iBuO	Et	H	1Et-5-Idz	C		419(M^++1)
B-a-122	1-a	B-a-121		iBuO	H	H	1Et-5-Idz	C		391(M^++1)
B-a-123	10k-1	Int.B-75		2FBnO	Et	H	2-Nap	C		453(M^++1)
B-a-124	1-a	B-a-123		2FBnO	H	H	2-Nap	C		425(M^++1)
B-a-125	10k-1	Int.B-76		2FBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		456(M^++1)
B-a-126	1-a	B-a-125		2FBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		428(M^++1)
B-a-127	10k-1	Int.B-77		2FBnO	Et	H	1Et-5-Ind	C		470(M^++1)
B-a-128	1-a	B-a-127		2FBnO	H	H	1Et-5-Ind	C		442(M^++1)
B-a-129	10k-1	Int.B-78		2FBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		457(M^++1)
B-a-130	1-a	B-a-129		2FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		429(M^++1)
B-a-131	10k-1	Int.B-79		2FBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		471(M^++1)
B-a-132	1-a	B-a-131		2FBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		443(M^++1)
B-a-133	10k-1	Int.B-80		2FBnO	Et	H	6-Qu	C		454(M^++1)
B-a-134	1-a	B-a-133		2FBnO	H	H	6-Qu	C		426(M^++1)
B-a-135	10k-1	Int.B-81		2FBnO	Et	H	6-IQ	C		454(M^++1)
B-a-136	1-a	B-a-135		2FBnO	H	H	6-IQ	C		426(M^++1)
B-a-137	10k-1	Int.B-82		3FBnO	Et	H	2-Nap	C		453(M^++1)
B-a-138	1-a	B-a-137		3FBnO	H	H	2-Nap	C		425(M^++1)
B-a-139	10k-1	Int.B-83		3FBnO	Et	H	1Et-5-Ind	C		470(M^++1)
B-a-140	1-a	B-a-139		3FBnO	H	H	1Et-5-Ind	C		442(M^++1)

[0297] [表53]

Table-B-a-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-141	10k-1	Int.B-84		3FBnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		456(M^++1)
B-a-142	1-a	B-a-141		3FBnO	H	H	1Me-6-Ind	C		428(M^++1)
B-a-143	10k-1	Int.B-85		3FBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		457(M^++1)
B-a-144	1-a	B-a-143		3FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		429(M^++1)
B-a-145	10k-1	Int.B-86		3FBnO	Et	H	5-BF	C		443(M^++1)
B-a-146	1-a	B-a-145		3FBnO	H	H	5-BF	C		415(M^++1)
B-a-147	10k-1	Int.B-87		3FBnO	Et	H	6-Qu	C		454(M^++1)
B-a-148	1-a	B-a-147		3FBnO	H	H	6-Qu	C		426(M^++1)
B-a-149	10k-1	Int.B-88		4FBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		456(M^++1)
B-a-150	1-a	B-a-149		4FBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		428(M^++1)
B-a-151	10k-1	Int.B-89		4FBnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		456(M^++1)
B-a-152	1-a	B-a-151		4FBnO	H	H	1Me-4-Ind	C		428(M^++1)
B-a-153	10k-1	Int.B-90		4FBnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		456(M^++1)
B-a-154	1-a	B-a-153		4FBnO	H	H	1Me-6-Ind	C		428(M^++1)
B-a-155	10k-1	Int.B-91		4FBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		471(M^++1)
B-a-156	1-a	B-a-155		4FBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		443(M^++1)
B-a-157	10k-1	Int.B-92		4FBnO	Et	H	6-Qu	C		454(M^++1)
B-a-158	1-a	B-a-157		4FBnO	H	H	6-Qu	C		426(M^++1)
B-a-159	10k-1	Int.B-93		2ClBnO	Et	H	2-Nap	C		469(M^++1)
B-a-160	1-a	B-a-159		2ClBnO	H	H	2-Nap	C		441(M^++1)
B-a-161	10k-1	Int.B-94		2ClBnO	Et	H	1Et-5-Ind	C		486(M^++1)
B-a-162	1-a	B-a-161		2ClBnO	H	H	1Et-5-Ind	C		458(M^++1)
B-a-163	10k-1	Int.B-95		2ClBnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		472(M^++1)
B-a-164	1-a	B-a-163		2ClBnO	H	H	1Me-4-Ind	C		444(M^++1)
B-a-165	10k-1	Int.B-96		2ClBnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		472(M^++1)
B-a-166	1-a	B-a-165		2ClBnO	H	H	1Me-6-Ind	C		444(M^++1)
B-a-167	10k-1	Int.B-97		2ClBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		487(M^++1)
B-a-168	1-a	B-a-167		2ClBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		459(M^++1)
B-a-169	10k-1	Int.B-98		3ClBnO	Et	H	2-Nap	C		469(M^++1)
B-a-170	1-a	B-a-169		3ClBnO	H	H	2-Nap	C		441(M^++1)
B-a-171	10k-1	Int.B-99		3ClBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		472(M^++1)
B-a-172	1-a	B-a-171		3ClBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		444(M^++1)
B-a-173	10k-1	Int.B-100		3ClBnO	Et	H	1Et-5-Ind	C		486(M^++1)
B-a-174	1-a	B-a-173		3ClBnO	H	H	1Et-5-Ind	C		458(M^++1)
B-a-175	10k-1	Int.B-101		3ClBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		473(M^++1)
B-a-176	1-a	B-a-175		3ClBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		442(M^++1)
B-a-177	10k-1	Int.B-102		3ClBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		487(M^++1)
B-a-178	1-a	B-a-177		3ClBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		459(M^++1)
B-a-179	10k-1	Int.B-103		3ClBnO	Et	H	5-BF	C		459(M^++1)
B-a-180	1-a	B-a-179		3ClBnO	H	H	5-BF	C		431(M^++1)
B-a-181	10k-1	Int.B-104		3ClBnO	Et	H	6-Qu	C		470(M^++1)
B-a-182	1-a	B-a-181		3ClBnO	H	H	6-Qu	C		442(M^++1)
B-a-183	10k-1	Int.B-105		4MeBnO	Et	H	2-Nap	C		449(M^++1)
B-a-184	1-a	B-a-183		4MeBnO	H	H	2-Nap	C		421(M^++1)
B-a-185	10k-1	Int.B-106		4MeBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
B-a-186	1-a	B-a-185		4MeBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		424(M^++1)
B-a-187	10k-1	Int.B-107		4MeBnO	Et	H	1Et-5-Ind	C		466(M^++1)
B-a-188	1-a	B-a-187		4MeBnO	H	H	1Et-5-Ind	C		438(M^++1)

[0298] [表54]

Table-B-a-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-189	10k-1	Int.B-108		4MeBnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		452(M^++1)
B-a-190	1-a	B-a-189		4MeBnO	H	H	1Me-6-Ind	C		424(M^++1)
B-a-191	10k-1	Int.B-109		4MeBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		453(M^++1)
B-a-192	1-a	B-a-191		4MeBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		425(M^++1)
B-a-193	10k-1	Int.B-110		4MeBnO	Et	H	6-IQ	C		450(M^++1)
B-a-194	1-a	B-a-193		4MeBnO	H	H	6-IQ	C		422(M^++1)
B-a-195	10k-1	Int.B-111		4CF3BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		505(M^++1)
B-a-196	1-a	B-a-195		4CF3BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		477(M^++1)
B-a-197	10k-1	Int.B-112		4CF3BnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		505(M^++1)
B-a-198	1-a	B-a-197		4CF3BnO	H	H	1Me-4-Ind	C		477(M^++1)
B-a-199	10k-1	Int.B-113		4CF3BnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		506(M^++1)
B-a-200	1-a	B-a-199		4CF3BnO	H	H	1Me-5-Idz	C		478(M^++1)
B-a-201	10k-1	Int.B-114		4CF3BnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		520(M^++1)
B-a-202	1-a	B-a-201		4CF3BnO	H	H	1Et-5-Idz	C		492(M^++1)
B-a-203	10k-1	Int.B-115		4CF3BnO	Et	H	6-Qu	C		503(M^++1)
B-a-204	1-a	B-a-203		4CF3BnO	H	H	6-Qu	C		475(M^++1)
B-a-205	10k-1	Int.B-116		2EtBuO	Et	H	2-Nap	C		429(M^++1)
B-a-206	1-a	B-a-205		2EtBuO	H	H	2-Nap	C		401(M^++1)
B-a-207	10k-1	Int.B-117		2EtBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		432(M^++1)
B-a-208	1-a	B-a-207		2EtBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		404(M^++1)
B-a-209	10k-1	Int.B-118		2EtBuO	Et	H	1Et-5-Ind	C		446(M^++1)
B-a-210	1-a	B-a-209		2EtBuO	H	H	1Et-5-Ind	C		418(M^++1)
B-a-211	10k-1	Int.B-119		2EtBuO	Et	H	1Me-5-Idz	C		433(M^++1)
B-a-212	1-a	B-a-211		2EtBuO	H	H	1Me-5-Idz	C		405(M^++1)
B-a-213	10k-1	Int.B-120		2EtBuO	Et	H	1Et-5-Idz	C		447(M^++1)
B-a-214	1-a	B-a-213		2EtBuO	H	H	1Et-5-Idz	C		419(M^++1)
B-a-215	10k-1	Int.B-121		2EtBuO	Et	H	6-Qu	C		430(M^++1)
B-a-216	1-a	B-a-215		2EtBuO	H	H	6-Qu	C		402(M^++1)
B-a-217	10k-1	Int.B-122		2EtBuO	Et	H	6-IQ	C		430(M^++1)
B-a-218	1-a	B-a-217		2EtBuO	H	H	6-IQ	C		402(M^++1)
B-a-219	10k-1	Int.B-123		2(4DMAPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		492(M^++1)
B-a-220	1-a	B-a-219		2(4DMAPh)EtO	H	H	2-Nap	C		464(M^++1)
B-a-221	10k-1	Int.B-124		2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		495(M^++1)
B-a-222	1-a	B-a-221		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		467(M^++1)
B-a-223	10k-1	Int.B-125		2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Me-4-Ind	C		495(M^++1)
B-a-224	1-a	B-a-223		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Me-4-Ind	C		467(M^++1)
B-a-225	10k-1	Int.B-126		2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		510(M^++1)
B-a-226	1-a	B-a-225		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		482(M^++1)
B-a-227	10k-1	Int.B-127		2(4DMAPh)EtO	Et	H	5-BF	C		482(M^++1)
B-a-228	1-a	B-a-227		2(4DMAPh)EtO	H	H	5-BF	C		454(M^++1)
B-a-229	10k-1	Int.B-128		2(4DMAPh)EtO	Et	H	6-Qu	C		193(M^++1)
B-a-230	1-a	B-a-229		2(4DMAPh)EtO	H	H	6-Qu	C		165(M^++1)
B-a-231	10k-1	Int.B-129		2(PhO)EtO	Et	H	1Et-5-Ind	C		482(M^++1)
B-a-232	1-a	B-a-231		2(PhO)EtO	H	H	1Et-5-Ind	C		454(M^++1)
B-a-233	10k-1	Int.B-130		2(PhO)EtO	Et	H	1Me-4-Ind	C		468(M^++1)
B-a-234	1-a	B-a-233		2(PhO)EtO	H	H	1Me-4-Ind	C		440(M^++1)
B-a-235	10k-1	Int.B-131		2(PhO)EtO	Et	H	1Me-6-Ind	C		468(M^++1)
B-a-236	1-a	B-a-235		2(PhO)EtO	H	H	1Me-6-Ind	C		440(M^++1)

[0299] [表55]

Taale-B-a-6

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-237	10k-1	Int.B-132		2(PhO)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		469(M^++1)
B-a-238	1-a	B-a-237		2(PhO)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		441(M^++1)
B-a-239	10k-1	Int.B-133		2(PhO)EtO	Et	H	6-IQ	C		466(M^++1)
B-a-240	1-a	B-a-239		2(PhO)EtO	H	H	6-IQ	C		438(M^++1)
B-a-241	10k-1	Int.B-134		1PhEtO	Et	H	2-Nap	C		449(M^++1)
B-a-242	1-a	B-a-241		1PhEtO	H	H	2-Nap	C		421(M^++1)
B-a-243	10k-1	Int.B-135		1PhEtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		452(M^++1)
B-a-244	1-a	B-a-243		1PhEtO	H	H	1Me-5-Ind	C		424(M^++1)
B-a-245	10k-1	Int.B-136		1PhEtO	Et	H	1Et-5-Ind	C		466(M^++1)
B-a-246	1-a	B-a-245		1PhEtO	H	H	1Et-5-Ind	C		438(M^++1)
B-a-247	10k-1	Int.B-137		1PhEtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		453(M^++1)
B-a-248	1-a	B-a-247		1PhEtO	H	H	1Me-5-Idz	C		425(M^++1)
B-a-249	10k-1	Int.B-138		1PhEtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		467(M^++1)
B-a-250	1-a	B-a-249		1PhEtO	H	H	1Et-5-Idz	C		439(M^++1)
B-a-251	10k-1	Int.B-139		1(2FPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		467(M^++1)
B-a-252	1-a	B-a-251		1(2FPh)EtO	H	H	2-Nap	C		439(M^++1)
B-a-253	10k-1	Int.B-140		1(2FPh)EtO	Et	H	1Et-5-Ind	C		484(M^++1)
B-a-254	1-a	B-a-253		1(2FPh)EtO	H	H	1Et-5-Ind	C		456(M^++1)
B-a-255	10k-1	Int.B-141		1(2FPh)EtO	Et	H	1Me-6-Ind	C		470(M^++1)
B-a-256	1-a	B-a-255		1(2FPh)EtO	H	H	1Me-6-Ind	C		442(M^++1)
B-a-257	10k-1	Int.B-142		1(2FPh)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		471(M^++1)
B-a-258	1-a	B-a-257		1(2FPh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		443(M^++1)
B-a-259	10k-1	Int.B-143		1(2FPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		485(M^++1)
B-a-260	1-a	B-a-259		1(2FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		457(M^++1)
B-a-261	10k-1	Int.B-144		1(2FPh)EtO	Et	H	6-IQ	C		468(M^++1)
B-a-262	1-a	B-a-261		1(2FPh)EtO	H	H	6-IQ	C		440(M^++1)
B-a-263	10k-1	Int.B-145		1(4ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		487(M^++1)
B-a-264	1-a	B-a-263		1(4ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		458(M^++1)
B-a-265	10k-1	Int.B-146		1(4ClPh)EtO	Et	H	1Me-4-Ind	C		487(M^++1)
B-a-266	1-a	B-a-265		1(4ClPh)EtO	H	H	1Me-4-Ind	C		458(M^++1)
B-a-267	10k-1	Int.B-147		1(4ClPh)EtO	Et	H	1Me-6-Ind	C		487(M^++1)
B-a-268	1-a	B-a-267		1(4ClPh)EtO	H	H	1Me-6-Ind	C		458(M^++1)
B-a-269	10k-1	Int.B-148		1(4ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		488(M^++1)
B-a-270	1-a	B-a-269		1(4ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		459(M^++1)
B-a-271	10k-1	Int.B-149		1(4ClPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		502(M^++1)
B-a-272	1-a	B-a-271		1(4ClPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		473(M^++1)
B-a-273	10k-1	Int.B-150		1(4ClPh)EtO	Et	H	5-BF	C		473(M^++1)
B-a-274	1-a	B-a-273		1(4ClPh)EtO	H	H	5-BF	C		445(M^++1)
B-a-275	10k-1	Int.B-151		4Me,cHexO	Et	H	2-Nap	C		441(M^++1)
B-a-276	1-a	B-a-275		4Me,cHexO	H	H	2-Nap	C		413(M^++1)
B-a-277	10k-1	Int.B-152		4Me,cHexO	Et	H	1Me-5-Ind	C		444(M^++1)
B-a-278	1-a	B-a-277		4Me,cHexO	H	H	1Me-5-Ind	C		416(M^++1)
B-a-279	10k-1	Int.B-153		4Me,cHexO	Et	H	1Et-5-Ind	C		458(M^++1)
B-a-280	1-a	B-a-279		4Me,cHexO	H	H	1Et-5-Ind	C		430(M^++1)
B-a-281	10k-1	Int.B-154		4Me,cHexO	Et	H	1Me-5-Idz	C		445(M^++1)
B-a-282	1-a	B-a-281		4Me,cHexO	H	H	1Me-5-Idz	C		417(M^++1)
B-a-283	10k-1	Int.B-155		4Me,cHexO	Et	H	1Et-5-Idz	C		459(M^++1)
B-a-284	1-a	B-a-283		4Me,cHexO	H	H	1Et-5-Idz	C		431(M^++1)

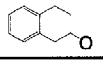
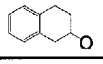
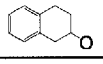
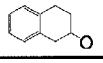
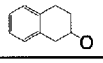
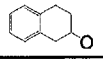
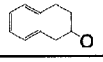
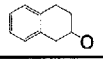
[0300] [表56]

Table-B-a-7

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-285	10k-1	Int.B-156		4Me,cHexO	Et	H	6-Qu	C		442 (M^++1)
B-a-286	1-a	B-a-285		4Me,cHexO	H	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
B-a-287	10k-1	Int.B-157		1IndanO	Et	H	2-Nap	C		461 (M^++1)
B-a-288	1-a	B-a-287		1IndanO	H	H	2-Nap	C		433 (M^++1)
B-a-289	10k-1	Int.B-158		1IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		464 (M^++1)
B-a-290	1-a	B-a-289		1IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		436 (M^++1)
B-a-291	10k-1	Int.B-159		1IndanO	Et	H	1Me-4-Ind	C		464 (M^++1)
B-a-292	1-a	B-a-291		1IndanO	H	H	1Me-4-Ind	C		436 (M^++1)
B-a-293	10k-1	Int.B-160		1IndanO	Et	H	1Me-6-Ind	C		464 (M^++1)
B-a-294	1-a	B-a-293		1IndanO	H	H	1Me-6-Ind	C		436 (M^++1)
B-a-295	10k-1	Int.B-161		1IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		465 (M^++1)
B-a-296	1-a	B-a-295		1IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		437 (M^++1)
B-a-297	10k-1	Int.B-162		1IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		479 (M^++1)
B-a-298	1-a	B-a-297		1IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		451 (M^++1)
B-a-299	10k-1	Int.B-163		1IndanO	Et	H	5-BF	C		451 (M^++1)
B-a-300	1-a	B-a-299		1IndanO	H	H	5-BF	C		423 (M^++1)
B-a-301	10k-1	Int.B-164		1IndanO	Et	H	6-Qu	C		462 (M^++1)
B-a-302	1-a	B-a-301		1IndanO	H	H	6-Qu	C		434 (M^++1)
B-a-303	10k-1	Int.B-165		2IndanO	Et	H	2-Nap	C		461 (M^++1)
B-a-304	1-a	B-a-303		2IndanO	H	H	2-Nap	C		433 (M^++1)
B-a-305	10k-1	Int.B-166		2IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		464 (M^++1)
B-a-306	1-a	B-a-305		2IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		436 (M^++1)
B-a-307	10k-1	Int.B-167		2IndanO	Et	H	1Et-5-Ind	C		478 (M^++1)
B-a-308	1-a	B-a-307		2IndanO	H	H	1Et-5-Ind	C		450 (M^++1)
B-a-309	10k-1	Int.B-168		2IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		465 (M^++1)
B-a-310	1-a	B-a-309		2IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		437 (M^++1)
B-a-311	10k-1	Int.B-169		2IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		479 (M^++1)
B-a-312	1-a	B-a-311		2IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		451 (M^++1)
B-a-313	10k-1	Int.B-170		2IndanO	Et	H	6-IQ	C		462 (M^++1)
B-a-314	1-a	B-a-313		2IndanO	H	H	6-IQ	C		434 (M^++1)
B-a-315	10k-1	Int.B-171		5OMe-2-IndanO	Et	H	2-Nap	C		491 (M^++1)
B-a-316	1-a	B-a-315		5OMe-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
B-a-317	10k-1	Int.B-172		5OMe-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Ind	C		508 (M^++1)
B-a-318	1-a	B-a-317		5OMe-2-IndanO	H	H	1Et-5-Ind	C		480 (M^++1)
B-a-319	10k-1	Int.B-173		5OMe-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		495 (M^++1)
B-a-320	1-a	B-a-319		5OMe-2-IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
B-a-321	10k-1	Int.B-174		5OMe-2-IndanO	Et	H	6-Qu	C		492 (M^++1)
B-a-322	1-a	B-a-321		5OMe-2-IndanO	H	H	6-Qu	C		464 (M^++1)
B-a-323	10k-1	Int.B-175		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		524 (M^++1)
B-a-324	1-a	B-a-323		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		496 (M^++1)
B-a-325	10k-1	Int.B-176		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	H	1Me-4-Ind	C		524 (M^++1)
B-a-326	1-a	B-a-325		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	1Me-4-Ind	C		496 (M^++1)
B-a-327	10k-1	Int.B-177		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	H	1Me-6-Ind	C		524 (M^++1)
B-a-328	1-a	B-a-327		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	1Me-6-Ind	C		496 (M^++1)
B-a-329	10k-1	Int.B-178		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		525 (M^++1)
B-a-330	1-a	B-a-329		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		497 (M^++1)
B-a-331	10k-1	Int.B-179		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	H	6-IQ	C		522 (M^++1)
B-a-332	1-a	B-a-331		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	6-IQ	C		494 (M^++1)

[0301] [表57]

Table-B-a-8

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-333	10k-1	Int.B-180		5F-2-IndanO	Et	H	2-Nap	C		479 (M^++1)
B-a-334	1-a	B-a-333		5F-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
B-a-335	10k-1	Int.B-181		5F-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
B-a-336	1-a	B-a-335		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
B-a-337	10k-1	Int.B-182		5F-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Ind	C		496 (M^++1)
B-a-338	1-a	B-a-337		5F-2-IndanO	H	H	1Et-5-Ind	C		468 (M^++1)
B-a-339	10k-1	Int.B-183		5F-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		483 (M^++1)
B-a-340	1-a	B-a-339		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
B-a-341	10k-1	Int.B-184		5F-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		497 (M^++1)
B-a-342	1-a	B-a-341		5F-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		469 (M^++1)
B-a-343	10k-1	Int.B-185		5F-2-IndanO	Et	H	6-Qu	C		480 (M^++1)
B-a-344	1-a	B-a-343		5F-2-IndanO	H	H	6-Qu	C		452 (M^++1)
B-a-345	10k-1	Int.B-186		5F-2-IndanO	Et	H	6-IQ	C		480 (M^++1)
B-a-346	1-a	B-a-345		5F-2-IndanO	H	H	6-IQ	C		452 (M^++1)
B-a-347	10k-1	Int.B-187			Et	H	2-Nap	C		475 (M^++1)
B-a-348	1-a	B-a-347			H	H	2-Nap	C		447 (M^++1)
B-a-349	10k-1	Int.B-188			Et	H	1Me-5-Ind	C		478 (M^++1)
B-a-350	1-a	B-a-349			H	H	1Me-5-Ind	C		450 (M^++1)
B-a-351	10k-1	Int.B-189			Et	H	1Me-6-Ind	C		478 (M^++1)
B-a-352	1-a	B-a-351			H	H	1Me-6-Ind	C		450 (M^++1)
B-a-353	10k-1	Int.B-190			Et	H	1Me-5-Idz	C		479 (M^++1)
B-a-354	1-a	B-a-353			H	H	1Me-5-Idz	C		451 (M^++1)
B-a-355	10k-1	Int.B-191			Et	H	6-Qu	C		476 (M^++1)
B-a-356	1-a	B-a-355			H	H	6-Qu	C		448 (M^++1)
B-a-357	10k-1	Int.B-192			Et	H	1Me-5-Ind	C		478 (M^++1)
B-a-358	1-a	B-a-357			H	H	1Me-5-Ind	C		450 (M^++1)
B-a-359	10k-1	Int.B-193			Et	H	1Et-5-Ind	C		492 (M^++1)
B-a-360	1-a	B-a-359			H	H	1Et-5-Ind	C		464 (M^++1)
B-a-361	10k-1	Int.B-194			Et	H	1Me-4-Ind	C		478 (M^++1)
B-a-362	1-a	B-a-361			H	H	1Me-4-Ind	C		450 (M^++1)
B-a-363	10k-1	Int.B-195			Et	H	1Et-5-Idz	C		465 (M^++1)

[0302] [表58]

Table-B-a-9

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-364	1-a	B-a-363			H	H	1Et-5-Idz	C		465 (M^++1)
B-a-365	10k-1	Int.B-196			Et	H	5-BF	C		465 (M^++1)
B-a-366	1-a	B-a-365			H	H	5-BF	C		437 (M^++1)
B-a-367	10k-1	Int.B-197		2(2MePh)EtO	Et	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
B-a-368	1-a	B-a-367		2(2MePh)EtO	H	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
B-a-369	10k-1	Int.B-198		2(2MePh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
B-a-370	1-a	B-a-369		2(2MePh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
B-a-371	10k-1	Int.B-199		2(2MePh)EtO	Et	H	1Et-5-Ind	C		480 (M^++1)
B-a-372	1-a	B-a-371		2(2MePh)EtO	H	H	1Et-5-Ind	C		452 (M^++1)
B-a-373	10k-1	Int.B-200		2(2MePh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		481 (M^++1)
B-a-374	1-a	B-a-373		2(2MePh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		453 (M^++1)
B-a-375	10k-1	Int.B-201		2(2MePh)EtO	Et	H	6-Qu	C		464 (M^++1)
B-a-376	1-a	B-a-375		2(2MePh)EtO	H	H	6-Qu	C		436 (M^++1)
B-a-377	10k-1	Int.B-202		2(3FPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		467 (M^++1)
B-a-378	1-a	B-a-377		2(3FPh)EtO	H	H	2-Nap	C		439 (M^++1)
B-a-379	10k-1	Int.B-203		2(3FPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		470 (M^++1)
B-a-380	1-a	B-a-379		2(3FPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		442 (M^++1)
B-a-381	10k-1	Int.B-204		2(3FPh)EtO	Et	H	1Me-4-Ind	C		470 (M^++1)
B-a-382	1-a	B-a-381		2(3FPh)EtO	H	H	1Me-4-Ind	C		442 (M^++1)
B-a-383	10k-1	Int.B-205		2(3FPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		485 (M^++1)
B-a-384	1-a	B-a-383		2(3FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		457 (M^++1)
B-a-385	10k-1	Int.B-206		2(3FPh)EtO	Et	H	6-IQ	C		468 (M^++1)
B-a-386	1-a	B-a-385		2(3FPh)EtO	H	H	6-IQ	C		440 (M^++1)
B-a-387	10k-1	Int.B-207		2(2ClPh)EtO	Et	H	1Et-5-Ind	C		501 (M^++1)
B-a-388	1-a	B-a-387		2(2ClPh)EtO	H	H	1Et-5-Ind	C		473 (M^++1)
B-a-389	10k-1	Int.B-208		2(2ClPh)EtO	Et	H	1Me-4-Ind	C		487 (M^++1)
B-a-390	1-a	B-a-389		2(2ClPh)EtO	H	H	1Me-4-Ind	C		458 (M^++1)
B-a-391	10k-1	Int.B-209		2(2ClPh)EtO	Et	H	1Me-6-Ind	C		487 (M^++1)
B-a-392	1-a	B-a-391		2(2ClPh)EtO	H	H	1Me-6-Ind	C		458 (M^++1)
B-a-393	10k-1	Int.B-210		2(2ClPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		502 (M^++1)
B-a-394	1-a	B-a-393		2(2ClPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		473 (M^++1)
B-a-395	10k-1	Int.B-211		2(2ClPh)EtO	Et	H	5-BF	C		473 (M^++1)
B-a-396	1-a	B-a-395		2(2ClPh)EtO	H	H	5-BF	C		445 (M^++1)

[0303] [表59]

Table-B-a-10

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-a-397	10k-1	Int.B-212		2(1-Nap)EtO	Et	H	2-Nap	C		499 (M^++1)
B-a-398	1-a	B-a-397		2(1-Nap)EtO	H	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
B-a-399	10k-1	Int.B-213		2(1-Nap)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		502 (M^++1)
B-a-400	1-a	B-a-399		2(1-Nap)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
B-a-401	10k-1	Int.B-214		2(1-Nap)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		503 (M^++1)
B-a-402	1-a	B-a-401		2(1-Nap)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
B-a-403	10k-1	Int.B-215		2(1-Nap)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		517 (M^++1)
B-a-404	1-a	B-a-403		2(1-Nap)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		489 (M^++1)
B-a-405	10k-1	Int.B-216		2(1-Nap)EtO	Et	H	6-IQ	C		500 (M^++1)
B-a-406	1-a	B-a-405		2(1-Nap)EtO	H	H	6-IQ	C		472 (M^++1)
B-a-407	10k-1	Int.B-217		2(PhS)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		484 (M^++1)
B-a-408	1-a	B-a-407		2(PhS)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		456 (M^++1)
B-a-409	10k-1	Int.B-218		2(PhS)EtO	Et	H	1Me-6-Ind	C		484 (M^++1)
B-a-410	1-a	B-a-409		2(PhS)EtO	H	H	1Me-6-Ind	C		456 (M^++1)
B-a-411	10k-1	Int.B-219		2(PhS)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		499 (M^++1)
B-a-412	1-a	B-a-411		2(PhS)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		471 (M^++1)
B-a-413	10k-1	Int.B-220		2(PhS)EtO	Et	H	6-Qu	C		482 (M^++1)
B-a-414	1-a	B-a-413		2(PhS)EtO	H	H	6-Qu	C		454 (M^++1)

[0304] 参考例10

4－ブロモ－5－シクロペンチルオキシ－2，3－ジヒドロインダン－1－オン（中間体B－221）の合成（製造法13工程h）

参考例1の中間体A－4の合成法（製造法8工程h）に記載の手順に従って、中間体A－1（1．19g）およびNBS（1．08g、WAKO）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体B－221；774．5mg）を得た（但し反応は室温にて1時間行った）。

Mass（LCMS）：295（M^+）、保持時間；4．98分（溶出条件：B）。

5－シクロペンチルオキシ－4－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－オン（中間体B－222）の合成（製造法11工程e－1）

実施例化合物A－a－1の合成法（製造法4工程e－1）に記載の手順に従って、中間体B－221（770．1mg）、2－ナフタレンボロン酸（476．2mg、TCI）、2M炭酸ナトリウム水溶液（1．9ml）および$(Ph_3P)_4Pd$（287．5mg、ナカライテスク社製）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体B－222；811．2mg）を得た（但し反応は12時間行った）。

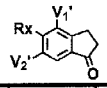
[0305] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．B－7に示す。

化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。

なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。

[0306] [表60]

Table-Int.B-7



Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-223	11e-1	Int.B-221	BRA3	cPenO	1Me-5-Ind	H	C		346 (M^++1)
Int.B-224	11e-1	Int.B-221	BRA4	cPenO	1Et-5-Ind	H	C		360 (M^++1)
Int.B-225	11e-1	Int.B-221	BRA5	cPenO	1Me-4-Ind	H	C		346 (M^++1)
Int.B-226	11e-1	Int.B-221	BRA6	cPenO	1Me-6-Ind	H	C		346 (M^++1)
Int.B-227	11e-1	Int.B-221	BRA8	cPenO	1Me-5-Idz	H	C		347 (M^++1)
Int.B-228	11e-1	Int.B-221	BRA9	cPenO	1Et-5-Idz	H	C		361 (M^++1)
Int.B-229	11e-1	Int.B-221	BRA11	cPenO	2-BF	H	C		333 (M^++1)
Int.B-230	11e-1	Int.B-221	BRA13	cPenO	6-Qu	H	C		344 (M^++1)
Int.B-231	11e-2	Int.B-221	Het3	cPenO	6-IQ	H	C		344 (M^++1)
Int.B-233	11e-1	Int.B-232	BRA1	BnO	2-Nap	H	C		365(M^++1)
Int.B-234	11e-1	Int.B-232	BRA3	BnO	1Me-5-Ind	H	C		368 (M^++1)
Int.B-235	11e-1	Int.B-232	BRA4	BnO	1Et-5-Ind	H	C		382(M^++1)
Int.B-236	11e-1	Int.B-232	BRA5	BnO	1Me-4-Ind	H	C		368 (M^++1)
Int.B-237	11e-1	Int.B-232	BRA6	BnO	1Me-6-Ind	H	C		368 (M^++1)
Int.B-238	11e-1	Int.B-232	BRA8	BnO	1Me-5-Idz	H	C		369 (M^++1)
Int.B-239	11e-1	Int.B-232	BRA9	BnO	1Et-5-Idz	H	C		383 (M^++1)
Int.B-240	11e-1	Int.B-232	BRA11	BnO	2-BF	H	C		355(M^++1)
Int.B-241	11e-1	Int.B-232	BRA13	BnO	6-Qu	H	C		366 (M^++1)
Int.B-242	11e-2	Int.B-232	Het3	BnO	6-IQ	H	C		366 (M^++1)

[0307] 参考例11

5－ベンジルオキシ－4－ブロモ－2，3－ジヒドロインダン－1－オン(中間体B－232)の合成(製造法13工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って、中間体B－12(4．10g)およびNBS(3．22g、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体B－232；2．17g)を得た(但し反応は室温にて15時間行った)。

Mass(LCMS)：317(M^+)、保持時間；4．89分(溶出条件：B)。

5－ベンジルオキシ－4－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロインデン－1－オン(中間体B－233)の合成(製造法11工程e－1)

実施例化合物A－a－1の合成法(製造法4工程e－1)に記載の手順に従って中間体B－232(2．16g)、2－ナフタレンボロン酸(2．34g、TCI)、2M炭酸ナトリウム水溶液(6．5ml)および$(Ph_3P)_4Pd$(821．3mg、ナカライテスク社製)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体B－233；2．76g)を得た(但し反応は12時間行っ

た)。Mass(LCMS):365(M^++1)、保持時間;N. D(溶出条件:C)。

[0308] 5－ヒドロキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロインデン－1－オン(中間体B－243)の合成

実施例A－a－107の中間体A－22の合成法に記載の手順に従って、中間体B－233(2. 76g)、10%水酸化パラジウム(1. 43g、NEケムキャット社製)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体B－243;1. 98g)を得た(但し反応は12時間行った)。Mass(LCMS):275(M^++1)、保持時間;N. D(溶出条件:C)。

5－シクロペンチルメチルオキシ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロインデン－1－オン(中間体B－253)の合成 (製造法4工程f－2)

参考例1の中間体A－1の合成法(製造法4工程f－2)に記載の手順に従って、中間体B－243(1. 03g)、シクロペンタンメタノール(202. 3ul、Ald)、ジターシャリーブチルアゾジカルボキシレート(297. 3mg、Ald)、トリフェニルホスフィン(276. 2mg、WAKO)、を反応させ処理することにより標記化合物(中間体B－253;1. 14g)を得た(但し反応は12時間行った)。Mass(LCMS):357(M^++1)、保持時間;N. D(溶出条件:C)。

[0309] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int. B－8からTable－Int. B－11に示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。なお、「Syn」の欄が空欄の場合には、Pd／C、水素を用いた脱保護反応を行った。

[0310] [表61]

Table-Int.B-8

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-243		Int.B-233		HO	2-Nap	H	C		275 (M^++1)
Int.B-244		Int.B-234		HO	1Me-5-Ind	H	C		278(M^++1)
Int.B-245		Int.B-235		HO	1Et-5-Ind	H	C		292 (M^++1)
Int.B-246		Int.B-236		HO	1Me-4-Ind	H	C		278 (M^++1)
Int.B-247		Int.B-237		HO	1Me-6-Ind	H	C		278 (M^++1)
Int.B-248		Int.B-238		HO	1Me-5-Idz	H	C		279 (M^++1)
Int.B-249		Int.B-239		HO	1Et-5-Idz	H	C		293 (M^++1)
Int.B-250		Int.B-240		HO	5-BF	H	C		265 (M^++1)
Int.B-251		Int.B-241		HO	6-Qu	H	C		276 (M^++1)
Int.B-252		Int.B-242		HO	6-IQ	H	C		276 (M^++1)
Int.B-253	f-2	Int.B-243	Al2	cPenMeO	2-Nap	H	C		357 (M^++1)
Int.B-254	f-2	Int.B-244	Al2	cPenMeO	1Me-5-Ind	H	C		360 (M^++1)
Int.B-255	f-2	Int.B-247	Al2	cPenMeO	1Me-6-Ind	H	C		360 (M^++1)
Int.B-256	f-2	Int.B-248	Al2	cPenMeO	1Me-5-Idz	H	C		361 (M^++1)
Int.B-257	f-2	Int.B-249	Al2	cPenMeO	1Et-5-Idz	H	C		375(M^++1)
Int.B-258	f-2	Int.B-251	Al2	cPenMeO	6-Qu	H	C		358 (M^++1)
Int.B-259	f-1	Int.B-243	Hal2	cHexMeO	2-Nap	H	C		371 (M^++1)
Int.B-260	f-1	Int.B-245	Hal2	cHexMeO	1Et-5-Ind	H	C		388 (M^++1)
Int.B-261	f-1	Int.B-246	Hal2	cHexMeO	1Me-4-Ind	H	C		374 (M^++1)
Int.B-262	f-1	Int.B-248	Hal2	cHexMeO	1Me-5-Idz	H	C		375 (M^++1)
Int.B-263	f-1	Int.B-249	Hal2	cHexMeO	1Et-5-Idz	H	C		389 (M^++1)
Int.B-264	f-1	Int.B-250	Hal2	cHexMeO	5-BF	H	C		361 (M^++1)
Int.B-265	f-1	Int.B-252	Hal2	cHexMeO	6-IQ	H	C		372 (M^++1)
Int.B-266	f-2	Int.B-243	Al3	cHexO	2-Nap	H	C		357 (M^++1)
Int.B-267	f-2	Int.B-244	Al3	cHexO	1Me-5-Ind	H	C		360 (M^++1)
Int.B-268	f-2	Int.B-245	Al3	cHexO	1Et-5-Ind	H	C		374 (M^++1)
Int.B-269	f-2	Int.B-246	Al3	cHexO	1Me-4-Ind	H	C		360 (M^++1)
Int.B-270	f-2	Int.B-248	Al3	cHexO	1Me-5-Idz	H	C		361 (M^++1)
Int.B-271	f-2	Int.B-249	Al3	cHexO	1Et-5-Idz	H	C		375 (M^++1)
Int.B-272	f-2	Int.B-251	Al3	cHexO	6-Qu	H	C		358 (M^++1)
Int.B-273	f-2	Int.B-243	Al4	cHepO	2-Nap	H	C		371 (M^++1)
Int.B-274	f-2	Int.B-244	Al4	cHepO	1Me-5-Ind	H	C		374 (M^++1)
Int.B-275	f-2	Int.B-249	Al4	cHepO	1Et-5-Idz	H	C		389 (M^++1)
Int.B-276	f-2	Int.B-252	Al4	cHepO	6-IQ	H	C		372 (M^++1)
Int.B-277	f-1	Int.B-245	Hal3	nPrO	1Et-5-Ind	H	C		334 (M^++1)
Int.B-278	f-1	Int.B-246	Hal3	nPrO	1Me-4-Ind	H	C		320 (M^++1)
Int.B-279	f-1	Int.B-249	Hal3	nPrO	1Et-5-Idz	H	C		335 (M^++1)
Int.B-280	f-1	Int.B-251	Hal3	nPrO	6-Qu	H	C		318(M^++1)
Int.B-281	f-1	Int.B-243	Hal4	iPrO	2-Nap	H	C		317 (M^++1)
Int.B-282	f-1	Int.B-245	Hal4	iPrO	1Et-5-Ind	H	C		334 (M^++1)
Int.B-283	f-1	Int.B-248	Hal4	iPrO	1Me-5-Idz	H	C		321 (M^++1)
Int.B-284	f-1	Int.B-252	Hal4	iPrO	6-IQ	H	C		318 (M^++1)
Int.B-285	f-1	Int.B-243	Hal5	nBuO	2-Nap	H	C		331 (M^++1)
Int.B-286	f-1	Int.B-244	Hal5	nBuO	1Me-5-Ind	H	C		334 (M^++1)
Int.B-287	f-1	Int.B-245	Hal5	nBuO	1Et-5-Ind	H	C		348 (M^+)
Int.B-288	f-1	Int.B-244	Hal6	iBuO	1Me-5-Ind	H	C		334 (M^++1)

[0311] [表62]

Table-Int.B-9

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-289	f-1	Int.B-245	Hal6	iBuO	1Et-5-Ind	H	C		348 (M^++1)
Int.B-290	f-1	Int.B-248	Hal6	iBuO	1Me-5-Idz	H	C		335 (M^++1)
Int.B-291	f-1	Int.B-249	Hal6	iBuO	1Et-5-Idz	H	C		349 (M^++1)
Int.B-292	f-1	Int.B-243	Hal7	2FBnO	2-Nap	H	C		383 (M^++1)
Int.B-293	f-1	Int.B-246	Hal7	2FBnO	1Me-4-Ind	H	C		386 (M^++1)
Int.B-294	f-1	Int.B-247	Hal7	2FBnO	1Me-6-Ind	H	C		386 (M^++1)
Int.B-295	f-1	Int.B-248	Hal7	2FBnO	1Me-5-Idz	H	C		387(M^++1)
Int.B-296	f-1	Int.B-251	Hal7	2FBnO	6-Qu	H	C		384 (M^++1)
Int.B-297	f-1	Int.B-244	Hal8	3FBnO	1Me-5-Ind	H	C		386 (M^++1)
Int.B-298	f-1	Int.B-245	Hal8	3FBnO	1Et-5-Ind	H	C		400 (M^++1)
Int.B-299	f-1	Int.B-247	Hal8	3FBnO	1Me-6-Ind	H	C		386 (M^++1)
Int.B-300	f-1	Int.B-250	Hal8	3FBnO	5-BF	H	C		373 (M^++1)
Int.B-301	f-1	Int.B-243	Hal9	4FBnO	2-Nap	H	C		383 (M^++1)
Int.B-302	f-1	Int.B-246	Hal9	4FBnO	1Me-4-Ind	H	C		386 (M^++1)
Int.B-303	f-1	Int.B-247	Hal9	4FBnO	1Me-6-Ind	H	C		386 (M^++1)
Int.B-304	f-1	Int.B-251	Hal9	4FBnO	6-Qu	H	C		384 (M^++1)
Int.B-305	f-1	Int.B-243	Hal10	2ClBnO	2-Nap	H	C		399(M^++1)
Int.B-306	f-1	Int.B-245	Hal10	2ClBnO	1Et-5-Ind	H	C		416 (M^++1)
Int.B-307	f-1	Int.B-248	Hal10	2ClBnO	1Me-5-Idz	H	C		403 (M^++1)
Int.B-308	f-1	Int.B-249	Hal10	2ClBnO	1Et-5-Idz	H	C		417 (M^++1)
Int.B-309	f-1	Int.B-244	Hal11	3ClBnO	1Me-5-Ind	H	C		402 (M^++1)
Int.B-310	f-1	Int.B-247	Hal11	3ClBnO	1Me-6-Ind	H	C		402 (M^++1)
Int.B-311	f-1	Int.B-249	Hal11	3ClBnO	1Et-5-Idz	H	C		417 (M^++1)
Int.B-312	f-1	Int.B-252	Hal11	3ClBnO	6-IQ	H	C		400 (M^++1)
Int.B-313	f-1	Int.B-243	Hal12	4MeBnO	2-Nap	H	C		379 (M^++1)
Int.B-314	f-1	Int.B-245	Hal12	4MeBnO	1Et-5-Ind	H	C		396 (M^++1)
Int.B-315	f-1	Int.B-248	Hal12	4MeBnO	1Me-5-Idz	H	C		383 (M^++1)
Int.B-316	f-1	Int.B-251	Hal12	4MeBnO	6-Qu	H	C		380 (M^++1)
Int.B-317	f-1	Int.B-244	Hal13	4CF3BnO	1Me-5-Ind	H	C		435 (M^++1)
Int.B-318	f-1	Int.B-246	Hal13	4CF3BnO	1Me-4-Ind	H	C		435 (M^++1)
Int.B-319	f-1	Int.B-249	Hal13	4CF3BnO	1Et-5-Idz	H	C		450 (M^++1)
Int.B-320	f-1	Int.B-251	Hal13	4CF3BnO	6-Qu	H	C		433 (M^++1)
Int.B-321	f-2	Int.B-243	Al5	2EtBuO	2-Nap	H	C		359 (M^++1)
Int.B-322	f-2	Int.B-244	Al5	2EtBuO	1Me-5-Ind	H	C		362 (M^++1)
Int.B-323	f-2	Int.B-245	Al5	2EtBuO	1Et-5-Ind	H	C		376 (M^++1)
Int.B-324	f-2	Int.B-248	Al5	2EtBuO	1Me-5-Idz	H	C		363 (M^++1)
Int.B-325	f-2	Int.B-252	Al5	2EtBuO	6-IQ	H	C		360 (M^++1)
Int.B-326	f-2	Int.B-243	Al6	2(4DMAPh)EtO	2-Nap	H	C		422 (M^++1)
Int.B-327	f-2	Int.B-244	Al6	2(4DMAPh)EtO	1Me-5-Ind	H	C		425 (M^++1)
Int.B-328	f-2	Int.B-246	Al6	2(4DMAPh)EtO	1Me-4-Ind	H	C		425 (M^++1)
Int.B-329	f-2	Int.B-249	Al6	2(4DMAPh)EtO	1Et-5-Idz	H	C		440 (M^++1)
Int.B-330	f-2	Int.B-246	Al7	2(PhO)EtO	1Me-4-Ind	H	C		398 (M^++1)
Int.B-331	f-2	Int.B-247	Al7	2(PhO)EtO	1Me-6-Ind	H	C		398 (M^++1)
Int.B-332	f-2	Int.B-248	Al7	2(PhO)EtO	1Me-5-Idz	H	C		399 (M^++1)
Int.B-333	f-2	Int.B-251	Al7	2(PhO)EtO	6-Qu	H	C		306 (M^++1)
Int.B-334	f-2	Int.B-243	Al8	1PhEtO	2-Nap	H	C		379 (M^++1)

[0312] [表63]

Table-Int.B-10

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-335	f-2	Int.B-245	AI8	1PhEtO	1Et-5-Ind	H	C		396 (M^++1)
Int.B-336	f-2	Int.B-246	AI8	1PhEtO	1Me-4-Ind	H	C		382 (M^++1)
Int.B-337	f-2	Int.B-248	AI8	1PhEtO	1Me-5-Idz	H	C		383 (M^++1)
Int.B-338	f-2	Int.B-249	AI8	1PhEtO	1Et-5-Idz	H	C		397 (M^++1)
Int.B-339	f-2	Int.B-243	AI9	1(2FPh)EtO	2-Nap	H	C		397 (M^++1)
Int.B-340	f-2	Int.B-245	AI9	1(2FPh)EtO	1Et-5-Ind	H	C		414 (M^++1)
Int.B-341	f-2	Int.B-248	AI9	1(2FPh)EtO	1Me-5-Idz	H	C		401 (M^++1)
Int.B-342	f-2	Int.B-252	AI9	1(2FPh)EtO	6-IQ	H	C		398 (M^++1)
Int.B-343	f-2	Int.B-244	AI10	1(4ClPh)EtO	1Me-5-Ind	H	C		416 (M^++1)
Int.B-344	f-2	Int.B-246	AI10	1(4ClPh)EtO	1Me-4-Ind	H	C		416 (M^++1)
Int.B-345	f-2	Int.B-247	AI10	1(4ClPh)EtO	1Me-6-Ind	H	C		416 (M^++1)
Int.B-346	f-2	Int.B-249	AI10	1(4ClPh)EtO	1Et-5-Idz	H	C		431 (M^++1)
Int.B-347	f-2	Int.B-243	AI11	4Me,cHexO	2-Nap	H	C		371 (M^++1)
Int.B-348	f-2	Int.B-245	AI11	4Me,cHexO	1Et-5-Ind	H	C		388 (M^++1)
Int.B-349	f-2	Int.B-248	AI11	4Me,cHexO	1Me-5-Idz	H	C		375 (M^++1)
Int.B-350	f-2	Int.B-250	AI11	4Me,cHexO	5-BF	H	C		361 (M^++1)
Int.B-351	f-2	Int.B-243	AI17	1IndanO	2-Nap	H	C		391 (M^++1)
Int.B-352	f-2	Int.B-244	AI17	1IndanO	1Me-5-Ind	H	C		394 (M^++1)
Int.B-353	f-2	Int.B-246	AI17	1IndanO	1Me-4-Ind	H	C		394 (M^++1)
Int.B-354	f-2	Int.B-248	AI17	1IndanO	1Me-5-Idz	H	C		395 (M^++1)
Int.B-355	f-2	Int.B-251	AI17	1IndanO	6-Qu	H	C		392 (M^++1)
Int.B-356	f-2	Int.B-243	AI18	2IndanO	2-Nap	H	C		391 (M^++1)
Int.B-357	f-2	Int.B-244	AI18	2IndanO	1Me-5-Ind	H	C		394 (M^++1)
Int.B-358	f-2	Int.B-245	AI18	2IndanO	1Et-5-Ind	H	C		408 (M^++1)
Int.B-359	f-2	Int.B-248	AI18	2IndanO	1Me-5-Idz	H	C		395 (M^++1)
Int.B-360	f-2	Int.B-249	AI18	2IndanO	1Et-5-Idz	H	C		409 (M^++1)
Int.B-361	f-2	Int.B-252	AI18	2IndanO	6-IQ	H	C		392 (M^++1)
Int.B-362	f-2	Int.B-243	AI19	5OMe-2-IndanO	2-Nap	H	C		421 (M^++1)
Int.B-363	f-2	Int.B-245	AI19	5OMe-2-IndanO	1Et-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
Int.B-364	f-2	Int.B-248	AI19	5OMe-2-IndanO	1Me-5-Idz	H	C		425 (M^++1)
Int.B-365	f-2	Int.B-251	AI19	5OMe-2-IndanO	6-Qu	H	C		422 (M^++1)
Int.B-366	f-2	Int.B-244	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	1Me-5-Ind	H	C		454 (M^++1)
Int.B-367	f-2	Int.B-246	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	1Me-4-Ind	H	C		454 (M^++1)
Int.B-368	f-2	Int.B-249	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	1Et-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
Int.B-369	f-2	Int.B-252	AI20	5,6D(OMe)-2-IndanO	6-IQ	H	C		452 (M^++1)
Int.B-370	f-2	Int.B-243	AI21	5F-2-IndanO	2-Nap	H	C		409 (M^++1)
Int.B-371	f-2	Int.B-244	AI21	5F-2-IndanO	1Me-5-Ind	H	C		412 (M^++1)
Int.B-372	f-2	Int.B-248	AI21	5F-2-IndanO	1Me-5-Idz	H	C		413 (M^++1)
Int.B-373	f-2	Int.B-249	AI21	5F-2-IndanO	1Et-5-Idz	H	C		427 (M^++1)
Int.B-374	f-2	Int.B-243	AI22		2-Nap	H	C		405 (M^++1)
Int.B-375	f-2	Int.B-244	AI22		1Me-5-Ind	H	C		408 (M^++1)
Int.B-376	f-2	Int.B-247	AI22		1Me-6-Ind	H	C		408 (M^++1)
Int.B-377	f-2	Int.B-248	AI22		1Me-5-Idz	H	C		409 (M^++1)

[0313] [表64]

Table-Int.B-11

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	V1'	V2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.B-378	f-2	Int.B-251	AI22		6-Qu	H	C		423 (M^++1)
Int.B-379	f-2	Int.B-244	AI23		1Me-5-Ind	H	C		408 (M^++1)
Int.B-380	f-2	Int.B-245	AI23		1Et-5-Ind	H	C		422 (M^++1)
Int.B-381	f-2	Int.B-246	AI23		1Me-4-Ind	H	C		408 (M^++1)
Int.B-382	f-2	Int.B-249	AI23		1Et-5-Idz	H	C		423 (M^++1)
Int.B-383	f-2	Int.B-250	AI23		5-BF	H	C		395 (M^++1)
Int.B-384	f-2	Int.B-243	AI24	2(2MePh)EtO	2-Nap	H	C		393 (M^++1)
Int.B-385	f-2	Int.B-245	AI24	2(2MePh)EtO	1Et-5-Ind	H	C		410 (M^++1)
Int.B-386	f-2	Int.B-247	AI24	2(2MePh)EtO	1Me-6-Ind	H	C		396 (M^++1)
Int.B-387	f-2	Int.B-249	AI24	2(2MePh)EtO	1Et-5-Idz	H	C		410 (M^++1)
Int.B-388	f-2	Int.B-244	AI25	2(3FPh)EtO	1Me-5-Ind	H	C		400 (M^++1)
Int.B-389	f-2	Int.B-246	AI25	2(3FPh)EtO	1Me-4-Ind	H	C		400 (M^++1)
Int.B-390	f-2	Int.B-248	AI25	2(3FPh)EtO	1Me-5-Idz	H	C		401 (M^++1)
Int.B-391	f-2	Int.B-252	AI25	2(3FPh)EtO	6-IQ	H	C		398 (M^++1)
Int.B-392	f-2	Int.B-243	AI26	2(2ClPh)EtO	2-Nap	H	C		413 (M^++1)
Int.B-393	f-2	Int.B-245	AI26	2(2ClPh)EtO	1Et-5-Ind	H	C		430 (M^++1)
Int.B-394	f-2	Int.B-246	AI26	2(2ClPh)EtO	1Me-4-Ind	H	C		416 (M^++1)
Int.B-395	f-2	Int.B-247	AI26	2(2ClPh)EtO	1Me-6-Ind	H	C		416 (M^++1)
Int.B-396	f-2	Int.B-249	AI26	2(2ClPh)EtO	1Et-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
Int.B-397	f-2	Int.B-250	AI26	2(2ClPh)EtO	5-BF	H	C		403 (M^++1)
Int.B-398	f-2	Int.B-243	AI28	2(1-Nap)EtO	2-Nap	H	C		429 (M^++1)
Int.B-399	f-2	Int.B-244	AI28	2(1-Nap)EtO	1Me-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
Int.B-400	f-2	Int.B-248	AI28	2(1-Nap)EtO	1Me-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
Int.B-401	f-2	Int.B-251	AI28	2(1-Nap)EtO	6-Qu	H	C		430 (M^++1)
Int.B-402	f-2	Int.B-252	AI28	2(1-Nap)EtO	6-IQ	H	C		430 (M^++1)
Int.B-403	f-2	Int.B-244	AI30	2(PhS)EtO	1Me-5-Ind	H	C		414 (M^++1)
Int.B-404	f-2	Int.B-247	AI30	2(PhS)EtO	1Me-6-Ind	H	C		414 (M^++1)
Int.B-405	f-2	Int.B-249	AI30	2(PhS)EtO	1Et-5-Idz	H	C		428 (M^++1)
Int.B-406	f-2	Int.B-251	AI30	2(PhS)EtO	6-Qu	H	C		412 (M^++1)

[0314] 実施例B－b－1

2－[5－シクロペンチルオキシ－4－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸エチル(化合物番号B－b－1)の合成(製造法10工程k－1)

参考例1の中間体A－2の合成法(製造法9工程k－1)に記載の手順に従って中間体B－222(254．0mg)およびジエチルホスホノ酢酸エチル(2ml、TCI)、水素化ナトリウム(241．3mg、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号B－b－1；202．0mg)を得た(但し反応は還流条件下18時間半行った)。

実施例B－b－2

2－[5－シクロペンチルオキシ－4－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸の合成（化合物番号B－b－2）の合成（製造法1工程a）

実施例化合物A－a－2の合成法（製造法1工程a）に記載の手順に従って実施例化合B－b－1（70．3mg）、2規定水酸化ナトリウム水溶液（0．45ml）を反応させ処理することにより標記化合物（化合物番号B－b－2；58．9mg）を得た（但し反応は3時間行った）。

[0315] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－B－b－1からTable－B－b－8に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。

[0316] [表65]

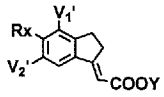


Table-B-b-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-b-1	10k-1	Int.B-222		cPenO	Et	2-Nap	H	C		413 (M^++1)
B-b-2	1-a	B-b-1		cPenO	H	2-Nap	H	C		385 (M^++1)
B-b-3	10k-1	Int.B-223		cPenO	Et	1Me-5-Ind	H	C		416 (M^++1)
B-b-4	1-a	B-b-3		cPenO	H	1Me-5-Ind	H	C		388 (M^++1)
B-b-5	10k-1	Int.B-224		cPenO	Et	1Et-5-Ind	H	C		430 (M^++1)
B-b-6	1-a	B-b-5		cPenO	H	1Et-5-Ind	H	C		402 (M^++1)
B-b-7	10k-1	Int.B-225		cPenO	Et	1Me-4-Ind	H	C		416 (M^++1)
B-b-8	1-a	B-b-7		cPenO	H	1Me-4-Ind	H	C		388 (M^++1)
B-b-9	10k-1	Int.B-226		cPenO	Et	1Me-6-Ind	H	C		416 (M^++1)
B-b-10	1-a	B-b-9		cPenO	H	1Me-6-Ind	H	C		388 (M^++1)
B-b-11	10k-1	Int.B-227		cPenO	Et	1Me-5-Idz	H	C		417 (M^++1)
B-b-12	1-a	B-b-11		cPenO	H	1Me-5-Idz	H	C		389 (M^++1)
B-b-13	10k-1	Int.B-228		cPenO	Et	1Et-5-Idz	H	C		431 (M^++1)
B-b-14	1-a	B-b-13		cPenO	H	1Et-5-Idz	H	C		403 (M^++1)
B-b-15	10k-1	Int.B-229		cPenO	Et	5-BF	H	C		403 (M^++1)
B-b-16	1-a	B-b-15		cPenO	H	5-BF	H	C		375 (M^++1)
B-b-17	10k-1	Int.B-230		cPenO	Et	6-Qu	H	C		414 (M^++1)
B-b-18	1-a	B-b-17		cPenO	H	6-Qu	H	C		386 (M^++1)
B-b-19	10k-1	Int.B-231		cPenO	Et	6-IQ	H	C		414 (M^++1)
B-b-20	1-a	B-b-19		cPenO	H	6-IQ	H	C		386 (M^++1)
B-b-21	10k-1	Int.B-233		BnO	Et	2-Nap	H	C		435 (M^++1)
B-b-22	1-a	B-b-21		BnO	H	2-Nap	H	C		407 (M^++1)
B-b-23	10k-1	Int.B-234		BnO	Et	1Me-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-b-24	1-a	B-b-23		BnO	H	1Me-5-Ind	H	C		410 (M^++1)
B-b-25	10k-1	Int.B-235		BnO	Et	1Et-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-b-26	1-a	B-b-25		BnO	H	1Et-5-Ind	H	C		424 (M^++1)
B-b-27	10k-1	Int.B-236		BnO	Et	1Me-4-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-b-28	1-a	B-b-27		BnO	H	1Me-4-Ind	H	C		410 (M^++1)
B-b-29	10k-1	Int.B-237		BnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-b-30	1-a	B-b-29		BnO	H	1Me-6-Ind	H	C		410 (M^++1)
B-b-31	10k-1	Int.B-238		BnO	Et	1Me-5-Idz	H	C		439 (M^++1)
B-b-32	1-a	B-b-31		BnO	H	1Me-5-Idz	H	C		411 (M^++1)
B-b-33	10k-1	Int.B-239		BnO	Et	1Et-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-b-34	1-a	B-b-33		BnO	H	1Et-5-Idz	H	C		425 (M^++1)
B-b-35	10k-1	Int.B-240		BnO	Et	5-BF	H	C		425 (M^++1)
B-b-36	1-a	B-b-35		BnO	H	5-BF	H	C		397 (M^++1)
B-b-37	10k-1	Int.B-241		BnO	Et	6-Qu	H	C		436 (M^++1)
B-b-38	1-a	B-b-37		BnO	H	6-Qu	H	C		408 (M^++1)
B-b-39	10k-1	Int.B-242		BnO	Et	6-IQ	H	C		436 (M^++1)
B-b-40	1-a	B-b-39		BnO	H	6-IQ	H	C		408 (M^++1)
B-b-41	10k-1	Int.B-253		cPenMeO	Et	2-Nap	H	C		427 (M^++1)
B-b-42	1-a	B-b-41		cPenMeO	H	2-Nap	H	C		399 (M^++1)
B-b-43	10k-1	Int.B-254		cPenMeO	Et	1Me-5-Ind	H	C		430 (M^++1)
B-b-44	1-a	B-b-43		cPenMeO	H	1Me-5-Ind	H	C		402 (M^++1)

[0317] [表66]

Table-B-b-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-b-45	10k-1	Int.B-255		cPenMeO	Et	1Me-6-Ind	H	C		430 (M^++1)
B-b-46	1-a	B-b-45		cPenMeO	H	1Me-6-Ind	H	C		402 (M^++1)
B-b-47	10k-1	Int.B-256		cPenMeO	Et	1Me-5-Idz	H	C		431 (M^++1)
B-b-48	1-a	B-b-47		cPenMeO	H	1Me-5-Idz	H	C		403 (M^++1)
B-b-49	10k-1	Int.B-257		cPenMeO	Et	1Et-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-b-50	1-a	B-b-49		cPenMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		417 (M^++1)
B-b-51	10k-1	Int.B-258		cPenMeO	Et	6-Qu	H	C		428 (M^++1)
B-b-52	1-a	B-b-51		cPenMeO	H	6-Qu	H	C		400 (M^++1)
B-b-53	10k-1	Int.B-259		cHexMeO	Et	2-Nap	H	C		441 (M^++1)
B-b-54	1-a	B-b-53		cHexMeO	H	2-Nap	H	C		413 (M^++1)
B-b-55	10k-1	Int.B-260		cHexMeO	Et	1Et-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-b-56	1-a	B-b-55		cHexMeO	H	1Et-5-Ind	H	C		430 (M^++1)
B-b-57	10k-1	Int.B-261		cHexMeO	Et	1Me-4-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-b-58	1-a	B-b-57		cHexMeO	H	1Me-4-Ind	H	C		416 (M^++1)
B-b-59	10k-1	Int.B-262		cHexMeO	Et	1Me-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-b-60	1-a	B-b-59		cHexMeO	H	1Me-5-Idz	H	C		417 (M^++1)
B-b-61	10k-1	Int.B-263		cHexMeO	Et	1Et-5-Idz	H	C		459 (M^++1)
B-b-62	1-a	B-b-61		cHexMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		431 (M^++1)
B-b-63	10k-1	Int.B-264		cHexMeO	Et	5-BF	H	C		431 (M^++1)
B-b-64	1-a	B-b-63		cHexMeO	H	5-BF	H	C		403 (M^++1)
B-b-65	10k-1	Int.B-265		cHexMeO	Et	6-IQ	H	C		442 (M^++1)
B-b-66	1-a	B-b-65		cHexMeO	H	6-IQ	H	C		414 (M^++1)
B-b-67	10k-1	Int.B-266		cHexO	Et	2-Nap	H	C		427 (M^++1)
B-b-68	1-a	B-b-67		cHexO	H	2-Nap	H	C		399 (M^++1)
B-b-69	10k-1	Int.B-267		cHexO	Et	1Me-5-Ind	H	C		430 (M^++1)
B-b-70	1-a	B-b-69		cHexO	H	1Me-5-Ind	H	C		402 (M^++1)
B-b-71	10k-1	Int.B-268		cHexO	Et	1Et-5-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-b-72	1-a	B-b-71		cHexO	H	1Et-5-Ind	H	C		416 (M^++1)
B-b-73	10k-1	Int.B-269		cHexO	Et	1Me-4-Ind	H	C		430 (M^++1)
B-b-74	1-a	B-b-73		cHexO	H	1Me-4-Ind	H	C		402 (M^++1)
B-b-75	10k-1	Int.B-270		cHexO	Et	1Me-5-Idz	H	C		431 (M^++1)
B-b-76	1-a	B-b-75		cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		403 (M^++1)
B-b-77	10k-1	Int.B-271		cHexO	Et	1Et-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-b-78	1-a	B-b-77		cHexO	H	1Et-5-Idz	H	C		417 (M^++1)
B-b-79	10k-1	Int.B-272		cHexO	Et	6-Qu	H	C		428 (M^++1)
B-b-80	1-a	B-b-79		cHexO	H	6-Qu	H	C		400 (M^++1)
B-b-81	10k-1	Int.B-273		cHepO	Et	2-Nap	H	C		441 (M^++1)
B-b-82	1-a	B-b-81		cHepO	H	2-Nap	H	C		413 (M^++1)
B-b-83	10k-1	Int.B-274		cHepO	Et	1Me-5-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-b-84	1-a	B-b-83		cHepO	H	1Me-5-Ind	H	C		416 (M^++1)
B-b-85	10k-1	Int.B-275		cHepO	Et	1Me-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-b-86	1-a	B-b-85		cHepO	H	1Me-5-Idz	H	C		417 (M^++1)
B-b-87	10k-1	Int.B-276		cHepO	Et	6-IQ	H	C		442 (M^++1)
B-b-88	1-a	B-b-87		cHepO	H	6-IQ	H	C		414 (M^++1)
B-b-89	10k-1	Int.B-277		nPrO	Et	1Et-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-b-90	1-a	B-b-89		nPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		376 (M^++1)
B-b-91	10k-1	Int.B-278		nPrO	Et	1Me-4-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-b-92	1-a	B-b-91		nPrO	H	1Me-4-Ind	H	C		362 (M^++1)

[0318] [表67]

Table-B-b-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-b-93	10k-1	Int.B-279		nPrO	Et	1Et-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-b-94	1-a	B-b-93		nPrO	H	1Et-5-Idz	H	C		377 (M^++1)
B-b-95	10k-1	Int.B-280		nPrO	Et	6-Qu	H	C		388 (M^++1)
B-b-96	1-a	B-b-95		nPrO	H	6-Qu	H	C		360 (M^++1)
B-b-97	10k-1	Int.B-281		iPrO	Et	2-Nap	H	C		387 (M^++1)
B-b-98	1-a	B-b-97		iPrO	H	2-Nap	H	C		359 (M^++1)
B-b-99	10k-1	Int.B-282		iPrO	Et	1Et-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-b-100	1-a	B-b-99		iPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		376 (M^++1)
B-b-101	10k-1	Int.B-283		iPrO	Et	1Me-5-Idz	H	C		391 (M^++1)
B-b-102	1-a	B-b-101		iPrO	H	1Me-5-Idz	H	C		363 (M^++1)
B-b-103	10k-1	Int.B-284		iPrO	Et	6-IQ	H	C		388 (M^++1)
B-b-104	1-a	B-b-103		iPrO	H	6-IQ	H	C		360 (M^++1)
B-b-105	10k-1	Int.B-285		nBuO	Et	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
B-b-106	1-a	B-b-105		nBuO	H	2-Nap	H	C		373 (M^++1)
B-b-107	10k-1	Int.B-286		nBuO	Et	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-b-108	1-a	B-b-107		nBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		376 (M^++1)
B-b-109	10k-1	Int.B-287		nBuO	Et	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-b-110	1-a	B-b-109		nBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		391 (M^++1)
B-b-111	10k-1	Int.B-288		iBuO	Et	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-b-112	1-a	B-b-111		iBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		376 (M^++1)
B-b-113	10k-1	Int.B-289		iBuO	Et	1Et-5-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-b-114	1-a	B-b-113		iBuO	H	1Et-5-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-b-115	10k-1	Int.B-290		iBuO	Et	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-b-116	1-a	B-b-115		iBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		377 (M^++1)
B-b-117	10k-1	Int.B-291		iBuO	Et	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-b-118	1-a	B-b-117		iBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		391 (M^++1)
B-b-119	10k-1	Int.B-292		2FBnO	Et	2-Nap	H	C		453 (M^++1)
B-b-120	1-a	B-b-119		2FBnO	H	2-Nap	H	C		425 (M^++1)
B-b-121	10k-1	Int.B-293		2FBnO	Et	1Me-4-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-122	1-a	B-b-121		2FBnO	H	1Me-4-Ind	H	C		428 (M^++1)
B-b-123	10k-1	Int.B-294		2FBnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-124	1-a	B-b-123		2FBnO	H	1Me-6-Ind	H	C		428 (M^++1)
B-b-125	10k-1	Int.B-295		2FBnO	Et	1Me-5-Idz	H	C		457 (M^++1)
B-b-126	1-a	B-b-125		2FBnO	H	1Me-5-Idz	H	C		429 (M^++1)
B-b-127	10k-1	Int.B-296		2FBnO	Et	6-Qu	H	C		454 (M^++1)
B-b-128	1-a	B-b-127		2FBnO	H	6-Qu	H	C		426 (M^++1)
B-b-129	10k-1	Int.B-297		3FBnO	Et	1Me-5-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-130	1-a	B-b-129		3FBnO	H	1Me-5-Ind	H	C		428 (M^++1)
B-b-131	10k-1	Int.B-298		3FBnO	Et	1Et-5-Ind	H	C		470 (M^++1)
B-b-132	1-a	B-b-131		3FBnO	H	1Et-5-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-b-133	10k-1	Int.B-299		3FBnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-134	1-a	B-b-133		3FBnO	H	1Me-6-Ind	H	C		428 (M^++1)
B-b-135	10k-1	Int.B-300		3FBnO	Et	5-BF	H	C		443 (M^++1)
B-b-136	1-a	B-b-135		3FBnO	H	5-BF	H	C		415 (M^++1)
B-b-137	10k-1	Int.B-301		4FBnO	Et	2-Nap	H	C		453 (M^++1)
B-b-138	1-a	B-b-137		4FBnO	H	2-Nap	H	C		425 (M^++1)
B-b-139	10k-1	Int.B-302		4FBnO	Et	1Me-4-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-140	1-a	B-b-139		4FBnO	H	1Me-4-Ind	H	C		428 (M^++1)

[0319] [表68]

Table-B-b-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-b-141	10k-1	Int.B-303		4FBnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-142	1-a	B-b-141		4FBnO	H	1Me-6-Ind	H	C		428 (M^++1)
B-b-143	10k-1	Int.B-304		4FBnO	Et	6-Qu	H	C		454 (M^++1)
B-b-144	1-a	B-b-143		4FBnO	H	6-Qu	H	C		426 (M^++1)
B-b-145	10k-1	Int.B-305		2ClBnO	Et	2-Nap	H	C		469 (M^++1)
B-b-146	1-a	B-b-145		2ClBnO	H	2-Nap	H	C		441 (M^++1)
B-b-147	10k-1	Int.B-306		2ClBnO	Et	1Et-5-Ind	H	C		486 (M^++1)
B-b-148	1-a	B-b-147		2ClBnO	H	1Et-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-b-149	10k-1	Int.B-307		2ClBnO	Et	1Me-5-Idz	H	C		473 (M^++1)
B-b-150	1-a	B-b-149		2ClBnO	H	1Me-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-b-151	10k-1	Int.B-308		2ClBnO	Et	1Et-5-Idz	H	C		487 (M^++1)
B-b-152	1-a	B-b-151		2ClBnO	H	1Et-5-Idz	H	C		459 (M^++1)
B-b-153	10k-1	Int.B-309		3ClBnO	Et	1Me-5-Ind	H	C		472 (M^++1)
B-b-154	1-a	B-b-153		3ClBnO	H	1Me-5-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-b-155	10k-1	Int.B-310		3ClBnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		472 (M^++1)
B-b-156	1-a	B-b-155		3ClBnO	H	1Me-6-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-b-157	10k-1	Int.B-311		3ClBnO	Et	1Et-5-Idz	H	C		487 (M^++1)
B-b-158	1-a	B-b-157		3ClBnO	H	1Et-5-Idz	H	C		459 (M^++1)
B-b-159	10k-1	Int.B-312		3ClBnO	Et	6-IQ	H	C		470 (M^++1)
B-b-160	1-a	B-b-159		3ClBnO	H	6-IQ	H	C		442 (M^++1)
B-b-161	10k-1	Int.B-313		4MeBnO	Et	2-Nap	H	C		449 (M^++1)
B-b-162	1-a	B-b-161		4MeBnO	H	2-Nap	H	C		421 (M^++1)
B-b-163	10k-1	Int.B-314		4MeBnO	Et	1Et-5-Ind	H	C		466 (M^++1)
B-b-164	1-a	B-b-163		4MeBnO	H	1Et-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-b-165	10k-1	Int.B-315		4MeBnO	Et	1Me-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-b-166	1-a	B-b-165		4MeBnO	H	1Me-5-Idz	H	C		425 (M^++1)
B-b-167	10k-1	Int.B-316		4MeBnO	Et	6-Qu	H	C		450 (M^++1)
B-b-168	1-a	B-b-167		4MeBnO	H	6-Qu	H	C		422 (M^++1)
B-b-169	10k-1	Int.B-317		4CF3BnO	Et	1Me-5-Ind	H	C		505 (M^++1)
B-b-170	1-a	B-b-169		4CF3BnO	H	1Me-5-Ind	H	C		477 (M^++1)
B-b-171	10k-1	Int.B-318		4CF3BnO	Et	1Me-4-Ind	H	C		505 (M^++1)
B-b-172	1-a	B-b-171		4CF3BnO	H	1Me-4-Ind	H	C		477 (M^++1)
B-b-173	10k-1	Int.B-319		4CF3BnO	Et	1Et-5-Idz	H	C		520 (M^++1)
B-b-174	1-a	B-b-173		4CF3BnO	H	1Et-5-Idz	H	C		492 (M^++1)
B-b-175	10k-1	Int.B-320		4CF3BnO	Et	6-Qu	H	C		503 (M^++1)
B-b-176	1-a	B-b-175		4CF3BnO	H	6-Qu	H	C		475 (M^++1)
B-b-177	10k-1	Int.B-321		2EtBuO	Et	2-Nap	H	C		429 (M^++1)
B-b-178	1-a	B-b-177		2EtBuO	H	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
B-b-179	10k-1	Int.B-322		2EtBuO	Et	1Me-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-b-180	1-a	B-b-179		2EtBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-b-181	10k-1	Int.B-323		2EtBuO	Et	1Et-5-Ind	H	C		446 (M^++1)
B-b-182	1-a	B-b-181		2EtBuO	H	1Et-5-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-b-183	10k-1	Int.B-324		2EtBuO	Et	1Me-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
B-b-184	1-a	B-b-183		2EtBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-b-185	10k-1	Int.B-325		2EtBuO	Et	6-IQ	H	C		430 (M^++1)
B-b-186	1-a	B-b-185		2EtBuO	H	6-IQ	H	C		402 (M^++1)
B-b-187	10k-1	Int.B-326		2(4DMAPh)EtO	Et	2-Nap	H	C		464 (M^++1)
B-b-188	1-a	B-b-187		2(4DMAPh)EtO	H	2-Nap	H	C		464 (M^++1)

[0320] [表69]

Table-B-b-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-b-189	10k-1	Int.B-327		2(4DMAPh)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		495 (M^++1)
B-b-190	1-a	B-b-189		2(4DMAPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		467 (M^++1)
B-b-191	10k-1	Int.B-328		2(4DMAPh)EtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		495 (M^++1)
B-b-192	1-a	B-b-191		2(4DMAPh)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		467 (M^++1)
B-b-193	10k-1	Int.B-329		2(4DMAPh)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		510 (M^++1)
B-b-194	1-a	B-b-193		2(4DMAPh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		482 (M^++1)
B-b-195	10k-1	Int.B-330		2(PhO)EtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		468 (M^++1)
B-b-196	1-a	B-b-195		2(PhO)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		440 (M^++1)
B-b-197	10k-1	Int.B-331		2(PhO)EtO	Et	1Me-6-Ind	H	C		468 (M^++1)
B-b-198	1-a	B-b-197		2(PhO)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		440 (M^++1)
B-b-199	10k-1	Int.B-332		2(PhO)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		469 (M^++1)
B-b-200	1-a	B-b-199		2(PhO)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		441 (M^++1)
B-b-201	10k-1	Int.B-333		2(PhO)EtO	Et	6-Qu	H	C		466 (M^++1)
B-b-202	1-a	B-b-201		2(PhO)EtO	H	6-Qu	H	C		438 (M^++1)
B-b-203	10k-1	Int.B-334		1PhEtO	Et	2-Nap	H	C		449 (M^++1)
B-b-204	1-a	B-b-203		1PhEtO	H	2-Nap	H	C		421 (M^++1)
B-b-205	10k-1	Int.B-335		1PhEtO	Et	1Et-5-Ind	H	C		466 (M^++1)
B-b-206	1-a	B-b-205		1PhEtO	H	1Et-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-b-207	10k-1	Int.B-336		1PhEtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-b-208	1-a	B-b-207		1PhEtO	H	1Me-4-Ind	H	C		424 (M^++1)
B-b-209	10k-1	Int.B-337		1PhEtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-b-210	1-a	B-b-209		1PhEtO	H	1Me-5-Idz	H	C		425 (M^++1)
B-b-211	10k-1	Int.B-338		1PhEtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		467 (M^++1)
B-b-212	1-a	B-b-211		1PhEtO	H	1Et-5-Idz	H	C		439 (M^++1)
B-b-213	10k-1	Int.B-339		1(2FPh)EtO	Et	2-Nap	H	C		467 (M^++1)
B-b-214	1-a	B-b-213		1(2FPh)EtO	H	2-Nap	H	C		439 (M^++1)
B-b-215	10k-1	Int.B-340		1(2FPh)EtO	Et	1Et-5-Ind	H	C		484 (M^++1)
B-b-216	1-a	B-b-215		1(2FPh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-217	10k-1	Int.B-341		1(2FPh)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		471 (M^++1)
B-b-218	1-a	B-b-217		1(2FPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		443 (M^++1)
B-b-219	10k-1	Int.B-342		1(2FPh)EtO	Et	6-IQ	H	C		468 (M^++1)
B-b-220	1-a	B-b-219		1(2FPh)EtO	H	6-IQ	H	C		440 (M^++1)
B-b-221	10k-1	Int.B-343		1(4ClPh)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		487 (M^++1)
B-b-222	1-a	B-b-221		1(4ClPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-b-223	10k-1	Int.B-344		1(4ClPh)EtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		487 (M^++1)
B-b-224	1-a	B-b-223		1(4ClPh)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-b-225	10k-1	Int.B-345		1(4ClPh)EtO	Et	1Me-6-Ind	H	C		487 (M^++1)
B-b-226	1-a	B-b-225		1(4ClPh)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-b-227	10k-1	Int.B-346		1(4ClPh)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		502 (M^++1)
B-b-228	1-a	B-b-227		1(4ClPh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		473 (M^++1)
B-b-229	10k-1	Int.B-347		4Me,cHexO	Et	2-Nap	H	C		441 (M^++1)
B-b-230	1-a	B-b-229		4Me,cHexO	H	2-Nap	H	C		413 (M^++1)
B-b-231	10k-1	Int.B-348		4Me,cHexO	Et	1Et-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-b-232	1-a	B-b-231		4Me,cHexO	H	1Et-5-Ind	H	C		430 (M^++1)
B-b-233	10k-1	Int.B-349		4Me,cHexO	Et	1Me-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-b-234	1-a	B-b-233		4Me,cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		417 (M^++1)
B-b-235	10k-1	Int.B-350		4Me,cHexO	Et	5-BF	H	C		431 (M^++1)
B-b-236	1-a	B-b-235		4Me,cHexO	H	5-BF	H	C		403 (M^++1)

[0321] [表70]

Table-B-b-6

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-b-237	10k-1	Int.B-351		1IndanO	Et	2-Nap	H	C		461 (M^++1)
B-b-238	1-a	B-b-237		1IndanO	H	2-Nap	H	C		433 (M^++1)
B-b-239	10k-1	Int.B-352		1IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		464 (M^++1)
B-b-240	1-a	B-b-239		1IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		436 (M^++1)
B-b-241	10k-1	Int.B-353		1IndanO	Et	1Me-4-Ind	H	C		464 (M^++1)
B-b-242	1-a	B-b-241		1IndanO	H	1Me-4-Ind	H	C		436 (M^++1)
B-b-243	10k-1	Int.B-354		1IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		465 (M^++1)
B-b-244	1-a	B-b-243		1IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		437 (M^++1)
B-b-245	10k-1	Int.B-355		1IndanO	Et	6-Qu	H	C		462 (M^++1)
B-b-246	1-a	B-b-245		1IndanO	H	6-Qu	H	C		434 (M^++1)
B-b-247	10k-1	Int.B-356		2IndanO	Et	2-Nap	H	C		461 (M^++1)
B-b-248	1-a	B-b-247		2IndanO	H	2-Nap	H	C		433 (M^++1)
B-b-249	10k-1	Int.B-357		2IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		464 (M^++1)
B-b-250	1-a	B-b-249		2IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		436 (M^++1)
B-b-251	10k-1	Int.B-358		2IndanO	Et	1Et-5-Ind	H	C		478 (M^++1)
B-b-252	1-a	B-b-251		2IndanO	H	1Et-5-Ind	H	C		450 (M^++1)
B-b-253	10k-1	Int.B-359		2IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		465 (M^++1)
B-b-254	1-a	B-b-253		2IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		437 (M^++1)
B-b-255	10k-1	Int.B-360		2IndanO	Et	1Et-5-Idz	H	C		479 (M^++1)
B-b-256	1-a	B-b-255		2IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		451 (M^++1)
B-b-257	10k-1	Int.B-361		2IndanO	Et	6-IQ	H	C		462 (M^++1)
B-b-258	1-a	B-b-257		2IndanO	H	6-IQ	H	C		434 (M^++1)
B-b-259	10k-1	Int.B-362		5OMe-2-IndanO	Et	2-Nap	H	C		491 (M^++1)
B-b-260	1-a	B-b-259		5OMe-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		463 (M^++1)
B-b-261	10k-1	Int.B-363		5OMe-2-IndanO	Et	1Et-5-Ind	H	C		508 (M^++1)
B-b-262	1-a	B-b-261		5OMe-2-IndanO	H	1Et-5-Ind	H	C		480 (M^++1)
B-b-263	10k-1	Int.B-364		5OMe-2-IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		495 (M^++1)
B-b-264	1-a	B-b-263		5OMe-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		467 (M^++1)
B-b-265	10k-1	Int.B-365		5OMe-2-IndanO	Et	6-Qu	H	C		492 (M^++1)
B-b-266	1-a	B-b-265		5OMe-2-IndanO	H	6-Qu	H	C		464 (M^++1)
B-b-267	10k-1	Int.B-366		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		524 (M^++1)
B-b-268	1-a	B-b-267		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		496 (M^++1)
B-b-269	10k-1	Int.B-367		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	1Me-4-Ind	H	C		524 (M^++1)
B-b-270	1-a	B-b-269		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-4-Ind	H	C		496 (M^++1)
B-b-271	10k-1	Int.B-368		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	1Et-5-Idz	H	C		539 (M^++1)
B-b-272	1-a	B-b-271		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		511 (M^++1)
B-b-273	10k-1	Int.B-369		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	6-IQ	H	C		522 (M^++1)
B-b-274	1-a	B-b-273		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	6-IQ	H	C		494 (M^++1)
B-b-275	10k-1	Int.B-370		5F-2-IndanO	Et	2-Nap	H	C		479 (M^++1)
B-b-276	1-a	B-b-275		5F-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		451 (M^++1)
B-b-277	10k-1	Int.B-371		5F-2-IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		482 (M^++1)
B-b-278	1-a	B-b-277		5F-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		454 (M^++1)
B-b-279	10k-1	Int.B-372		5F-2-IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		483 (M^++1)
B-b-280	1-a	B-b-279		5F-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
B-b-281	10k-1	Int.B-373		5F-2-IndanO	Et	1Et-5-Idz	H	C		497 (M^++1)
B-b-282	1-a	B-b-281		5F-2-IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		469 (M^++1)

[0322] [表71]

Tbble-B-b-7

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-b-283	10k-1	Int.B-374			Et	2-Nap	H	C		475 (M^++1)
B-b-284	1-a	B-b-283			H	2-Nap	H	C		447 (M^++1)
B-b-285	10k-1	Int.B-375			Et	1Me-5-Ind	H	C		478 (M^++1)
B-b-286	1-a	B-b-285			H	1Me-5-Ind	H	C		450 (M^++1)
B-b-287	10k-1	Int.B-376			Et	1Me-6-Ind	H	C		478 (M^++1)
B-b-288	1-a	B-b-287			H	1Me-6-Ind	H	C		450 (M^++1)
B-b-289	10k-1	Int.B-377			Et	1Me-5-Idz	H	C		479 (M^++1)
B-b-290	1-a	B-b-289			H	1Me-5-Idz	H	C		451 (M^++1)
B-b-291	10k-1	Int.B-378			Et	6-Qu	H	C		476 (M^++1)
B-b-292	1-a	B-b-291			H	6-Qu	H	C		448 (M^++1)
B-b-293	10k-1	Int.B-379			Et	1Me-5-Ind	H	C		478 (M^++1)
B-b-294	1-a	B-b-293			H	1Me-5-Ind	H	C		450 (M^++1)
B-b-295	10k-1	Int.B-380			Et	1Et-5-Ind	H	C		492 (M^++1)
B-b-296	1-a	B-b-295			H	1Et-5-Ind	H	C		464 (M^++1)
B-b-297	10k-1	Int.B-381			Et	1Me-4-Ind	H	C		478 (M^++1)
B-b-298	1-a	B-b-297			H	1Me-4-Ind	H	C		450 (M^++1)
B-b-299	10k-1	Int.B-382			Et	1Et-5-Idz	H	C		493 (M^++1)
B-b-300	1-a	B-b-299			H	1Et-5-Idz	H	C		465 (M^++1)
B-b-301	10k-1	Int.B-383			Et	5-BF	H	C		465 (M^++1)
B-b-302	1-a	B-b-301			H	5-BF	H	C		437 (M^++1)
B-b-303	10k-1	Int.B-384		2(2MePh)EtO	Et	2-Nap	H	C		463 (M^++1)
B-b-304	1-a	B-b-303		2(2MePh)EtO	H	2-Nap	H	C		435 (M^++1)
B-b-305	10k-1	Int.B-385		2(2MePh)EtO	Et	1Et-5-Ind	H	C		480 (M^++1)
B-b-306	1-a	B-b-305		2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-b-307	10k-1	Int.B-386		2(2MePh)EtO	Et	1Me-6-Ind	H	C		466 (M^++1)
B-b-308	1-a	B-b-307		2(2MePh)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-b-309	10k-1	Int.B-387		2(2MePh)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		481 (M^++1)
B-b-310	1-a	B-b-309		2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		453 (M^++1)

[0323] [表72]

Table-B-b-8

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-b-311	10k-1	Int.B-388		2(3FPh)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		470 (M^++1)
B-b-312	1-a	B-b-311		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-b-313	10k-1	Int.B-389		2(3FPh)EtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		470 (M^++1)
B-b-314	1-a	B-b-313		2(3FPh)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-b-315	10k-1	Int.B-390		2(3FPh)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		471 (M^++1)
B-b-316	1-a	B-b-315		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		443 (M^++1)
B-b-317	10k-1	Int.B-391		2(3FPh)EtO	Et	6-IQ	H	C		468 (M^++1)
B-b-318	1-a	B-b-317		2(3FPh)EtO	H	6-IQ	H	C		440 (M^++1)
B-b-319	10k-1	Int.B-392		2(2ClPh)EtO	Et	2-Nap	H	C		484 (M^++1)
B-b-320	1-a	B-b-319		2(2ClPh)EtO	H	2-Nap	H	C		455 (M^++1)
B-b-321	10k-1	Int.B-393		2(2ClPh)EtO	Et	1Et-5-Ind	H	C		501 (M^++1)
B-b-322	1-a	B-b-321		2(2ClPh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		473 (M^++1)
B-b-323	10k-1	Int.B-394		2(2ClPh)EtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		487 (M^++1)
B-b-324	1-a	B-b-323		2(2ClPh)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-b-325	10k-1	Int.B-395		2(2ClPh)EtO	Et	1Me-6-Ind	H	C		487 (M^++1)
B-b-326	1-a	B-b-325		2(2ClPh)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-b-327	10k-1	Int.B-396		2(2ClPh)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		502 (M^++1)
B-b-328	1-a	B-b-327		2(2ClPh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		473 (M^++1)
B-b-329	10k-1	Int.B-397		2(2ClPh)EtO	Et	5-BF	H	C		473 (M^++1)
B-b-330	1-a	B-b-329		2(2ClPh)EtO	H	5-BF	H	C		445 (M^++1)
B-b-331	10k-1	Int.B-398		2(1-Nap)EtO	Et	2-Nap	H	C		499 (M^++1)
B-b-332	1-a	B-b-331		2(1-Nap)EtO	H	2-Nap	H	C		471 (M^++1)
B-b-333	10k-1	Int.B-399		2(1-Nap)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		502 (M^++1)
B-b-334	1-a	B-b-333		2(1-Nap)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		474 (M^++1)
B-b-335	10k-1	Int.B-400		2(1-Nap)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		503 (M^++1)
B-b-336	1-a	B-b-335		2(1-Nap)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		475 (M^++1)
B-b-337	10k-1	Int.B-401		2(1-Nap)EtO	Et	6-Qu	H	C		500 (M^++1)
B-b-338	1-a	B-b-337		2(1-Nap)EtO	H	6-Qu	H	C		472 (M^++1)
B-b-339	10k-1	Int.B-402		2(1-Nap)EtO	Et	6-IQ	H	C		500 (M^++1)
B-b-340	1-a	B-b-339		2(1-Nap)EtO	H	6-IQ	H	C		472 (M^++1)
B-b-341	10k-1	Int.B-403		2(PhS)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		484 (M^++1)
B-b-342	1-a	B-b-341		2(PhS)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-343	10k-1	Int.B-404		2(PhS)EtO	Et	1Me-6-Ind	H	C		484 (M^++1)
B-b-344	1-a	B-b-343		2(PhS)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-b-345	10k-1	Int.B-405		2(PhS)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		499 (M^++1)
B-b-346	1-a	B-b-345		2(PhS)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		471 (M^++1)
B-b-347	10k-1	Int.B-406		2(PhS)EtO	Et	6-Qu	H	C		482 (M^++1)
B-b-348	1-a	B-b-347		2(PhS)EtO	H	6-Qu	H	C		454 (M^++1)

[0324] 実施例B－c－1

2－[5－シクロペンチルオキシ－4－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチルの合成(化合物番号B－c－1)(製造法9工程j)

参考例1の中間体A－3の合成法(製造法9工程j)に記載の手順に従って実施例化合物B－b－1(121. 4mg)およびPd／C(26. 6mg、Merck社製)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号B－c－1;108. 6mg)を得た(但し反応は1時間半行った)。

実施例B－c－2

2－[5－シクロペンチルオキシ－4－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸の合成(化合物番号B－c－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合B－c－1(105. 2mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0. 63ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号B－c－2;95. 8mg)を得た(但し反応は14時間行った)。

[0325] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－B－c－1からTable－B－c－6に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。

[0326] [表73]

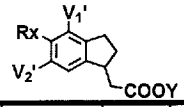


Table-B-c-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-c-1	9-j	B-b-1		cPenO	Et	2-Nap	H	C		415 (M^++1)
B-c-2	1-a	B-c-1		cPenO	H	2-Nap	H	C		387 (M^++1)
B-c-3	9-j	B-b-3		cPenO	Et	1Me-5-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-c-4	1-a	B-c-3		cPenO	H	1Me-5-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-c-5	9-j	B-b-5		cPenO	Et	1Et-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-c-6	1-a	B-c-5		cPenO	H	1Et-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-c-7	9-j	B-b-7		cPenO	Et	1Me-4-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-c-8	1-a	B-c-7		cPenO	H	1Me-4-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-c-9	9-j	B-b-9		cPenO	Et	1Me-6-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-c-10	1-a	B-c-9		cPenO	H	1Me-6-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-c-11	9-j	B-b-11		cPenO	Et	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-c-12	1-a	B-c-11		cPenO	H	1Me-5-Idz	H	C		391 (M^++1)
B-c-13	9-j	B-b-13		cPenO	Et	1Et-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
B-c-14	1-a	B-c-13		cPenO	H	1Et-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-c-15	9-j	B-b-15		cPenO	Et	5-BF	H	C		405 (M^++1)
B-c-16	1-a	B-c-15		cPenO	H	5-BF	H	C		377 (M^++1)
B-c-17	9-j	B-b-17		cPenO	Et	6-Qu	H	C		416 (M^++1)
B-c-18	1-a	B-c-17		cPenO	H	6-Qu	H	C		388 (M^++1)
B-c-19	9-j	B-b-19		cPenO	Et	6-IQ	H	C		416 (M^++1)
B-c-20	1-a	B-c-19		cPenO	H	6-IQ	H	C		388 (M^++1)
B-c-21	9-j	B-b-41		cPenMeO	Et	2-Nap	H	C		429 (M^++1)
B-c-22	1-a	B-c-21		cPenMeO	H	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
B-c-23	9-j	B-b-43		cPenMeO	Et	1Me-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-c-24	1-a	B-c-23		cPenMeO	H	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-c-25	9-j	B-b-45		cPenMeO	Et	1Me-6-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-c-26	1-a	B-c-25		cPenMeO	H	1Me-6-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-c-27	9-j	B-b-47		cPenMeO	Et	1Me-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
B-c-28	1-a	B-c-27		cPenMeO	H	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-c-29	9-j	B-b-49		cPenMeO	Et	1Et-5-Idz	H	C		447 (M^++1)
B-c-30	1-a	B-c-29		cPenMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-c-31	9-j	B-b-51		cPenMeO	Et	6-Qu	H	C		430 (M^++1)
B-c-32	1-a	B-c-31		cPenMeO	H	6-Qu	H	C		402 (M^++1)
B-c-33	9-j	B-b-53		cHexMeO	Et	2-Nap	H	C		443 (M^++1)
B-c-34	1-a	B-c-33		cHexMeO	H	2-Nap	H	C		415 (M^++1)
B-c-35	9-j	B-b-55		cHexMeO	Et	1Et-5-Ind	H	C		460 (M^++1)
B-c-36	1-a	B-c-35		cHexMeO	H	1Et-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-c-37	9-j	B-b-57		cHexMeO	Et	1Me-4-Ind	H	C		446 (M^++1)
B-c-38	1-a	B-c-37		cHexMeO	H	1Me-4-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-c-39	9-j	B-b-59		cHexMeO	Et	1Me-5-Idz	H	C		447 (M^++1)
B-c-40	1-a	B-c-39		cHexMeO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-c-41	9-j	B-b-61		cHexMeO	Et	1Et-5-Idz	H	C		461 (M^++1)
B-c-42	1-a	B-c-41		cHexMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
B-c-43	9-j	B-b-63		cHexMeO	Et	5-BF	H	C		433 (M^++1)
B-c-44	1-a	B-c-43		cHexMeO	H	5-BF	H	C		405 (M^++1)

[0327] [表74]

Table-B-c-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-c-45	9-j	B-b-65		cHexMeO	Et	6-IQ	H	C		444 (M^++1)
B-c-46	1-a	B-c-45		cHexMeO	H	6-IQ	H	C		416 (M^++1)
B-c-47	9-j	B-b-67		cHexO	Et	2-Nap	H	C		429 (M^++1)
B-c-48	1-a	B-c-47		cHexO	H	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
B-c-49	9-j	B-b-69		cHexO	Et	1Me-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-c-50	1-a	B-c-49		cHexO	H	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-c-51	9-j	B-b-73		cHexO	Et	1Me-4-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-c-52	1-a	B-c-51		cHexO	H	1Me-4-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-c-53	9-j	B-b-75		cHexO	Et	1Me-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
B-c-54	1-a	B-c-53		cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-c-55	9-j	B-b-77		cHexO	Et	1Et-5-Idz	H	C		447 (M^++1)
B-c-56	1-a	B-c-55		cHexO	H	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-c-57	9-j	B-b-81		cHepO	Et	2-Nap	H	C		443 (M^++1)
B-c-58	1-a	B-c-57		cHepO	H	2-Nap	H	C		415 (M^++1)
B-c-59	9-j	B-b-83		cHepO	Et	1Me-5-Ind	H	C		446 (M^++1)
B-c-60	1-a	B-c-59		cHepO	H	1Me-5-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-c-61	9-j	B-b-85		cHepO	Et	1Me-5-Idz	H	C		447 (M^++1)
B-c-62	1-a	B-c-61		cHepO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-c-63	9-j	B-b-87		cHepO	Et	6-IQ	H	C		444 (M^++1)
B-c-64	1-a	B-c-63		cHepO	H	6-IQ	H	C		416 (M^++1)
B-c-65	9-j	B-b-89		nPrO	Et	1Et-5-Ind	H	C		406 (M^++1)
B-c-66	1-a	B-c-65		nPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-c-67	9-j	B-b-93		nPrO	Et	1Et-5-Idz	H	C		407 (M^++1)
B-c-68	1-a	B-c-67		nPrO	H	1Et-5-Idz	H	C		379 (M^++1)
B-c-69	9-j	B-b-95		nPrO	Et	6-Qu	H	C		390 (M^++1)
B-c-70	1-a	B-c-69		nPrO	H	6-Qu	H	C		362 (M^++1)
B-c-71	9-j	B-b-97		iPrO	Et	2-Nap	H	C		389 (M^++1)
B-c-72	1-a	B-c-71		iPrO	H	2-Nap	H	C		361 (M^++1)
B-c-73	9-j	B-b-99		iPrO	Et	1Et-5-Ind	H	C		406 (M^++1)
B-c-74	1-a	B-c-73		iPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-c-75	9-j	B-b-101		iPrO	Et	1Me-5-Idz	H	C		393 (M^++1)
B-c-76	1-a	B-c-75		iPrO	H	1Me-5-Idz	H	C		365 (M^++1)
B-c-77	9-j	B-b-103		iPrO	Et	6-IQ	H	C		390 (M^++1)
B-c-78	1-a	B-c-77		iPrO	H	6-IQ	H	C		362 (M^++1)
B-c-79	9-j	B-b-105		nBuO	Et	2-Nap	H	C		403 (M^++1)
B-c-80	1-a	B-c-79		nBuO	H	2-Nap	H	C		375 (M^++1)
B-c-81	9-j	B-b-107		nBuO	Et	1Me-5-Ind	H	C		406 (M^++1)
B-c-82	1-a	B-c-81		nBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-c-83	9-j	B-b-109		nBuO	Et	1Et-5-Idz	H	C		421 (M^++1)
B-c-84	1-a	B-c-83		nBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		393 (M^++1)
B-c-85	9-j	B-b-111		iBuO	Et	1Me-5-Ind	H	C		406 (M^++1)
B-c-86	1-a	B-c-85		iBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-c-87	9-j	B-b-113		iBuO	Et	1Et-5-Ind	H	C		420 (M^++1)
B-c-88	1-a	B-c-87		iBuO	H	1Et-5-Ind	H	C		392 (M^++1)
B-c-89	9-j	B-b-115		iBuO	Et	1Me-5-Idz	H	C		407 (M^++1)
B-c-90	1-a	B-c-89		iBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		379 (M^++1)
B-c-91	9-j	B-b-117		iBuO	Et	1Et-5-Idz	H	C		421 (M^++1)
B-c-92	1-a	B-c-91		iBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		393 (M^++1)

[0328] [表75]

Tacle-B-c-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-c-93	9-j	B-b-177		2EtBuO	Et	2-Nap	H	C		431 (M^++1)
B-c-94	1-a	B-c-93		2EtBuO	H	2-Nap	H	C		403 (M^++1)
B-c-95	9-j	B-b-179		2EtBuO	Et	1Me-5-Ind	H	C		434 (M^++1)
B-c-96	1-a	B-c-95		2EtBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		406 (M^++1)
B-c-97	9-j	B-b-181		2EtBuO	Et	1Et-5-Ind	H	C		448 (M^++1)
B-c-98	1-a	B-c-97		2EtBuO	H	1Et-5-Ind	H	C		420 (M^++1)
B-c-99	9-j	B-b-183		2EtBuO	Et	1Me-5-Idz	H	C		435 (M^++1)
B-c-100	1-a	B-c-99		2EtBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		407 (M^++1)
B-c-101	9-j	B-b-185		2EtBuO	Et	6-IQ	H	C		432 (M^++1)
B-c-102	1-a	B-c-101		2EtBuO	H	6-IQ	H	C		404 (M^++1)
B-c-103	9-j	B-b-187		2(4DMAPh)EtO	Et	2-Nap	H	C		494 (M^++1)
B-c-104	1-a	B-c-103		2(4DMAPh)EtO	H	2-Nap	H	C		466 (M^++1)
B-c-105	9-j	B-b-189		2(4DMAPh)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		497 (M^++1)
B-c-106	1-a	B-c-105		2(4DMAPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		469 (M^++1)
B-c-107	9-j	B-b-191		2(4DMAPh)EtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		497 (M^++1)
B-c-108	1-a	B-c-107		2(4DMAPh)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		469 (M^++1)
B-c-109	9-j	B-b-193		2(4DMAPh)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		512 (M^++1)
B-c-110	1-a	B-c-109		2(4DMAPh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		484 (M^++1)
B-c-111	9-j	B-b-195		2(PhO)EtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		470 (M^++1)
B-c-112	1-a	B-c-111		2(PhO)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-c-113	9-j	B-b-197		2(PhO)EtO	Et	1Me-6-Ind	H	C		470 (M^++1)
B-c-114	1-a	B-c-113		2(PhO)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-c-115	9-j	B-b-199		2(PhO)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		471 (M^++1)
B-c-116	1-a	B-c-115		2(PhO)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		443 (M^++1)
B-c-117	9-j	B-b-203		1PhEtO	Et	2-Nap	H	C		451 (M^++1)
B-c-118	1-a	B-c-117		1PhEtO	H	2-Nap	H	C		423 (M^++1)
B-c-119	9-j	B-b-205		1PhEtO	Et	1Et-5-Ind	H	C		468 (M^++1)
B-c-120	1-a	B-c-119		1PhEtO	H	1Et-5-Ind	H	C		440 (M^++1)
B-c-121	9-j	B-b-207		1PhEtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		454 (M^++1)
B-c-122	1-a	B-c-121		1PhEtO	H	1Me-4-Ind	H	C		426 (M^++1)
B-c-123	9-j	B-b-209		1PhEtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
B-c-124	1-a	B-c-123		1PhEtO	H	1Me-5-Idz	H	C		427 (M^++1)
B-c-125	9-j	B-b-211		1PhEtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		469 (M^++1)
B-c-126	1-a	B-c-125		1PhEtO	H	1Et-5-Idz	H	C		441 (M^++1)
B-c-127	9-j	B-b-213		1(2FPh)EtO	Et	2-Nap	H	C		469 (M^++1)
B-c-128	1-a	B-c-127		1(2FPh)EtO	H	2-Nap	H	C		441 (M^++1)
B-c-129	9-j	B-b-215		1(2FPh)EtO	Et	1Et-5-Ind	H	C		486 (M^++1)
B-c-130	1-a	B-c-129		1(2FPh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-c-131	9-j	B-b-217		1(2FPh)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		473 (M^++1)
B-c-132	1-a	B-c-131		1(2FPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-c-133	9-j	B-b-229		4Me,cHexO	Et	2-Nap	H	C		443 (M^++1)
B-c-134	1-a	B-c-133		4Me,cHexO	H	2-Nap	H	C		415 (M^++1)
B-c-135	9-j	B-b-231		4Me,cHexO	Et	1Et-5-Ind	H	C		460 (M^++1)
B-c-136	1-a	B-c-135		4Me,cHexO	H	1Et-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-c-137	9-j	B-b-233		4Me,cHexO	Et	1Me-5-Idz	H	C		447 (M^++1)
B-c-138	1-a	B-c-137		4Me,cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-c-139	9-j	B-b-235		4Me,cHexO	Et	5-BF	H	C		433 (M^++1)
B-c-140	1-a	B-c-139		4Me,cHexO	H	5-BF	H	C		405 (M^++1)

[0329] [表76]

Table-B-c-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-c-141	9-j	B-b-237		1IndanO	Et	2-Nap	H	C		463 (M^++1)
B-c-142	1-a	B-c-141		1IndanO	H	2-Nap	H	C		435 (M^++1)
B-c-143	9-j	B-b-239		1IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		466 (M^++1)
B-c-144	1-a	B-c-143		1IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-c-145	9-j	B-b-241		1IndanO	Et	1Me-4-Ind	H	C		466 (M^++1)
B-c-146	1-a	B-c-145		1IndanO	H	1Me-4-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-c-147	9-j	B-b-243		1IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		467 (M^++1)
B-c-148	1-a	B-c-147		1IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		439 (M^++1)
B-c-149	9-j	B-b-245		1IndanO	Et	6-Qu	H	C		464 (M^++1)
B-c-150	1-a	B-c-149		1IndanO	H	6-Qu	H	C		436 (M^++1)
B-c-151	9-j	B-b-247		2IndanO	Et	2-Nap	H	C		463 (M^++1)
B-c-152	1-a	B-c-151		2IndanO	H	2-Nap	H	C		435 (M^++1)
B-c-153	9-j	B-b-249		2IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		466 (M^++1)
B-c-154	1-a	B-c-153		2IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-c-155	9-j	B-b-251		2IndanO	Et	1Et-5-Ind	H	C		480 (M^++1)
B-c-156	1-a	B-c-155		2IndanO	H	1Et-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-c-157	9-j	B-b-253		2IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		467 (M^++1)
B-c-158	1-a	B-c-157		2IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		439 (M^++1)
B-c-159	9-j	B-b-255		2IndanO	Et	1Et-5-Idz	H	C		481 (M^++1)
B-c-160	1-a	B-c-159		2IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-c-161	9-j	B-b-257		2IndanO	Et	6-IQ	H	C		464 (M^++1)
B-c-162	1-a	B-c-161		2IndanO	H	6-IQ	H	C		436 (M^++1)
B-c-163	9-j	B-b-259		5OMe-2-IndanO	Et	2-Nap	H	C		493 (M^++1)
B-c-164	1-a	B-c-163		5OMe-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		465 (M^++1)
B-c-165	9-j	B-b-261		5OMe-2-IndanO	Et	1Et-5-Ind	H	C		510 (M^++1)
B-c-166	1-a	B-c-165		5OMe-2-IndanO	H	1Et-5-Ind	H	C		482 (M^++1)
B-c-167	9-j	B-b-263		5OMe-2-IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		497 (M^++1)
B-c-168	1-a	B-c-167		5OMe-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		469 (M^++1)
B-c-169	9-j	B-b-267		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		526 (M^++1)
B-c-170	1-a	B-c-169		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		498 (M^++1)
B-c-171	9-j	B-b-269		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	1Me-4-Ind	H	C		526 (M^++1)
B-c-172	1-a	B-c-171		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-4-Ind	H	C		498 (M^++1)
B-c-173	9-j	B-b-271		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	1Et-5-Idz	H	C		541 (M^++1)
B-c-174	1-a	B-c-173		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		513 (M^++1)
B-c-175	9-j	B-b-273		5,6D(OMe)-2-IndanO	Et	6-IQ	H	C		524 (M^++1)
B-c-176	1-a	B-c-175		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	6-IQ	H	C		496 (M^++1)
B-c-177	9-j	B-b-275		5F-2-IndanO	Et	2-Nap	H	C		481 (M^++1)
B-c-178	1-a	B-c-177		5F-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		453 (M^++1)
B-c-179	9-j	B-b-277		5F-2-IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		484 (M^++1)
B-c-180	1-a	B-c-179		5F-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-c-181	9-j	B-b-279		5F-2-IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		485 (M^++1)
B-c-182	1-a	B-c-181		5F-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		457 (M^++1)
B-c-183	9-j	B-b-281		5F-2-IndanO	Et	1Et-5-Idz	H	C		499 (M^++1)
B-c-184	1-a	B-c-183		5F-2-IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		471 (M^++1)
B-c-185	9-j	B-b-283			Et	2-Nap	H	C		477 (M^++1)
B-c-186	1-a	B-c-185			H	2-Nap	H	C		449 (M^++1)

[0330] [表77]

Table-B-c-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-c-187	9-j	B-b-285			Et	1Me-5-Ind	H	C		480 (M^++1)
B-c-188	1-a	B-c-187			H	1Me-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-c-189	9-j	B-b-287			Et	1Me-6-Ind	H	C		480 (M^++1)
B-c-190	1-a	B-c-189			H	1Me-6-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-c-191	9-j	B-b-289			Et	1Me-5-Idz	H	C		481 (M^++1)
B-c-192	1-a	B-c-191			H	1Me-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-c-193	9-j	B-b-291			Et	6-Qu	H	C		478 (M^++1)
B-c-194	1-a	B-c-193			H	6-Qu	H	C		450 (M^++1)
B-c-195	9-j	B-b-293			Et	1Me-5-Ind	H	C		480 (M^++1)
B-c-196	1-a	B-c-195			H	1Me-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-c-197	9-j	B-b-295			Et	1Et-5-Ind	H	C		494 (M^++1)
B-c-198	1-a	B-c-197			H	1Et-5-Ind	H	C		466 (M^++1)
B-c-199	9-j	B-b-297			Et	1Me-4-Ind	H	C		480 (M^++1)
B-c-200	1-a	B-c-199			H	1Me-4-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-c-201	9-j	B-b-299			Et	1Et-5-Idz	H	C		495 (M^++1)
B-c-202	1-a	B-c-201			H	1Et-5-Idz	H	C		467 (M^++1)
B-c-203	9-j	B-b-303		2(2MePh)EtO	Et	2-Nap	H	C		465 (M^++1)
B-c-204	1-a	B-c-203		2(2MePh)EtO	H	2-Nap	H	C		437 (M^++1)
B-c-205	9-j	B-b-305		2(2MePh)EtO	Et	1Et-5-Ind	H	C		482 (M^++1)
B-c-206	1-a	B-c-205		2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		454 (M^++1)
B-c-207	9-j	B-b-307		2(2MePh)EtO	Et	1Me-6-Ind	H	C		468 (M^++1)
B-c-208	1-a	B-c-207		2(2MePh)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		440 (M^++1)
B-c-209	9-j	B-b-309		2(2MePh)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		483 (M^++1)
B-c-210	1-a	B-c-209		2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
B-c-211	9-j	B-b-311		2(3FPh)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		472 (M^++1)
B-c-212	1-a	B-c-211		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-c-213	9-j	B-b-313		2(3FPh)EtO	Et	1Me-4-Ind	H	C		472 (M^++1)
B-c-214	1-a	B-c-213		2(3FPh)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-c-215	9-j	B-b-315		2(3FPh)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		473 (M^++1)
B-c-216	1-a	B-c-215		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-c-217	9-j	B-b-317		2(3FPh)EtO	Et	6-IQ	H	C		470 (M^++1)
B-c-218	1-a	B-c-217		2(3FPh)EtO	H	6-IQ	H	C		442 (M^++1)
B-c-219	9-j	B-b-331		2(1-NapEt)O	Et	2-Nap	H	C		501 (M^++1)
B-c-220	1-a	B-c-219		2(1-NapEt)O	H	2-Nap	H	C		473 (M^++1)

[0331] [表78]

Table-B-c-6

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-c-221	9-j	B-b-333		2(1-NapEt)O	Et	1Me-5-Ind	H	C		504 (M^++1)
B-c-222	1-a	B-c-221		2(1-NapEt)O	H	1Me-5-Ind	H	C		476 (M^++1)
B-c-223	9-j	B-b-335		2(1-NapEt)O	Et	1Me-5-Idz	H	C		505 (M^++1)
B-c-224	1-a	B-c-223		2(1-NapEt)O	H	1Me-5-Idz	H	C		477 (M^++1)
B-c-225	9-j	B-b-337		2(1-NapEt)O	Et	6-Qu	H	C		502 (M^++1)
B-c-226	1-a	B-c-225		2(1-NapEt)O	H	6-Qu	H	C		474 (M^++1)
B-c-227	9-j	B-b-341		2(PhS)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		486 (M^++1)
B-c-228	1-a	B-c-227		2(PhS)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-c-229	9-j	B-b-343		2(PhS)EtO	Et	1Me-6-Ind	H	C		486 (M^++1)
B-c-230	1-a	B-c-229		2(PhS)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-c-231	9-j	B-b-345		2(PhS)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		501 (M^++1)
B-c-232	1-a	B-c-231		2(PhS)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		473 (M^++1)

[0332] 実施例B－d－1

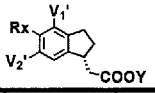
(R)－2－[5－シクロペンチルオキシ－4－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸の合成(化合物番号B－d－1)の合成

実施例化合物B－c－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物(化合物番号B－d－1;18mg)を得た。

上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－B－d－1からTable－B－d－3に示す。化合物の製造は、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお、「Syn」の欄が空欄の場合には、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。

[0333] [表79]

Table-B-d-1



Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-d-1		B-c-2		cPenO	H	2-Nap	H	C		387 (M^++1)
B-d-2		B-c-4		cPenO	H	1Me-5-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-d-3		B-c-6		cPenO	H	1Et-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-d-4		B-c-8		cPenO	H	1Me-4-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-d-5		B-c-10		cPenO	H	1Me-6-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-d-6		B-c-12		cPenO	H	1Me-5-Idz	H	C		391 (M^++1)
B-d-7		B-c-14		cPenO	H	1Et-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-d-8		B-c-16		cPenO	H	5-BF	H	C		377 (M^++1)
B-d-9		B-c-18		cPenO	H	6-Qu	H	C		388 (M^++1)
B-d-10		B-c-20		cPenO	H	6-IQ	H	C		388 (M^++1)
B-d-11		B-c-22		cPenMeO	H	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
B-d-12		B-c-24		cPenMeO	H	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-d-13		B-c-26		cPenMeO	H	1Me-6-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-d-14		B-c-28		cPenMeO	H	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-d-15		B-c-30		cPenMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-d-16		B-c-32		cPenMeO	H	6-Qu	H	C		402 (M^++1)
B-d-17		B-c-34		cHexMeO	H	2-Nap	H	C		415 (M^++1)
B-d-18		B-c-36		cHexMeO	H	1Et-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-d-19		B-c-38		cHexMeO	H	1Me-4-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-d-20		B-c-40		cHexMeO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-d-21		B-c-42		cHexMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
B-d-22		B-c-44		cHexMeO	H	5-BF	H	C		405 (M^++1)
B-d-23		B-c-48		cHexO	H	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
B-d-24		B-c-50		cHexO	H	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-d-25		B-c-52		cHexO	H	1Me-4-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-d-26		B-c-54		cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-d-27		B-c-56		cHexO	H	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-d-28		B-c-58		cHepO	H	2-Nap	H	C		415 (M^++1)
B-d-29		B-c-60		cHepO	H	1Me-5-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-d-30		B-c-62		cHepO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-d-31		B-c-64		cHepO	H	6-IQ	H	C		416 (M^++1)
B-d-32		B-c-66		nPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-d-33		B-c-68		nPrO	H	1Et-5-Idz	H	C		379 (M^++1)
B-d-34		B-c-70		nPrO	H	6-Qu	H	C		362 (M^++1)
B-d-35		B-c-72		iPrO	H	2-Nap	H	C		361 (M^++1)
B-d-36		B-c-74		iPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-d-37		B-c-76		iPrO	H	1Me-5-Idz	H	C		365 (M^++1)
B-d-38		B-c-80		nBuO	H	2-Nap	H	C		375 (M^++1)
B-d-39		B-c-82		nBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-d-40		B-c-84		nBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		393 (M^++1)
B-d-41		B-c-86		iBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-d-42		B-c-88		iBuO	H	1Et-5-Ind	H	C		392 (M^++1)
B-d-43		B-c-90		iBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		379 (M^++1)
B-d-44		B-c-92		iBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		393 (M^++1)

[0334] [表80]

Table-B-d-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-d-45		B-c-94		2EtBuO	H	2-Nap	H	C		403 (M^++1)
B-d-46		B-c-96		2EtBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		406 (M^++1)
B-d-47		B-c-98		2EtBuO	H	1Et-5-Ind	H	C		420 (M^++1)
B-d-48		B-c-100		2EtBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		407 (M^++1)
B-d-49		B-c-102		2EtBuO	H	6-IQ	H	C		404 (M^++1)
B-d-50		B-c-104		2(4DMAPh)EtO	H	2-Nap	H	C		466 (M^++1)
B-d-51		B-c-106		2(4DMAPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		469 (M^++1)
B-d-52		B-c-110		2(4DMAPh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		484 (M^++1)
B-d-53		B-c-112		2(PhO)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-d-54		B-c-114		2(PhO)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-d-55		B-c-116		2(PhO)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		443 (M^++1)
B-d-56		B-c-118		1PhEtO	H	2-Nap	H	C		423 (M^++1)
B-d-57		B-c-120		1PhEtO	H	1Et-5-Ind	H	C		440 (M^++1)
B-d-58		B-c-124		1PhEtO	H	1Me-5-Idz	H	C		427 (M^++1)
B-d-59		B-c-128		1(2FPh)EtO	H	2-Nap	H	C		441 (M^++1)
B-d-60		B-c-130		1(2FPh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-d-61		B-c-136		4Me,cHexO	H	1Et-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-d-62		B-c-138		4Me,cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-d-63		B-c-140		4Me,cHexO	H	5-BF	H	C		405 (M^++1)
B-d-64		B-c-142		1IndanO	H	2-Nap	H	C		435 (M^++1)
B-d-65		B-c-144		1IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-d-66		B-c-146		1IndanO	H	1Me-4-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-d-67		B-c-148		1IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		439 (M^++1)
B-d-68		B-c-150		1IndanO	H	6-Qu	H	C		436 (M^++1)
B-d-69		B-c-154		2IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-d-70		B-c-156		2IndanO	H	1Et-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-d-71		B-c-158		2IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		439 (M^++1)
B-d-72		B-c-160		2IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-d-73		B-c-164		5OMe-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		465 (M^++1)
B-d-74		B-c-166		5OMe-2-IndanO	H	1Et-5-Ind	H	C		482 (M^++1)
B-d-75		B-c-168		5OMe-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		469 (M^++1)
B-d-76		B-c-170		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		498 (M^++1)
B-d-77		B-c-172		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-4-Ind	H	C		498 (M^++1)
B-d-78		B-c-176		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	6-IQ	H	C		496 (M^++1)
B-d-79		B-c-178		5F-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		453 (M^++1)
B-d-80		B-c-180		5F-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-d-81		B-c-182		5F-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		457 (M^++1)
B-d-82		B-c-184		5F-2-IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		471 (M^++1)
B-d-83		B-c-186			H	2-Nap	H	C		449 (M^++1)
B-d-84		B-c-190			H	1Me-6-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-d-85		B-c-192			H	1Me-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-d-86		B-c-196			H	1Me-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-d-87		B-c-202			H	1Et-5-Idz	H	C		467 (M^++1)

[0335] [表81]

Table-B-d-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-d-88		B-c-204		2(2MePh)EtO	H	2-Nap	H	C		437 (M^++1)
B-d-89		B-c-206		2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		454 (M^++1)
B-d-90		B-c-210		2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
B-d-91		B-c-212		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-d-92		B-c-214		2(3FPh)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-d-93		B-c-216		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-d-94		B-c-220		2(1-NapEt)O	H	2-Nap	H	C		473 (M^++1)
B-d-95		B-c-222		2(1-NapEt)O	H	1Me-5-Ind	H	C		476 (M^++1)
B-d-96		B-c-224		2(1-NapEt)O	H	1Me-5-Idz	H	C		477 (M^++1)
B-d-97		B-c-226		2(1-NapEt)O	H	6-Qu	H	C		474 (M^++1)
B-d-98		B-c-228		2(PhS)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-d-99		B-c-230		2(PhS)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-d-100		B-c-232		2(PhS)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		473 (M^++1)

[0336] 実施例B－e－1

(S)－2－[5－シクロペンチルオキシ－4－(ナフタレン－2－イル)－2,3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸の合成(化合物番号B－e－1)の合成

実施例化合物B－c－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物(化合物番号B－e－1;19.2mg)を得た。

上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－B－e－1からTable－B－e－3に示す。化合物の製造は、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお、「Syn」の欄が空欄の場合には、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。

[0337] [表82]

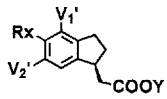


Table-B-e-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-e-1		B-c-2		cPenO	H	2-Nap	H	C		387 (M^++1)
B-e-2		B-c-4		cPenO	H	1Me-5-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-e-3		B-c-6		cPenO	H	1Et-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-e-4		B-c-8		cPenO	H	1Me-4-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-e-5		B-c-10		cPenO	H	1Me-6-Ind	H	C		390 (M^++1)
B-e-6		B-c-12		cPenO	H	1Me-5-Idz	H	C		391 (M^++1)
B-e-7		B-c-14		cPenO	H	1Et-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-e-8		B-c-16		cPenO	H	5-BF	H	C		377 (M^++1)
B-e-9		B-c-18		cPenO	H	6-Qu	H	C		388 (M^++1)
B-e-10		B-c-20		cPenO	H	6-IQ	H	C		388 (M^++1)
B-e-11		B-c-22		cPenMeO	H	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
B-e-12		B-c-24		cPenMeO	H	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-e-13		B-c-26		cPenMeO	H	1Me-6-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-e-14		B-c-28		cPenMeO	H	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-e-15		B-c-30		cPenMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-e-16		B-c-32		cPenMeO	H	6-Qu	H	C		402 (M^++1)
B-e-17		B-c-34		cHexMeO	H	2-Nap	H	C		415 (M^++1)
B-e-18		B-c-36		cHexMeO	H	1Et-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-e-19		B-c-38		cHexMeO	H	1Me-4-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-e-20		B-c-40		cHexMeO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-e-21		B-c-42		cHexMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
B-e-22		B-c-44		cHexMeO	H	5-BF	H	C		405 (M^++1)
B-e-23		B-c-48		cHexO	H	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
B-e-24		B-c-50		cHexO	H	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-e-25		B-c-52		cHexO	H	1Me-4-Ind	H	C		404 (M^++1)
B-e-26		B-c-54		cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
B-e-27		B-c-56		cHexO	H	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-e-28		B-c-58		cHepO	H	2-Nap	H	C		415 (M^++1)
B-e-29		B-c-60		cHepO	H	1Me-5-Ind	H	C		418 (M^++1)
B-e-30		B-c-62		cHepO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-e-31		B-c-64		cHepO	H	6-IQ	H	C		416 (M^++1)
B-e-32		B-c-66		nPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-e-33		B-c-68		nPrO	H	1Et-5-Idz	H	C		379 (M^++1)
B-e-34		B-c-70		nPrO	H	6-Qu	H	C		362 (M^++1)
B-e-35		B-c-72		iPrO	H	2-Nap	H	C		361 (M^++1)
B-e-36		B-c-74		iPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-e-37		B-c-76		iPrO	H	1Me-5-Idz	H	C		365 (M^++1)
B-e-38		B-c-80		nBuO	H	2-Nap	H	C		375 (M^++1)
B-e-39		B-c-82		nBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-e-40		B-c-84		nBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		393 (M^++1)
B-e-41		B-c-86		iBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		378 (M^++1)
B-e-42		B-c-88		iBuO	H	1Et-5-Ind	H	C		392 (M^++1)
B-e-43		B-c-90		iBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		379 (M^++1)
B-e-44		B-c-92		iBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		393 (M^++1)

[0338] [表83]

Table-B-e-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-e-45		B-c-94		2EtBuO	H	2-Nap	H	C		403 (M^++1)
B-e-46		B-c-96		2EtBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		406 (M^++1)
B-e-47		B-c-98		2EtBuO	H	1Et-5-Ind	H	C		420 (M^++1)
B-e-48		B-c-100		2EtBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		407 (M^++1)
B-e-49		B-c-102		2EtBuO	H	6-IQ	H	C		404 (M^++1)
B-e-50		B-c-104		2(4DMAPh)EtO	H	2-Nap	H	C		466 (M^++1)
B-e-51		B-c-106		2(4DMAPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		469 (M^++1)
B-e-52		B-c-110		2(4DMAPh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		484 (M^++1)
B-e-53		B-c-112		2(PhO)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-e-54		B-c-114		2(PhO)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		442 (M^++1)
B-e-55		B-c-116		2(PhO)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		443 (M^++1)
B-e-56		B-c-118		1PhEtO	H	2-Nap	H	C		423 (M^++1)
B-e-57		B-c-120		1PhEtO	H	1Et-5-Ind	H	C		440 (M^++1)
B-e-58		B-c-124		1PhEtO	H	1Me-5-Idz	H	C		427 (M^++1)
B-e-59		B-c-128		1(2FPh)EtO	H	2-Nap	H	C		441 (M^++1)
B-e-60		B-c-130		1(2FPh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-e-61		B-c-136		4Me,cHexO	H	1Et-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
B-e-62		B-c-138		4Me,cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
B-e-63		B-c-140		4Me,cHexO	H	5-BF	H	C		405 (M^++1)
B-e-64		B-c-142		1IndanO	H	2-Nap	H	C		435 (M^++1)
B-e-65		B-c-144		1IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-e-66		B-c-146		1IndanO	H	1Me-4-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-e-67		B-c-148		1IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		439 (M^++1)
B-e-68		B-c-150		1IndanO	H	6-Qu	H	C		436 (M^++1)
B-e-69		B-c-154		2IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		438 (M^++1)
B-e-70		B-c-156		2IndanO	H	1Et-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-e-71		B-c-158		2IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		439 (M^++1)
B-e-72		B-c-160		2IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-e-73		B-c-164		5OMe-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		465 (M^++1)
B-e-74		B-c-166		5OMe-2-IndanO	H	1Et-5-Ind	H	C		482 (M^++1)
B-e-75		B-c-168		5OMe-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		469 (M^++1)
B-e-76		B-c-170		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		498 (M^++1)
B-e-77		B-c-172		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	1Me-4-Ind	H	C		498 (M^++1)
B-e-78		B-c-176		5,6D(OMe)-2-IndanO	H	6-IQ	H	C		496 (M^++1)
B-e-79		B-c-178		5F-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		453 (M^++1)
B-e-80		B-c-180		5F-2-IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		456 (M^++1)
B-e-81		B-c-182		5F-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		457 (M^++1)
B-e-82		B-c-184		5F-2-IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		471 (M^++1)
B-e-83		B-c-186			H	2-Nap	H	C		449 (M^++1)
B-e-84		B-c-190			H	1Me-6-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-e-85		B-c-192			H	1Me-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
B-e-86		B-c-196			H	1Me-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
B-e-87		B-c-202			H	1Et-5-Idz	H	C		467 (M^++1)

[0339] [表84]

Table-B-e-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
B-e-88		B-c-204		2(2MePh)EtO	H	2-Nap	H	C		437 (M^++1)
B-e-89		B-c-206		2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Ind	H	C		454 (M^++1)
B-e-90		B-c-210		2(2MePh)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
B-e-91		B-c-212		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-e-92		B-c-214		2(3FPh)EtO	H	1Me-4-Ind	H	C		444 (M^++1)
B-e-93		B-c-216		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		445 (M^++1)
B-e-94		B-c-220		2(1-NapEt)O	H	2-Nap	H	C		473 (M^++1)
B-e-95		B-c-222		2(1-NapEt)O	H	1Me-5-Ind	H	C		476 (M^++1)
B-e-96		B-c-224		2(1-NapEt)O	H	1Me-5-Idz	H	C		477 (M^++1)
B-e-97		B-c-226		2(1-NapEt)O	H	6-Qu	H	C		474 (M^++1)
B-e-98		B-c-228		2(PhS)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-e-99		B-c-230		2(PhS)EtO	H	1Me-6-Ind	H	C		458 (M^++1)
B-e-100		B-c-232		2(PhS)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		473 (M^++1)

[0340] 参考例12

2－[6－(ナフタレン－2－イル)－5－トリフルオロメタンスルフォニル－2,3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(中間体c－a－1)の合成(製造法5工程g)

中間体A－22(973.5mg)の脱水ピリジン溶液(15ml)に無水トリフルオロメタンスルホン酸(543ul、ALD)を氷冷下加え、その後室温まで昇温し、2時間半撹拌した。反応混合液を減圧下濃縮した後、酢酸エチル(800ml)で抽出し、有機層を1N塩酸、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル＝9:1)で精製し、標記化合物(中間体c－a－1;839.5mg)を得た。

上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int.C－a－1からTable－Int.C－a－3に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。

[0341] [表85]

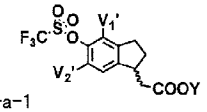


Table-C-a-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.c-a-2	5-g	Int.A-23		Et	H	5-Ind	C		468 (M^++1)
Int.c-a-3	5-g	Int.A-24		Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
Int.c-a-4	5-g	Int.A-25		Et	H	5-1Idz	C		469 (M^++1)
Int.c-a-5	5-g	Int.A-26		Et	H	1Me-5-Idz	C		443 (M^++1)
Int.c-a-6	5-g	Int.A-27		Et	H	1Et-5-Idz	C		497 (M^++1)
Int.c-a-7	5-g	Int.A-28		Et	H	5-BF	C		469 (M^++1)
Int.c-a-8	5-g	Int.A-29		Et	H	6-Qu	C		480 (M^++1)

[0342] [表86]

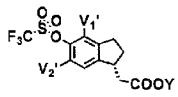


Table-C-b-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.c-b-1	5-g	Int.A-106		Et	H	2-Nap	C		479 (M^++1)
Int.c-b-2	5-g	Int.A-107		Et	H	5-Ind	C		468 (M^++1)
Int.c-b-3	5-g	Int.A-108		Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
Int.c-b-4	5-g	Int.A-109		Et	H	5-1Idz	C		469 (M^++1)
Int.c-b-5	5-g	Int.A-110		Et	H	1Me-5-Idz	C		443 (M^++1)
Int.c-b-6	5-g	Int.A-111		Et	H	1Et-5-Idz	C		497 (M^++1)
Int.c-b-7	5-g	Int.A-112		Et	H	5-BF	C		469 (M^++1)
Int.c-b-8	5-g	Int.A-113		Et	H	6-Qu	C		480 (M^++1)

[0343] [表87]

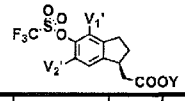


Table-C-c-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.c-c-1	5-g	Int.A-206		Et	H	2-Nap	C		479 (M^++1)
Int.c-c-2	5-g	Int.A-207		Et	H	5-Ind	C		468 (M^++1)
Int.c-c-3	5-g	Int.A-208		Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
Int.c-c-4	5-g	Int.A-209		Et	H	5-1Idz	C		469 (M^++1)
Int.c-c-5	5-g	Int.A-210		Et	H	1Me-5-Idz	C		443 (M^++1)
Int.c-c-6	5-g	Int.A-211		Et	H	1Et-5-Idz	C		497 (M^++1)
Int.c-c-7	5-g	Int.A-212		Et	H	5-BF	C		469 (M^++1)
Int.c-c-8	5-g	Int.A-213		Et	H	6-Qu	C		480 (M^++1)

[0344] 実施例Ca－a－1

2－[6－(ナフタレン－2－イル)－5－フェニル－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号Ca－a－1)の合成(製造法5工程e)

中間体C－a－1(110. 4mg)、フェニルボロン酸(74. 3mg、Ald)、炭酸セシウム(254. 9mg)、$PdCl_2$(dppf)(27. 6mg)にトルエン(600μl)、メタノール(1. 2ml)、水(1. 2ml)を加え、窒素雰囲気下、90℃で15時間半撹拌した。反応混合液に酢酸エチル(30ml)を加え、水、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下

溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(Quad, ヘキサン:酢酸エチル=9:1)で精製し、標記化合物(化合物番号Ca－a－1;69. 4mg)を得た。

[0345] 実施例Ca－a－2

2－[6－(ナフタレン－2－イル)－5－フェニル－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号Ca－a－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って、実施例化合物Ca－a－1(63. 3mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(250μl)反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号Ca－a－2;53. 4mg)を得た。但し反応は2時間行った)。

上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－Ca－A－1からTable－Ca－A－14、Table－Ca－B－1からTable－Ca－B－11、Table－Ca－C－1からTable－Ca－C－11に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。また、「Syn」の欄が空欄のものはHPLCにて分取をすることで目的物を得たことを示す。

[0346] [表88]

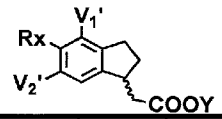


Table-Ca-A-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-1	5-e	Int.c-a-1	BRA14	Ph	Et	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-a-2	1-a	Ca-a-1		Ph	H	H	2-Nap	C		379 (M^++1)
Ca-a-3	5-e	Int.c-a-1	BRA15	2-MePh	Et	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-a-4	1-a	Ca-a-3		2-MePh	H	H	2-Nap	C		393 (M^++1)
Ca-a-5	5-e	Int.c-a-1	BRA16	3-MePh	Et	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-a-6	1-a	Ca-a-5		3-MePh	H	H	2-Nap	C		393 (M^++1)
Ca-a-7	5-e	Int.c-a-1	BRA17	4-MePh	Et	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-a-8	1-a	Ca-a-7		4-MePh	H	H	2-Nap	C		393 (M^++1)
Ca-a-9	5-e	Int.c-a-1	BRA18	2-EtPh	Et	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-a-10	1-a	Ca-a-9		2-EtPh	H	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-a-11	5-e	Int.c-a-1	BRA20	2-iPrPh	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
Ca-a-12	1-a	Ca-a-11		2-iPrPh	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-a-13	5-e	Int.c-a-1	BRA21	4-iPrPh	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
Ca-a-14	1-a	Ca-a-13		4-iPrPh	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-a-15	5-e	Int.c-a-1	BRA22	1-nBuPh	Et	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
Ca-a-16	1-a	Ca-a-15		1-nBuPh	H	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-a-17	5-e	Int.c-a-1	BRA24	2-MeOPh	Et	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-a-18	1-a	Ca-a-17		2-MeOPh	H	H	2-Nap	C		409 (M^++1)
Ca-a-19	5-e	Int.c-a-1	BRA25	3-MeOPh	Et	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-a-20	1-a	Ca-a-19		3-MeOPh	H	H	2-Nap	C		409 (M^++1)
Ca-a-21	5-e	Int.c-a-1	BRA27	2-EtOPh	Et	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-a-22	1-a	Ca-a-21		2-EtOPh	H	H	2-Nap	C		423 (M^++1)
Ca-a-23	5-e	Int.c-a-1	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
Ca-a-24	1-a	Ca-a-23		4-iPrOPh	H	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-a-25	5-e	Int.c-a-1	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
Ca-a-26	1-a	Ca-a-25		3-nPrOPh	H	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-a-27	5-e	Int.c-a-1	BRA34	4-nBuOPh	Et	H	2-Nap	C		479 (M^++1)
Ca-a-28	1-a	Ca-a-27		4-nBuOPh	H	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-a-29	5-e	Int.c-a-1	BRA36	4-DMAPh	Et	H	2-Nap	C		450 (M^++1)
Ca-a-30	1-a	Ca-a-29		4-DMAPh	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
Ca-a-31	5-e	Int.c-a-1	BRA37	2-FPh	Et	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-a-32	1-a	Ca-a-31		2-FPh	H	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-a-33	5-e	Int.c-a-1	BRA38	3-FPh	Et	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-a-34	1-a	Ca-a-33		3-FPh	H	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-a-35	5-e	Int.c-a-1	BRA39	4-FPh	Et	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-a-36	1-a	Ca-a-35		4-FPh	H	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-a-37	5-e	Int.c-a-1	BRA40	2-ClPh	Et	H	2-Nap	C		441 (M^++1)
Ca-a-38	1-a	Ca-a-37		2-ClPh	H	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-a-39	5-e	Int.c-a-1	BRA42	4-ClPh	Et	H	2-Nap	C		441 (M^++1)
Ca-a-40	1-a	Ca-a-39		4-ClPh	H	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-a-41	5-e	Int.c-a-1	BRA44	3-CF3Ph	Et	H	2-Nap	C		475 (M^++1)
Ca-a-42	1-a	Ca-a-41		3-CF3Ph	H	H	2-Nap	C		447 (M^++1)
Ca-a-43	5-e	Int.c-a-1	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)

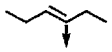
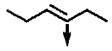
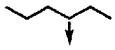
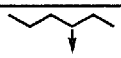
[0347] [表89]

Table-Ca-A-2

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-44	1-a	Ca-a-43		2,3-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-a-45	5-e	Int.c-a-1	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
Ca-a-46	1-a	Ca-a-45		2,4-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-a-47	5-e	Int.c-a-1	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
Ca-a-48	1-a	Ca-a-47		2,6-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-a-49	5-e	Int.c-a-1	BRA50	3,4-DFPh	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
Ca-a-50	1-a	Ca-a-49		3,4-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-a-51	5-e	Int.c-a-1	BRA51	3,5-DFPh	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
Ca-a-52	1-a	Ca-a-51		3,5-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-a-53	5-e	Int.c-a-1	BRA52	2,4-DClPh	Et	H	2-Nap	C		476 (M^++1)
Ca-a-54	1-a	Ca-a-53		2,4-DClPh	H	H	2-Nap	C		448 (M^++1)
Ca-a-55	5-e	Int.c-a-1	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	2-Nap	C		476 (M^++1)
Ca-a-56	1-a	Ca-a-55		3,4-DClPh	H	H	2-Nap	C		448 (M^++1)
Ca-a-57	5-e	Int.c-a-1	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-a-58	1-a	Ca-a-57		2,3-DMePh	H	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-a-59	5-e	Int.c-a-1	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-a-60	1-a	Ca-a-59		2,4-DMePh	H	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-a-61	5-e	Int.c-a-1	BRA58	2-Furan	Et	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-a-62	1-a	Ca-a-61		2-Furan	H	H	2-Nap	C		369 (M^++1)
Ca-a-63	5-e	Int.c-a-1	BRA59	3-Furan	Et	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-a-64	1-a	Ca-a-63		3-Furan	H	H	2-Nap	C		369 (M^++1)
Ca-a-65	5-e	Int.c-a-1	BRA60	2-Thiophene	Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-a-66	1-a	Ca-a-65		2-Thiophene	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-a-67	5-e	Int.c-a-1	BRA61	3-Thiophene	Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-a-68	1-a	Ca-a-67		3-Thiophene	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-a-69	5-e	Int.c-a-1	BRA62	3-Pyridine	Et	H	2-Nap	C		408 (M^++1)
Ca-a-70	1-a	Ca-a-69		3-Pyridine	H	H	2-Nap	C		380 (M^++1)
Ca-a-71	5-e	Int.c-a-1	BRA63	4-Pyridine	Et	H	2-Nap	C		408 (M^++1)
Ca-a-72	1-a	Ca-a-71		4-Pyridine	H	H	2-Nap	C		380 (M^++1)
Ca-a-73	5-e	Int.c-a-1	BRA65	4-PhPh	Et	H	2-Nap	C		483 (M^++1)
Ca-a-74	1-a	Ca-a-73		4-PhPh	H	H	2-Nap	C		455 (M^++1)
Ca-a-75	5-e	Int.c-a-1	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-a-76	1-a	Ca-a-75		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-a-77	9-j	Ca-a-75		nHex-	Et	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-a-78	1-a	Ca-a-77		nHex-	H	H	2-Nap	C		387 (M^++1)
Ca-a-79	5-e	Int.c-a-1	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-a-80	1-a	Ca-a-79		4FPhCH=CH-	H	H	2-Nap	C		423 (M^++1)
Ca-a-81	9-j	Ca-a-79		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	2-Nap	C		453 (M^++1)
Ca-a-82	1-a	Ca-a-80		$4FPhC_2H_4-$	H	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-a-83	5-e	Int.c-a-1	BRA68	4ClPhCH=CH-	Et	H	2-Nap	C		468 (M^++1)
Ca-a-84	1-a	Ca-a-80		4ClPhCH=CH-	H	H	2-Nap	C		439 (M^++1)
Ca-a-85	5-e	Int.c-a-1	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	2-Nap	C		447 (M^++1)
Ca-a-86	1-a	Ca-a-85		4MePhCH=CH-	H	H	2-Nap	C		419 (M^++1)
Ca-a-87	9-j	Ca-a-85		$4MePhC_2H_4-$	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
Ca-a-88	1-a	Ca-a-87		$4MePhC_2H_4-$	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-a-89	5-e	Int.c-a-1	BRA72	$MeOCH_2CH=CH-$	Et	H	2-Nap	C		401 (M^++1)
Ca-a-90	1-a	Ca-a-89		$MeOCH_2CH=CH-$	H	H	2-Nap	C		373 (M^++1)

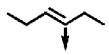
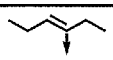
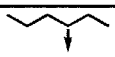
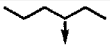
[0348] [表90]

Table-Ca-A-3

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-91	9-j	Ca-a-89		$MeOCH_2C_2H_4$-	Et	H	2-Nap	C		403 (M^++1)
Ca-a-92	1-a	Ca-a-91		$MeOCH_2C_2H_4$-	H	H	2-Nap	C		375 (M^++1)
Ca-a-93	5-e	Int.c-a-1	BRA73		Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-a-94	1-a	Ca-a-93			H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-a-95	9-j	Ca-a-93			Et	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-a-96	1-a	Ca-a-71			H	H	2-Nap	C		387 (M^++1)
Ca-a-97	5-e	Int.c-a-2	BRA14	Ph	Et	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-a-98	1-a	Ca-a-97		Ph	H	H	5-Ind	C		368 (M^++1)
Ca-a-99	5-e	Int.c-a-2	BRA16	3-MePh	Et	H	5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-a-100	1-a	Ca-a-99		3-MePh	H	H	5-Ind	C		382 (M^++1)
Ca-a-101	5-e	Int.c-a-2	BRA18	2-EtPh	Et	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-a-102	1-a	Ca-a-101		2-EtPh	H	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-a-103	5-e	Int.c-a-2	BRA19	4-EtPh	Et	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-a-104	1-a	Ca-a-103		4-EtPh	H	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-a-105	5-e	Int.c-a-2	BRA20	2-iPrPh	Et	H	5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-a-106	1-a	Ca-a-105		2-iPrPh	H	H	5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-a-107	5-e	Int.c-a-2	BRA23	4-tBuPh	Et	H	5-Ind	C		452 (M^++1)
Ca-a-108	1-a	Ca-a-107		4-tBuPh	H	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-a-109	5-e	Int.c-a-2	BRA25	3-MeOPh	Et	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-a-110	1-a	Ca-a-109		3-MeOPh	H	H	5-Ind	C		398 (M^++1)
Ca-a-111	5-e	Int.c-a-2	BRA26	4-MeOPh	Et	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-a-112	1-a	Ca-a-111		4-MeOPh	H	H	5-Ind	C		398 (M^++1)
Ca-a-113	5-e	Int.c-a-2	BRA28	3-EtOPh	Et	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-a-114	1-a	Ca-a-113		3-EtOPh	H	H	5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-a-115	5-e	Int.c-a-2	BRA29	3-iPrOPh	Et	H	5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-a-116	1-a	Ca-a-115		3-iPrOPh	H	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-a-117	5-e	Int.c-a-2	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-a-118	1-a	Ca-a-116		3-nPrOPh	H	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-a-119	5-e	Int.c-a-2	BRA32	4-nPrOPh	Et	H	5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-a-120	1-a	Ca-a-120		4-nPrOPh	H	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-a-121	5-e	Int.c-a-2	BRA33	3-nBuOPh	Et	H	5-Ind	C		468 (M^++1)
Ca-a-122	1-a	Ca-a-122		3-nBuOPh	H	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-a-123	5-e	Int.c-a-2	BRA36	4-DMAPh	Et	H	5-Ind	C		439 (M^++1)
Ca-a-124	1-a	Ca-a-123		4-DMAPh	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
Ca-a-125	5-e	Int.c-a-2	BRA37	2-FPh	Et	H	5-Ind	C		414 (M^++1)
Ca-a-126	1-a	Ca-a-125		2-FPh	H	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-a-127	5-e	Int.c-a-2	BRA38	3-FPh	Et	H	5-Ind	C		414 (M^++1)
Ca-a-128	1-a	Ca-a-127		3-FPh	H	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-a-129	5-e	Int.c-a-2	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-Ind	C		430 (M^++1)
Ca-a-130	1-a	Ca-a-129		3-ClPh	H	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-a-131	5-e	Int.c-a-2	BRA42	4-ClPh	Et	H	5-Ind	C		430 (M^++1)
Ca-a-132	1-a	Ca-a-131		4-ClPh	H	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-a-133	5-e	Int.c-a-2	BRA43	2-CF3Ph	Et	H	5-Ind	C		464 (M^++1)
Ca-a-134	1-a	Ca-a-133		2-CF3Ph	H	H	5-Ind	C		436 (M^++1)
Ca-a-135	5-e	Int.c-a-2	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	5-Ind	C		464 (M^++1)

[0349] [表91]

Table-Ca-A-4

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-136	1-a	Ca-a-135		4-CF3Ph	H	H	5-Ind	C		436 (M^++1)
Ca-a-137	5-e	Int.c-a-2	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-a-138	1-a	Ca-a-137		2,4-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-a-139	5-e	Int.c-a-2	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-a-140	1-a	Ca-a-139		2,5-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-a-141	5-e	Int.c-a-2	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-a-142	1-a	Ca-a-141		2,6-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-a-143	5-e	Int.c-a-2	BRA53	3,5-DClPh	Et	H	5-Ind	C		465 (M^++1)
Ca-a-144	1-a	Ca-a-143		3,5-DClPh	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
Ca-a-145	5-e	Int.c-a-2	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	5-Ind	C		465 (M^++1)
Ca-a-146	1-a	Ca-a-145		3,4-DClPh	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
Ca-a-147	5-e	Int.c-a-2	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-a-148	1-a	Ca-a-147		2,4-DMePh	H	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-a-149	5-e	Int.c-a-2	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-a-150	1-a	Ca-a-149		2,6-DMePh	H	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-a-151	5-e	Int.c-a-2	BRA58	2-Furan	Et	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-a-152	1-a	Ca-a-151		2-Furan	H	H	5-Ind	C		358 (M^++1)
Ca-a-153	5-e	Int.c-a-2	BRA59	3-Furan	Et	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-a-154	1-a	Ca-a-153		3-Furan	H	H	5-Ind	C		358 (M^++1)
Ca-a-155	5-e	Int.c-a-2	BRA60	2-Thiophene	Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-a-156	1-a	Ca-a-155		2-Thiophene	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-a-157	5-e	Int.c-a-2	BRA61	3-Thiophene	Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-a-158	1-a	Ca-a-157		3-Thiophene	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-a-159	5-e	Int.c-a-2	BRA63	4-Pyridine	Et	H	5-Ind	C		397 (M^++1)
Ca-a-160	1-a	Ca-a-159		4-Pyridine	H	H	5-Ind	C		369 (M^++1)
Ca-a-161	5-e	Int.c-a-2	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-a-162	1-a	Ca-a-161		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-a-163	5-e	Int.c-a-2	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-a-164	1-a	Ca-a-163		4FPhCH=CH-	H	H	5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-a-165	9-j	Ca-a-163		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	5-Ind	C		442 (M^++1)
Ca-a-166	1-a	Ca-a-165		$4FPhC_2H_4-$	H	H	5-Ind	C		414 (M^++1)
Ca-a-167	5-e	Int.c-a-2	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	5-Ind	C		436 (M^++1)
Ca-a-168	1-a	Ca-a-167		4MePhCH=CH-	H	H	5-Ind	C		408 (M^++1)
Ca-a-169	5-e	Int.c-a-2	BRA73		Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-a-170	1-a	Ca-a-169			H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-a-171	9-j	Ca-a-169			Et	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-a-172	1-a	Ca-a-171			H	H	5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-a-173	5-e	Int.c-a-3	BRA15	2-MePh	Et	H	1Me-5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-a-174	1-a	Ca-a-173		2-MePh	H	H	1Me-5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-a-175	5-e	Int.c-a-3	BRA17	4-MePh	Et	H	1Me-5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-a-176	1-a	Ca-a-175		4-MePh	H	H	1Me-5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-a-177	5-e	Int.c-a-3	BRA19	4-EtPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-a-178	1-a	Ca-a-177		4-EtPh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-a-179	5-e	Int.c-a-3	BRA21	4-iPrPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		452 (M^++1)

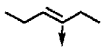
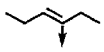
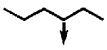
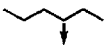
[0350] [表92]

Table-Ca-A-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-180	1-a	Ca-a-179		4-iPrPh	H	H	1Me-5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-a-181	5-e	Int.c-a-3	BRA22	1-nBuPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
Ca-a-182	1-a	Ca-a-181		1-nBuPh	H	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-a-183	5-e	Int.c-a-3	BRA24	2-MeOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-a-184	1-a	Ca-a-183		2-MeOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-a-185	5-e	Int.c-a-3	BRA26	4-MeOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-a-186	1-a	Ca-a-185		4-MeOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-a-187	5-e	Int.c-a-3	BRA27	2-EtOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-a-188	1-a	Ca-a-187		2-EtOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-a-189	5-e	Int.c-a-3	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
Ca-a-190	1-a	Ca-a-189		4-iPrOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-a-191	5-e	Int.c-a-3	BRA32	4-nPrOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
Ca-a-192	1-a	Ca-a-191		4-nPrOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-a-193	5-e	Int.c-a-3	BRA33	3-nBuOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
Ca-a-194	1-a	Ca-a-193		3-nBuOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-a-195	5-e	Int.c-a-3	BRA35	3-DMAPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		453 (M^++1)
Ca-a-196	1-a	Ca-a-195		3-DMAPh	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
Ca-a-197	5-e	Int.c-a-3	BRA37	2-FPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-a-198	1-a	Ca-a-197		2-FPh	H	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-a-199	5-e	Int.c-a-3	BRA38	3-FPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-a-200	1-a	Ca-a-199		3-FPh	H	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-a-201	5-e	Int.c-a-3	BRA39	4-FPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-a-202	1-a	Ca-a-201		4-FPh	H	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-a-203	5-e	Int.c-a-3	BRA40	2-ClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		444 (M^++1)
Ca-a-204	1-a	Ca-a-203		2-ClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-a-205	5-e	Int.c-a-3	BRA41	3-ClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		444 (M^++1)
Ca-a-206	1-a	Ca-a-205		3-ClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-a-207	5-e	Int.c-a-3	BRA44	3-CF3Ph	Et	H	1Me-5-Ind	C		478 (M^++1)
Ca-a-208	1-a	Ca-a-207		3-CF3Ph	H	H	1Me-5-Ind	C		450 (M^++1)
Ca-a-209	5-e	Int.c-a-3	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	1Me-5-Ind	C		478 (M^++1)
Ca-a-210	1-a	Ca-a-209		4-CF3Ph	H	H	1Me-5-Ind	C		450 (M^++1)
Ca-a-211	5-e	Int.c-a-3	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		446 (M^++1)
Ca-a-212	1-a	Ca-a-211		2,4-DFPh	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-a-213	5-e	Int.c-a-3	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		446 (M^++1)
Ca-a-214	1-a	Ca-a-213		2,5-DFPh	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-a-215	5-e	Int.c-a-3	BRA50	3,4-DFPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		446 (M^++1)
Ca-a-216	1-a	Ca-a-215		3,4-DFPh	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-a-217	5-e	Int.c-a-3	BRA52	2,4-DClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
Ca-a-218	1-a	Ca-a-217		2,4-DClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
Ca-a-219	5-e	Int.c-a-3	BRA53	3,5-DClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
Ca-a-220	1-a	Ca-a-219		3,5-DClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
Ca-a-221	5-e	Int.c-a-3	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
Ca-a-222	1-a	Ca-a-221		3,4-DClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
Ca-a-223	5-e	Int.c-a-3	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-a-224	1-a	Ca-a-223		2,4-DMePh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-a-225	5-e	Int.c-a-3	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-a-226	1-a	Ca-a-225		2,6-DMePh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)

[0351] [表93]

Table-Ca-A-6

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-227	5-e	Int.c-a-3	BRA59	3-Furan	Et	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-a-228	1-a	Ca-a-227		3-Furan	H	H	1Me-5-Ind	C		372 (M^++1)
Ca-a-229	5-e	Int.c-a-3	BRA60	2-Thiophene	Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-a-230	1-a	Ca-a-229		2-Thiophene	H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-a-231	5-e	Int.c-a-3	BRA61	3-Thiophene	Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-a-232	1-a	Ca-a-231		3-Thiophene	H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-a-233	5-e	Int.c-a-3	BRA63	4-Pyridine	Et	H	1Me-5-Ind	C		411 (M^++1)
Ca-a-234	1-a	Ca-a-233		4-Pyridine	H	H	1Me-5-Ind	C		383 (M^++1)
Ca-a-235	5-e	Int.c-a-3	BRA65	4-PhPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		486 (M^++1)
Ca-a-236	1-a	Ca-a-235		4-PhPh	H	H	1Me-5-Ind	C		458 (M^++1)
Ca-a-237	5-e	Int.c-a-3	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-a-238	1-a	Ca-a-237		4FPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-a-239	9-j	Ca-a-237		$4FPhC_2H_4$-	Et	H	1Me-5-Ind	C		456 (M^++1)
Ca-a-240	1-a	Ca-a-239		$4FPhC_2H_4$-	H	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-a-241	5-e	Int.c-a-3	BRA68	4ClPhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		471 (M^++1)
Ca-a-242	1-a	Ca-a-241		4ClPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		442 (M^++1)
Ca-a-243	5-e	Int.c-a-3	BRA72	$MeOCH_2CH$=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-a-244	1-a	Ca-a-243		$MeOCH_2CH$=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-a-245	9-j	Ca-a-243		$MeOCH_2C_2H_4$-	Et	H	1Me-5-Ind	C		406 (M^++1)
Ca-a-246	1-a	Ca-a-245		$MeOCH_2C_2H_4$-	H	H	1Me-5-Ind	C		378 (M^++1)
Ca-a-247	5-e	Int.c-a-3	BRA73		Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-a-248	1-a	Ca-a-247			H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-a-249	9-j	Ca-a-247			Et	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-a-250	1-a	Ca-a-249			H	H	1Me-5-Ind	C		390 (M^++1)
Ca-a-251	5-e	Int.c-a-4	BRA14	Ph	Et	H	5-1Idz	C		397 (M^++1)
Ca-a-252	1-a	Ca-a-251		Ph	H	H	5-1Idz	C		369 (M^++1)
Ca-a-253	5-e	Int.c-a-4	BRA16	3-MePh	Et	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-254	1-a	Ca-a-253		3-MePh	H	H	5-1Idz	C		383 (M^++1)
Ca-a-255	5-e	Int.c-a-4	BRA17	4-MePh	Et	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-256	1-a	Ca-a-255		4-MePh	H	H	5-1Idz	C		383 (M^++1)
Ca-a-257	5-e	Int.c-a-4	BRA18	2-EtPh	Et	H	5-1Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-258	1-a	Ca-a-257		2-EtPh	H	H	5-1Idz	C		397 (M^++1)
Ca-a-259	5-e	Int.c-a-4	BRA20	2-iPrPh	Et	H	5-1Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-260	1-a	Ca-a-259		2-iPrPh	H	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-261	5-e	Int.c-a-4	BRA23	4-tBuPh	Et	H	5-1Idz	C		453 (M^++1)
Ca-a-262	1-a	Ca-a-261		4-tBuPh	H	H	5-1Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-263	5-e	Int.c-a-4	BRA25	3-MeOPh	Et	H	5-1Idz	C		427 (M^++1)
Ca-a-264	1-a	Ca-a-263		3-MeOPh	H	H	5-1Idz	C		399 (M^++1)
Ca-a-265	5-e	Int.c-a-4	BRA28	3-EtOPh	Et	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-266	1-a	Ca-a-265		3-EtOPh	H	H	5-1Idz	C		413 (M^++1)
Ca-a-267	5-e	Int.c-a-4	BRA29	3-iPrOPh	Et	H	5-1Idz	C		455 (M^++1)
Ca-a-268	1-a	Ca-a-267		3-iPrOPh	H	H	5-1Idz	C		427 (M^++1)
Ca-a-269	5-e	Int.c-a-4	BRA32	4-nPrOPh	Et	H	5-1Idz	C		455 (M^++1)

[0352] [表94]

Table-Ca-A-7

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-270	1-a	Ca-a-269		4-nPrOPh	H	H	5-1Idz	C		427 (M^++1)
Ca-a-271	5-e	Int.c-a-4	BRA33	3-nBuOPh	Et	H	5-1Idz	C		469 (M^++1)
Ca-a-272	1-a	Ca-a-271		3-nBuOPh	H	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-273	5-e	Int.c-a-4	BRA35	3-DMAPh	Et	H	5-1Idz	C		440 (M^++1)
Ca-a-274	1-a	Ca-a-273		3-DMAPh	H	H	5-1Idz	C		412 (M^++1)
Ca-a-275	5-e	Int.c-a-4	BRA36	4-DMAPh	Et	H	5-1Idz	C		440 (M^++1)
Ca-a-276	1-a	Ca-a-275		4-DMAPh	H	H	5-1Idz	C		412 (M^++1)
Ca-a-277	5-e	Int.c-a-4	BRA38	3-FPh	Et	H	5-1Idz	C		415 (M^++1)
Ca-a-278	1-a	Ca-a-277		3-FPh	H	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-a-279	5-e	Int.c-a-4	BRA39	4-FPh	Et	H	5-1Idz	C		415 (M^++1)
Ca-a-280	1-a	Ca-a-279		4-FPh	H	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-a-281	5-e	Int.c-a-4	BRA40	2-ClPh	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
Ca-a-282	1-a	Ca-a-281		2-ClPh	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-a-283	5-e	Int.c-a-4	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
Ca-a-284	1-a	Ca-a-283		3-ClPh	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-a-285	5-e	Int.c-a-4	BRA42	4-ClPh	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
Ca-a-286	1-a	Ca-a-285		4-ClPh	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-a-287	5-e	Int.c-a-4	BRA43	2-CF3Ph	Et	H	5-1Idz	C		465 (M^++1)
Ca-a-288	1-a	Ca-a-287		2-CF3Ph	H	H	5-1Idz	C		437 (M^++1)
Ca-a-289	5-e	Int.c-a-4	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	5-1Idz	C		465 (M^++1)
Ca-a-290	1-a	Ca-a-289		4-CF3Ph	H	H	5-1Idz	C		437 (M^++1)
Ca-a-291	5-e	Int.c-a-4	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	5-1Idz	C		433 (M^++1)
Ca-a-292	1-a	Ca-a-291		2,5-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-a-293	5-e	Int.c-a-4	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	5-1Idz	C		433 (M^++1)
Ca-a-294	1-a	Ca-a-293		2,6-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-a-295	5-e	Int.c-a-4	BRA51	3,5-DFPh	Et	H	5-1Idz	C		433 (M^++1)
Ca-a-296	1-a	Ca-a-295		3,5-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-a-297	5-e	Ca-a-295	BRA52	2,4-DClPh	Et	H	5-1Idz	C		466 (M^++1)
Ca-a-298	1-a	Ca-a-297		2,4-DClPh	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
Ca-a-299	5-e	Int.c-a-4	BRA53	3,5-DClPh	Et	H	5-1Idz	C		466 (M^++1)
Ca-a-300	1-a	Ca-a-299		3,5-DClPh	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
Ca-a-301	5-e	Int.c-a-4	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	5-1Idz	C		466 (M^++1)
Ca-a-302	1-a	Ca-a-301		3,4-DClPh	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
Ca-a-303	5-e	Int.c-a-4	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	5-1Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-304	1-a	Ca-a-303		2,3-DMePh	H	H	5-1Idz	C		397 (M^++1)
Ca-a-305	5-e	Int.c-a-4	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	5-1Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-306	1-a	Ca-a-305		2,6-DMePh	H	H	5-1Idz	C		397 (M^++1)
Ca-a-307	5-e	Int.c-a-4	BRA58	2-Furan	Et	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-a-308	1-a	Ca-a-307		2-Furan	H	H	5-1Idz	C		359 (M^++1)
Ca-a-309	5-e	Int.c-a-4	BRA59	3-Furan	Et	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-a-310	1-a	Ca-a-309		3-Furan	H	H	5-1Idz	C		359 (M^++1)
Ca-a-311	5-e	Int.c-a-4	BRA60	2-Thiophene	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-a-312	1-a	Ca-a-311		2-Thiophene	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)
Ca-a-313	5-e	Int.c-a-4	BRA61	3-Thiophene	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-a-314	1-a	Ca-a-313		3-Thiophene	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)
Ca-a-315	5-e	Int.c-a-4	BRA62	3-Pyridine	Et	H	5-1Idz	C		398 (M^++1)
Ca-a-316	1-a	Ca-a-315		3-Pyridine	H	H	5-1Idz	C		370 (M^++1)

[0353] [表95]

Table-Ca-A-8

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-317	5-e	Int.c-a-4	BRA63	4-Pyridine	Et	H	5-1Idz	C		398 (M^++1)
Ca-a-318	1-a	Ca-a-317		4-Pyridine	H	H	5-1Idz	C		370 (M^++1)
Ca-a-319	5-e	Int.c-a-4	BRA65	4-PhPh	Et	H	5-1Idz	C		473 (M^++1)
Ca-a-320	1-a	Ca-a-319		4-PhPh	H	H	5-1Idz	C		445 (M^++1)
Ca-a-321	5-e	Int.c-a-4	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-a-322	1-a	Ca-a-321		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)
Ca-a-323	9-j	Ca-a-321		nHex-	Et	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-a-324	1-a	Ca-a-323		nHex-	H	H	5-1Idz	C		377 (M^++1)
Ca-a-325	5-e	Int.c-a-4	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-326	1-a	Ca-a-325		4FPhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		413 (M^++1)
Ca-a-327	9-j	Ca-a-325		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	5-1Idz	C		443 (M^++1)
Ca-a-328	1-a	Ca-a-327		$4FPhC_2H_4-$	H	H	5-1Idz	C		415 (M^++1)
Ca-a-329	5-e	Int.c-a-4	BRA68	4ClPhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		457 (M^++1)
Ca-a-330	1-a	Ca-a-329		4ClPhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		429 (M^++1)
Ca-a-331	5-e	Int.c-a-4	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		429 (M^++1)
Ca-a-332	1-a	Ca-a-331		2cHexCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		401 (M^++1)
Ca-a-333	9-j	Ca-a-331		$2cHexC_2H_4-$	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
Ca-a-334	1-a	Ca-a-333		$2cHexC_2H_4-$	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-a-335	5-e	Int.c-a-4	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		437 (M^++1)
Ca-a-336	1-a	Ca-a-335		4MePhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		409 (M^++1)
Ca-a-337	9-j	Ca-a-335		$4MePhC_2H_4-$	Et	H	5-1Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-338	1-a	Ca-a-337		$4MePhC_2H_4-$	H	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-339	5-e	Int.c-a-5	BRA14	Ph	Et	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-340	1-a	Ca-a-339		Ph	H	H	1Me-5-Idz	C		383 (M^++1)
Ca-a-341	5-e	Int.c-a-5	BRA15	2-MePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-342	1-a	Ca-a-341		2-MePh	H	H	1Me-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-a-343	5-e	Int.c-a-5	BRA16	3-MePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-344	1-a	Ca-a-343		3-MePh	H	H	1Me-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-a-345	5-e	Int.c-a-5	BRA17	4-MePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-346	1-a	Ca-a-345		4-MePh	H	H	1Me-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-a-347	5-e	Int.c-a-5	BRA18	2-EtPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-348	1-a	Ca-a-347		2-EtPh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-349	5-e	Int.c-a-5	BRA20	2-iPrPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		453 (M^++1)
Ca-a-350	1-a	Ca-a-349		2-iPrPh	H	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-351	5-e	Int.c-a-5	BRA22	1-nBuPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-a-352	1-a	Ca-a-351		1-nBuPh	H	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-353	5-e	Int.c-a-5	BRA23	4-tBuPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-a-354	1-a	Ca-a-353		4-tBuPh	H	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-355	5-e	Int.c-a-5	BRA24	2-MeOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-356	1-a	Ca-a-355		2-MeOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
Ca-a-357	5-e	Int.c-a-5	BRA26	4-MeOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-358	1-a	Ca-a-357		4-MeOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
Ca-a-359	5-e	Int.c-a-5	BRA27	2-EtOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-a-360	1-a	Ca-a-359		2-EtOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
Ca-a-361	5-e	Int.c-a-5	BRA29	3-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-a-362	1-a	Ca-a-361		3-iPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)

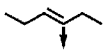
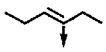
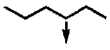
[0354] [表96]

Table-Ca-A-9

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-363	5-e	Int.c-a-5	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-a-364	1-a	Ca-a-363		4-iPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-365	5-e	Int.c-a-5	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-a-366	1-a	Ca-a-365		3-nPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-367	5-e	Int.c-a-5	BRA32	4-nPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-a-368	1-a	Ca-a-367		4-nPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-369	5-e	Int.c-a-5	BRA34	4-nBuOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		483 (M^++1)
Ca-a-370	1-a	Ca-a-369		4-nBuOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-a-371	5-e	Int.c-a-5	BRA35	3-DMAPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		454 (M^++1)
Ca-a-372	1-a	Ca-a-371		3-DMAPh	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
Ca-a-373	5-e	Int.c-a-5	BRA36	4-DMAPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		454 (M^++1)
Ca-a-374	1-a	Ca-a-373		4-DMAPh	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
Ca-a-375	5-e	Int.c-a-5	BRA37	2-FPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-a-376	1-a	Ca-a-375		2-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-a-377	5-e	Int.c-a-5	BRA38	3-FPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-a-378	1-a	Ca-a-377		3-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-a-379	5-e	Int.c-a-5	BRA39	4-FPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-a-380	1-a	Ca-a-379		4-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-a-381	5-e	Int.c-a-5	BRA41	3-ClPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		445 (M^++1)
Ca-a-382	1-a	Ca-a-381		3-ClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-a-383	5-e	Int.c-a-5	BRA42	4-ClPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		445 (M^++1)
Ca-a-384	1-a	Ca-a-383		4-ClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-a-385	5-e	Int.c-a-5	BRA44	3-CF3Ph	Et	H	1Me-5-Idz	C		479 (M^++1)
Ca-a-386	1-a	Ca-a-385		3-CF3Ph	H	H	1Me-5-Idz	C		451 (M^++1)
Ca-a-387	5-e	Int.c-a-5	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-a-388	1-a	Ca-a-387		2,3-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-a-389	5-e	Int.c-a-5	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-a-390	1-a	Ca-a-389		2,4-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-a-391	5-e	Int.c-a-5	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-a-392	1-a	Ca-a-391		2,6-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-a-393	5-e	Int.c-a-5	BRA52	2,4-DClPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		480 (M^++1)
Ca-a-394	1-a	Ca-a-393		2,4-DClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
Ca-a-395	5-e	Int.c-a-5	BRA53	3,5-DClPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		480 (M^++1)
Ca-a-396	1-a	Ca-a-395		3,5-DClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
Ca-a-397	5-e	Int.c-a-5	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-398	1-a	Ca-a-397		2,3-DMePh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-399	5-e	Int.c-a-5	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-400	1-a	Ca-a-399		2,4-DMePh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-401	5-e	Int.c-a-5	BRA58	2-Furan	Et	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-a-402	1-a	Ca-a-401		2-Furan	H	H	1Me-5-Idz	C		373 (M^++1)
Ca-a-403	5-e	Int.c-a-5	BRA59	3-Furan	Et	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-a-404	1-a	Ca-a-403		3-Furan	H	H	1Me-5-Idz	C		373 (M^++1)
Ca-a-405	5-e	Int.c-a-5	BRA60	2-Thiophene	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-a-406	1-a	Ca-a-405		2-Thiophene	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-a-407	5-e	Int.c-a-5	BRA61	3-Thiophene	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-a-408	1-a	Ca-a-407		3-Thiophene	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)

[0355] [表97]

Table-Ca-A-10

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-409	5-e	Int.c-a-5	BRA62	3-Pyridine	Et	H	1Me-5-Idz	C		412 (M^++1)
Ca-a-410	1-a	Ca-a-409		3-Pyridine	H	H	1Me-5-Idz	C		384 (M^++1)
Ca-a-411	5-e	Int.c-a-5	BRA63	4-Pyridine	Et	H	1Me-5-Idz	C		412 (M^++1)
Ca-a-412	1-a	Ca-a-411		4-Pyridine	H	H	1Me-5-Idz	C		384 (M^++1)
Ca-a-413	5-e	Int.c-a-5	BRA65	4-PhPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		487 (M^++1)
Ca-a-414	1-a	Ca-a-413		4-PhPh	H	H	1Me-5-Idz	C		459 (M^++1)
Ca-a-415	5-e	Int.c-a-5	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-a-416	1-a	Ca-a-415		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-a-417	9-j	Ca-a-415		nHex-	Et	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-a-418	1-a	Ca-a-417		nHex-	H	H	1Me-5-Idz	C		391 (M^++1)
Ca-a-419	5-e	Int.c-a-5	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-a-420	1-a	Ca-a-419		4FPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
Ca-a-421	9-j	Ca-a-419		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		457 (M^++1)
Ca-a-422	1-a	Ca-a-421		$4FPhC_2H_4-$	H	H	1Me-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-a-423	5-e	Int.c-a-5	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		443 (M^++1)
Ca-a-424	1-a	Ca-a-423		2cHexCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-a-425	9-j	Ca-a-423		$2cHexC_2H_4-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		445 (M^++1)
Ca-a-426	1-a	Ca-a-425		$2cHexC_2H_4-$	H	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-a-427	5-e	Int.c-a-5	BRA70	4CF3PhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		505 (M^++1)
Ca-a-428	1-a	Ca-a-427		4CF3PhCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		477 (M^++1)
Ca-a-429	9-j	Ca-a-427		$4CF3PhC_2H_4-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		507 (M^++1)
Ca-a-430	1-a	Ca-a-429		$4CF3PhC_2H_4-$	H	H	1Me-5-Idz	C		479 (M^++1)
Ca-a-431	5-e	Int.c-a-5	BRA73		Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-a-432	1-a	Ca-a-431			H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-a-433	9-j	Ca-a-431			Et	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-a-434	1-a	Ca-a-433			H	H	1Me-5-Idz	C		391 (M^++1)
Ca-a-435	5-e	Int.c-a-6	BRA14	Ph	Et	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-436	1-a	Ca-a-435		Ph	H	H	1Et-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-a-437	5-e	Int.c-a-6	BRA16	3-MePh	Et	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-438	1-a	Ca-a-437		3-MePh	H	H	1Et-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-a-439	5-e	Int.c-a-6	BRA18	2-EtPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		453 (M^++1)
Ca-a-440	1-a	Ca-a-439		2-EtPh	H	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-441	5-e	Int.c-a-6	BRA20	2-iPrPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-a-442	1-a	Ca-a-441		2-iPrPh	H	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-443	5-e	Int.c-a-6	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		483 (M^++1)
Ca-a-444	1-a	Ca-a-443		3-nPrOPh	H	H	1Et-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-a-445	5-e	Int.c-a-6	BRA35	3-DMAPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		468 (M^++1)
Ca-a-446	1-a	Ca-a-445		3-DMAPh	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
Ca-a-447	5-e	Int.c-a-6	BRA37	2-FPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		443 (M^++1)
Ca-a-448	1-a	Ca-a-447		2-FPh	H	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-a-449	5-e	Int.c-a-6	BRA38	3-FPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		443 (M^++1)
Ca-a-450	1-a	Ca-a-449		3-FPh	H	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-a-451	5-e	Int.c-a-6	BRA40	2-ClPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		460 (M^++1)
Ca-a-452	1-a	Ca-a-451		2-ClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-a-453	5-e	Int.c-a-6	BRA41	3-ClPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		460 (M^++1)
Ca-a-454	1-a	Ca-a-453		3-ClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)

[0356] [表98]

Table-Ca-A-11

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-455	5-e	Int.c-a-6	BRA43	2-CF3Ph	Et	H	1Et-5-Idz	C		493 (M^++1)
Ca-a-456	1-a	Ca-a-455		2-CF3Ph	H	H	1Et-5-Idz	C		465 (M^++1)
Ca-a-457	5-e	Int.c-a-6	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		461 (M^++1)
Ca-a-458	1-a	Ca-a-457		2,4-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-a-459	5-e	Int.c-a-6	BRA48	2.5-DFPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		461 (M^++1)
Ca-a-460	1-a	Ca-a-459		2.5-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-a-461	5-e	Int.c-a-6	BRA50	3,4-DFPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		461 (M^++1)
Ca-a-462	1-a	Ca-a-461		3,4-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-a-463	5-e	Int.c-a-6	BRA52	2,4-DClPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		494 (M^++1)
Ca-a-464	1-a	Ca-a-463		2,4-DClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		466 (M^++1)
Ca-a-465	5-e	Int.c-a-6	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		494 (M^++1)
Ca-a-466	1-a	Ca-a-465		3,4-DClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		466 (M^++1)
Ca-a-467	5-e	Int.c-a-6	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	1Et-5-Idz	C		453 (M^++1)
Ca-a-468	1-a	Ca-a-467		2,3-DMePh	H	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-469	5-e	Int.c-a-6	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	1Et-5-Idz	C		453 (M^++1)
Ca-a-470	1-a	Ca-a-469		2,6-DMePh	H	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-a-471	5-e	Int.c-a-6	BRA58	2-Furan	Et	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-a-472	1-a	Ca-a-471		2-Furan	H	H	1Et-5-Idz	C		387 (M^++1)
Ca-a-473	5-e	Int.c-a-6	BRA60	2-Thiophene	Et	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-a-474	1-a	Ca-a-473		2-Thiophene	H	H	1Et-5-Idz	C		403 (M^++1)
Ca-a-475	5-e	Int.c-a-6	BRA63	4-Pyridine	Et	H	1Et-5-Idz	C		426 (M^++1)
Ca-a-476	1-a	Ca-a-475		4-Pyridine	H	H	1Et-5-Idz	C		398 (M^++1)
Ca-a-477	5-e	Int.c-a-6	BRA65	4-PhPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		501 (M^++1)
Ca-a-478	1-a	Ca-a-477		4-PhPh	H	H	1Et-5-Idz	C		473 (M^++1)
Ca-a-479	5-e	Int.c-a-6	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	1Et-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-a-480	1-a	Ca-a-479		4FPhCH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-a-481	9-j	Ca-a-479		4FPhC_2H_4-	Et	H	1Et-5-Idz	C		471 (M^++1)
Ca-a-482	1-a	Ca-a-481		4FPhC_2H_4-	H	H	1Et-5-Idz	C		443 (M^++1)
Ca-a-483	5-e	Int.c-a-6	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	1Et-5-Idz	C		457 (M^++1)
Ca-a-484	1-a	Ca-a-483		2cHexCH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-a-485	9-j	Ca-a-483		2cHexC_2H_4-	Et	H	1Et-5-Idz	C		459 (M^++1)
Ca-a-486	1-a	Ca-a-485		2cHexC_2H_4-	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-a-487	5-e	Int.c-a-6	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	1Et-5-Idz	C		465 (M^++1)
Ca-a-488	1-a	Ca-a-487		4MePhCH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		437 (M^++1)
Ca-a-489	9-j	Ca-a-487		4MePhC_2H_4-	Et	H	1Et-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-a-490	1-a	Ca-a-489		4MePhC_2H_4-	H	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-a-491	5-e	Int.c-a-7	BRA14	Ph	Et	H	5-BF	C		397 (M^++1)
Ca-a-492	1-a	Ca-a-491		Ph	H	H	5-BF	C		369 (M^++1)
Ca-a-493	5-e	Int.c-a-7	BRA16	3-MePh	Et	H	5-BF	C		411 (M^++1)
Ca-a-494	1-a	Ca-a-493		3-MePh	H	H	5-BF	C		383 (M^++1)
Ca-a-495	5-e	Int.c-a-7	BRA17	4-MePh	Et	H	5-BF	C		411 (M^++1)
Ca-a-496	1-a	Ca-a-495		4-MePh	H	H	5-BF	C		383 (M^++1)
Ca-a-497	5-e	Int.c-a-7	BRA20	2-iPrPh	Et	H	5-BF	C		439 (M^++1)
Ca-a-498	1-a	Ca-a-497		2-iPrPh	H	H	5-BF	C		411 (M^++1)
Ca-a-499	5-e	Int.c-a-7	BRA23	4-tBuPh	Et	H	5-BF	C		453 (M^++1)
Ca-a-500	1-a	Ca-a-499		4-tBuPh	H	H	5-BF	C		425 (M^++1)

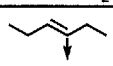
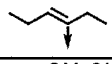
[0357] [表99]

Table-Ca-A-12

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-501	5-e	Int.c-a-7	BRA25	3-MeOPh	Et	H	5-BF	C		427 (M^++1)
Ca-a-502	1-a	Ca-a-501		3-MeOPh	H	H	5-BF	C		399 (M^++1)
Ca-a-503	5-e	Int.c-a-7	BRA27	2-EtOPh	Et	H	5-BF	C		441 (M^++1)
Ca-a-504	1-a	Ca-a-503		2-EtOPh	H	H	5-BF	C		413 (M^++1)
Ca-a-505	5-e	Int.c-a-7	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	5-BF	C		455 (M^++1)
Ca-a-506	1-a	Ca-a-505		3-nPrOPh	H	H	5-BF	C		427 (M^++1)
Ca-a-507	5-e	Int.c-a-7	BRA33	3-nBuOPh	Et	H	5-BF	C		469 (M^++1)
Ca-a-508	1-a	Ca-a-507		3-nBuOPh	H	H	5-BF	C		441 (M^++1)
Ca-a-509	5-e	Int.c-a-7	BRA35	3-DMAPh	Et	H	5-BF	C		440 (M^++1)
Ca-a-510	1-a	Ca-a-509		3-DMAPh	H	H	5-BF	C		412 (M^++1)
Ca-a-511	5-e	Int.c-a-7	BRA37	2-FPh	Et	H	5-BF	C		415 (M^++1)
Ca-a-512	1-a	Ca-a-511		2-FPh	H	H	5-BF	C		387 (M^++1)
Ca-a-513	5-e	Int.c-a-7	BRA39	4-FPh	Et	H	5-BF	C		415 (M^++1)
Ca-a-514	1-a	Ca-a-513		4-FPh	H	H	5-BF	C		387 (M^++1)
Ca-a-515	5-e	Int.c-a-7	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-BF	C		431 (M^++1)
Ca-a-516	1-a	Ca-a-515		3-ClPh	H	H	5-BF	C		403 (M^++1)
Ca-a-517	5-e	Int.c-a-7	BRA43	2-CF3Ph	Et	H	5-BF	C		465 (M^++1)
Ca-a-518	1-a	Ca-a-517		2-CF3Ph	H	H	5-BF	C		437 (M^++1)
Ca-a-519	5-e	Int.c-a-7	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	5-BF	C		433 (M^++1)
Ca-a-520	1-a	Ca-a-519		2,5-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-a-521	5-e	Int.c-a-7	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	5-BF	C		433 (M^++1)
Ca-a-522	1-a	Ca-a-521		2,6-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-a-523	5-e	Int.c-a-7	BRA50	3,4-DFPh	Et	H	5-BF	C		433 (M^++1)
Ca-a-524	1-a	Ca-a-523		3,4-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-a-525	5-e	Int.c-a-7	BRA53	3,5-DClPh	Et	H	5-BF	C		466 (M^++1)
Ca-a-526	1-a	Ca-a-525		3,5-DClPh	H	H	5-BF	C		438 (M^++1)
Ca-a-527	5-e	Int.c-a-7	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	5-BF	C		425 (M^++1)
Ca-a-528	1-a	Ca-a-527		2,3-DMePh	H	H	5-BF	C		397 (M^++1)
Ca-a-529	5-e	Int.c-a-7	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	5-BF	C		425 (M^++1)
Ca-a-530	1-a	Ca-a-529		2,6-DMePh	H	H	5-BF	C		397 (M^++1)
Ca-a-531	5-e	Int.c-a-7	BRA58	2-Furan	Et	H	5-BF	C		387 (M^++1)
Ca-a-532	1-a	Ca-a-531		2-Furan	H	H	5-BF	C		359 (M^++1)
Ca-a-533	5-e	Int.c-a-7	BRA61	3-Thiophene	Et	H	5-BF	C		403 (M^++1)
Ca-a-534	1-a	Ca-a-533		3-Thiophene	H	H	5-BF	C		375 (M^++1)
Ca-a-535	5-e	Int.c-a-7	BRA64	3-PhPh	Et	H	5-BF	C		473 (M^++1)
Ca-a-536	1-a	Ca-a-535		3-PhPh	H	H	5-BF	C		445 (M^++1)
Ca-a-537	5-e	Int.c-a-8	BRA14	Ph	Et	H	6-Qu	C		408 (M^++1)
Ca-a-538	1-a	Ca-a-537		Ph	H	H	6-Qu	C		380 (M^++1)
Ca-a-539	5-e	Int.c-a-8	BRA15	2-MePh	Et	H	6-Qu	C		422 (M^++1)
Ca-a-540	1-a	Ca-a-539		2-MePh	H	H	6-Qu	C		394 (M^++1)
Ca-a-541	5-e	Int.c-a-8	BRA17	4-MePh	Et	H	6-Qu	C		422 (M^++1)
Ca-a-542	1-a	Ca-a-541		4-MePh	H	H	6-Qu	C		394 (M^++1)
Ca-a-543	5-e	Int.c-a-8	BRA22	1-nBuPh	Et	H	6-Qu	C		464 (M^++1)
Ca-a-544	1-a	Ca-a-543		1-nBuPh	H	H	6-Qu	C		436 (M^++1)
Ca-a-545	5-e	Int.c-a-8	BRA25	3-MeOPh	Et	H	6-Qu	C		438 (M^++1)
Ca-a-546	1-a	Ca-a-545		3-MeOPh	H	H	6-Qu	C		410 (M^++1)

[0358] [表100]

Table-Ca-A-13

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-547	5-e	Int.c-a-8	BRA28	3-EtOPh	Et	H	6-Qu	C		452 (M^++1)
Ca-a-548	1-a	Ca-a-547		3-EtOPh	H	H	6-Qu	C		424 (M^++1)
Ca-a-549	5-e	Int.c-a-8	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	6-Qu	C		466 (M^++1)
Ca-a-550	1-a	Ca-a-549		4-iPrOPh	H	H	6-Qu	C		438 (M^++1)
Ca-a-551	5-e	Int.c-a-8	BRA36	4-DMAPh	Et	H	6-Qu	C		451 (M^++1)
Ca-a-552	1-a	Ca-a-551		4-DMAPh	H	H	6-Qu	C		423 (M^++1)
Ca-a-553	5-e	Int.c-a-8	BRA38	3-FPh	Et	H	6-Qu	C		426 (M^++1)
Ca-a-554	1-a	Ca-a-553		3-FPh	H	H	6-Qu	C		398 (M^++1)
Ca-a-555	5-e	Int.c-a-8	BRA40	2-ClPh	Et	H	6-Qu	C		442 (M^++1)
Ca-a-556	1-a	Ca-a-555		2-ClPh	H	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-a-557	5-e	Int.c-a-8	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	6-Qu	C		476 (M^++1)
Ca-a-558	1-a	Ca-a-557		4-CF3Ph	H	H	6-Qu	C		448 (M^++1)
Ca-a-559	5-e	Int.c-a-8	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	6-Qu	C		444 (M^++1)
Ca-a-560	1-a	Ca-a-559		2,4-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-a-561	5-e	Int.c-a-8	BRA50	3,4-DFPh	Et	H	6-Qu	C		444 (M^++1)
Ca-a-562	1-a	Ca-a-561		3,4-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-a-563	5-e	Int.c-a-8	BRA51	3,5-DFPh	Et	H	6-Qu	C		444 (M^++1)
Ca-a-564	1-a	Ca-a-563		3,5-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-a-565	5-e	Int.c-a-8	BRA52	2,4-DClPh	Et	H	6-Qu	C		477 (M^++1)
Ca-a-566	1-a	Ca-a-565		2,4-DClPh	H	H	6-Qu	C		449 (M^++1)
Ca-a-567	5-e	Int.c-a-8	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	6-Qu	C		477 (M^++1)
Ca-a-568	1-a	Ca-a-567		3,4-DClPh	H	H	6-Qu	C		449 (M^++1)
Ca-a-569	5-e	Int.c-a-8	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	6-Qu	C		436 (M^++1)
Ca-a-570	1-a	Ca-a-569		2,4-DMePh	H	H	6-Qu	C		408 (M^++1)
Ca-a-571	5-e	Int.c-a-8	BRA58	2-Furan	Et	H	6-Qu	C		398 (M^++1)
Ca-a-572	1-a	Ca-a-571		2-Furan	H	H	6-Qu	C		370 (M^++1)
Ca-a-573	5-e	Int.c-a-8	BRA60	2-Thiophene	Et	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-a-574	1-a	Ca-a-573		2-Thiophene	H	H	6-Qu	C		386 (M^++1)
Ca-a-575	5-e	Int.c-a-8	BRA62	3-Pyridine	Et	H	6-Qu	C		409 (M^++1)
Ca-a-576	1-a	Ca-a-575		3-Pyridine	H	H	6-Qu	C		381 (M^++1)
Ca-a-577	5-e	Int.c-a-8	BRA65	4-PhPh	Et	H	6-Qu	C		484 (M^++1)
Ca-a-578	1-a	Ca-a-577		4-PhPh	H	H	6-Qu	C		456 (M^++1)
Ca-a-579	5-e	Int.c-a-8	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	6-Qu	C		452 (M^++1)
Ca-a-580	1-a	Ca-a-579		4FPhCH=CH-	H	H	6-Qu	C		424 (M^++1)
Ca-a-581	9-j	Ca-a-579		$4FPhC_2H_4$-	Et	H	6-Qu	C		454 (M^++1)
Ca-a-582	1-a	Ca-a-581		$4FPhC_2H_4$-	H	H	6-Qu	C		426 (M^++1)
Ca-a-583	5-e	Int.c-a-8	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	6-Qu	C		448 (M^++1)
Ca-a-584	1-a	Ca-a-583		4MePhCH=CH-	H	H	6-Qu	C		420 (M^++1)
Ca-a-585	9-j	Ca-a-583		$4MePhC_2H_4$-	Et	H	6-Qu	C		450 (M^++1)
Ca-a-586	1-a	Ca-a-585		$4MePhC_2H_4$-	H	H	6-Qu	C		422 (M^++1)
Ca-a-587	5-e	Int.c-a-8	BRA73		Et	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-a-588	1-a	Ca-a-587			H	H	6-Qu	C		386 (M^++1)
Ca-a-589	5-e	Int.c-a-1	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-a-590	1-a	Ca-a-589		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	2-Nap	C		343 (M^++1)

[0359] [表101]

Table-Ca-A-14

Exp.	Syn.	SM1	SM2	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-a-591	9-j	Ca-a-589		nPr	Et	H	2-Nap	C		373 (M^++1)
Ca-a-592	1-a	Ca-a-591		nPr	H	H	2-Nap	C		345 (M^++1)
Ca-a-593	5-e	Int.c-a-1	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-a-594	1-a	Ca-a-593		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	2-Nap	C		343 (M^++1)
Ca-a-595	5-e	Int.c-a-1	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		399 (M^++1)
Ca-a-596	1-a	Ca-a-595		C_3H_7CH=CH-	H	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-a-597	9-j	Ca-a-595		nPen	Et	H	2-Nap	C		401 (M^++1)
Ca-a-598	1-a	Ca-a-597		nPen	H	H	2-Nap	C		373 (M^++1)
Ca-a-599	5-e	Int.c-a-2	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	5-Ind	C		360 (M^++1)
Ca-a-600	1-a	Ca-a-599		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-Ind	C		332 (M^++1)
Ca-a-601	9-j	Ca-a-599		nPr	Et	H	5-Ind	C		362 (M^++1)
Ca-a-602	1-a	Ca-a-601		nPr	H	H	5-Ind	C		334 (M^++1)
Ca-a-603	5-e	Int.c-a-2	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-a-604	1-a	Ca-a-603		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-Ind	C		360 (M^++1)
Ca-a-605	5-e	Int.c-a-3	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-a-606	1-a	Ca-a-605		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		346 (M^++1)
Ca-a-607	9-j	Ca-a-605		nPr	Et	H	1Me-5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-a-608	1-a	Ca-a-607		nPr	H	H	1Me-5-Ind	C		348 (M^++1)
Ca-a-609	5-e	Int.c-a-3	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-a-610	1-a	Ca-a-609		C_3H_7CH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-a-611	5-e	Int.c-a-4	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		361 (M^++1)
Ca-a-612	1-a	Ca-a-611		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		333 (M^++1)
Ca-a-613	9-j	Ca-a-611		nPr	Et	H	5-1Idz	C		363 (M^++1)
Ca-a-614	1-a	Ca-a-613		nPr	H	H	5-1Idz	C		335 (M^++1)
Ca-a-615	5-e	Int.c-a-4	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		389 (M^++1)
Ca-a-616	1-a	Ca-a-615		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		361 (M^++1)
Ca-a-617	9-j	Ca-a-615		nPen	Et	H	5-1Idz	C		391 (M^++1)
Ca-a-618	1-a	Ca-a-617		nPen	H	H	5-1Idz	C		363 (M^++1)
Ca-a-619	5-e	Int.c-a-5	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Ca-a-620	1-a	Ca-a-619		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		347 (M^++1)
Ca-a-621	9-j	Ca-a-619		nPr	Et	H	1Me-5-Idz	C		377 (M^++1)
Ca-a-622	1-a	Ca-a-621		nPr	H	H	1Me-5-Idz	C		349 (M^++1)
Ca-a-623	5-e	Int.c-a-5	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Ca-a-624	1-a	Ca-a-623		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		347 (M^++1)
Ca-a-625	5-e	Int.c-a-6	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	1Et-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-a-626	1-a	Ca-a-625		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		361 (M^++1)
Ca-a-627	9-j	Ca-a-625		nPr	Et	H	1Et-5-Idz	C		391 (M^++1)
Ca-a-628	1-a	Ca-a-627		nPr	H	H	1Et-5-Idz	C		363 (M^++1)
Ca-a-629	5-e	Int.c-a-7	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	5-BF	C		361 (M^++1)
Ca-a-630	1-a	Ca-a-629		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-BF	C		333 (M^++1)
Ca-a-631	5-e	Int.c-a-7	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	5-BF	C		389 (M^++1)
Ca-a-632	1-a	Ca-a-631		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-BF	C		361 (M^++1)
Ca-a-633	5-e	Int.c-a-8	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	6-Qu	C		372 (M^++1)
Ca-a-634	1-a	Ca-a-633		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	6-Qu	C		344 (M^++1)
Ca-a-635	5-e	Int.c-a-8	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	6-Qu	C		400 (M^++1)
Ca-a-636	1-a	Ca-a-635		C_3H_7CH=CH-	H	H	6-Qu	C		372 (M^++1)

[0360] [表102]

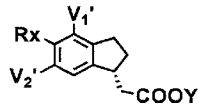
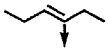
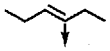
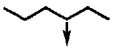
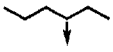


Table-Ca-B-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-1	5-e	Int.c-b-1	BRA14	Ph	Et	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-b-2	1-a	Ca-b-1		Ph	H	H	2-Nap	C		379 (M^++1)
Ca-b-3	5-e	Int.c-b-1	BRA15	2-MePh	Et	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-b-4	1-a	Ca-b-3		2-MePh	H	H	2-Nap	C		393 (M^++1)
Ca-b-5	5-e	Int.c-b-1	BRA17	4-MePh	Et	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-b-6	1-a	Ca-b-5		4-MePh	H	H	2-Nap	C		393 (M^++1)
Ca-b-7	5-e	Int.c-b-1	BRA19	4-EtPh	Et	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-b-8	1-a	Ca-b-7		4-EtPh	H	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-b-9	5-e	Int.c-b-1	BRA20	2-iPrPh	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
Ca-b-10	1-a	Ca-b-9		2-iPrPh	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-b-11	5-e	Int.c-b-1	BRA22	1-nBuPh	Et	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
Ca-b-12	1-a	Ca-b-11		1-nBuPh	H	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-b-13	5-e	Int.c-b-1	BRA23	4-tBuPh	Et	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
Ca-b-14	1-a	Ca-b-13		4-tBuPh	H	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-b-15	5-e	Int.c-b-1	BRA24	2-MeOPh	Et	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-b-16	1-a	Ca-b-15		2-MeOPh	H	H	2-Nap	C		409 (M^++1)
Ca-b-17	5-e	Int.c-b-1	BRA26	4-MeOPh	Et	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-b-18	1-a	Ca-b-17		4-MeOPh	H	H	2-Nap	C		409 (M^++1)
Ca-b-19	5-e	Int.c-b-1	BRA28	3-EtOPh	Et	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-b-20	1-a	Ca-b-19		3-EtOPh	H	H	2-Nap	C		423 (M^++1)
Ca-b-21	5-e	Int.c-b-1	BRA29	3-iPrOPh	Et	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
Ca-b-22	1-a	Ca-b-21		3-iPrOPh	H	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-b-23	5-e	Int.c-b-1	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
Ca-b-24	1-a	Ca-b-23		3-nPrOPh	H	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-b-25	5-e	Int.c-b-1	BRA34	4-nBuOPh	Et	H	2-Nap	C		479 (M^++1)
Ca-b-26	1-a	Ca-b-25		4-nBuOPh	H	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-b-27	5-e	Int.c-b-1	BRA35	3-DMAPh	Et	H	2-Nap	C		450 (M^++1)
Ca-b-28	1-a	Ca-b-27		3-DMAPh	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
Ca-b-29	5-e	Int.c-b-1	BRA37	2-FPh	Et	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-b-30	1-a	Ca-b-29		2-FPh	H	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-b-31	5-e	Int.c-b-1	BRA39	4-FPh	Et	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-b-32	1-a	Ca-b-31		4-FPh	H	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-b-33	5-e	Int.c-b-1	BRA40	2-ClPh	Et	H	2-Nap	C		441 (M^++1)
Ca-b-34	1-a	Ca-b-33		2-ClPh	H	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-b-35		Ca-a-40		4-ClPh	H	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-b-36		Ca-a-42		3-CF3Ph	H	H	2-Nap	C		447 (M^++1)
Ca-b-37	5-e	Int.c-b-1	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
Ca-b-38	1-a	Ca-b-37		2,3-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-b-39		Ca-a-48		2,6-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-b-40		Ca-a-54		2,4-DClPh	H	H	2-Nap	C		448 (M^++1)
Ca-b-41	5-e	Int.c-b-1	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-b-42	1-a	Ca-b-41		2,3-DMePh	H	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-b-43	5-e	Int.c-b-1	BRA58	2-Furan	Et	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-b-44	1-a	Ca-b-43		2-Furan	H	H	2-Nap	C		369 (M^++1)

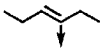
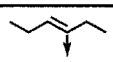
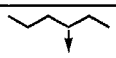
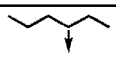
[0361] [表103]

Table-Ca-B-2

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-45		Ca-a-64		3-Furan	H	H	2-Nap	C		369 (M^++1)
Ca-b-46	5-e	Int.c-b-1	BRA60	2-Thiophene	Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-b-47	1-a	Ca-b-46		2-Thiophene	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-b-48		Ca-a-68		3-Thiophene	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-b-49	5-e	Int.c-b-1	BRA63	4-Pyridine	Et	H	2-Nap	C		408 (M^++1)
Ca-b-50	1-a	Ca-b-49		4-Pyridine	H	H	2-Nap	C		380 (M^++1)
Ca-b-51	5-e	Int.c-b-1	BRA64	3-PhPh	Et	H	2-Nap	C		483 (M^++1)
Ca-b-52	1-a	Ca-b-51		3-PhPh	H	H	2-Nap	C		455 (M^++1)
Ca-b-53	5-e	Int.c-b-1	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-b-54	1-a	Ca-b-53		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-b-55	9-j	Ca-b-53		nHex-	Et	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-b-56	1-a	Ca-b-55		nHex-	H	H	2-Nap	C		387 (M^++1)
Ca-b-57	5-e	Int.c-b-1	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-b-58	1-a	Ca-b-57		4FPhCH=CH-	H	H	2-Nap	C		423 (M^++1)
Ca-b-59	9-j	Ca-b-57		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	2-Nap	C		453 (M^++1)
Ca-b-60	1-a	Ca-b-59		$4FPhC_2H_4-$	H	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-b-61	5-e	Int.c-b-1	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	2-Nap	C		447 (M^++1)
Ca-b-62	1-a	Ca-b-61		4MePhCH=CH-	H	H	2-Nap	C		419 (M^++1)
Ca-b-63	9-j	Ca-b-61		$4MePhC_2H_4-$	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
Ca-b-64	1-a	Ca-b-63		$4MePhC_2H_4-$	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-b-65	5-e	Int.c-b-1	BRA73		Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-b-66	1-a	Ca-b-65			H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-b-67	9-j	Ca-b-65			Et	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-b-68	1-a	Ca-b-67			H	H	2-Nap	C		387 (M^++1)
Ca-b-69	5-e	Int.c-b-2	BRA14	Ph	Et	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-b-70	1-a	Ca-b-69		Ph	H	H	5-Ind	C		368 (M^++1)
Ca-b-71	5-e	Int.c-b-2	BRA15	2-MePh	Et	H	5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-b-72	1-a	Ca-b-71		2-MePh	H	H	5-Ind	C		382 (M^++1)
Ca-b-73	5-e	Int.c-b-2	BRA18	2-EtPh	Et	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-b-74	1-a	Ca-b-73		2-EtPh	H	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-b-75		Ca-a-106		2-iPrPh	H	H	5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-b-76	5-e	Int.c-b-2	BRA25	3-MeOPh	Et	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-b-77	1-a	Ca-b-76		3-MeOPh	H	H	5-Ind	C		398 (M^++1)
Ca-b-78	5-e	Int.c-b-2	BRA28	3-EtOPh	Et	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-b-79	1-a	Ca-b-78		3-EtOPh	H	H	5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-b-80	5-e	Int.c-b-2	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-b-81	1-a	Ca-b-80		4-iPrOPh	H	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-b-82	5-e	Int.c-b-2	BRA32	4-nPrOPh	Et	H	5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-b-83	1-a	Ca-b-82		4-nPrOPh	H	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-b-84	5-e	Int.c-b-2	BRA35	3-DMAPh	Et	H	5-Ind	C		439 (M^++1)
Ca-b-85	1-a	Ca-b-84		3-DMAPh	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
Ca-b-86		Ca-a-126		2-FPh	H	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-b-87	5-e	Int.c-b-2	BRA38	3-FPh	Et	H	5-Ind	C		414 (M^++1)
Ca-b-88	1-a	Ca-b-87		3-FPh	H	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-b-89	5-e	Int.c-b-2	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-Ind	C		430 (M^++1)
Ca-b-90	1-a	Ca-b-89		3-ClPh	H	H	5-Ind	C		402 (M^++1)

[0362] [表104]

Table-Ca-B-3

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-89	5-e	Int.c-b-2	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-Ind	C		430 (M^++1)
Ca-b-90	1-a	Ca-b-89		3-ClPh	H	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-b-91	5-e	Int.c-b-2	BRA42	4-ClPh	Et	H	5-Ind	C		430 (M^++1)
Ca-b-92	1-a	Ca-b-91		4-ClPh	H	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-b-93	5-e	Int.c-b-2	BRA43	2-CF3Ph	Et	H	5-Ind	C		464 (M^++1)
Ca-b-94	1-a	Ca-b-93		2-CF3Ph	H	H	5-Ind	C		436 (M^++1)
Ca-b-95	5-e	Int.c-b-2	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-b-96	1-a	Ca-b-95		2,3-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-b-97	5-e	Int.c-b-2	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-b-98	1-a	Ca-b-97		2,6-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-b-99	5-e	Int.c-b-2	BRA51	3,5-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-b-100	1-a	Ca-b-99		3,5-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-b-101		Ca-a-144		3,5-DClPh	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
Ca-b-102	5-e	Int.c-b-2	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	5-Ind	C		465 (M^++1)
Ca-b-103	1-a	Ca-b-102		3,4-DClPh	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
Ca-b-104	5-e	Int.c-b-2	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-b-105	1-a	Ca-b-104		2,3-DMePh	H	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-b-106	5-e	Int.c-b-2	BRA58	2-Furan	Et	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-b-107	1-a	Ca-b-106		2-Furan	H	H	5-Ind	C		358 (M^++1)
Ca-b-108	5-e	Int.c-b-2	BRA59	3-Furan	Et	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-b-109	1-a	Ca-b-108		3-Furan	H	H	5-Ind	C		358 (M^++1)
Ca-b-110	5-e	Int.c-b-2	BRA60	2-Thiophene	Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-b-111	1-a	Ca-b-110		2-Thiophene	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-b-112		Ca-a-158		3-Thiophene	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-b-113	5-e	Int.c-b-2	BRA62	3-Pyridine	Et	H	5-Ind	C		397 (M^++1)
Ca-b-114	1-a	Ca-b-113		3-Pyridine	H	H	5-Ind	C		369 (M^++1)
Ca-b-115	5-e	Int.c-b-2	BRA64	3-PhPh	Et	H	5-Ind	C		472 (M^++1)
Ca-b-116	1-a	Ca-b-115		3-PhPh	H	H	5-Ind	C		444 (M^++1)
Ca-b-117	5-e	Int.c-b-2	BRA66	C_4H_9CH=CH-	Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-b-118	1-a	Ca-b-116		C_4H_9CH=CH-	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-b-119	9-j	Ca-b-116		nHex-	Et	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-b-120	1-a	Ca-b-120		nHex-	H	H	5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-b-121	5-e	Int.c-b-2	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-b-122	1-a	Ca-b-122		4FPhCH=CH-	H	H	5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-b-123	5-e	Int.c-b-2	BRA73		Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-b-124	1-a	Ca-b-123			H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-b-125	9-j	Ca-b-123			Et	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-b-126	1-a	Ca-b-125			H	H	5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-b-127	5-e	Int.c-b-3	BRA14	Ph	Et	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-b-128	1-a	Ca-b-127		Ph	H	H	1Me-5-Ind	C		382 (M^++1)
Ca-b-129	5-e	Ca-a-174	BRA15	2-MePh	Et	H	1Me-5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-b-130	1-a	Ca-a-176		2-MePh	H	H	1Me-5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-b-131	5-e	Int.c-b-3	BRA19	4-EtPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-b-132	1-a	Ca-b-131		4-EtPh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-b-133	5-e	Int.c-b-3	BRA22	1-nBuPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
Ca-b-134	1-a	Ca-b-133		1-nBuPh	H	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)

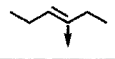
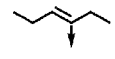
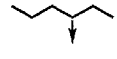
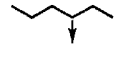
[0363] [表105]

Table-Ca-b-4

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-135	5-e	Int.c-b-3	BRA24	2-MeOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-b-136	1-a	Ca-b-135		2-MeOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-b-137		Ca-a-188		2-EtOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-b-138	5-e	Int.c-b-3	BRA29	3-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
Ca-b-139	1-a	Ca-b-138		3-iPrOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-b-140	5-e	Int.c-b-3	BRA32	4-nPrOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
Ca-b-141	1-a	Ca-b-140		4-nPrOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-b-142	5-e	Int.c-b-3	BRA34	4-nBuOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
Ca-b-143	1-a	Ca-b-142		4-nBuOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-b-144	5-e	Int.c-b-3	BRA36	4-DMAPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		453 (M^++1)
Ca-b-145	1-a	Ca-b-144		4-DMAPh	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
Ca-b-146	5-e	Int.c-b-3	BRA37	2-FPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-b-147	1-a	Ca-b-146		2-FPh	H	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-b-148	5-e	Int.c-b-3	BRA39	4-FPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-b-149	1-a	Ca-b-148		4-FPh	H	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-b-150	5-e	Int.c-b-3	BRA42	4-ClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		444 (M^++1)
Ca-b-151	1-a	Ca-b-150		4-ClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-b-152	5-e	Int.c-b-3	BRA44	3-CF3Ph	Et	H	1Me-5-Ind	C		478 (M^++1)
Ca-b-153	1-a	Ca-b-152		3-CF3Ph	H	H	1Me-5-Ind	C		450 (M^++1)
Ca-b-154		Ca-a-212		2,4-DFPh	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-b-155	5-e	Int.c-b-3	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		446 (M^++1)
Ca-b-156	1-a	Ca-b-155		2,6-DFPh	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-b-157	5-e	Int.c-b-3	BRA50	3,4-DFPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		446 (M^++1)
Ca-b-158	1-a	Ca-b-157		3,4-DFPh	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-b-159	5-e	Int.c-b-3	BRA51	3,5-DClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
Ca-b-160	1-a	Ca-b-159		3,5-DClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
Ca-b-161	5-e	Int.c-b-3	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
Ca-b-162	1-a	Ca-b-161		3,4-DClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
Ca-b-163	5-e	Int.c-b-3	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-b-164	1-a	Ca-b-163		2,3-DMePh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-b-165		Ca-a-224		2,4-DMePh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-b-166	5-e	Int.c-b-3	BRA58	2-Furan	Et	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-b-167	1-a	Ca-b-166		2-Furan	H	H	1Me-5-Ind	C		372 (M^++1)
Ca-b-168	5-e	Int.c-b-3	BRA59	3-Furan	Et	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-b-169	1-a	Ca-b-168		3-Furan	H	H	1Me-5-Ind	C		372 (M^++1)
Ca-b-170	5-e	Int.c-b-3	BRA60	2-Thiophene	Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-b-171	1-a	Ca-b-170		2-Thiophene	H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-b-172	5-e	Int.c-b-3	BRA61	3-Thiophene	Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-b-173	1-a	Ca-b-172		3-Thiophene	H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-b-174		Ca-a-234		4-Pyridine	H	H	1Me-5-Ind	C		383 (M^++1)
Ca-b-175	5-e	Int.c-b-3	BRA64	3-PhPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		486 (M^++1)
Ca-b-176	1-a	Ca-b-175		3-PhPh	H	H	1Me-5-Ind	C		458 (M^++1)
Ca-b-177		Ca-a-238		4FPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-b-178		Ca-a-240		4FPhC_2H_4-	H	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-b-179	5-e	Int.c-b-3	BRA68	4ClPhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		471 (M^++1)
Ca-b-180	1-a	Ca-b-179		4ClPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		442 (M^++1)

[0364] [表106]

Table-Ca-B-5

Exp.	Syn.	SM1	SM2	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-181	5-e	Int.c-b-3	BRA73		Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-b-182	1-a	Ca-b-181			H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-b-183	9-j	Ca-b-181			Et	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-b-184	1-a	Ca-b-183			H	H	1Me-5-Ind	C		390 (M^++1)
Ca-b-185		Ca-a-252		Ph	H	H	5-1Idz	C		369 (M^++1)
Ca-b-186	5-e	Int.c-b-4	BRA17	4-MePh	Et	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-b-187	1-a	Ca-b-186		4-MePh	H	H	5-1Idz	C		383 (M^++1)
Ca-b-188	5-e	Int.c-b-4	BRA19	4-EtPh	Et	H	5-1Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-189	1-a	Ca-b-188		4-EtPh	H	H	5-1Idz	C		397 (M^++1)
Ca-b-190		Ca-a-260		2-iPrPh	H	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-b-191	5-e	Int.c-b-4	BRA22	1-nBuPh	Et	H	5-1Idz	C		453 (M^++1)
Ca-b-192	1-a	Ca-b-191		1-nBuPh	H	H	5-1Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-193	5-e	Int.c-b-4	BRA25	3-MeOPh	Et	H	5-1Idz	C		427 (M^++1)
Ca-b-194	1-a	Ca-b-193		3-MeOPh	H	H	5-1Idz	C		399 (M^++1)
Ca-b-195	5-e	Int.c-b-4	BRA28	3-EtOPh	Et	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
Ca-b-196	1-a	Ca-b-195		3-EtOPh	H	H	5-1Idz	C		413 (M^++1)
Ca-b-197	5-e	Int.c-b-4	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	5-1Idz	C		455 (M^++1)
Ca-b-198	1-a	Ca-b-197		4-iPrOPh	H	H	5-1Idz	C		427 (M^++1)
Ca-b-199	5-e	Int.c-b-4	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	5-1Idz	C		455 (M^++1)
Ca-b-200	1-a	Ca-b-199		3-nPrOPh	H	H	5-1Idz	C		427 (M^++1)
Ca-b-201		Ca-a-276		4-DMAPh	H	H	5-1Idz	C		412 (M^++1)
Ca-b-202	5-e	Int.c-b-4	BRA37	2-FPh	Et	H	5-1Idz	C		415 (M^++1)
Ca-b-203	1-a	Ca-b-202		2-FPh	H	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-b-204	5-e	Int.c-b-4	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
Ca-b-205	1-a	Ca-b-204		3-ClPh	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-b-206	5-e	Int.c-b-4	BRA42	4-ClPh	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
Ca-b-207	1-a	Ca-b-206		4-ClPh	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-b-208	5-e	Int.c-b-4	BRA44	3-CF3Ph	Et	H	5-1Idz	C		465 (M^++1)
Ca-b-209	1-a	Ca-b-208		3-CF3Ph	H	H	5-1Idz	C		437 (M^++1)
Ca-b-210	5-e	Int.c-b-4	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	5-1Idz	C		433 (M^++1)
Ca-b-211	1-a	Ca-b-210		2,3-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-b-212	5-e	Int.c-b-4	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	5-1Idz	C		433 (M^++1)
Ca-b-213	1-a	Ca-b-212		2,5-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-b-214		Ca-a-294		2,6-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-b-215		Ca-a-298		2,4-DClPh	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
Ca-b-216		Ca-a-302		3,4-DClPh	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
Ca-b-217	5-e	Int.c-b-4	BRA58	2-Furan	Et	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-b-218	1-a	Ca-b-217		2-Furan	H	H	5-1Idz	C		359 (M^++1)
Ca-b-219	5-e	Int.c-b-4	BRA59	3-Furan	Et	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-b-220	1-a	Ca-b-219		3-Furan	H	H	5-1Idz	C		359 (M^++1)
Ca-b-221	5-e	Int.c-b-4	BRA60	2-Thiophene	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-b-222	1-a	Ca-b-221		2-Thiophene	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)
Ca-b-223	5-e	Int.c-b-4	BRA61	3-Thiophene	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-b-224	1-a	Ca-b-223		3-Thiophene	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)
Ca-b-225		Ca-a-316		3-Pyridine	H	H	5-1Idz	C		398 (M^++1)
Ca-b-226		Ca-a-318		4-Pyridine	H	H	5-1Idz	C		370 (M^++1)

[0365] [表107]

Table-Ca-B-6

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-225		Ca-a-316		3-Pyridine	H	H	5-1Idz	C		398 (M^++1)
Ca-b-226		Ca-a-318		4-Pyridine	H	H	5-1Idz	C		370 (M^++1)
Ca-b-227	5-e	Int.c-b-4	BRA66	C_4H_9CH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-b-228	1-a	Ca-b-227		C_4H_9CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)
Ca-b-229	9-j	Ca-b-227		nHex-	Et	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-b-230	1-a	Ca-b-229		nHex-	H	H	5-1Idz	C		377 (M^++1)
Ca-b-231	5-e	Int.c-b-4	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
Ca-b-232	1-a	Ca-b-231		4FPhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		413 (M^++1)
Ca-b-233	9-j	Ca-b-231		$4FPhC_2H_4$-	Et	H	5-1Idz	C		443 (M^++1)
Ca-b-234	1-a	Ca-b-233		$4FPhC_2H_4$-	H	H	5-1Idz	C		415 (M^++1)
Ca-b-235	5-e	Int.c-b-4	BRA68	4ClPhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		457 (M^++1)
Ca-b-236	1-a	Ca-b-235		4ClPhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		429 (M^++1)
Ca-b-237	5-e	Int.c-b-4	BRA70	4CF3PhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		491 (M^++1)
Ca-b-238	1-a	Ca-b-237		4CF3PhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		463 (M^++1)
Ca-b-239	9-j	Ca-b-237		$4CF3PhC_2H_4$-	Et	H	5-1Idz	C		493 (M^++1)
Ca-b-240	1-a	Ca-b-239		$4CF3PhC_2H_4$-	H	H	5-1Idz	C		465 (M^++1)
Ca-b-241	5-e	Int.c-b-4	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		437 (M^++1)
Ca-b-242	1-a	Ca-b-241		4MePhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		409 (M^++1)
Ca-b-243	9-j	Ca-b-241		$4MePhC_2H_4$-	Et	H	5-1Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-244	1-a	Ca-b-243		$4MePhC_2H_4$-	H	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-b-245		Ca-a-340		Ph	H	H	1Me-5-Idz	C		383 (M^++1)
Ca-b-246	5-e	Int.c-b-5	BRA15	2-MePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-247	1-a	Ca-b-246		2-MePh	H	H	1Me-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-b-248	5-e	Int.c-b-5	BRA16	3-MePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-249	1-a	Ca-b-248		3-MePh	H	H	1Me-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-b-250	5-e	Ca-b-249	BRA18	2-EtPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-251	1-a	Int.c-b-5		2-EtPh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-b-252	5-e	Ca-b-251	BRA20	2-iPrPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		453 (M^++1)
Ca-b-253	1-a	Int.c-b-5		2-iPrPh	H	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-254		Ca-a-352		1-nBuPh	H	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-255	5-e	Int.c-b-5	BRA23	4-tBuPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-b-256	1-a	Ca-b-255		4-tBuPh	H	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-257	5-e	Int.c-b-5	BRA25	3-MeOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-b-258	1-a	Ca-b-257		3-MeOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
Ca-b-259	5-e	Int.c-b-5	BRA26	4-MeOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-b-260	1-a	Ca-b-259		4-MeOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
Ca-b-261	5-e	Int.c-b-5	BRA28	3-EtOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-b-262	1-a	Ca-b-261		3-EtOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
Ca-b-263	5-e	Int.c-b-5	BRA29	3-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-b-264	1-a	Ca-b-263		3-iPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-b-265	5-e	Int.c-b-5	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-b-266	1-a	Ca-b-265		4-iPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-b-267	5-e	Int.c-b-5	BRA32	4-nPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-b-268	1-a	Ca-b-267		4-nPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-b-269	5-e	Int.c-b-5	BRA33	3-nBuOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		483 (M^++1)
Ca-b-270	1-a	Ca-b-269		3-nBuOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)

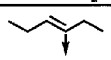
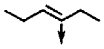
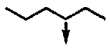
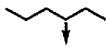
[0366] [表108]

Table-Ca-B-7

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-271	5-e	Int.c-b-5	BRA36	4-DMAPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		454 (M^++1)
Ca-b-272	1-a	Ca-b-271		4-DMAPh	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
Ca-b-273		Ca-a-376		2-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-b-274		Ca-a-378		3-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-b-275		Ca-a-380		4-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-b-276	5-e	Int.c-b-5	BRA42	4-ClPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		445 (M^++1)
Ca-b-277	1-a	Ca-b-276		4-ClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-b-278	5-e	Int.c-b-5	BRA43	2-CF3Ph	Et	H	1Me-5-Idz	C		479 (M^++1)
Ca-b-279	1-a	Ca-b-278		2-CF3Ph	H	H	1Me-5-Idz	C		451 (M^++1)
Ca-b-280	5-e	Int.c-b-5	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-b-281	1-a	Ca-b-280		2,3-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-b-282	5-e	Int.c-b-5	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-b-283	1-a	Ca-b-282		2,5-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-b-284	5-e	Int.c-b-5	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-b-285	1-a	Ca-b-284		2,6-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-b-286	5-e	Int.c-b-5	BRA51	3,5-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-b-287	1-a	Ca-b-286		3,5-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-b-288		Ca-a-394		2,4-DClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
Ca-b-289		Ca-a-396		3,5-DClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
Ca-b-290	5-e	Int.c-b-5	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-291	1-a	Ca-b-290		2,3-DMePh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-b-292	5-e	Int.c-b-5	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-293	1-a	Ca-b-292		2,6-DMePh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-b-294	5-e	Ca-b-293	BRA58	2-Furan	Et	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-b-295	1-a	Ca-b-294		2-Furan	H	H	1Me-5-Idz	C		373 (M^++1)
Ca-b-296	5-e	Ca-b-295	BRA59	3-Furan	Et	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-b-297	1-a	Ca-b-296		3-Furan	H	H	1Me-5-Idz	C		373 (M^++1)
Ca-b-298	5-e	Ca-b-297	BRA60	2-Thiophene	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-b-299	1-a	Int.c-b-5		2-Thiophene	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-b-300	5-e	Ca-b-299	BRA61	3-Thiophene	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-b-301	1-a	Int.c-b-5		3-Thiophene	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-b-302		Ca-a-410		3-Pyridine	H	H	1Me-5-Idz	C		384 (M^++1)
Ca-b-303		Ca-a-412		4-Pyridine	H	H	1Me-5-Idz	C		384 (M^++1)
Ca-b-304	5-e	Int.c-b-5	BRA64	3-PhPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		487 (M^++1)
Ca-b-305	1-a	Ca-b-304		3-PhPh	H	H	1Me-5-Idz	C		459 (M^++1)
Ca-b-306	5-e	Int.c-b-5	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-b-307	1-a	Ca-b-306		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-b-308	9-j	Ca-b-306		nHex-	Et	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-b-309	1-a	Ca-b-308		nHex-	H	H	1Me-5-Idz	C		391 (M^++1)
Ca-b-310	5-e	Int.c-b-5	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-b-311	1-a	Ca-b-310		4FPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
Ca-b-312	9-j	Ca-b-310		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		457 (M^++1)
Ca-b-313	1-a	Ca-b-312		$4FPhC_2H_4-$	H	H	1Me-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-b-314	5-e	Int.c-b-5	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		443 (M^++1)
Ca-b-315	1-a	Ca-b-314		2cHexCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-b-316	9-j	Ca-b-314		$2cHexC_2H_4-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		445 (M^++1)

[0367] [表109]

Table-Ca-B-8

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-317	1-a	Ca-b-316		2cHexC_2H_4-	H	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-b-318	5-e	Int.c-b-5	BRA70	4CF_3PhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		505 (M^++1)
Ca-b-319	1-a	Ca-b-318		4CF3PhCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		477 (M^++1)
Ca-b-320	5-e	Ca-b-318		4CF3PhC_2H_4-	Et	H	1Me-5-Idz	C		507 (M^++1)
Ca-b-321	1-a	Ca-b-320		4CF3PhC_2H_4-	H	H	1Me-5-Idz	C		479 (M^++1)
Ca-b-322	5-e	Int.c-b-5	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		451 (M^++1)
Ca-b-323	1-a	Ca-b-322		4MePhCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		423 (M^++1)
Ca-b-324	9-j	Ca-b-322		4Me-PhC_2H_4-	Et	H	1Me-5-Idz	C		453 (M^++1)
Ca-b-325	1-a	Ca-b-324		4Me-PhC_2H_4-	H	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-326	5-e	Int.c-b-5	BRA73		Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-b-327	1-a	Ca-b-326			H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-b-328	9-j	Ca-b-326			Et	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-b-329	1-a	Ca-b-328			H	H	1Me-5-Idz	C		391 (M^++1)
Ca-b-330	5-e	Int.c-b-6	BRA14	Ph	Et	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-331	1-a	Ca-b-330		Ph	H	H	1Et-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-b-332	5-e	Int.c-b-6	BRA15	2-MePh	Et	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-333	1-a	Ca-b-332		2-MePh	H	H	1Et-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-b-334		Ca-a-438		3-MePh	H	H	1Et-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-b-335		Ca-a-440		2-EtPh	H	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-336	5-e	Int.c-b-6	BRA20	2-iPrPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-b-337	1-a	Ca-b-336		2-iPrPh	H	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-338	5-e	Int.c-b-6	BRA27	2-EtOPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-b-339	1-a	Ca-b-338		2-EtOPh	H	H	1Et-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-b-340		Ca-a-444		3-nPrOPh	H	H	1Et-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-b-341	5-e	Int.c-b-6	BRA35	3-DMAPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		468 (M^++1)
Ca-b-342	1-a	Ca-b-341		3-DMAPh	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
Ca-b-343		Ca-a-450		3-FPh	H	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-b-344	5-e	Int.c-b-6	BRA40	2-ClPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		460 (M^++1)
Ca-b-345	1-a	Ca-b-344		2-ClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-b-346		Ca-a-454		3-ClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-b-347	5-e	Int.c-b-6	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		461 (M^++1)
Ca-b-348	1-a	Ca-b-347		2,4-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-b-349	5-e	Int.c-b-6	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		461 (M^++1)
Ca-b-350	1-a	Ca-b-349		2,5-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-b-351		Ca-a-462		3,4-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-b-352	5-e	Ca-b-351	BRA53	3,5-DClPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		494 (M^++1)
Ca-b-353	1-a	Int.c-b-6		3,5-DClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		466 (M^++1)
Ca-b-354	5-e	Ca-b-353	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		494 (M^++1)
Ca-b-355	1-a	Ca-b-354		3,4-DClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		466 (M^++1)
Ca-b-356		Ca-a-470		2,6-DMePh	H	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-b-357	5-e	Ca-b-356	BRA58	2-Furan	Et	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-b-358	1-a	Ca-b-357		2-Furan	H	H	1Et-5-Idz	C		387 (M^++1)
Ca-b-359	5-e	Ca-b-358	BRA61	3-Thiophene	Et	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-b-360	1-a	Ca-b-359		3-Thiophene	H	H	1Et-5-Idz	C		403 (M^++1)

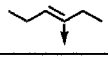
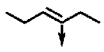
[0368] [表110]

Table-Ca-B-9

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-361		Ca-a-476		4-Pyridine	H	H	1Et-5-Idz	C		398 (M^++1)
Ca-b-362		Ca-a-478		4-PhPh	H	H	1Et-5-Idz	C		473 (M^++1)
Ca-b-363	5-e	Int.c-b-6	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	1Et-5-Idz	C		457 (M^++1)
Ca-b-364	1-a	Ca-b-363		2cHexCH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-b-365	9-j	Ca-b-363		2cHexC_2H_4-	Et	H	1Et-5-Idz	C		459 (M^++1)
Ca-b-366	1-a	Ca-b-365		2cHexC_2H_4-	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-b-367	5-e	Int.c-b-6	BRA71	4MePhCH=CH-	Et	H	1Et-5-Idz	C		465 (M^++1)
Ca-b-368	1-a	Ca-b-367		4MePhCH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		437 (M^++1)
Ca-b-369	5-e	Ca-b-367		4MePhC_2H_4-	Et	H	1Et-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-b-370	1-a	Ca-b-369		4MePhC_2H_4-	H	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-b-371		Ca-a-492		Ph	H	H	5-BF	C		369 (M^++1)
Ca-b-372		Ca-a-494		3-MePh	H	H	5-BF	C		383 (M^++1)
Ca-b-373		Ca-a-498		2-iPrPh	H	H	5-BF	C		411 (M^++1)
Ca-b-374		Ca-a-500		4-tBuPh	H	H	5-BF	C		425 (M^++1)
Ca-b-375	5-e	Int.c-b-7	BRA25	3-MeOPh	Et	H	5-BF	C		427 (M^++1)
Ca-b-376	1-a	Ca-b-375		3-MeOPh	H	H	5-BF	C		399 (M^++1)
Ca-b-377	5-e	Int.c-b-7	BRA27	2-EtOPh	Et	H	5-BF	C		441 (M^++1)
Ca-b-378	1-a	Ca-b-377		2-EtOPh	H	H	5-BF	C		413 (M^++1)
Ca-b-379		Ca-a-506		3-nPrOPh	H	H	5-BF	C		427 (M^++1)
Ca-b-380		Ca-a-508		3-nBuOPh	H	H	5-BF	C		441 (M^++1)
Ca-b-381		Ca-a-510		3-DMAPh	H	H	5-BF	C		412 (M^++1)
Ca-b-382	5-e	Int.c-b-7	BRA36	4-DMAPh	Et	H	5-BF	C		412 (M^++1)
Ca-b-383	1-a	Ca-b-382		4-DMAPh	H	H	5-BF	C		440 (M^++1)
Ca-b-384		Ca-a-512		2-FPh	H	H	5-BF	C		387 (M^++1)
Ca-b-385		Ca-a-514		4-FPh	H	H	5-BF	C		387 (M^++1)
Ca-b-386	5-e	Int.c-b-7	BRA42	4-ClPh	Et	H	5-BF	C		403 (M^++1)
Ca-b-387	1-a	Ca-b-386		4-ClPh	H	H	5-BF	C		431 (M^++1)
Ca-b-388	5-e	Int.c-b-7	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	5-BF	C		465 (M^++1)
Ca-b-389	1-a	Ca-b-388		4-CF3Ph	H	H	5-BF	C		437 (M^++1)
Ca-b-390	5-e	Int.c-b-7	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	5-BF	C		433 (M^++1)
Ca-b-391	1-a	Ca-b-390		2,4-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-b-392	5-e	Int.c-b-7	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	5-BF	C		433 (M^++1)
Ca-b-393	1-a	Ca-b-392		2,6-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-b-394		Ca-a-524		3,4-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-b-395		Ca-a-526		3,5-DClPh	H	H	5-BF	C		438 (M^++1)
Ca-b-396	5-e	Int.c-b-7	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	5-BF	C		425 (M^++1)
Ca-b-397	1-a	Ca-b-396		2,6-DMePh	H	H	5-BF	C		397 (M^++1)
Ca-b-398		Ca-a-532		2-Furan	H	H	5-BF	C		359 (M^++1)
Ca-b-399		Ca-a-534		3-Thiophene	H	H	5-BF	C		375 (M^++1)
Ca-b-400		Ca-a-538		Ph	H	H	6-Qu	C		380 (M^++1)
Ca-b-401		Ca-a-542		4-MePh	H	H	6-Qu	C		394 (M^++1)
Ca-b-402	5-e	Int.c-b-8	BRA22	1-nBuPh	Et	H	6-Qu	C		464 (M^++1)
Ca-b-403	1-a	Ca-b-402		1-nBuPh	H	H	6-Qu	C		436 (M^++1)
Ca-b-404		Ca-a-546		3-MeOPh	H	H	6-Qu	C		410 (M^++1)
Ca-b-405		Ca-a-550		4-iPrOPh	H	H	6-Qu	C		438 (M^++1)
Ca-b-406	5-e	Ca-b-405	BRA35	3-DMAPh	Et	H	6-Qu	C		451 (M^++1)

[0369] [表111]

Table-Ca-B-10

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-407	1-a	Ca-b-406		3-DMAPh	H	H	6-Qu	C		423 (M^++1)
Ca-b-408		Ca-a-554		3-FPh	H	H	6-Qu	C		398 (M^++1)
Ca-b-409	5-e	Ca-b-408	BRA42	4-ClPh	Et	H	6-Qu	C		442 (M^++1)
Ca-b-410	1-a	Ca-b-409		4-ClPh	H	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-b-411	5-e	Int.c-b-8	BRA44	3-CF3Ph	Et	H	6-Qu	C		476 (M^++1)
Ca-b-412	1-a	Ca-b-411		3-CF3Ph	H	H	6-Qu	C		448 (M^++1)
Ca-b-413		Ca-a-560		2,4-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-b-414	5-e	Int.c-b-8	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	6-Qu	C		444 (M^++1)
Ca-b-415	1-a	Ca-b-414		2,6-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-b-416		Ca-a-562		3,4-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-b-417		Ca-a-566		2,4-DClPh	H	H	6-Qu	C		449 (M^++1)
Ca-b-418	5-e	Int.c-b-8	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	6-Qu	C		436 (M^++1)
Ca-b-419	1-a	Ca-b-418		2,3-DMePh	H	H	6-Qu	C		408 (M^++1)
Ca-b-420		Ca-a-572		2-Furan	H	H	6-Qu	C		370 (M^++1)
Ca-b-421	5-e	Int.c-b-8	BRA59	3-Furan	Et	H	6-Qu	C		398 (M^++1)
Ca-b-422	1-a	Ca-b-421		3-Furan	H	H	6-Qu	C		370 (M^++1)
Ca-b-423		Ca-a-574		2-Thiophene	H	H	6-Qu	C		386 (M^++1)
Ca-b-424	5-e	Int.c-b-8	BRA61	3-Thiophene	Et	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-b-425	1-a	Ca-b-424		3-Thiophene	H	H	6-Qu	C		386 (M^++1)
Ca-b-426		Ca-a-576		3-Pyridine	H	H	6-Qu	C		381 (M^++1)
Ca-b-427		Ca-a-578		4-PhPh	H	H	6-Qu	C		456 (M^++1)
Ca-b-428	5-e	Int.c-b-8	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	6-Qu	C		440 (M^++1)
Ca-b-429	1-a	Ca-b-428		2cHexCH=CH-	H	H	6-Qu	C		412 (M^++1)
Ca-b-430	9-j	Ca-b-428		2cHexC_2H_4-	Et	H	6-Qu	C		442 (M^++1)
Ca-b-431	1-a	Ca-b-430		2cHexC_2H_4-	H	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-b-432		Ca-a-584		4MePhCH=CH-	H	H	6-Qu	C		448 (M^++1)
Ca-b-433		Ca-a-586		4MePhC_2H_4-	H	H	6-Qu	C		422 (M^++1)
Ca-b-434	5-e	Int.c-b-8	BRA73		Et	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-b-435	1-a	Ca-b-434			H	H	6-Qu	C		386 (M^++1)
Ca-b-436	5-e	Int.c-b-1	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-b-437	1-a	Ca-b-436		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	2-Nap	C		343 (M^++1)
Ca-b-438	9-j	Ca-b-436		nPr	Et	H	2-Nap	C		373 (M^++1)
Ca-b-439	1-a	Ca-b-438		nPr	H	H	2-Nap	C		345 (M^++1)
Ca-b-440	5-e	Int.c-b-1	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-b-441	1-a	Ca-b-440		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	2-Nap	C		343 (M^++1)
Ca-b-442	5-e	Int.c-b-1	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		399 (M^++1)
Ca-b-443	1-a	Ca-b-442		C_3H_7CH=CH-	H	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-b-444	9-j	Ca-b-442		nPen	Et	H	2-Nap	C		401 (M^++1)
Ca-b-445	1-a	Ca-b-444		nPen	H	H	2-Nap	C		373 (M^++1)
Ca-b-446	5-e	Int.c-b-2	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	5-Ind	C		360 (M^++1)
Ca-b-447	1-a	Ca-b-446		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-Ind	C		332 (M^++1)
Ca-b-448		Ca-b-446		nPr	H	H	5-Ind	C		362 (M^++1)
Ca-b-449	1-a	Ca-b-448		nPr	H	H	5-Ind	C		334 (M^++1)
Ca-b-450		Ca-a-604		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-Ind	C		360 (M^++1)

[0370] [表112]

Table-Ca-B-11

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-b-451	5-e	Int.c-b-3	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-b-452	1-a	Ca-b-451		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		346 (M^++1)
Ca-b-453	9-j	Ca-b-451		nPr	Et	H	1Me-5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-b-454	1-a	Ca-b-453		nPr	H	H	1Me-5-Ind	C		348 (M^++1)
Ca-b-455	5-e	Int.c-b-3	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-b-456	1-a	Ca-b-455		C_3H_7CH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-b-457	9-j	Ca-b-455		nPen	Et	H	1Me-5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-b-458	1-a	Ca-b-457		nPen	H	H	1Me-5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-b-459	5-e	Int.c-b-4	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		361 (M^++1)
Ca-b-460	1-a	Ca-b-459		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		333 (M^++1)
Ca-b-461	9-j	Ca-b-459		nPr	Et	H	5-1Idz	C		363 (M^++1)
Ca-b-462	1-a	Ca-b-461		nPr	H	H	5-1Idz	C		335 (M^++1)
Ca-b-463	5-e	Int.c-b-4	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		361 (M^++1)
Ca-b-464	1-a	Ca-b-463		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		333 (M^++1)
Ca-b-465		Ca-a-616		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		389 (M^++1)
Ca-b-466		Ca-a-618		nPen	H	H	5-1Idz	C		363 (M^++1)
Ca-b-467	5-e	Int.c-b-6	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Ca-b-468	1-a	Ca-b-467		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		347 (M^++1)
Ca-b-469	9-j	Ca-b-467		nPr	Et	H	1Me-5-Idz	C		377 (M^++1)
Ca-b-470	1-a	Ca-b-469		nPr	H	H	1Me-5-Idz	C		349 (M^++1)
Ca-b-471	5-e	Int.c-b-6	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Ca-b-472	1-a	Ca-b-471		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		347 (M^++1)
Ca-b-473	5-e	Int.c-b-6	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		403 (M^++1)
Ca-b-474	1-a	Ca-b-473		C_3H_7CH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Ca-b-475	9-j	Ca-b-473		nPen	Et	H	1Me-5-Idz	C		405 (M^++1)
Ca-b-476	1-a	Ca-b-475		nPen	H	H	1Me-5-Idz	C		377 (M^++1)
Ca-b-477		Ca-a-626		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-b-478		Ca-a-628		nPr	H	H	1Et-5-Idz	C		363 (M^++1)
Ca-b-479		Ca-a-630		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-BF	C		333 (M^++1)
Ca-b-480	5-e	Int.c-b-7	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	5-BF	C		361 (M^++1)
Ca-b-481	1-a	Ca-b-479		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	5-BF	C		333 (M^++1)
Ca-b-482	5-e	Int.c-b-7	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	5-BF	C		361 (M^++1)
Ca-b-483	1-a	Ca-b-482		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-BF	C		389 (M^++1)
Ca-b-484	5-e	Int.c-b-8	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	6-Qu	C		372 (M^++1)
Ca-b-485	1-a	Ca-b-483		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	6-Qu	C		344 (M^++1)
Ca-b-486	9-j	Ca-b-483		nPr	Et	H	6-Qu	C		346 (M^++1)
Ca-b-487	1-a	Ca-b-486		nPr	H	H	6-Qu	C		374 (M^++1)
Ca-b-488		Ca-a-636		C_3H_7CH=CH-	H	H	6-Qu	C		372 (M^++1)

[0371] [表113]

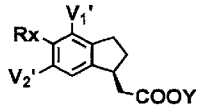
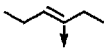
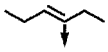
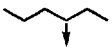
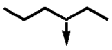


Table-Ca-C-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-1	5-e	Int.c-c-1	BRA14	Ph	Et	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-c-2	1-a	Ca-c-1		Ph	H	H	2-Nap	C		379 (M^++1)
Ca-c-3	5-e	Int.c-c-1	BRA16	3-MePh	Et	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-c-4	1-a	Ca-c-3		3-MePh	H	H	2-Nap	C		393 (M^++1)
Ca-c-5	5-e	Int.c-c-1	BRA17	4-MePh	Et	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-c-6	1-a	Ca-c-5		4-MePh	H	H	2-Nap	C		393 (M^++1)
Ca-c-7	5-e	Int.c-c-1	BRA18	2-EtPh	Et	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-c-8	1-a	Ca-c-7		2-EtPh	H	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-c-9	5-e	Int.c-c-1	BRA20	2-iPrPh	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
Ca-c-10	1-a	Ca-c-9		2-iPrPh	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-c-11	5-e	Int.c-c-1	BRA21	4-iPrPh	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
Ca-c-12	1-a	Ca-c-11		4-iPrPh	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
Ca-c-13	5-e	Int.c-c-1	BRA23	4-tBuPh	Et	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
Ca-c-14	1-a	Ca-c-13		4-tBuPh	H	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-c-15	5-e	Int.c-c-1	BRA24	2-MeOPh	Et	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-c-16	1-a	Ca-c-15		2-MeOPh	H	H	2-Nap	C		409 (M^++1)
Ca-c-17	5-e	Int.c-c-1	BRA25	3-MeOPh	Et	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-c-18	1-a	Ca-c-17		3-MeOPh	H	H	2-Nap	C		409 (M^++1)
Ca-c-19	5-e	Int.c-c-1	BRA27	2-EtOPh	Et	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-c-20	1-a	Ca-c-19		2-EtOPh	H	H	2-Nap	C		423 (M^++1)
Ca-c-21	5-e	Int.c-c-1	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
Ca-c-22	1-a	Ca-c-21		4-iPrOPh	H	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-c-23	5-e	Int.c-c-1	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
Ca-c-24	1-a	Ca-c-23		3-nPrOPh	H	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
Ca-c-25	5-e	Int.c-c-1	BRA33	3-nBuOPh	Et	H	2-Nap	C		479 (M^++1)
Ca-c-26	1-a	Ca-c-25		3-nBuOPh	H	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-c-27	5-e	Int.c-c-1	BRA36	4-DMAPh	Et	H	2-Nap	C		450 (M^++1)
Ca-c-28	1-a	Ca-c-27		4-DMAPh	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
Ca-c-29	5-e	Int.c-c-1	BRA37	2-FPh	Et	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-c-30	1-a	Ca-c-29		2-FPh	H	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-c-31	5-e	Int.c-c-1	BRA38	3-FPh	Et	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-c-32	1-a	Ca-c-31		3-FPh	H	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-c-33	5-e	Int.c-c-1	BRA41	3-ClPh	Et	H	2-Nap	C		441 (M^++1)
Ca-c-34	1-a	Ca-c-33		3-ClPh	H	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-c-35		Ca-a-40		4-ClPh	H	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-c-36		Ca-a-42		3-CF3Ph	H	H	2-Nap	C		447 (M^++1)
Ca-c-37	5-e	Int.c-c-1	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
Ca-c-38	1-a	Ca-c-37		2,5-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-c-39		Ca-a-48		2,6-DFPh	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-c-40		Ca-a-54		2,4-DClPh	H	H	2-Nap	C		448 (M^++1)
Ca-c-41	5-e	Int.c-c-1	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
Ca-c-42	1-a	Ca-c-41		2,4-DMePh	H	H	2-Nap	C		407 (M^++1)
Ca-c-43	5-e	Int.c-c-1	BRA58	2-Furan	Et	H	2-Nap	C		397 (M^++1)
Ca-c-44	1-a	Ca-c-43		2-Furan	H	H	2-Nap	C		369 (M^++1)

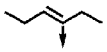
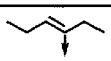
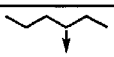
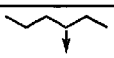
[0372] [表114]

Table-Ca-C-2

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-45		Ca-a-64		3-Furan	H	H	2-Nap	C		369 (M^++1)
Ca-c-46	5-e	Int.c-c-1	BRA60	2-Thiophene	Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-c-47	1-a	Ca-c-46		2-Thiophene	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-c-48		Ca-a-68		3-Thiophene	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-c-49	5-e	Int.c-c-1	BRA62	3-Pyridine	Et	H	2-Nap	C		408 (M^++1)
Ca-c-50	1-a	Ca-c-49		3-Pyridine	H	H	2-Nap	C		380 (M^++1)
Ca-c-51	5-e	Int.c-c-1	BRA65	4-PhPh	Et	H	2-Nap	C		483 (M^++1)
Ca-c-52	1-a	Ca-c-51		4-PhPh	H	H	2-Nap	C		455 (M^++1)
Ca-c-53	5-e	Int.c-c-1	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-c-54	1-a	Ca-c-53		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-c-55	9-j	Ca-c-53		nHex-	Et	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-c-56	1-a	Ca-c-55		nHex-	H	H	2-Nap	C		387 (M^++1)
Ca-c-57	5-e	Int.c-c-1	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
Ca-c-58	1-a	Ca-c-57		4FPhCH=CH-	H	H	2-Nap	C		423 (M^++1)
Ca-c-59	9-j	Ca-c-57		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	2-Nap	C		453 (M^++1)
Ca-c-60	1-a	Ca-c-59		$4FPhC_2H_4-$	H	H	2-Nap	C		425 (M^++1)
Ca-c-61	5-e	Int.c-c-1	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	2-Nap	C		439 (M^++1)
Ca-c-62	1-a	Ca-c-61		2cHexCH=CH-	H	H	2-Nap	C		411 (M^++1)
Ca-c-63	9-j	Ca-c-61		$2cHexC_2H_4-$	Et	H	2-Nap	C		441 (M^++1)
Ca-c-64	1-a	Ca-c-63		$2cHexC_2H_4-$	H	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-c-65	5-e	Int.c-c-1	BRA73		Et	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
Ca-c-66	1-a	Ca-c-65			H	H	2-Nap	C		385 (M^++1)
Ca-c-67	9-j	Ca-c-65			Et	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
Ca-c-68	1-a	Ca-c-67			H	H	2-Nap	C		387 (M^++1)
Ca-c-69	5-e	Int.c-c-2	BRA14	Ph	Et	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-c-70	1-a	Ca-c-69		Ph	H	H	5-Ind	C		368 (M^++1)
Ca-c-71	5-e	Int.c-c-2	BRA17	4-MePh	Et	H	5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-c-72	1-a	Ca-c-71		4-MePh	H	H	5-Ind	C		382 (M^++1)
Ca-c-73	5-e	Int.c-c-2	BRA19	4-EtPh	Et	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-c-74	1-a	Ca-c-73		4-EtPh	H	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-c-75		Ca-a-106		2-iPrPh	H	H	5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-c-76	5-e	Int.c-c-2	BRA26	4-MeOPh	Et	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-c-77	1-a	Ca-c-76		4-MeOPh	H	H	5-Ind	C		398 (M^++1)
Ca-c-78	5-e	Int.c-c-2	BRA28	3-EtOPh	Et	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-c-79	1-a	Ca-c-78		3-EtOPh	H	H	5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-c-80	5-e	Int.c-c-2	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-c-81	1-a	Ca-c-80		4-iPrOPh	H	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-c-82	5-e	Int.c-c-2	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-c-83	1-a	Ca-c-82		3-nPrOPh	H	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-c-84	5-e	Int.c-c-2	BRA35	3-DMAPh	Et	H	5-Ind	C		439 (M^++1)
Ca-c-85	1-a	Ca-c-84		3-DMAPh	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
Ca-c-86		Ca-a-126		2-FPh	H	H	5-Ind	C		414 (M^++1)
Ca-c-87	5-e	Int.c-c-2	BRA39	4-FPh	H	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-c-88	1-a	Ca-c-87		4-FPh	Et	H	5-Ind	C		414 (M^++1)

[0373] [表115]

Table-Ca-C-3

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-89	5-e	Int.c-c-2	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-Ind	C		430 (M^++1)
Ca-c-90	1-a	Ca-c-89		3-ClPh	H	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-c-91	5-e	Int.c-c-2	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-Ind	C		430 (M^++1)
Ca-c-92	1-a	Ca-c-91		3-ClPh	H	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-c-93	5-e	Int.c-c-2	BRA44	3-CF3Ph	Et	H	5-Ind	C		464 (M^++1)
Ca-c-94	1-a	Ca-c-93		3-CF3Ph	H	H	5-Ind	C		436 (M^++1)
Ca-c-95	5-e	Int.c-c-2	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-c-96	1-a	Ca-c-95		2,3-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-c-97	5-e	Int.c-c-2	BRA48	2,5-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-c-98	1-a	Ca-c-97		2,5-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-c-99	5-e	Int.c-c-2	BRA50	3,4-DFPh	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
Ca-c-100	1-a	Ca-c-99		3,4-DFPh	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-c-101		Ca-a-144		3,5-DClPh	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
Ca-c-102	5-e	Int.c-c-2	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	5-Ind	C		465 (M^++1)
Ca-c-103	1-a	Ca-c-102		3,4-DClPh	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
Ca-c-104	5-e	Int.c-c-2	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
Ca-c-105	1-a	Ca-c-104		2,4-DMePh	H	H	5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-c-106	5-e	Int.c-c-2	BRA58	2-Furan	Et	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-c-107	1-a	Ca-c-106		2-Furan	H	H	5-Ind	C		358 (M^++1)
Ca-c-108	5-e	Int.c-c-2	BRA59	3-Furan	Et	H	5-Ind	C		386 (M^++1)
Ca-c-109	1-a	Ca-c-108		3-Furan	H	H	5-Ind	C		358 (M^++1)
Ca-c-110	5-e	Int.c-c-2	BRA60	2-Thiophene	Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-c-111	1-a	Ca-c-110		2-Thiophene	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-c-112		Ca-a-158		3-Thiophene	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-c-113	5-e	Int.c-c-2	BRA62	3-Pyridine	Et	H	5-Ind	C		397 (M^++1)
Ca-c-114	1-a	Ca-c-113		3-Pyridine	H	H	5-Ind	C		369 (M^++1)
Ca-c-115	5-e	Int.c-c-2	BRA65	4-PhPh	Et	H	5-Ind	C		472 (M^++1)
Ca-c-116	1-a	Ca-c-115		4-PhPh	H	H	5-Ind	C		444 (M^++1)
Ca-c-117	5-e	Int.c-c-2	BRA66	C_4H_9CH=CH-	Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-c-118	1-a	Ca-c-116		C_4H_9CH=CH-	H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-c-119	9-j	Ca-c-116		nHex-	Et	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-c-120	1-a	Ca-c-120		nHex-	H	H	5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-c-121	5-e	Int.c-c-2	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-c-122	1-a	Ca-c-122		4FPhCH=CH-	H	H	5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-c-123	5-e	Int.c-c-2	BRA73		Et	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-c-124	1-a	Ca-c-123			H	H	5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-c-125	9-j	Ca-c-123			Et	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-c-126	1-a	Ca-c-125			H	H	5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-c-127	5-e	Int.c-c-3	BRA14	Ph	Et	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-c-128	1-a	Ca-c-127		Ph	H	H	1Me-5-Ind	C		382 (M^++1)
Ca-c-129	5-e	Int.c-c-3	BRA17	4-MePh	Et	H	1Me-5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-c-130	1-a	Ca-c-129		4-MePh	H	H	1Me-5-Ind	C		396 (M^++1)
Ca-c-131	5-e	Int.c-c-3	BRA18	2-EtPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-c-132	1-a	Ca-c-131		2-EtPh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)

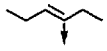
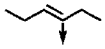
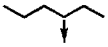
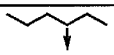
[0374] [表116]

Table-Ca-C-4

Exp.	Syn	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-133	5-e	Int.c-c-3	BRA22	1-nBuPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
Ca-c-134	1-a	Ca-c-133		1-nBuPh	H	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-c-135	5-e	Int.c-c-3	BRA25	3-MeOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-c-136	1-a	Ca-c-135		3-MeOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		412 (M^++1)
Ca-c-137		Ca-a-188		2-EtOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-c-138	5-e	Int.c-c-3	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
Ca-c-139	1-a	Ca-c-138		4-iPrOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-c-140	5-e	Int.c-c-3	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
Ca-c-141	1-a	Ca-c-140		3-nPrOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
Ca-c-142	5-e	Int.c-c-3	BRA34	4-nBuOPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
Ca-c-143	1-a	Ca-c-142		4-nBuOPh	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
Ca-c-144	5-e	Int.c-c-3	BRA36	4-DMAPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		453 (M^++1)
Ca-c-145	1-a	Ca-c-144		4-DMAPh	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
Ca-c-146	5-e	Int.c-c-3	BRA38	3-FPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-c-147	1-a	Ca-c-146		3-FPh	H	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-c-148	5-e	Int.c-c-3	BRA39	4-FPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)
Ca-c-149	1-a	Ca-c-148		4-FPh	H	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-c-150	5-e	Int.c-c-3	BRA40	2-ClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		444 (M^++1)
Ca-c-151	1-a	Ca-c-150		2-ClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-c-152	5-e	Int.c-c-3	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	1Me-5-Ind	C		478 (M^++1)
Ca-c-153	1-a	Ca-c-152		4-CF3Ph	H	H	1Me-5-Ind	C		450 (M^++1)
Ca-c-154		Ca-a-212		2,4-DFPh	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-c-155	5-e	Int.c-c-3	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		446 (M^++1)
Ca-c-156	1-a	Ca-c-155		2,6-DFPh	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-c-157	5-e	Int.c-c-3	BRA51	3,5-DClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
Ca-c-158	1-a	Ca-c-157		3,5-DClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
Ca-c-159	5-e	Int.c-c-3	BRA52	2,4-DClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
Ca-c-160	1-a	Ca-c-159		2,4-DClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
Ca-c-161	5-e	Int.c-c-3	BRA54	3,4-DClPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
Ca-c-162	1-a	Ca-c-161		3,4-DClPh	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
Ca-c-163	5-e	Int.c-c-3	BRA55	2,3-DMePh	Et	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
Ca-c-164	1-a	Ca-c-163		2,3-DMePh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-c-165		Ca-a-224		2,4-DMePh	H	H	1Me-5-Ind	C		410 (M^++1)
Ca-c-166	5-e	Int.c-c-3	BRA58	2-Furan	Et	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-c-167	1-a	Ca-c-166		2-Furan	H	H	1Me-5-Ind	C		372 (M^++1)
Ca-c-168	5-e	Int.c-c-3	BRA59	3-Furan	Et	H	1Me-5-Ind	C		400 (M^++1)
Ca-c-169	1-a	Ca-c-168		3-Furan	H	H	1Me-5-Ind	C		372 (M^++1)
Ca-c-170	5-e	Int.c-c-3	BRA60	2-Thiophene	Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-c-171	1-a	Ca-c-170		2-Thiophene	H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-c-172	5-e	Int.c-c-3	BRA61	3-Thiophene	Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-c-173	1-a	Ca-c-172		3-Thiophene	H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-c-174		Ca-a-234		4-Pyridine	H	H	1Me-5-Ind	C		383 (M^++1)
Ca-c-175	5-e	Int.c-c-3	BRA64	3-PhPh	Et	H	1Me-5-Ind	C		486 (M^++1)
Ca-c-176	1-a	Ca-c-175		3-PhPh	H	H	1Me-5-Ind	C		458 (M^++1)
Ca-c-177		Ca-a-238		4FPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)
Ca-c-178		Ca-a-240		4FPhC_2H_4-	H	H	1Me-5-Ind	C		428 (M^++1)

[0375] [表117]

Table-Ca-C-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-179	5-e	Int.c-c-3	BRA70	4CF_3PhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		504 (M^++1)
Ca-c-180	1-a	Ca-c-179		4CF_3PhCH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		476 (M^++1)
Ca-c-181	5-e	Int.c-c-3	BRA73		Et	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
Ca-c-182	1-a	Ca-c-181			H	H	1Me-5-Ind	C		388 (M^++1)
Ca-c-183	9-j	Ca-c-181			Et	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
Ca-c-184	1-a	Ca-c-183			H	H	1Me-5-Ind	C		390 (M^++1)
Ca-c-185		Ca-a-252		Ph	H	H	5-1Idz	C		369 (M^++1)
Ca-c-186	5-e	Int.c-c-4	BRA16	3-MePh	Et	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-c-187	1-a	Ca-c-186		3-MePh	H	H	5-1Idz	C		383 (M^++1)
Ca-c-188	5-e	Int.c-c-4	BRA19	4-EtPh	Et	H	5-1Idz	C		425 (M^++1)
Ca-c-189	1-a	Ca-c-188		4-EtPh	H	H	5-1Idz	C		397 (M^++1)
Ca-c-190		Ca-a-260		2-iPrPh	H	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
Ca-c-191	5-e	Int.c-c-4	BRA23	4-tBuPh	Et	H	5-1Idz	C		453 (M^++1)
Ca-c-192	1-a	Ca-c-191		4-tBuPh	H	H	5-1Idz	C		425 (M^++1)
Ca-c-193	5-e	Int.c-c-4	BRA24	2-MeOPh	Et	H	5-1Idz	C		427 (M^++1)
Ca-c-194	1-a	Ca-c-193		2-MeOPh	H	H	5-1Idz	C		399 (M^++1)
Ca-c-195	5-e	Int.c-c-4	BRA28	3-EtOPh	Et	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-196	1-a	Ca-c-195		3-EtOPh	H	H	5-1Idz	C		413 (M^++1)
Ca-c-197	5-e	Int.c-c-4	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	5-1Idz	C		455 (M^++1)
Ca-c-198	1-a	Ca-c-197		4-iPrOPh	H	H	5-1Idz	C		427 (M^++1)
Ca-c-199	5-e	Int.c-c-4	BRA33	3-nBuOPh	Et	H	5-1Idz	C		469 (M^++1)
Ca-c-200	1-a	Ca-c-199		3-nBuOPh	H	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-201		Ca-a-276		4-DMAPh	H	H	5-1Idz	C		412 (M^++1)
Ca-c-202	5-e	Int.c-c-4	BRA38	3-FPh	Et	H	5-1Idz	C		415 (M^++1)
Ca-c-203	1-a	Ca-c-202		3-FPh	H	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-c-204	5-e	Int.c-c-4	BRA42	4-ClPh	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
Ca-c-205	1-a	Ca-c-204		4-ClPh	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-c-206	5-e	Int.c-c-4	BRA43	2-CF3Ph	Et	H	5-1Idz	C		465 (M^++1)
Ca-c-207	1-a	Ca-c-206		2-CF3Ph	H	H	5-1Idz	C		437 (M^++1)
Ca-c-208	5-e	Int.c-c-4	BRA44	3-CF3Ph	Et	H	5-1Idz	C		465 (M^++1)
Ca-c-209	1-a	Ca-c-208		3-CF3Ph	H	H	5-1Idz	C		437 (M^++1)
Ca-c-210	5-e	Int.c-c-4	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	5-1Idz	C		433 (M^++1)
Ca-c-211	1-a	Ca-c-210		2,3-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-c-212	5-e	Int.c-c-4	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	5-1Idz	C		433 (M^++1)
Ca-c-213	1-a	Ca-c-212		2,4-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-c-214		Ca-a-294		2,6-DFPh	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-c-215		Ca-a-298		2,4-DClPh	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
Ca-c-216		Ca-a-302		3,4-DClPh	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
Ca-c-217	5-e	Int.c-c-4	BRA58	2-Furan	Et	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-c-218	1-a	Ca-c-217		2-Furan	H	H	5-1Idz	C		359 (M^++1)
Ca-c-219	5-e	Int.c-c-4	BRA59	3-Furan	Et	H	5-1Idz	C		387 (M^++1)
Ca-c-220	1-a	Ca-c-219		3-Furan	H	H	5-1Idz	C		359 (M^++1)
Ca-c-221	5-e	Int.c-c-4	BRA60	2-Thiophene	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-c-222	1-a	Ca-c-221		2-Thiophene	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)

[0376] [表118]

Table-Ca-C-6

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-223	5-e	Int.c-c-4	BRA61	3-Thiophene	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-c-224	1-a	Ca-c-223		3-Thiophene	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)
Ca-c-225		Ca-a-316		3-Pyridine	H	H	5-1Idz	C		370 (M^++1)
Ca-c-226		Ca-a-318		4-Pyridine	H	H	5-1Idz	C		370 (M^++1)
Ca-c-227	5-e	Int.c-c-4	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-c-228	1-a	Ca-c-227		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	5-1Idz	C		375 (M^++1)
Ca-c-229	9-j	Ca-c-227		nHex-	Et	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
Ca-c-230	1-a	Ca-c-229		nHex-	H	H	5-1Idz	C		377 (M^++1)
Ca-c-231	5-e	Int.c-c-4	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-232	1-a	Ca-c-231		4FPhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		413 (M^++1)
Ca-c-233	9-j	Ca-c-231		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	5-1Idz	C		443 (M^++1)
Ca-c-234	1-a	Ca-c-233		$4FPhC_2H_4-$	H	H	5-1Idz	C		415 (M^++1)
Ca-c-235	5-e	Int.c-c-4	BRA68	4ClPhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		457 (M^++1)
Ca-c-236	1-a	Ca-c-235		4ClPhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		429 (M^++1)
Ca-c-237	5-e	Int.c-c-4	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		429 (M^++1)
Ca-c-238	1-a	Ca-c-237		2cHexCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		401 (M^++1)
Ca-c-239	9-j	Ca-c-237		$2cHexC_2H_4-$	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
Ca-c-240	1-a	Ca-c-239		$2cHexC_2H_4-$	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
Ca-c-241	5-e	Int.c-c-4	BRA70	4CF3PhCH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		491 (M^++1)
Ca-c-242	1-a	Ca-c-241		4CF3PhCH=CH-	H	H	5-1Idz	C		463 (M^++1)
Ca-c-243	9-j	Ca-c-241		$4CF3PhC_2H_4-$	Et	H	5-1Idz	C		493 (M^++1)
Ca-c-244	1-a	Ca-c-243		$4CF3PhC_2H_4-$	H	H	5-1Idz	C		465 (M^++1)
Ca-c-245		Ca-a-340		Ph	H	H	1Me-5-Idz	C		383 (M^++1)
Ca-c-246	5-e	Int.c-c-5	BRA16	3-MePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-c-247	1-a	Ca-c-246		3-MePh	H	H	1Me-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-c-248	5-e	Int.c-c-5	BRA17	4-MePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-c-249	1-a	Ca-c-248		4-MePh	H	H	1Me-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-c-250	5-e	Ca-c-249	BRA18	2-EtPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-c-251	1-a	Int.c-c-5		2-EtPh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-c-252	5-e	Ca-c-251	BRA21	4-iPrPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		453 (M^++1)
Ca-c-253	1-a	Int.c-c-5		4-iPrPh	H	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-c-254		Ca-a-352		1-nBuPh	H	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-c-255	5-e	Int.c-c-5	BRA23	4-tBuPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-c-256	1-a	Ca-c-255		4-tBuPh	H	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-c-257	5-e	Int.c-c-5	BRA24	2-MeOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-258	1-a	Ca-c-257		2-MeOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
Ca-c-259	5-e	Int.c-c-5	BRA26	4-MeOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-260	1-a	Ca-c-259		4-MeOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
Ca-c-261	5-e	Int.c-c-5	BRA27	2-EtOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-c-262	1-a	Ca-c-261		2-EtOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
Ca-c-263	5-e	Int.c-c-5	BRA29	3-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-c-264	1-a	Ca-c-263		3-iPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-265	5-e	Int.c-c-5	BRA30	4-iPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-c-266	1-a	Ca-c-265		4-iPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-267	5-e	Int.c-c-5	BRA31	3-nPrOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-c-268	1-a	Ca-c-267		3-nPrOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)

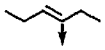
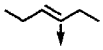
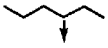
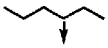
[0377] [表119]

Table-Ca-C-7

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-269	5-e	Int.c-c-5	BRA33	3-nBuOPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		483 (M^++1)
Ca-c-270	1-a	Ca-c-269		3-nBuOPh	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-c-271	5-e	Int.c-c-5	BRA35	3-DMAPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		454 (M^++1)
Ca-c-272	1-a	Ca-c-271		3-DMAPh	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
Ca-c-273		Ca-a-376		2-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-c-274		Ca-a-378		3-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-c-275		Ca-a-380		4-FPh	H	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-c-276	5-e	Int.c-c-5	BRA40	2-ClPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		445 (M^++1)
Ca-c-277	1-a	Ca-c-276		2-ClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-c-278	5-e	Int.c-c-5	BRA43	2-CF3Ph	Et	H	1Me-5-Idz	C		479 (M^++1)
Ca-c-279	1-a	Ca-c-278		2-CF3Ph	H	H	1Me-5-Idz	C		451 (M^++1)
Ca-c-280	5-e	Int.c-c-5	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	1Me-5-Idz	C		479 (M^++1)
Ca-c-281	1-a	Ca-c-280		4-CF3Ph	H	H	1Me-5-Idz	C		451 (M^++1)
Ca-c-282	5-e	Int.c-c-5	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-c-283	1-a	Ca-c-282		2,4-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-c-284	5-e	Int.c-c-5	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-c-285	1-a	Ca-c-284		2,6-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-c-286	5-e	Int.c-c-5	BRA50	3,4-DFPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
Ca-c-287	1-a	Ca-c-286		3,4-DFPh	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-c-288		Ca-a-394		2,4-DClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
Ca-c-289		Ca-a-396		3,5-DClPh	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
Ca-c-290	5-e	Int.c-c-5	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-c-291	1-a	Ca-c-290		2,4-DMePh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-c-292	5-e	Int.c-c-5	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-c-293	1-a	Ca-c-292		2,6-DMePh	H	H	1Me-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-c-294	5-e	Ca-c-293	BRA58	2-Furan	Et	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-c-295	1-a	Ca-c-294		2-Furan	H	H	1Me-5-Idz	C		373 (M^++1)
Ca-c-296	5-e	Ca-c-295	BRA59	3-Furan	Et	H	1Me-5-Idz	C		401 (M^++1)
Ca-c-297	1-a	Ca-c-296		3-Furan	H	H	1Me-5-Idz	C		373 (M^++1)
Ca-c-298	5-e	Ca-c-297	BRA60	2-Thiophene	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-c-299	1-a	Int.c-c-5		2-Thiophene	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-c-300	5-e	Ca-c-299	BRA61	3-Thiophene	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-c-301	1-a	Int.c-c-5		3-Thiophene	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-c-302		Ca-a-410		3-Pyridine	H	H	1Me-5-Idz	C		384 (M^++1)
Ca-c-303		Ca-a-412		4-Pyridine	H	H	1Me-5-Idz	C		384 (M^++1)
Ca-c-304	5-e	Int.c-c-5	BRA64	3-PhPh	Et	H	1Me-5-Idz	C		487 (M^++1)
Ca-c-305	1-a	Ca-c-304		3-PhPh	H	H	1Me-5-Idz	C		459 (M^++1)
Ca-c-306	5-e	Int.c-c-5	BRA66	$C_4H_9CH=CH-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-c-307	1-a	Ca-c-306		$C_4H_9CH=CH-$	H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-c-308	9-j	Ca-c-306		nHex-	Et	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-c-309	1-a	Ca-c-308		nHex-	H	H	1Me-5-Idz	C		391 (M^++1)
Ca-c-310	5-e	Int.c-c-5	BRA67	4FPhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-c-311	1-a	Ca-c-310		4FPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
Ca-c-312	9-j	Ca-c-310		$4FPhC_2H_4-$	Et	H	1Me-5-Idz	C		457 (M^++1)
Ca-c-313	1-a	Ca-c-312		$4FPhC_2H_4-$	H	H	1Me-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-c-314	5-e	Int.c-c-5	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		443 (M^++1)

[0378] [表120]

Table-Ca-C-8

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-315	1-a	Ca-c-314		2cHexCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-c-316	9-j	Ca-c-314		2cHexC_2H_4-	Et	H	1Me-5-Idz	C		445 (M^++1)
Ca-c-317	1-a	Ca-c-316		2cHexC_2H_4-	H	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-c-318	5-e	Int.c-c-5	BRA70	4CF_3PhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		505 (M^++1)
Ca-c-319	1-a	Ca-c-318		4CF3PhCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		477 (M^++1)
Ca-c-320	9-j	Ca-c-318		4CF3PhC_2H_4-	Et	H	1Me-5-Idz	C		507 (M^++1)
Ca-c-321	1-a	Ca-c-320		4CF3PhC_2H_4-	H	H	1Me-5-Idz	C		479 (M^++1)
Ca-c-322	5-e	Int.c-c-5	BRA72	3MeOPhCH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-c-323	1-a	Ca-c-322		3MeOPhCH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-c-324	9-j	Ca-c-322		3MeOPhC_2H_4-	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-c-325	1-a	Ca-c-324		3MeOPhC_2H_4-	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-326	5-e	Int.c-c-5	BRA73		Et	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
Ca-c-327	1-a	Ca-c-326			H	H	1Me-5-Idz	C		389 (M^++1)
Ca-c-328	9-j	Ca-c-326			Et	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
Ca-c-329	1-a	Ca-c-328			H	H	1Me-5-Idz	C		391 (M^++1)
Ca-c-330	5-e	Int.c-c-6	BRA14	Ph	Et	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-c-331	1-a	Ca-c-330		Ph	H	H	1Et-5-Idz	C		397 (M^++1)
Ca-c-332	5-e	Int.c-c-6	BRA15	2-MePh	Et	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-c-333	1-a	Ca-c-332		2-MePh	H	H	1Et-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-c-334		Ca-a-438		3-MePh	H	H	1Et-5-Idz	C		411 (M^++1)
Ca-c-335		Ca-a-440		2-EtPh	H	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-c-336	5-e	Int.c-c-6	BRA21	4-iPrPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		467 (M^++1)
Ca-c-337	1-a	Ca-c-336		4-iPrPh	H	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
Ca-c-338	5-e	Int.c-c-6	BRA28	3-EtOPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		469 (M^++1)
Ca-c-339	1-a	Ca-c-338		3-EtOPh	H	H	1Et-5-Idz	C		441 (M^++1)
Ca-c-340		Ca-a-444		3-nPrOPh	H	H	1Et-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-c-341	5-e	Int.c-c-6	BRA36	4-DMAPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		468 (M^++1)
Ca-c-342	1-a	Ca-c-341		4-DMAPh	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
Ca-c-343		Ca-a-450		3-FPh	H	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-c-344	5-e	Int.c-c-6	BRA39	4-FPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		443 (M^++1)
Ca-c-345	1-a	Ca-c-344		4-FPh	H	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-c-346		Ca-a-454		3-ClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-c-347	5-e	Int.c-c-6	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		461 (M^++1)
Ca-c-348	1-a	Ca-c-347		2,3-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-c-349	5-e	Int.c-c-6	BRA48	2.5-DFPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		461 (M^++1)
Ca-c-350	1-a	Ca-c-349		2.5-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-c-351		Ca-a-462		3,4-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-c-352	5-e	Ca-c-351	BRA51	3,5-DFPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		461 (M^++1)
Ca-c-353	1-a	Int.c-c-6		3,5-DFPh	H	H	1Et-5-Idz	C		433 (M^++1)
Ca-c-354	5-e	Ca-c-353	BRA53	3,5-DClPh	Et	H	1Et-5-Idz	C		494 (M^++1)
Ca-c-355	1-a	Ca-c-354		3,5-DClPh	H	H	1Et-5-Idz	C		466 (M^++1)
Ca-c-356		Ca-a-470		2,6-DMePh	H	H	1Et-5-Idz	C		425 (M^++1)
Ca-c-357	5-e	Ca-c-356	BRA59	3-Furan	Et	H	1Et-5-Idz	C		415 (M^++1)
Ca-c-358	1-a	Ca-c-357		3-Furan	H	H	1Et-5-Idz	C		387 (M^++1)

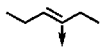
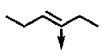
[0379] [表121]

Table-Ca-C-9

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-359	5-e	Ca-c-358	BRA60	2-Thiophene	Et	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-c-360	1-a	Ca-c-359		2-Thiophene	H	H	1Et-5-Idz	C		403 (M^++1)
Ca-c-361		Ca-a-476		4-Pyridine	H	H	1Et-5-Idz	C		398 (M^++1)
Ca-c-362		Ca-a-478		4-PhPh	H	H	1Et-5-Idz	C		473 (M^++1)
Ca-c-363	5-e	Int.c-c-6	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	1Et-5-Idz	C		457 (M^++1)
Ca-c-364	1-a	Ca-c-363		2cHexCH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		429 (M^++1)
Ca-c-365	9-j	Ca-c-363		2cHexC_2H_4-	Et	H	1Et-5-Idz	C		459 (M^++1)
Ca-c-366	1-a	Ca-c-365		2cHexC_2H_4-	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
Ca-c-367	5-e	Int.c-c-6	BRA72	3MeOPhCH=CH-	Et	H	1Et-5-Idz	C		481 (M^++1)
Ca-c-368	1-a	Ca-c-367		3MeOPhCH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		453 (M^++1)
Ca-c-369	5-e	Ca-c-367		3MeOPhC_2H_4-	Et	H	1Et-5-Idz	C		483 (M^++1)
Ca-c-370	1-a	Ca-c-369		3MeOPhC_2H_4-	H	H	1Et-5-Idz	C		455 (M^++1)
Ca-c-371		Ca-a-492		Ph	H	H	5-BF	C		369 (M^++1)
Ca-c-372		Ca-a-494		3-MePh	H	H	5-BF	C		383 (M^++1)
Ca-c-373		Ca-a-498		2-iPrPh	H	H	5-BF	C		411 (M^++1)
Ca-c-374		Ca-a-500		4-tBuPh	H	H	5-BF	C		425 (M^++1)
Ca-c-375	5-e	Int.c-c-7	BRA25	3-MeOPh	Et	H	5-BF	C		427 (M^++1)
Ca-c-376	1-a	Ca-c-375		3-MeOPh	H	H	5-BF	C		399 (M^++1)
Ca-c-377	5-e	Int.c-c-7	BRA28	3-EtOPh	Et	H	5-BF	C		441 (M^++1)
Ca-c-378	1-a	Ca-c-377		3-EtOPh	H	H	5-BF	C		413 (M^++1)
Ca-c-379		Ca-a-506		3-nPrOPh	H	H	5-BF	C		427 (M^++1)
Ca-c-380		Ca-a-508		3-nBuOPh	H	H	5-BF	C		441 (M^++1)
Ca-c-381		Ca-a-510		3-DMAPh	H	H	5-BF	C		412 (M^++1)
Ca-c-382	5-e	Int.c-c-7	BRA36	4-DMAPh	Et	H	5-BF	C		440 (M^++1)
Ca-c-383	1-a	Ca-c-382		4-DMAPh	H	H	5-BF	C		412 (M^++1)
Ca-c-384		Ca-a-512		2-FPh	H	H	5-BF	C		387 (M^++1)
Ca-c-385		Ca-a-514		4-FPh	H	H	5-BF	C		387 (M^++1)
Ca-c-386	5-e	Int.c-c-7	BRA41	3-ClPh	Et	H	5-BF	C		431 (M^++1)
Ca-c-387	1-a	Ca-c-386		3-ClPh	H	H	5-BF	C		403 (M^++1)
Ca-c-388	5-e	Int.c-c-7	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	5-BF	C		465 (M^++1)
Ca-c-389	1-a	Ca-c-388		4-CF3Ph	H	H	5-BF	C		437 (M^++1)
Ca-c-390	5-e	Int.c-c-7	BRA46	2,3-DFPh	Et	H	5-BF	C		433 (M^++1)
Ca-c-391	1-a	Ca-c-390		2,3-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-c-392	5-e	Int.c-c-7	BRA47	2,4-DFPh	Et	H	5-BF	C		433 (M^++1)
Ca-c-393	1-a	Ca-c-392		2,4-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-c-394		Ca-a-524		3,4-DFPh	H	H	5-BF	C		405 (M^++1)
Ca-c-395		Ca-a-526		3,5-DClPh	H	H	5-BF	C		438 (M^++1)
Ca-c-396	5-e	Int.c-c-7	BRA56	2,4-DMePh	Et	H	5-BF	C		425 (M^++1)
Ca-c-397	1-a	Ca-c-396		2,4-DMePh	H	H	5-BF	C		397 (M^++1)
Ca-c-398		Ca-a-532		2-Furan	H	H	5-BF	C		359 (M^++1)
Ca-c-399		Ca-a-534		3-Thiophene	H	H	5-BF	C		375 (M^++1)
Ca-c-400		Ca-a-538		Ph	H	H	6-Qu	C		380 (M^++1)
Ca-c-401		Ca-a-542		4-MePh	H	H	6-Qu	C		394 (M^++1)
Ca-c-402	5-e	Int.c-c-8	BRA23	4-tBuPh	Et	H	6-Qu	C		464 (M^++1)
Ca-c-403	1-a	Ca-c-402		4-tBuPh	H	H	6-Qu	C		436 (M^++1)
Ca-c-404		Ca-a-546		3-MeOPh	H	H	6-Qu	C		410 (M^++1)

[0380] [表122]

Table-Ca-C-10

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-405		Ca-a-550		4-iPrOPh	H	H	6-Qu	C		438 (M^++1)
Ca-c-406	5-e	Int.c-c-8	BRA36	4-DMAPh	Et	H	6-Qu	C		451 (M^++1)
Ca-c-407	1-a	Ca-c-406		4-DMAPh	H	H	6-Qu	C		423 (M^++1)
Ca-c-408		Ca-a-554		3-FPh	H	H	6-Qu	C		398 (M^++1)
Ca-c-409	5-e	Int.c-c-8	BRA40	2-ClPh	Et	H	6-Qu	C		442 (M^++1)
Ca-c-410	1-a	Ca-c-409		2-ClPh	H	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-c-411	5-e	Int.c-c-8	BRA45	4-CF3Ph	Et	H	6-Qu	C		476 (M^++1)
Ca-c-412	1-a	Ca-c-411		4-CF3Ph	H	H	6-Qu	C		448 (M^++1)
Ca-c-413		Ca-a-560		2,4-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-c-414	5-e	Int.c-c-8	BRA49	2,6-DFPh	Et	H	6-Qu	C		444 (M^++1)
Ca-c-415	1-a	Ca-c-414		2,6-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-c-416		Ca-a-562		3,4-DFPh	H	H	6-Qu	C		416 (M^++1)
Ca-c-417		Ca-a-566		2,4-DClPh	H	H	6-Qu	C		449 (M^++1)
Ca-c-418	5-e	Int.c-c-8	BRA57	2,6-DMePh	Et	H	6-Qu	C		436 (M^++1)
Ca-c-419	1-a	Ca-c-418		2,6-DMePh	H	H	6-Qu	C		408 (M^++1)
Ca-c-420		Ca-a-572		2-Furan	H	H	6-Qu	C		370 (M^++1)
Ca-c-421	5-e	Int.c-c-8	BRA59	3-Furan	Et	H	6-Qu	C		398 (M^++1)
Ca-c-422	1-a	Ca-c-421		3-Furan	H	H	6-Qu	C		370 (M^++1)
Ca-c-423		Ca-a-574		2-Thiophene	H	H	6-Qu	C		386 (M^++1)
Ca-c-424	5-e	Int.c-c-8	BRA61	3-Thiophene	Et	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-c-425	1-a	Ca-c-424		3-Thiophene	H	H	6-Qu	C		386 (M^++1)
Ca-c-426		Ca-a-576		3-Pyridine	H	H	6-Qu	C		381 (M^++1)
Ca-c-427		Ca-a-578		4-PhPh	H	H	6-Qu	C		456 (M^++1)
Ca-c-428	5-e	Int.c-c-8	BRA68	4ClPhCH=CH-	Et	H	6-Qu	C		469 (M^++1)
Ca-c-429	1-a	Ca-c-427		4ClPhCH=CH-	H	H	6-Qu	C		440 (M^++1)
Ca-c-430	5-e	Int.c-c-8	BRA69	2cHexCH=CH-	Et	H	6-Qu	C		440 (M^++1)
Ca-c-431	1-a	Ca-c-430		2cHexCH=CH-	H	H	6-Qu	C		412 (M^++1)
Ca-c-432		Ca-a-584		4MePhCH=CH-	H	H	6-Qu	C		420 (M^++1)
Ca-c-433		Ca-a-586		4MePhC_2H_4-	H	H	6-Qu	C		422 (M^++1)
Ca-c-434	5-e	Int.c-c-8	BRA73		Et	H	6-Qu	C		414 (M^++1)
Ca-c-435	1-a	Ca-c-434			H	H	6-Qu	C		386 (M^++1)
Ca-c-436	5-e	Int.c-c-1	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-c-437	1-a	Ca-c-436		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	2-Nap	C		343 (M^++1)
Ca-c-438	9-j	Ca-c-436		nPr	Et	H	2-Nap	C		373 (M^++1)
Ca-c-439	1-a	Ca-c-438		nPr	H	H	2-Nap	C		345 (M^++1)
Ca-c-440	5-e	Int.c-c-1	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-c-441	1-a	Ca-c-440		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	2-Nap	C		343 (M^++1)
Ca-c-442	5-e	Int.c-c-1	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	2-Nap	C		399 (M^++1)
Ca-c-443	1-a	Ca-c-442		C_3H_7CH=CH-	H	H	2-Nap	C		371 (M^++1)
Ca-c-444	9-j	Ca-c-442		nPen	Et	H	2-Nap	C		401 (M^++1)
Ca-c-445	1-a	Ca-c-444		nPen	H	H	2-Nap	C		373 (M^++1)
Ca-c-446	5-e	Int.c-c-2	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	5-Ind	C		360 (M^++1)
Ca-c-447	1-a	Ca-c-446		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-Ind	C		332 (M^++1)
Ca-c-448	9-j	Ca-c-446		nPr	Et	H	5-Ind	C		362 (M^++1)

[0381] [表123]

Table-Ca-C-11

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rx	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Ca-c-449	1-a	Ca-c-448		nPr	H	H	5-Ind	C		334 (M^++1)
Ca-c-450		Ca-a-604		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-Ind	C		360 (M^++1)
Ca-c-451	5-e	Int.c-c-3	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-c-452	1-a	Ca-c-451		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		346 (M^++1)
Ca-c-453	9-j	Ca-c-451		nPr	Et	H	1Me-5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-c-454	1-a	Ca-c-453		nPr	H	H	1Me-5-Ind	C		348 (M^++1)
Ca-c-455	5-e	Int.c-c-3	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	1Me-5-Ind	C		402 (M^++1)
Ca-c-456	1-a	Ca-c-455		C_3H_7CH=CH-	H	H	1Me-5-Ind	C		374 (M^++1)
Ca-c-457	9-j	Ca-c-455		nPen	Et	H	1Me-5-Ind	C		404 (M^++1)
Ca-c-458	1-a	Ca-c-457		nPen	H	H	1Me-5-Ind	C		376 (M^++1)
Ca-c-459	5-e	Int.c-c-4	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		361 (M^++1)
Ca-c-460	1-a	Ca-c-459		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		333 (M^++1)
Ca-c-461	9-j	Ca-c-459		nPr	Et	H	5-1Idz	C		363 (M^++1)
Ca-c-462	1-a	Ca-c-461		nPr	H	H	5-1Idz	C		335 (M^++1)
Ca-c-463	5-e	Int.c-c-4	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	5-1Idz	C		361 (M^++1)
Ca-c-464	1-a	Ca-c-463		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		333 (M^++1)
Ca-c-465		Ca-a-616		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-1Idz	C		361 (M^++1)
Ca-c-466		Ca-a-618		nPen	H	H	5-1Idz	C		363 (M^++1)
Ca-c-467	5-e	Int.c-c-5	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Ca-c-468	1-a	Ca-c-467		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		347 (M^++1)
Ca-c-469	9-j	Ca-c-467		nPr	Et	H	1Me-5-Idz	C		377 (M^++1)
Ca-c-470	1-a	Ca-c-469		nPr	H	H	1Me-5-Idz	C		349 (M^++1)
Ca-c-471	5-e	Int.c-c-5	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Ca-c-472	1-a	Ca-c-471		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		347 (M^++1)
Ca-c-473	5-e	Int.c-c-5	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	1Me-5-Idz	C		403 (M^++1)
Ca-c-474	1-a	Ca-c-473		C_3H_7CH=CH-	H	H	1Me-5-Idz	C		375 (M^++1)
Ca-c-475	9-j	Ca-c-473		nPen	Et	H	1Me-5-Idz	C		405 (M^++1)
Ca-c-476	1-a	Ca-c-475		nPen	H	H	1Me-5-Idz	C		377 (M^++1)
Ca-c-477		Ca-a-626		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	1Et-5-Idz	C		361 (M^++1)
Ca-c-478		Ca-a-628		nPr	H	H	1Et-5-Idz	C		363 (M^++1)
Ca-c-479		Ca-a-630		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	5-BF	C		333 (M^++1)
Ca-c-480	5-e	Int.c-c-7	BRA75	Cis-CH_3CH=CH-	Et	H	5-BF	C		361 (M^++1)
Ca-c-481	1-a	Ca-c-479		Cis-CH_3CH=CH-	H	H	5-BF	C		333 (M^++1)
Ca-c-482	5-e	Int.c-c-7	BRA76	C_3H_7CH=CH-	Et	H	5-BF	C		389 (M^++1)
Ca-c-483	1-a	Ca-c-482		C_3H_7CH=CH-	H	H	5-BF	C		361 (M^++1)
Ca-c-484	5-e	Int.c-c-8	BRA74	Trans-CH_3CH=CH-	Et	H	6-Qu	C		372 (M^++1)
Ca-c-485	1-a	Ca-c-483		Trans-CH_3CH=CH-	H	H	6-Qu	C		344 (M^++1)
Ca-c-486	9-j	Ca-c-483		nPr	Et	H	6-Qu	C		374 (M^++1)
Ca-c-487	1-a	Ca-c-486		nPr	H	H	6-Qu	C		346 (M^++1)
Ca-c-488		Ca-a-636		C_3H_7CH=CH-	H	H	6-Qu	C		372 (M^++1)

[0382] 参考例13

5－ベンジルメチルアミノ－2，3－ジヒドロインデン－1－オン（中間体n－a－1）の合成（製造法14工程n－1）

5－フルオロ－1－インダノン（1．56g、Frontier社製）のジメチルスルホキシド溶液（3ml）に炭酸カリウム（341．3mg、WAKO）、ベンジルメチルアミン（2ml、TCI）を加え、100℃にて17時間攪拌した。反応液に水（30ml）を加え、酢酸エチル（20ml×2）で抽出後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄した。有機層を乾燥後、減圧

下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝6:1)で精製し標記化合物(中間体n－a－1;1．56g)を得た。Mass(LCMS):252(M^+＋1)、保持時間;4．46分(溶出条件:B)。

5－(ピペリジン－1－イル)－2，3－ジヒドロインデン－1－オン(中間体n－a－3)の合成(製造法14工程n－1)

参考例13の中間体n―a－1に記載の手順に従って、5－フルオロ－1－インダノン(1．40g、Frontier社製)、炭酸カリウム(311．4mg、WAKO)、ピペリジン(1．5ml、TCI)を反応、処理させることで標記化合物(中間体n－c－1;1．33g)を得た。Mass(LCMS):216(M^+＋1)、保持時間;4．34分(溶出条件:D)。

[0383] 2－(5－ベンジルメチルアミノ－2，3－ジヒドロインデン－1－イル－イリデン)酢酸エチル(中間体n－b－1)の合成(製造法9工程k－1)

参考例1の中間体A－2の合成法(製造法9工程k－1)に記載の手順に従って、中間体n－a－1(1．56g)、ジエチルホスホノ酢酸エチル(7．5ml、TCI)、水素化ナトリウム(1．28g、WAKO)を反応、処理させることで標記化合物(中間体n－b－1;991．2mg)を得た。Mass(LCMS):322(M^+＋1)、保持時間;5．99分(溶出条件:B)。

2－(5－メチルアミノ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体n－b－2)の合成(製造法9工程j)

参考例1の中間体A－3の合成法(製造法9工程j)に記載の手順に従って、中間体n－b－1(991．2mg)、10%パラジウム炭素(76．3mg、Merck社製)を反応、処理させることで標記化合物(中間体n－b－2;786．2mg)を得た。Mass(LCMS):234(M^+＋1)、保持時間;3．51分(溶出条件:D)。

2－(4－ブロモ－5－メチルアミノ－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体n－b－3)の合成(製造法8工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って、中間体n－b－2(236．2mg)およびNBS(182．1g)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体n－b－3;255．4mg)を得た(但し反応は室温にて3時間行った)。Mass(LCMS):312(M^+＋1)、保持時間;5．25分(溶出条件:D)。

[0384] 参考例14

2－[5－ターシャリーブチルオキシカルボニル－6－(ナフタレン－2－イル)－2,3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(中間体n－b－7)の合成(製造法4工程d)

中間体c－a－1(2.05g)のトルエン(88ml)溶液にカルバミン酸ターシャリーブチル(2.56g、WAKO)、キサントホス(1.01g、Strem社製)、炭酸セシウム(2.14g、WAKO)を加え、窒素雰囲気下、トリスジベンジリデンアセトンジパラジウム(800mg、WAKO)を加えオートクレーブ中、115℃で16時間撹拌した。反応混合液をろ過し、減圧濃縮し、残渣カラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝5:1)で精製し、標記化合物(中間体n－b－7;1.00g)を得た。Mass(LCMS):446(M^+＋1)、保持時間;N.D(溶出条件:C)。

2－[5－アミノ－6－(ナフタレン－2－イル)－2,3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(中間体n－b－8)の合成(製造法4工程d)

中間体n－b－7(1.00g)に4規定塩酸／ジオキサン溶液(23ml)を加え、室温で4時間攪拌した。反応溶液を濃縮した後、酢酸エチル(50ml)を加え、飽和重曹水にて洗浄、減圧濃縮し、標記化合物(中間体n－b－8;863mg)を得た。Mass(LCMS):346(M^+＋1)、保持時間;N.D(溶出条件:D)。

[0385] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int.N－a－1、Table－Int.N－b－1に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「AMN(番号)」で示すハライド試薬はTable－AMNに示したものである。またTable－Int.N－b－1中の「S／D」の欄に「S」と記したものは化合物中のインダン環とカルボニル基を結ぶ2つの炭素原子が単結合でつながった化合物を示し、「D」と記したものは化合物中のベンゼン環とカルボニル基を結ぶ2つの炭素原子が二重結合でつながった化合物を示す。また、「Syn」の欄が空欄のものは水素、Pd／Cを用いた還元反応をしたことを示す。

[0386] [表124]

Table-AMN

Reagent	The name of reagent	manufacture
AMN1	BnMeNH	TCI
AMN2	BnEtNH	TCI
AMN3	Piperidine	TCI
AMN4	4-Methylpiperidine	TCI
AMN5	2-Methylpiperidine	TCI
AMN6	3-Methylpiperidine	TCI
AMN7	3,5-Dimethylpiperidine	TCI
AMN8	4-Phenylpiperidine	WAKO
AMN9	4-Benzylpiperidine	TCI
AMN10	Morpholine	TCI
AMN11	2,6-Dimethylmorpholine	WAKO
AMN12	cis-2,6-Dimethylmorpholine	TCI
AMN13	1-Phenylpiperazine	TCI
AMN14	1-(2-Pyridyl)piperazine	TCI
AMN15	1-(4-Fluorophenyll)piperazine	WAKO
AMN16	1-(2-Fluorophenyll)piperazine	WAKO
AMN17	1-(3-Chlorophenyll)piperazine	WAKO
AMN18	Hexamethyleneimine	TCI
AMN19	Pyrrolidine	TCI

[0387] [表125]

Table-CHO

Reagent	The name of reagent	manufacture
CHO1	Formaldehyde	WAKO
CHO2	acetaldehyde	WAKO
CHO3	n-Propylaldehyde	TCI
CHO4	acetone	TCI
CHO5	n-Butyraldehyde	TCI
CHO6	Isobutyraldehyde	TCI
CHO7	cyclopentanone	WAKO
CHO8	cyclohexanone	WAKO
CHO9	2-Methylcyclohexanone	TCI
CHO10	2-Indanone	WAKO
CHO11	4-Fluorobenzaldehyde	TCI
CHO12	2-Fluorobenzaldehyde	TCI
CHO13	3-Fluorobenzaldehyde	TCI
CHO14	2-ChloroBenzaldehyde	TCI
CHO15	4-Chlorobenzaldehyde	TCI
CHO16	2-Bromobenzaldehyde	TCI
CHO17	2-Trifluoromethylbenzaldehyde	TCI
CHO18	2,3-difluorobenzaldehyde	TCI
CHO19	4-Methylbenzaldehyde	TCI
CHO20	2-Phenylbenzaldehyde	Ald
CHO21	p-anisaldehyde	TCI
CHO22	o-anisaldehyde	TCI
CHO23	4-Dimethylaminobenzaldehyde	TCI
CHO24	4-Methylthiobenzaldehyde	TCI
CHO25	1-Naphthylaldehyde	TCI
CHO26	2-Naphthylaldehyde	TCI
CHO27	2-Furaldehyde	TCI
CHO28	3-Furaldehyde	TCI
CHO29	2-Thiophenaldehyde	TCI

[0388] [表126]

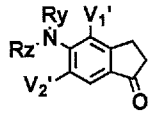
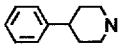
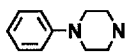
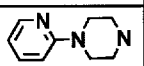
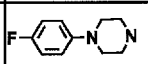
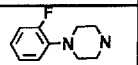
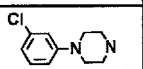


Table-Int.N-a-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rz	Ry	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.n-a-2	14n-1	AMN2		Et	Bn	H	H	C		266 (M^++1)
Int.n-a-4	14n-1	AMN4				H	H	C		230 (M^++1)
Int.n-a-5	14n-1	AMN5				H	H	C		230 (M^++1)
Int.n-a-6	14n-1	AMN6				H	H	C		230 (M^++1)
Int.n-a-7	14n-1	AMN7				H	H	C		244 (M^++1)
Int.n-a-8	14n-1	AMN8				H	H	C		292 (M^++1)
Int.n-a-9	14n-1	AMN9				H	H	C		306 (M^++1)
Int.n-a-10	14n-1	AMN10				H	H	C		218 (M^++1)
Int.n-a-11	14n-1	AMN11				H	H	C		246 (M^++1)
Int.n-a-12	14n-1	AMN12				H	H	C		246 (M^++1)
Int.n-a-13	14n-1	AMN13				H	H	C		293 (M^++1)
Int.n-a-14	14n-1	AMN14				H	H	C		294 (M^++1)
Int.n-a-15	14n-1	AMN15				H	H	C		311 (M^++1)
Int.n-a-16	14n-1	AMN16				H	H	C		311 (M^++1)
Int.n-a-17	14n-1	AMN17				H	H	C		327 (M^++1)
Int.n-a-18	14n-1	AMN18				H	H	C		244 (M^++1)

[0389] [表127]

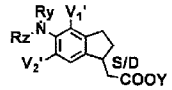


Table-Int.N-b-1

Exp.	Syn.	SM1	SM2	Rz	Ry	Y	V_1'	V_2'	S/D	LCMS		
										method	RTime	Mass
Int.n-b-4	10k-1	Int.n-a-2		Et	Bn	Et	H	H	D	C		336 (M^++1)
Int.n-b-5		Int.n-b-4		Et	H	Et	H	H	S	C		248 (M^++1)
Int.n-b-6	13-h	Int.n-b-5		Et	H	Et	H	Br	S	C		326 (M^+)
Int.n-b-9	5-d	Int.c-a-2		H	H	Et	H	5-Ind	S	C		335 (M^++1)
Int.n-b-10	5-d	Int.c-a-3		H	H	Et	H	1Me-5-Ind	S	C		349 (M^++1)
Int.n-b-11	5-d	Int.c-a-4		H	H	Et	H	5-1Idz	S	C		336 (M^++1)
Int.n-b-12	5-d	Int.c-a-5		H	H	Et	H	1Me-5-Idz	S	C		350 (M^++1)
Int.n-b-13	5-d	Int.c-a-6		H	H	Et	H	1Et-5-Idz	S	C		364 (M^++1)
Int.n-b-14	5-d	Int.c-a-7		H	H	Et	H	5-BF	S	C		336 (M^++1)
Int.n-b-15	5-d	Int.c-a-8		H	H	Et	H	6-Qu	S	C		347 (M^++1)

[0390] 実施例N－a－1

2－[5－メチルアミノ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチルの合成(化合物番号N－a－1)の合成(製造法4工程e－1)

実施例化合物A－a－1の合成法(製造法4工程e－1)に記載の手順に従って中間体n－b－3(439. 4mg)、2－ナフタレンボロン酸(684. 2mg、Ald)、2M炭酸ナトリウム水溶液(2. 2ml)および$(Ph_3P)_4Pd$(276. 3mg、ナカライテスク社製)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号N－a－1;632. 3mg)を得た(但し反応は15時間行った)。

実施例N－a－2

2－[5－メチルアミノ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号N－a－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物N－a－1(98. 6mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0. 45ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号N－a－2;88. 7mg)を得た(但し反応は1時間行った)。

[0391] 実施例N－a－31

2－[5－ジメチルアミノ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号N－a－31)の合成(製造法14工程n－2)

実施例化合物N－a－1(99. 5mg)のメタノール(10ml)溶液に、30%ホロムアルデヒド水溶液(350ul、WAKO)及びシアノトリヒドロほう酸ナトリウム(42. 2mg、WAKO)を加え、60℃にて1時間撹拌した。反応混合液を減圧下濃縮した後、ジクロロメタン(150ml)で抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄、乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝6:1)で精製し、標記化合物(化合物番号N－a－31;45. 2mg)を得た。

実施例N－a－43

2－[5－エチルメチルアミノ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号N－a－43)の合成(製造法14工程n－2)

実施例化合物N－a－1(99. 5mg)のジクロロメタン(5ml)溶液に、アセトアルデヒ

ド(40ul、TCI)、トリアセトキシ水素化ほう酸ナトリウム(224．1mg、Ald)及び酢酸(100uL)を加え、室温にて13時間撹拌した。反応混合液をジクロロメタン(20ml×2)で抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄、乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝6:1)で精製し、標記化合物(化合物番号N－a－43;87．3mg)を得た。

[0392] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－N－A－1からTable－N－A－6に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。化合物の製造は、表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに、「CHO(番号)」で示すホルミル試薬はTable－CHOに示したものである。

[0393] [表128]

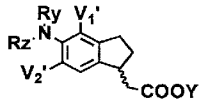


Table-N-A-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-a-1	4e-1	Int.n-b-3	BRA1	H	Me	Et	H	2-Nap	C		360 (M^++1)
N-a-2	1-a	N-a-1		H	Me	H	H	2-Nap	C		332 (M^++1)
N-a-3	4e-1	Int.n-b-3	BRA2	H	Me	Et	H	5-Ind	C		349 (M^++1)
N-a-4	1-a	N-a-3		H	Me	H	H	5-Ind	C		321 (M^++1)
N-a-5	4e-1	Int.n-b-3	BRA3	H	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-6	1-a	N-a-5		H	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		335 (M^++1)
N-a-7	4e-1	Int.n-b-3	BRA4	H	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-8	1-a	N-a-7		H	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		349 (M^++1)
N-a-9	4e-1	Int.n-b-3	BRA5	H	Me	Et	H	1Me-4-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-10	1-a	N-a-9		H	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		335 (M^++1)
N-a-11	4e-1	Int.n-b-3	BRA6	H	Me	Et	H	1Me-6-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-12	1-a	N-a-11		H	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		335 (M^++1)
N-a-13	4e-1	Int.n-b-3	BRA7	H	Me	Et	H	5-1Idz	C		350 (M^++1)
N-a-14	1-a	N-a-13		H	Me	H	H	5-1Idz	C		322 (M^++1)
N-a-15	4e-1	Int.n-b-3	BRA8	H	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		364 (M^++1)
N-a-16	1-a	N-a-15		H	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		336 (M^++1)
N-a-17	4e-1	Int.n-b-3	BRA9	H	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-a-18	1-a	N-a-17		H	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-a-19	4e-1	Int.n-b-3	BRA10	H	Me	Et	H	2Me-5-Idz	C		364 (M^++1)
N-a-20	1-a	N-a-19		H	Me	H	H	2Me-5-Idz	C		336 (M^++1)
N-a-21	4e-1	Int.n-b-3	BRA11	H	Me	Et	H	5-BF	C		350 (M^++1)
N-a-22	1-a	N-a-21		H	Me	H	H	5-BF	C		322 (M^++1)
N-a-23	4e-2	Int.n-b-3	Het1	H	Me	Et	H	5-Bzt	C		367 (M^++1)
N-a-24	1-a	N-a-23		H	Me	H	H	5-Bzt	C		339 (M^++1)
N-a-25	4e-2	Int.n-b-3	Het2	H	Me	Et	H	3-Qu	C		361 (M^++1)
N-a-26	1-a	N-a-25		H	Me	H	H	3-Qu	C		333 (M^++1)
N-a-27	4e-1	Int.n-b-3	BRA13	H	Me	Et	H	6-Qu	C		361 (M^++1)
N-a-28	1-a	N-a-27		H	Me	H	H	6-Qu	C		333 (M^++1)
N-a-29	4e-2	Int.n-b-3	Het3	H	Me	Et	H	6-IQ	C		361 (M^++1)
N-a-30	1-a	N-a-29		H	Me	H	H	6-IQ	C		333 (M^++1)
N-a-31	14n-2	N-a-1	CHO1	Me	Me	Et	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-a-32	1-a	N-a-31		Me	Me	H	H	2-Nap	C		346 (M^++1)
N-a-33	14n-2	N-a-3	CHO1	Me	Me	Et	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-34	1-a	N-a-33		Me	Me	H	H	5-Ind	C		335 (M^++1)
N-a-35	14n-2	N-a-5	CHO1	Me	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-36	1-a	N-a-35		Me	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		349 (M^++1)
N-a-37	14n-2	N-a-13	CHO1	Me	Me	Et	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-a-38	1-a	N-a-37		Me	Me	H	H	5-1Idz	C		336 (M^++1)
N-a-39	14n-2	N-a-15	CHO1	Me	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-a-40	1-a	N-a-39		Me	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-a-41	14n-2	N-a-27	CHO1	Me	Me	Et	H	6-Qu	C		375 (M^++1)
N-a-42	1-a	N-a-41		Me	Me	H	H	6-Qu	C		347 (M^++1)
N-a-43	14n-2	N-a-1	CHO2	Et	Me	Et	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-a-44	1-a	N-a-43		Et	Me	H	H	2-Nap	C		360 (M^++1)

[0394] [表129]

Table-N-A-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-a-45	14n-2	N-a-3	CHO2	Et	Me	Et	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-46	1-a	N-a-45		Et	Me	H	H	5-Ind	C		349 (M^++1)
N-a-47	14n-2	N-a-5	CHO2	Et	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-48	1-a	N-a-47		Et	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-49	14n-2	N-a-7	CHO2	Et	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-50	1-a	N-a-49		Et	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-51	14n-2	N-a-9	CHO2	Et	Me	Et	H	1Me-4-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-52	1-a	N-a-51		Et	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-53	14n-2	N-a-11	CHO2	Et	Me	Et	H	1Me-6-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-54	1-a	N-a-53		Et	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-55	14n-2	N-a-13	CHO2	Et	Me	Et	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-a-56	1-a	N-a-55		Et	Me	H	H	5-1Idz	C		350 (M^++1)
N-a-57	14n-2	N-a-15	CHO2	Et	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-a-58	1-a	N-a-57		Et	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		364 (M^++1)
N-a-59	14n-2	N-a-25	CHO2	Et	Me	Et	H	3-Qu	C		389 (M^++1)
N-a-60	1-a	N-a-59		Et	Me	H	H	3-Qu	C		361 (M^++1)
N-a-61	14n-2	N-a-29	CHO2	Et	Me	Et	H	6-IQ	C		389 (M^++1)
N-a-62	1-a	N-a-61		Et	Me	H	H	6-IQ	C		361 (M^++1)
N-a-63	14n-2	N-a-1	CHO3	nPr	Me	Et	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-a-64	1-a	N-a-63		nPr	Me	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-a-65	14n-2	N-a-3	CHO3	nPr	Me	Et	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-66	1-a	N-a-65		nPr	Me	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-67	14n-2	N-a-5	CHO3	nPr	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-68	1-a	N-a-67		nPr	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-69	14n-2	N-a-13	CHO3	nPr	Me	Et	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-a-70	1-a	N-a-69		nPr	Me	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-a-71	14n-2	N-a-15	CHO3	nPr	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-a-72	1-a	N-a-71		nPr	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-a-73	14n-2	N-a-21	CHO3	nPr	Me	Et	H	5-BF	C		392 (M^++1)
N-a-74	1-a	N-a-73		nPr	Me	H	H	5-BF	C		364 (M^++1)
N-a-75	14n-2	N-a-25	CHO3	nPr	Me	Et	H	3-Qu	C		403 (M^++1)
N-a-76	1-a	N-a-75		nPr	Me	H	H	3-Qu	C		375 (M^++1)
N-a-77	14n-2	N-a-1	CHO4	iPr	Me	Et	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-a-78	1-a	N-a-77		iPr	Me	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-a-79	14n-2	N-a-3	CHO4	iPr	Me	Et	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-80	1-a	N-a-79		iPr	Me	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-81	14n-2	N-a-5	CHO4	iPr	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-82	1-a	N-a-81		iPr	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-83	14n-2	N-a-7	CHO4	iPr	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		419 (M^++1)
N-a-84	1-a	N-a-83		iPr	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-85	14n-2	N-a-11	CHO4	iPr	Me	Et	H	1Me-6-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-86	1-a	N-a-85		iPr	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-87	14n-2	N-a-13	CHO4	iPr	Me	Et	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-a-88	1-a	N-a-87		iPr	Me	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-a-89	14n-2	N-a-15	CHO4	iPr	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-a-90	1-a	N-a-89		iPr	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)

[0395] [表130]

Table-N-A-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-a-91	14n-2	N-a-1	CHO5	nBu	Me	Et	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-a-92	1-a	N-a-91		nBu	Me	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-a-93	14n-2	N-a-3	CHO5	nBu	Me	Et	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-94	1-a	N-a-93		nBu	Me	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-95	14n-2	N-a-5	CHO5	nBu	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		419 (M^++1)
N-a-96	1-a	N-a-95		nBu	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-97	14n-2	N-a-11	CHO5	nBu	Me	Et	H	1Me-6-Ind	C		419 (M^++1)
N-a-98	1-a	N-a-97		nBu	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-99	14n-2	N-a-13	CHO5	nBu	Me	Et	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-a-100	1-a	N-a-99		nBu	Me	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-a-101	14n-2	N-a-15	CHO5	nBu	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-a-102	1-a	N-a-101		nBu	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-a-103	14n-2	N-a-25	CHO5	nBu	Me	Et	H	3-Qu	C		417 (M^++1)
N-a-104	1-a	N-a-103		nBu	Me	H	H	3-Qu	C		389 (M^++1)
N-a-105	14n-2	N-a-27	CHO5	nBu	Me	Et	H	6-Qu	C		417 (M^++1)
N-a-106	1-a	N-a-105		nBu	Me	H	H	6-Qu	C		389 (M^++1)
N-a-107	14n-2	N-a-1	CHO6	iBu	Me	Et	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-a-108	1-a	N-a-107		iBu	Me	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-a-109	14n-2	N-a-3	CHO6	iBu	Me	Et	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-110	1-a	N-a-109		iBu	Me	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-111	14n-2	N-a-5	CHO6	iBu	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		419 (M^++1)
N-a-112	1-a	N-a-111		iBu	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-113	14n-2	N-a-7	CHO6	iBu	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		433 (M^++1)
N-a-114	1-a	N-a-113		iBu	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-115	14n-2	N-a-11	CHO6	iBu	Me	Et	H	1Me-6-Ind	C		419 (M^++1)
N-a-116	1-a	N-a-115		iBu	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-117	14n-2	N-a-13	CHO6	iBu	Me	Et	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-a-118	1-a	N-a-117		iBu	Me	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-a-119	14n-2	N-a-15	CHO6	iBu	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-a-120	1-a	N-a-119		iBu	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-a-121	14n-2	N-a-17	CHO6	iBu	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		434 (M^++1)
N-a-122	1-a	N-a-121		iBu	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-a-123	14n-2	N-a-1	CHO7	cPen	Me	Et	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-a-124	1-a	N-a-123		cPen	Me	H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-a-125	14n-2	N-a-3	CHO7	cPen	Me	Et	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-a-126	1-a	N-a-125		cPen	Me	H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-a-127	14n-2	N-a-5	CHO7	cPen	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-a-128	1-a	N-a-127		cPen	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-a-129	14n-2	N-a-7	CHO7	cPen	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-a-130	1-a	N-a-129		cPen	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-a-131	14n-2	N-a-13	CHO7	cPen	Me	Et	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-a-132	1-a	N-a-131		cPen	Me	H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-a-133	14n-2	N-a-15	CHO7	cPen	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-a-134	1-a	N-a-133		cPen	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-a-135	14n-2	N-a-17	CHO7	cPen	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-a-136	1-a	N-a-135		cPen	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)

[0396] [表131]

Table-N-A-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-a-137	14n-2	N-a-1	CHO8	cHex	Me	Et	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-a-138	1-a	N-a-137		cHex	Me	H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-a-139	14n-2	N-a-3	CHO8	cHex	Me	Et	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-a-140	1-a	N-a-139		cHex	Me	H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-a-141	14n-2	N-a-5	CHO8	cHex	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-a-142	1-a	N-a-141		cHex	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-a-143	14n-2	N-a-9	CHO8	cHex	Me	Et	H	1Me-4-Ind	C		445 (M^++1)
N-a-144	1-a	N-a-143		cHex	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		417 (M^++1)
N-a-145	14n-2	N-a-11	CHO8	cHex	Me	Et	H	1Me-6-Ind	C		445 (M^++1)
N-a-146	1-a	N-a-145		cHex	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		417 (M^++1)
N-a-147	14n-2	N-a-13	CHO8	cHex	Me	Et	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-a-148	1-a	N-a-147		cHex	Me	H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-a-149	14n-2	N-a-15	CHO8	cHex	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-a-150	1-a	N-a-149		cHex	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-a-151	14n-2	N-a-17	CHO8	cHex	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-a-152	1-a	N-a-151		cHex	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-a-153	14n-2	N-a-1	CHO9	2MecHex	Me	Et	H	2-Nap	C		456 (M^++1)
N-a-154	1-a	N-a-153		2MecHex	Me	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-a-155	14n-2	N-a-3	CHO9	2MecHex	Me	Et	H	5-Ind	C		445 (M^++1)
N-a-156	1-a	N-a-155		2MecHex	Me	H	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-a-157	14n-2	N-a-5	CHO9	2MecHex	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		459 (M^++1)
N-a-158	1-a	N-a-157		2MecHex	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-a-159	14n-2	N-a-11	CHO9	2MecHex	Me	Et	H	1Me-6-Ind	C		459 (M^++1)
N-a-160	1-a	N-a-159		2MecHex	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		431 (M^++1)
N-a-161	14n-2	N-a-13	CHO9	2MecHex	Me	Et	H	5-1Idz	C		446 (M^++1)
N-a-162	1-a	N-a-161		2MecHex	Me	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-a-163	14n-2	N-a-15	CHO9	2MecHex	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-a-164	1-a	N-a-163		2MecHex	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-a-165	14n-2	N-a-1	CHO10	2Indane	Me	Et	H	2-Nap	C		476 (M^++1)
N-a-166	1-a	N-a-165		2Indane	Me	H	H	2-Nap	C		448 (M^++1)
N-a-167	14n-2	N-a-3	CHO10	2Indane	Me	Et	H	5-Ind	C		465 (M^++1)
N-a-168	1-a	N-a-167		2Indane	Me	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
N-a-169	14n-2	N-a-5	CHO10	2Indane	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
N-a-170	1-a	N-a-169		2Indane	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
N-a-171	14n-2	N-a-13	CHO10	2Indane	Me	Et	H	5-1Idz	C		466 (M^++1)
N-a-172	1-a	N-a-171		2Indane	Me	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
N-a-173	14n-2	N-a-15	CHO10	2Indane	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		480 (M^++1)
N-a-174	1-a	N-a-173		2Indane	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
N-a-175	4e-1	Int.n-b-6	BRA1	H	Et	Et	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-a-176	1-a	N-a-175		H	Et	H	H	2-Nap	C		346 (M^++1)
N-a-177	4e-1	Int.n-b-6	BRA2	H	Et	Et	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-178	1-a	N-a-177		H	Et	H	H	5-Ind	C		335 (M^++1)
N-a-179	4e-1	Int.n-b-6	BRA3	H	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-180	1-a	N-a-179		H	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		349 (M^++1)
N-a-181	4e-1	Int.n-b-6	BRA4	H	Et	Et	H	1Et-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-182	1-a	N-a-181		H	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		363 (M^++1)

[0397] [表132]

Table-N-A-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-a-183	4e-1	Int.n-b-6	BRA7	H	Et	Et	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-a-184	1-a	N-a-183		H	Et	H	H	5-1Idz	C		336 (M^++1)
N-a-185	4e-1	Int.n-b-6	BRA8	H	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-a-186	1-a	N-a-185		H	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-a-187	4e-1	Int.n-b-6	BRA9	H	Et	Et	H	1Et-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-a-188	1-a	N-a-187		H	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		364 (M^++1)
N-a-189	14n-2	N-a-175	CHO2	Et	Et	Et	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-a-190	1-a	N-a-189		Et	Et	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-a-191	14n-2	N-a-177	CHO2	Et	Et	Et	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-192	1-a	N-a-191		Et	Et	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-a-193	14n-2	N-a-179	CHO2	Et	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-194	1-a	N-a-193		Et	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-195	14n-2	N-a-183	CHO2	Et	Et	Et	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-a-196	1-a	N-a-195		Et	Et	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-a-197	14n-2	N-a-185	CHO2	Et	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-a-198	1-a	N-a-197		Et	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-a-199	14n-2	N-a-187	CHO2	Et	Et	Et	H	1Et-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-a-200	1-a	N-a-199		Et	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-a-201	14n-2	N-a-175	CHO3	nPr	Et	Et	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-a-202	1-a	N-a-201		nPr	Et	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-a-203	14n-2	N-a-177	CHO3	nPr	Et	Et	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-204	1-a	N-a-203		nPr	Et	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-205	14n-2	N-a-179	CHO3	nPr	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		419 (M^++1)
N-a-206	1-a	N-a-205		nPr	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-207	14n-2	N-a-183	CHO3	nPr	Et	Et	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-a-208	1-a	N-a-207		nPr	Et	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-a-209	14n-2	N-a-185	CHO3	nPr	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-a-210	1-a	N-a-209		nPr	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-a-211	14n-2	N-a-175	CHO4	iPr	Et	Et	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-a-212	1-a	N-a-211		iPr	Et	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-a-213	14n-2	N-a-177	CHO4	iPr	Et	Et	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-214	1-a	N-a-213		iPr	Et	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-a-215	14n-2	N-a-181	CHO4	iPr	Et	Et	H	1Et-5-Ind	C		433 (M^++1)
N-a-216	1-a	N-a-215		iPr	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-217	14n-2	N-a-183	CHO4	iPr	Et	Et	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-a-218	1-a	N-a-217		iPr	Et	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-a-219	14n-2	N-a-187	CHO4	iPr	Et	Et	H	1Et-5-Idz	C		434 (M^++1)
N-a-220	1-a	N-a-219		iPr	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-a-221	14n-2	N-a-175	CHO5	nBu	Et	Et	H	2-Nap	C		430 (M^++1)
N-a-222	1-a	N-a-221		nBu	Et	H	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-a-223	14n-2	N-a-177	CHO5	nBu	Et	Et	H	5-Ind	C		419 (M^++1)
N-a-224	1-a	N-a-223		nBu	Et	H	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-225	14n-2	N-a-183	CHO5	nBu	Et	Et	H	5-1Idz	C		420 (M^++1)
N-a-226	1-a	N-a-225		nBu	Et	H	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-a-227	14n-2	N-a-185	CHO5	nBu	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		434 (M^++1)
N-a-228	1-a	N-a-227		nBu	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)

[0398] [表133]

Table-N-A-6

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-a-229	14n-2	N-a-175	CHO6	iBu	Et	Et	H	2-Nap	C		430 (M^++1)
N-a-230	1-a	N-a-229		iBu	Et	H	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-a-231	14n-2	N-a-177	CHO6	iBu	Et	Et	H	5-Ind	C		419 (M^++1)
N-a-232	1-a	N-a-231		iBu	Et	H	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-a-233	14n-2	N-a-179	CHO6	iBu	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		433 (M^++1)
N-a-234	1-a	N-a-233		iBu	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-a-235	14n-2	N-a-183	CHO6	iBu	Et	Et	H	5-1Idz	C		420 (M^++1)
N-a-236	1-a	N-a-235		iBu	Et	H	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-a-237	14n-2	N-a-185	CHO6	iBu	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		434 (M^++1)
N-a-238	1-a	N-a-237		iBu	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-a-239	14n-2	N-a-187	CHO6	iBu	Et	Et	H	1Et-5-Idz	C		448 (M^++1)
N-a-240	1-a	N-a-239		iBu	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-a-241	14n-2	N-a-175	CHO7	cPen	Et	Et	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-a-242	1-a	N-a-241		cPen	Et	H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-a-243	14n-2	N-a-177	CHO7	cPen	Et	Et	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-a-244	1-a	N-a-243		cPen	Et	H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-a-245	14n-2	N-a-179	CHO7	cPen	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-a-246	1-a	N-a-245		cPen	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-a-247	14n-2	N-a-181	CHO7	cPen	Et	Et	H	1Et-5-Ind	C		459 (M^++1)
N-a-248	1-a	N-a-247		cPen	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-a-249	14n-2	N-a-183	CHO7	cPen	Et	Et	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-a-250	1-a	N-a-249		cPen	Et	H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-a-251	14n-2	N-a-185	CHO7	cPen	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-a-252	1-a	N-a-251		cPen	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-a-253	14n-2	N-a-187	CHO7	cPen	Et	Et	H	1Et-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-a-254	1-a	N-a-253		cPen	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-a-255	14n-2	N-a-175	CHO8	cHex	Et	Et	H	2-Nap	C		456 (M^++1)
N-a-256	1-a	N-a-255		cHex	Et	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-a-257	14n-2	N-a-177	CHO8	cHex	Et	Et	H	5-Ind	C		445 (M^++1)
N-a-258	1-a	N-a-257		cHex	Et	H	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-a-259	14n-2	N-a-179	CHO8	cHex	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		459 (M^++1)
N-a-260	1-a	N-a-259		cHex	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-a-261	14n-2	N-a-183	CHO8	cHex	Et	Et	H	5-1Idz	C		446 (M^++1)
N-a-262	1-a	N-a-261		cHex	Et	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-a-263	14n-2	N-a-185	CHO8	cHex	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-a-264	1-a	N-a-263		cHex	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-a-265	14n-2	N-a-175	CHO10	2Indane	Et	Et	H	2-Nap	C		490 (M^++1)
N-a-266	1-a	N-a-265		2Indane	Et	H	H	2-Nap	C		462 (M^++1)
N-a-267	14n-2	N-a-177	CHO10	2Indane	Et	Et	H	5-Ind	C		479 (M^++1)
N-a-268	1-a	N-a-267		2Indane	Et	H	H	5-Ind	C		451 (M^++1)
N-a-269	14n-2	N-a-179	CHO10	2Indane	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		493 (M^++1)
N-a-270	1-a	N-a-269		2Indane	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		465 (M^++1)
N-a-271	14n-2	N-a-183	CHO10	2Indane	Et	Et	H	5-1Idz	C		480 (M^++1)
N-a-272	1-a	N-a-271		2Indane	Et	H	H	5-1Idz	C		452 (M^++1)
N-a-273	14n-2	N-a-185	CHO10	2Indane	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		494 (M^++1)
N-a-274	1-a	N-a-273		2Indane	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		466 (M^++1)

[0399] 実施例N－b－1

2－[5－ベンジルアミノ－6－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号N－b－1)の合成(製造法5工程d)

中間体c－a－1（110．4mg）のトルエン（2．5ml）溶液に2，2’－ビス（ジフェニルフォスフィノ）－1，1’－ビナフタレン（[以下「BINAP」と略す]48．8mg、Ald）、リン酸カリウム（91．8mg、WAKO）、ベンジルアミン（70ul、TCI）を加え、窒素雰囲気下、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（0）（[以下「$Pd_2(dba)_3$」と略す]（31．6mg、Ald）を加えた後100℃で14時間撹拌した後、反応溶液に2－（ジターシャリーブチルホスフィノ）ビフェニル（31．6mg、WAKO）を加え、さらに24時間攪拌した。反応混合液に酢酸エチル（30ml）、水（15ml）を加えて抽出後、有機層を飽和食塩水で洗浄、乾燥後、減圧濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Quad、ヘキサン：酢酸エチル＝4：1、）で精製し、標記化合物（化合物番号N－b－1；24．4mg）を得た。

[0400] 実施例N－b－45

2－[5－（2－フルオロベンジルアミノ）－6－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル（化合物番号N－b－45）の合成（製造法14工程n－2）

実施例化合物N－a－43の合成法（製造法14工程n－2）に記載の手順に従って、中間体n－b－8（115．3mg）、2－フルオロベンズアルデヒド（75ul、TCI）、トリアセトキシ水素化ほう素ナトリウム（231．2mg、Ald）及び酢酸（90uL）を反応させ処理することにより標記化合物（化合物番号N－b－45；82．2mg）を得た（但し反応は18時間行った）。

上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－N－B－1からTable－N－B－9に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。化合物の製造は、表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「CHO（番号）」で示すホルミル試薬はTable－CHOに示したものである。

[0401] [表134]

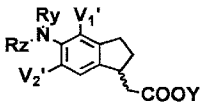


Table-N-B-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-1	4e-1	Int.c-a-1		Bn	H	Et	H	2-Nap	C		436 (M^++1)
N-b-2	1-a	N-b-1		Bn	H	H	H	2-Nap	C		408 (M^++1)
N-b-3	4e-1	Int.c-a-2		Bn	H	Et	H	5-Ind	C		425 (M^++1)
N-b-4	1-a	N-b-3		Bn	H	H	H	5-Ind	C		397 (M^++1)
N-b-5	4e-1	Int.c-a-3		Bn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		439 (M^++1)
N-b-6	1-a	N-b-5		Bn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		411 (M^++1)
N-b-7	4e-1	Int.c-a-4		Bn	H	Et	H	5-1Idz	C		426 (M^++1)
N-b-8	1-a	N-b-7		Bn	H	H	H	5-1Idz	C		398 (M^++1)
N-b-9	4e-1	Int.c-a-5		Bn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-b-10	1-a	N-b-9		Bn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		412 (M^++1)
N-b-11	4e-1	Int.c-a-6		Bn	H	Et	H	1Et-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-b-12	1-a	N-b-11		Bn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-b-13	4e-1	Int.c-a-7		Bn	H	Et	H	5-BF	C		426 (M^++1)
N-b-14	1-a	N-b-13		Bn	H	H	H	5-BF	C		398 (M^++1)
N-b-15	4e-1	Int.c-a-8		Bn	H	Et	H	6-Qu	C		437 (M^++1)
N-b-16	1-a	N-b-15		Bn	H	H	H	6-Qu	C		409 (M^++1)
N-b-17	14n-2	N-b-1	CHO1	Bn	Me	Et	H	2-Nap	C		450 (M^++1)
N-b-18	1-a	N-b-17		Bn	Me	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
N-b-19	14n-2	N-b-3	CHO1	Bn	Me	Et	H	5-Ind	C		439 (M^++1)
N-b-20	1-a	N-b-19		Bn	Me	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
N-b-21	14n-2	N-b-5	CHO1	Bn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		453 (M^++1)
N-b-22	1-a	N-b-21		Bn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
N-b-23	14n-2	N-b-7	CHO1	Bn	Me	Et	H	5-1Idz	C		440 (M^++1)
N-b-24	1-a	N-b-23		Bn	Me	H	H	5-1Idz	C		412 (M^++1)
N-b-25	14n-2	N-b-9	CHO1	Bn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-b-26	1-a	N-b-25		Bn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-b-27	14n-2	N-b-11	CHO1	Bn	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		468 (M^++1)
N-b-28	1-a	N-b-27		Bn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-b-29	14n-2	N-b-13	CHO1	Bn	Me	Et	H	5-BF	C		440 (M^++1)
N-b-30	1-a	N-b-29		Bn	Me	H	H	5-BF	C		412 (M^++1)
N-b-31	14n-2	N-b-1	CHO2	Bn	Et	Et	H	2-Nap	C		464 (M^++1)
N-b-32	1-a	N-b-31		Bn	Et	H	H	2-Nap	C		436 (M^++1)
N-b-33	14n-2	N-b-3	CHO2	Bn	Et	Et	H	5-Ind	C		453 (M^++1)
N-b-34	1-a	N-b-33		Bn	Et	H	H	5-Ind	C		425 (M^++1)
N-b-35	14n-2	N-b-5	CHO2	Bn	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		467 (M^++1)
N-b-36	1-a	N-b-35		Bn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		439 (M^++1)
N-b-37	14n-2	N-b-7	CHO2	Bn	Et	Et	H	5-1Idz	C		454 (M^++1)
N-b-38	1-a	N-b-37		Bn	Et	H	H	5-1Idz	C		426 (M^++1)
N-b-39	14n-2	N-b-9	CHO2	Bn	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		468 (M^++1)
N-b-40	1-a	N-b-39		Bn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-b-41	14n-2	N-b-11	CHO2	Bn	Et	Et	H	1Et-5-Idz	C		482 (M^++1)
N-b-42	1-a	N-b-41		Bn	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-b-43	14n-2	N-b-15	CHO2	Bn	Et	Et	H	6-Qu	C		465 (M^++1)
N-b-44	1-a	N-b-43		Bn	Et	H	H	6-Qu	C		437 (M^++1)

[0402] [表135]

Table-N-B-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-45	14n-2	Int.n-b-8	CHO11	4FBn	H	Et	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-b-46	1-a	N-b-45		4FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-b-47	14n-2	Int.n-b-9	CHO11	4FBn	H	Et	H	5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-48	1-a	N-b-47		4FBn	H	H	H	5-Ind	C		415 (M^++1)
N-b-49	14n-2	Int.n-b-10	CHO11	4FBn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-50	1-a	N-b-49		4FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-b-51	14n-2	Int.n-b-11	CHO11	4FBn	H	Et	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-b-52	1-a	N-b-51		4FBn	H	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-b-53	14n-2	Int.n-b-12	CHO11	4FBn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-54	1-a	N-b-53		4FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-b-55	14n-2	N-b-45	CHO1	4FBn	Me	Et	H	2-Nap	C		468 (M^++1)
N-b-56	1-a	N-b-55		4FBn	Me	H	H	2-Nap	C		440 (M^++1)
N-b-57	14n-2	N-b-47	CHO1	4FBn	Me	Et	H	5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-58	1-a	N-b-57		4FBn	Me	H	H	5-Ind	C		429 (M^++1)
N-b-59	14n-2	N-b-49	CHO1	4FBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		471 (M^++1)
N-b-60	1-a	N-b-59		4FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-61	14n-2	N-b-51	CHO1	4FBn	Me	Et	H	5-1Idz	C		458 (M^++1)
N-b-62	1-a	N-b-61		4FBn	Me	H	H	5-1Idz	C		430 (M^++1)
N-b-63	14n-2	N-b-53	CHO1	4FBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		472 (M^++1)
N-b-64	1-a	N-b-63		4FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-b-65	14n-2	N-b-45	CHO2	4FBn	Et	Et	H	2-Nap	C		482 (M^++1)
N-b-66	1-a	N-b-65		4FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-b-67	14n-2	N-b-47	CHO2	4FBn	Et	Et	H	5-Ind	C		471 (M^++1)
N-b-68	1-a	N-b-67		4FBn	Et	H	H	5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-69	14n-2	N-b-49	CHO2	4FBn	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		485 (M^++1)
N-b-70	1-a	N-b-69		4FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-71	14n-2	N-b-51	CHO2	4FBn	Et	Et	H	5-1Idz	C		472 (M^++1)
N-b-72	1-a	N-b-71		4FBn	Et	H	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-b-73	14n-2	N-b-53	CHO2	4FBn	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		486 (M^++1)
N-b-74	1-a	N-b-73		4FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-75	14n-2	Int.n-b-8	CHO12	2FBn	H	Et	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-b-76	1-a	N-b-75		2FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-b-77	14n-2	Int.n-b-9	CHO12	2FBn	H	Et	H	5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-78	1-a	N-b-77		2FBn	H	H	H	5-Ind	C		415 (M^++1)
N-b-79	14n-2	Int.n-b-10	CHO12	2FBn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-80	1-a	N-b-79		2FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-b-81	14n-2	Int.n-b-12	CHO12	2FBn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-82	1-a	N-b-80		2FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-b-83	14n-2	Int.n-b-13	CHO12	2FBn	H	Et	H	1Et-5-Idz	C		472 (M^++1)
N-b-84	1-a	N-b-80		2FBn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-b-85	14n-2	Int.n-b-14	CHO12	2FBn	H	Et	H	5-BF	C		444 (M^++1)
N-b-86	1-a	N-b-85		2FBn	H	H	H	5-BF	C		416 (M^++1)
N-b-87	14n-2	N-b-75	CHO1	2FBn	Me	Et	H	2-Nap	C		468 (M^++1)
N-b-88	1-a	N-b-87		2FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-b-89	14n-2	N-b-77	CHO1	2FBn	Me	Et	H	5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-90	1-a	N-b-89		2FBn	H	H	H	5-Ind	C		415 (M^++1)

[0403] [表136]

Table-N-B-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-91	14n-2	N-b-79	CHO1	2FBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		471 (M^++1)
N-b-92	1-a	N-b-91		2FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-93	14n-2	N-b-81	CHO1	2FBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		472 (M^++1)
N-b-94	1-a	N-b-93		2FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-b-95	14n-2	N-b-83	CHO1	2FBn	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		486 (M^++1)
N-b-96	1-a	N-b-71		2FBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-97	14n-2	N-b-75	CHO2	2FBn	Et	Et	H	2-Nap	C		482 (M^++1)
N-b-98	1-a	N-b-97		2FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-b-99	14n-2	N-b-77	CHO2	2FBn	Et	Et	H	5-Ind	C		471 (M^++1)
N-b-100	1-a	N-b-99		2FBn	Et	H	H	5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-101	14n-2	N-b-79	CHO2	2FBn	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		485 (M^++1)
N-b-102	1-a	N-b-101		2FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-103	14n-2	N-b-81	CHO2	2FBn	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		486 (M^++1)
N-b-104	1-a	N-b-103		2FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-105	14n-2	N-b-83	CHO2	2FBn	Et	Et	H	1Et-5-Idz	C		500 (M^++1)
N-b-106	1-a	N-b-105		2FBn	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		472 (M^++1)
N-b-107	14n-2	Int.n-b-8	CHO13	3FBn	H	Et	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-b-108	1-a	N-b-107		3FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-b-109	14n-2	Int.n-b-10	CHO13	3FBn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-110	1-a	N-b-109		3FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-b-111	14n-2	Int.n-b-11	CHO13	3FBn	H	Et	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-b-112	1-a	N-b-111		3FBn	H	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-b-113	14n-2	Int.n-b-12	CHO13	3FBn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-114	1-a	N-b-113		3FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-b-115	14n-2	N-b-107	CHO1	3FBn	Me	Et	H	2-Nap	C		468 (M^++1)
N-b-116	1-a	N-b-115		3FBn	Me	H	H	2-Nap	C		440 (M^++1)
N-b-117	14n-2	N-b-109	CHO1	3FBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		471 (M^++1)
N-b-118	1-a	N-b-116		3FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-119	14n-2	N-b-111	CHO1	3FBn	Me	Et	H	5-1Idz	C		458 (M^++1)
N-b-120	1-a	N-b-120		3FBn	Me	H	H	5-1Idz	C		430 (M^++1)
N-b-121	14n-2	N-b-113	CHO1	3FBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		472 (M^++1)
N-b-122	1-a	N-b-122		3FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-b-123	14n-2	N-b-107	CHO2	3FBn	Et	Et	H	2-Nap	C		482 (M^++1)
N-b-124	1-a	N-b-123		3FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-b-125	14n-2	N-b-109	CHO2	3FBn	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		485 (M^++1)
N-b-126	1-a	N-b-125		3FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-127	14n-2	N-b-111	CHO2	3FBn	Et	Et	H	5-1Idz	C		472 (M^++1)
N-b-128	1-a	N-b-127		3FBn	Et	H	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-b-129	14n-2	N-b-113	CHO2	3FBn	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		486 (M^++1)
N-b-130	1-a	N-b-129		3FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-131	14n-2	Int.n-b-8	CHO14	2ClBn	H	Et	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
N-b-132	1-a	N-b-131		2ClBn	H	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-b-133	14n-2	Int.n-b-9	CHO14	2ClBn	H	Et	H	5-Ind	C		460 (M^++1)
N-b-134	1-a	N-b-133		2ClBn	H	H	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-b-135	14n-2	Int.n-b-10	CHO14	2ClBn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
N-b-136	1-a	N-b-135		2ClBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)

[0404] [表137]

Table-N-B-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-137	14n-2	Int.n-b-11	CHO14	2ClBn	H	Et	H	5-1Idz	C		460 (M^++1)
N-b-138	1-a	N-b-137		2ClBn	H	H	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-b-139	14n-2	Int.n-b-12	CHO14	2ClBn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
N-b-140	1-a	N-b-139		2ClBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-b-141	14n-2	N-b-131	CHO1	2ClBn	Me	Et	H	2-Nap	C		485 (M^++1)
N-b-142	1-a	N-b-141		2ClBn	Me	H	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
N-b-143	14n-2	N-b-135	CHO1	2ClBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		488 (M^++1)
N-b-144	1-a	N-b-143		2ClBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
N-b-145	14n-2	N-b-137	CHO1	2ClBn	Me	Et	H	5-1Idz	C		475 (M^++1)
N-b-146	1-a	N-b-145		2ClBn	Me	H	H	5-1Idz	C		446 (M^++1)
N-b-147	14n-2	N-b-131	CHO2	2ClBn	Et	Et	H	2-Nap	C		499 (M^++1)
N-b-148	1-a	N-b-147		2ClBn	Et	H	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
N-b-149	14n-2	N-b-135	CHO2	2ClBn	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		502 (M^++1)
N-b-150	1-a	N-b-149		2ClBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
N-b-151	14n-2	N-b-139	CHO2	2ClBn	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		503 (M^++1)
N-b-152	1-a	N-b-151		2ClBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
N-b-153	14n-2	Int.n-b-8	CHO15	4ClBn	H	Et	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
N-b-154	1-a	N-b-153		4ClBn	H	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-b-155	14n-2	Int.n-b-9	CHO15	4ClBn	H	Et	H	5-Ind	C		460 (M^++1)
N-b-156	1-a	N-b-155		4ClBn	H	H	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-b-157	14n-2	Int.n-b-10	CHO15	4ClBn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
N-b-158	1-a	N-b-157		4ClBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-b-159	14n-2	Int.n-b-11	CHO15	4ClBn	H	Et	H	5-1Idz	C		460 (M^++1)
N-b-160	1-a	N-b-159		4ClBn	H	H	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-b-161	14n-2	Int.n-b-12	CHO15	4ClBn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
N-b-162	1-a	N-b-161		4ClBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-b-163	14n-2	N-a-1	CHO15	4ClBn	Me	Et	H	2-Nap	C		485 (M^++1)
N-b-164	1-a	N-b-163		4ClBn	Me	H	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
N-b-165	14n-2	N-a-3	CHO15	4ClBn	Me	Et	H	5-Ind	C		474 (M^++1)
N-b-166	1-a	N-b-165		4ClBn	Me	H	H	5-Ind	C		445 (M^++1)
N-b-167	14n-2	N-a-5	CHO15	4ClBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		488 (M^++1)
N-b-168	1-a	N-b-167		4ClBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
N-b-169	14n-2	N-a-13	CHO15	4ClBn	Me	Et	H	5-1Idz	C		475 (M^++1)
N-b-170	1-a	N-b-169		4ClBn	Me	H	H	5-1Idz	C		446 (M^++1)
N-b-171	14n-2	N-a-15	CHO15	4ClBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		489 (M^++1)
N-b-172	1-a	N-b-171		4ClBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-b-173	14n-2	N-a-175	CHO15	4ClBn	Et	Et	H	2-Nap	C		499 (M^++1)
N-b-174	1-a	N-b-173		4ClBn	Et	H	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
N-b-175	14n-2	N-a-177	CHO15	4ClBn	Et	Et	H	5-Ind	C		488 (M^++1)
N-b-176	1-a	N-b-175		4ClBn	Et	H	H	5-Ind	C		460 (M^++1)
N-b-177	14n-2	N-a-179	CHO15	4ClBn	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		502 (M^++1)
N-b-178	1-a	N-b-177		4ClBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
N-b-179	14n-2	N-a-183	CHO15	4ClBn	Et	Et	H	5-1Idz	C		489 (M^++1)
N-b-180	1-a	N-b-179		4ClBn	Et	H	H	5-1Idz	C		460 (M^++1)
N-b-181	14n-2	N-a-185	CHO15	4ClBn	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		503 (M^++1)
N-b-182	1-a	N-b-181		4ClBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)

[0405] [表138]

Table-N-B-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-183	14n-2	N-a-1	CHO16	2BrBn	Me	Et	H	2-Nap	C		528 (M^+)
N-b-184	1-a	N-b-183		2BrBn	Me	H	H	2-Nap	C		500 (M^+)
N-b-185	14n-2	N-a-3	CHO16	2BrBn	Me	Et	H	5-Ind	C		517 (M^+)
N-b-186	1-a	N-b-185		2BrBn	Me	H	H	5-Ind	C		489 (M^+)
N-b-187	14n-2	N-a-5	CHO16	2BrBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		531 (M^+)
N-b-188	1-a	N-b-187		2BrBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		503 (M^+)
N-b-189	14n-2	N-a-7	CHO16	2BrBn	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		545 (M^+)
N-b-190	1-a	N-b-189		2BrBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		517 (M^+)
N-b-191	14n-2	N-a-13	CHO16	2BrBn	Me	Et	H	5-1Idz	C		518 (M^+)
N-b-192	1-a	N-b-191		2BrBn	Me	H	H	5-1Idz	C		491 (M^+)
N-b-193	14n-2	N-a-15	CHO16	2BrBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		532 (M^+)
N-b-194	1-a	N-b-193		2BrBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		504 (M^+)
N-b-195	14n-2	N-a-17	CHO16	2BrBn	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		546 (M^+)
N-b-196	1-a	N-b-195		2BrBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		518 (M^+)
N-b-197	14n-2	N-a-1	CHO17	2CF3Bn	Me	Et	H	2-Nap	C		518 (M^++1)
N-b-198	1-a	N-b-197		2CF3Bn	Me	H	H	2-Nap	C		490 (M^++1)
N-b-199	14n-2	N-a-3	CHO17	2CF3Bn	Me	Et	H	5-Ind	C		507 (M^++1)
N-b-200	1-a	N-b-199		2CF3Bn	Me	H	H	5-Ind	C		479 (M^++1)
N-b-201	14n-2	N-a-5	CHO17	2CF3Bn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		521 (M^++1)
N-b-202	1-a	N-b-201		2CF3Bn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		493 (M^++1)
N-b-203	14n-2	N-a-13	CHO17	2CF3Bn	Me	Et	H	5-1Idz	C		508 (M^++1)
N-b-204	1-a	N-b-203		2CF3Bn	Me	H	H	5-1Idz	C		480 (M^++1)
N-b-205	14n-2	N-a-15	CHO17	2CF3Bn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		522 (M^++1)
N-b-206	1-a	N-b-205		2CF3Bn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		494 (M^++1)
N-b-207	14n-2	Int.n-b-8	CHO18	2,3DFBn	H	Et	H	2-Nap	C		472 (M^++1)
N-b-208	1-a	N-b-207		2,3DFBn	H	H	H	2-Nap	C		444 (M^++1)
N-b-209	14n-2	Int.n-b-9	CHO18	2,3DFBn	H	Et	H	5-Ind	C		461 (M^++1)
N-b-210	1-a	N-b-209		2,3DFBn	H	H	H	5-Ind	C		433 (M^++1)
N-b-211	14n-2	Int.n-b-10	CHO18	2,3DFBn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		475 (M^++1)
N-b-212	1-a	N-b-211		2,3DFBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		447 (M^++1)
N-b-213	14n-2	Int.n-b-12	CHO18	2,3DFBn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		476 (M^++1)
N-b-214	1-a	N-b-213		2,3DFBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		448 (M^++1)
N-b-215	14n-2	N-a-1	CHO18	2,3DFBn	Me	Et	H	2-Nap	C		486 (M^++1)
N-b-216	1-a	N-b-215		2,3DFBn	Me	H	H	2-Nap	C		458 (M^++1)
N-b-217	14n-2	N-a-3	CHO18	2,3DFBn	Me	Et	H	5-Ind	C		475 (M^++1)
N-b-218	1-a	N-b-217		2,3DFBn	Me	H	H	5-Ind	C		447 (M^++1)
N-b-219	14n-2	N-a-5	CHO18	2,3DFBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		489 (M^++1)
N-b-220	1-a	N-b-219		2,3DFBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		461 (M^++1)
N-b-221	14n-2	N-a-15	CHO18	2,3DFBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		490 (M^++1)
N-b-222	1-a	N-b-221		2,3DFBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		462 (M^++1)
N-b-223	14n-2	Int.n-b-8	CHO19	4MeBn	H	Et	H	2-Nap	C		450 (M^++1)
N-b-224	1-a	N-b-223		4MeBn	H	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
N-b-225	14n-2	Int.n-b-9	CHO19	4MeBn	H	Et	H	5-Ind	C		439 (M^++1)
N-b-226	1-a	N-b-225		4MeBn	H	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
N-b-227	14n-2	Int.n-b-10	CHO19	4MeBn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		453 (M^++1)
N-b-228	1-a	N-b-227		4MeBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)

[0406] [表139]

Table-N-B-6

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rz	Ry	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-229	14n-2	Int.n-b-12	CHO19	4MeBn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-b-230	1-a	N-b-229		4MeBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-b-231	14n-2	Int.n-b-13	CHO19	4MeBn	H	Et	H	1Et-5-Idz	C		468 (M^++1)
N-b-232	1-a	N-b-231		4MeBn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-b-233	14n-2	N-b-223	CHO1	4MeBn	Me	Et	H	2-Nap	C		464 (M^++1)
N-b-234	1-a	N-b-233		4MeBn	Me	H	H	2-Nap	C		436 (M^++1)
N-b-235	14n-2	N-b-225	CHO1	4MeBn	Me	Et	H	5-Ind	C		453 (M^++1)
N-b-236	1-a	N-b-235		4MeBn	Me	H	H	5-Ind	C		425 (M^++1)
N-b-237	14n-2	N-b-227	CHO1	4MeBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		467 (M^++1)
N-b-238	1-a	N-b-237		4MeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		439 (M^++1)
N-b-239	14n-2	N-b-229	CHO1	4MeBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		468 (M^++1)
N-b-240	1-a	N-b-239		4MeBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-b-241	14n-2	N-b-231	CHO1	4MeBn	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		482 (M^++1)
N-b-242	1-a	N-b-241		4MeBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-b-243	14n-2	N-a-1	CHO20	2PhBn	Me	Et	H	2-Nap	C		526 (M^++1)
N-b-244	1-a	N-b-243		2PhBn	Me	H	H	2-Nap	C		498 (M^++1)
N-b-245	14n-2	N-a-3	CHO20	2PhBn	Me	Et	H	5-Ind	C		515 (M^++1)
N-b-246	1-a	N-b-245		2PhBn	Me	H	H	5-Ind	C		487 (M^++1)
N-b-247	14n-2	N-a-5	CHO20	2PhBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		529 (M^++1)
N-b-248	1-a	N-b-247		2PhBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		501 (M^++1)
N-b-249	14n-2	N-a-13	CHO20	2PhBn	Me	Et	H	5-1Idz	C		516 (M^++1)
N-b-250	1-a	N-b-249		2PhBn	Me	H	H	5-1Idz	C		488 (M^++1)
N-b-251	14n-2	N-a-15	CHO20	2PhBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		530 (M^++1)
N-b-252	1-a	N-b-251		2PhBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		502 (M^++1)
N-b-253	14n-2	N-a-17	CHO20	2PhBn	Me	Et	H	1Et-5-Idz	C		544 (M^++1)
N-b-254	1-a	N-b-253		2PhBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		516 (M^++1)
N-b-255	14n-2	N-a-175	CHO20	2PhBn	Et	Et	H	2-Nap	C		540 (M^++1)
N-b-256	1-a	N-b-255		2PhBn	Et	H	H	2-Nap	C		512 (M^++1)
N-b-257	14n-2	N-a-179	CHO20	2PhBn	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		543 (M^++1)
N-b-258	1-a	N-b-257		2PhBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		515 (M^++1)
N-b-259	14n-2	N-a-185	CHO20	2PhBn	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		544 (M^++1)
N-b-260	1-a	N-b-259		2PhBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		516 (M^++1)
N-b-261	14n-2	N-a-1	CHO21	4OMeBn	Me	Et	H	2-Nap	C		480 (M^++1)
N-b-262	1-a	N-b-261		4OMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		452 (M^++1)
N-b-263	14n-2	N-a-3	CHO21	4OMeBn	Me	Et	H	5-Ind	C		469 (M^++1)
N-b-264	1-a	N-b-263		4OMeBn	Me	H	H	5-Ind	C		441 (M^++1)
N-b-265	14n-2	N-a-5	CHO21	4OMeBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		483 (M^++1)
N-b-266	1-a	N-b-265		4OMeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		455 (M^++1)
N-b-267	14n-2	N-a-7	CHO21	4OMeBn	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		497 (M^++1)
N-b-268	1-a	N-b-267		4OMeBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		469 (M^++1)
N-b-269	14n-2	N-a-13	CHO21	4OMeBn	Me	Et	H	5-1Idz	C		470 (M^++1)
N-b-270	1-a	N-b-269		4OMeBn	Me	H	H	5-1Idz	C		442 (M^++1)
N-b-271	14n-2	N-a-175	CHO21	4OMeBn	Et	Et	H	2-Nap	C		494 (M^++1)
N-b-272	1-a	N-b-271		4OMeBn	Et	H	H	2-Nap	C		466 (M^++1)
N-b-273	14n-2	N-a-185	CHO21	4OMeBn	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		498 (M^++1)
N-b-274	1-a	N-b-273		4OMeBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		470 (M^++1)

[0407] [表140]

Table-N-B-7

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rz	Ry	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-275	14n-2	Int.n-b-8	CHO22	2OMeBn	H	Et	H	2-Nap	C		466 (M^++1)
N-b-276	1-a	N-b-275		2OMeBn	H	H	H	2-Nap	C		438 (M^++1)
N-b-277	14n-2	Int.n-b-9	CHO22	2OMeBn	H	Et	H	5-Ind	C		455 (M^++1)
N-b-278	1-a	N-b-277		2OMeBn	H	H	H	5-Ind	C		427 (M^++1)
N-b-279	14n-2	Int.n-b-10	CHO22	2OMeBn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		469 (M^++1)
N-b-280	1-a	N-b-279		2OMeBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		441 (M^++1)
N-b-281	14n-2	Int.n-b-11	CHO22	2OMeBn	H	Et	H	5-1Idz	C		456 (M^++1)
N-b-282	1-a	N-b-281		2OMeBn	H	H	H	5-1Idz	C		428 (M^++1)
N-b-283	14n-2	Int.n-b-12	CHO22	2OMeBn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		470 (M^++1)
N-b-284	1-a	N-b-283		2OMeBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		442 (M^++1)
N-b-285	14n-2	N-a-1	CHO22	2OMeBn	Me	Et	H	2-Nap	C		480 (M^++1)
N-b-286	1-a	N-b-285		2OMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		452 (M^++1)
N-b-287	14n-2	N-a-15	CHO22	2OMeBn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		484 (M^++1)
N-b-288	1-a	N-b-287		2OMeBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		456 (M^++1)
N-b-289	14n-2	Int.n-b-8	CHO23	4DMABn	H	Et	H	2-Nap	C		479 (M^++1)
N-b-290	1-a	N-b-289		4DMABn	H	H	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
N-b-291	14n-2	Int.n-b-9	CHO23	4DMABn	H	Et	H	5-Ind	C		468 (M^++1)
N-b-292	1-a	N-b-291		4DMABn	H	H	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
N-b-293	14n-2	Int.n-b-10	CHO23	4DMABn	H	Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
N-b-294	1-a	N-b-293		4DMABn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
N-b-295	14n-2	Int.n-b-11	CHO23	4DMABn	H	Et	H	5-1Idz	C		469 (M^++1)
N-b-296	1-a	N-b-295		4DMABn	H	H	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
N-b-297	14n-2	Int.n-b-12	CHO23	4DMABn	H	Et	H	1Me-5-Idz	C		483 (M^++1)
N-b-298	1-a	N-b-297		4DMABn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
N-b-299	14n-2	N-a-1	CHO23	4DMABn	Me	Et	H	2-Nap	C		493 (M^++1)
N-b-300	1-a	N-b-299		4DMABn	Me	H	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
N-b-301	14n-2	N-a-5	CHO23	4DMABn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		496 (M^++1)
N-b-302	1-a	N-b-301		4DMABn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
N-b-303	14n-2	N-a-13	CHO23	4DMABn	Me	Et	H	5-1Idz	C		483 (M^++1)
N-b-304	1-a	N-b-303		4DMABn	Me	H	H	5-1Idz	C		455 (M^++1)
N-b-305	14n-2	N-a-15	CHO23	4DMABn	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		497 (M^++1)
N-b-306	1-a	N-b-305		4DMABn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
N-b-307	14n-2	N-a-1	CHO24	4SMeBn	Me	Et	H	2-Nap	C		496 (M^++1)
N-b-308	1-a	N-b-307		4SMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		468 (M^++1)
N-b-309	14n-2	N-a-3	CHO24	4SMeBn	Me	Et	H	5-Ind	C		485 (M^++1)
N-b-310	1-a	N-b-309		4SMeBn	Me	H	H	5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-311	14n-2	N-a-5	CHO24	4SMeBn	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		499 (M^++1)
N-b-312	1-a	N-b-311		4SMeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		471 (M^++1)
N-b-313	14n-2	N-a-7	CHO24	4SMeBn	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		513 (M^++1)
N-b-314	1-a	N-b-313		4SMeBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		485 (M^++1)
N-b-315	14n-2	N-a-13	CHO24	4SMeBn	Me	Et	H	5-1Idz	C		486 (M^++1)
N-b-316	1-a	N-b-315		4SMeBn	Me	H	H	5-1Idz	C		458 (M^++1)
N-b-317	14n-2	N-a-1	CHO25	1NapMe	Me	Et	H	2-Nap	C		500 (M^++1)
N-b-318	1-a	N-b-317		1NapMe	Me	H	H	2-Nap	C		472 (M^++1)
N-b-319	14n-2	N-a-5	CHO25	1NapMe	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		503 (M^++1)
N-b-320	1-a	N-b-319		1NapMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		475 (M^++1)

[0408] [表141]

Table-N-B-8

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rz	Ry	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-321	14n-2	N-a-15	CHO25	1NapMe	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		504 (M^++1)
N-b-322	1-a	N-b-321		1NapMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		476 (M^++1)
N-b-323	14n-2	N-a-1	CHO26	2NapMe	Me	Et	H	2-Nap	C		500 (M^++1)
N-b-324	1-a	N-b-323		2NapMe	Me	H	H	2-Nap	C		472 (M^++1)
N-b-325	14n-2	N-a-3	CHO26	2NapMe	Me	Et	H	5-Ind	C		489 (M^++1)
N-b-326	1-a	N-b-325		2NapMe	Me	H	H	5-Ind	C		461 (M^++1)
N-b-327	14n-2	N-a-5	CHO26	2NapMe	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		503 (M^++1)
N-b-328	1-a	N-b-327		2NapMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		475 (M^++1)
N-b-329	14n-2	N-a-7	CHO26	2NapMe	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		517 (M^++1)
N-b-330	1-a	N-b-329		2NapMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		489 (M^++1)
N-b-331	14n-2	N-a-13	CHO26	2NapMe	Me	Et	H	5-1Idz	C		490 (M^++1)
N-b-332	1-a	N-b-331		2NapMe	Me	H	H	5-1Idz	C		462 (M^++1)
N-b-333	14n-2	N-a-15	CHO26	2NapMe	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		504 (M^++1)
N-b-334	1-a	N-b-333		2NapMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		476 (M^++1)
N-b-335	14n-2	N-a-1	CHO27	2FRMe	Me	Et	H	2-Nap	C		440 (M^++1)
N-b-336	1-a	N-b-335		2FRMe	Me	H	H	2-Nap	C		412 (M^++1)
N-b-337	14n-2	N-a-5	CHO27	2FRMe	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-338	1-a	N-b-337		2FRMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		415 (M^++1)
N-b-339	14n-2	N-a-7	CHO27	2FRMe	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-340	1-a	N-b-339		2FRMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-b-341	14n-2	N-a-13	CHO27	2FRMe	Me	Et	H	5-1Idz	C		430 (M^++1)
N-b-342	1-a	N-b-341		2FRMe	Me	H	H	5-1Idz	C		402 (M^++1)
N-b-343	14n-2	N-a-15	CHO27	2FRMe	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-b-344	1-a	N-b-343		2FRMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		416 (M^++1)
N-b-345	14n-2	N-a-175	CHO27	2FRMe	Et	Et	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-b-346	1-a	N-b-345		2FRMe	Et	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-b-347	14n-2	N-a-179	CHO27	2FRMe	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-348	1-a	N-b-347		2FRMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-b-349	14n-2	N-a-181	CHO27	2FRMe	Et	Et	H	1Et-5-Ind	C		471 (M^++1)
N-b-350	1-a	N-b-349		2FRMe	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-351	14n-2	N-a-183	CHO27	2FRMe	Et	Et	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-b-352	1-a	N-b-351		2FRMe	Et	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-b-353	14n-2	N-a-185	CHO27	2FRMe	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-354	1-a	N-b-353		2FRMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-b-355	14n-2	N-a-1	CHO28	3FRMe	Me	Et	H	2-Nap	C		440 (M^++1)
N-b-356	1-a	N-b-355		3FRMe	Me	H	H	2-Nap	C		412 (M^++1)
N-b-357	14n-2	N-a-3	CHO28	3FRMe	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-b-358	1-a	N-b-357		3FRMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		415 (M^++1)
N-b-359	14n-2	N-a-13	CHO28	3FRMe	Me	Et	H	5-1Idz	C		430 (M^++1)
N-b-360	1-a	N-b-359		3FRMe	Me	H	H	5-1Idz	C		402 (M^++1)
N-b-361	14n-2	N-a-15	CHO28	3FRMe	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-b-362	1-a	N-b-361		3FRMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		416 (M^++1)
N-b-363	14n-2	N-a-175	CHO28	3FRMe	Et	Et	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-b-364	1-a	N-b-363		3FRMe	Et	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-b-365	14n-2	N-a-179	CHO28	3FRMe	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-b-366	1-a	N-b-365		3FRMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)

[0409] [表142]

Table-N-B-9

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Rz	Ry	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-b-367	14n-2	N-a-183	CHO28	3FRMe	Et	Et	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-b-368	1-a	N-b-367		3FRMe	Et	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-b-369	14n-2	N-a-185	CHO28	3FRMe	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-b-370	1-a	N-b-369		3FRMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-b-371	14n-2	N-a-187	CHO28	3FRMe	Et	Et	H	1Et-5-Idz	C		472 (M^++1)
N-b-372	1-a	N-b-371		3FRMe	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-b-373	14n-2	N-a-1	CHO29	2TPMe	Me	Et	H	2-Nap	C		456 (M^++1)
N-b-374	1-a	N-b-373		2TPMe	Me	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-b-375	14n-2	N-a-5	CHO29	2TPMe	Me	Et	H	1Me-5-Ind	C		459 (M^++1)
N-b-376	1-a	N-b-375		2TPMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-b-377	14n-2	N-a-7	CHO29	2TPMe	Me	Et	H	1Et-5-Ind	C		473 (M^++1)
N-b-378	1-a	N-b-377		2TPMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-b-379	14n-2	N-a-13	CHO29	2TPMe	Me	Et	H	5-1Idz	C		446 (M^++1)
N-b-380	1-a	N-b-379		2TPMe	Me	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-b-381	14n-2	N-a-15	CHO29	2TPMe	Me	Et	H	1Me-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-b-382	1-a	N-b-381		2TPMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-b-383	14n-2	N-a-175	CHO29	2TPMe	Et	Et	H	2-Nap	C		470 (M^++1)
N-b-384	1-a	N-b-383		2TPMe	Et	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-b-385	14n-2	N-a-177	CHO29	2TPMe	Et	Et	H	5-Ind	C		459 (M^++1)
N-b-386	1-a	N-b-385		2TPMe	Et	H	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-b-387	14n-2	N-a-179	CHO29	2TPMe	Et	Et	H	1Me-5-Ind	C		473 (M^++1)
N-b-388	1-a	N-b-387		2TPMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-b-389	14n-2	N-a-181	CHO29	2TPMe	Et	Et	H	1Et-5-Ind	C		487 (M^++1)
N-b-390	1-a	N-b-389		2TPMe	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		459 (M^++1)
N-b-391	14n-2	N-a-183	CHO29	2TPMe	Et	Et	H	5-1Idz	C		460 (M^++1)
N-b-392	1-a	N-b-391		2TPMe	Et	H	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-b-393	14n-2	N-a-185	CHO29	2TPMe	Et	Et	H	1Me-5-Idz	C		474 (M^++1)
N-b-394	1-a	N-b-393		2TPMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)

[0410] 参考例15

2－[5－(ピペリジン－1－イル)－2, 3－ジヒドロインデン－1－イル－イリデン]酢酸エチル(中間体n－c－1)の合成(製造法9工程k－1)

参考例1の中間体A－2の合成法(製造法9工程k－1)に記載の手順に従って、中間体n－a－3(1. 33g)、ジエチルホスホノ酢酸エチル(7. 5ml、TCI)、水素化ナトリウム(1. 23g、WAKO)を反応、処理させることで標記化合物(中間体n－c－2;1. 208g)を得た。Mass(LCMS):286(M^+＋1)、保持時間;5. 93分(溶出条件:B)。

2－(5－(ピペリジン－1－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル)酢酸エチル(中間体n－c－2)の合成(製造法9工程j)

参考例1の中間体A－3の合成法(製造法9工程j)に記載の手順に従って、中間体n－c－1(1. 20g)、10%パラジウム炭素(82. 2mg、Merck社製)を反応、処理させることで標記化合物(中間体n－c－2;1. 286mg)を得た。Mass(LCMS):288(

M^+＋1)、保持時間;3．55分(溶出条件:D)。

2－[6－ブロモ－5－(ピペリジン－1－イル)－2，3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチル(中間体n－c－3)の合成(製造法8工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って、中間体n－c－2(272．3mg)およびNBS(180．0mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体n－c－3;165．3mg)を得た(但し反応は室温にて1時間行った)。Mass(LCMS):365(M^+)、保持時間;3．97分(溶出条件:B)。

[0411] 参考例16

2－(5－フルオロ－2，3－ジヒドロインデン－1－イル－イリデン)酢酸エチル(中間体n－c－46)の合成(製造法9工程k－1)

参考例1の中間体A－2の合成法(製造法9工程k－1)に記載の手順に従って、5－フルオロ－1－インダノン(5．32g)、ジエチルホスホノ酢酸エチル(23ml、TCI)、水素化ナトリウム(4．13g、WAKO)を反応、処理させることで標記化合物(中間体N－c－46;5．24g)を得た。Mass(LCMS):221(M^+＋1)、保持時間;5．13分(溶出条件:B)。

2－[5－(ピペラジン－1－イル)－2，3－ジヒドロインデン－1－イル－イリデン]酢酸エチル(中間体n－c－47)の合成(製造法14工程n)

参考例12の中間体n―a－1の合成法(製造法14工程n)に記載の手順に従って、中間体n－c－46(2．29g)、炭酸カリウム(1．21g、WAKO)、ピペラジン(1．2ml、TCI)を反応、処理させることで標記化合物(中間体N－c－47;1．28g)を得た。Mass(LCMS):272(M^+＋1)、保持時間;5．98分(溶出条件:B)。

[0412] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．N－c－1、Table－Int．N－c－2に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「AMN(番号)」で示すハライド試薬はTable－AMNに示したものである。またTable－Int．N－b－1中の「S／

D」の欄に「S」と記したものは化合物中のインダン環とカルボニル基を結ぶ2つの炭素原子が単結合でつながった化合物を示し、「D」と記したものは化合物中のベンゼン環とカルボニル基を結ぶ2つの炭素原子が二重結合でつながった化合物を示す。

[0413] [表143]

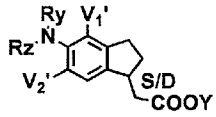
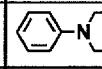
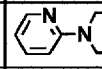
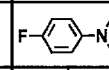
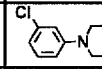
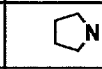


Table-Int.N-c-1

Exp.	Syn.	SM1	SM2	RyRz	Y	V_1'	V_2'	S/D	LCMS		
									method	RTime	Mass
Int.n-c-4	10k-1	Int.n-a-4			Et	H	H	D	C		300 (M^++1)
Int.n-c-5	10-j	Int.n-c-4			Et	H	H	S	C		302 (M^++1)
Int.n-c-6	13-h	Int.n-c-5			Et	H	Br	S	C		380 (M^+)
Int.n-c-7	10k-1	Int.n-a-5			Et	H	H	D	C		300 (M^++1)
Int.n-c-8	10-j	Int.n-c-7			Et	H	H	S	C		302 (M^++1)
Int.n-c-9	13-h	Int.n-c-8			Et	H	Br	S	C		380 (M^+)
Int.n-c-10	10k-1	Int.n-a-6			Et	H	H	D	C		300 (M^++1)
Int.n-c-11	10-j	Int.n-c-10			Et	H	H	S	C		302 (M^++1)
Int.n-c-12	13-h	Int.n-c-11			Et	H	Br	S	C		380 (M^+)
Int.n-c-13	10k-1	Int.n-a-7			Et	H	H	D	C		314 (M^++1)
Int.n-c-14	10-j	Int.n-c-13			Et	H	H	S	C		316 (M^++1)
Int.n-c-15	13-h	Int.n-c-14			Et	H	Br	S	C		394 (M^+)
Int.n-c-16	10k-1	Int.n-a-8			Et	H	H	D	C		362 (M^++1)
Int.n-c-17	10-j	Int.n-c-16			Et	H	H	S	C		364 (M^++1)
Int.n-c-18	13-h	Int.n-c-17			Et	H	Br	S	C		442 (M^+)
Int.n-c-19	10k-1	Int.n-a-9			Et	H	H	D	C		376 (M^++1)
Int.n-c-20	10-j	Int.n-c-19			Et	H	H	S	C		378 (M^++1)
Int.n-c-21	13-h	Int.n-c-20			Et	H	Br	S	C		456 (M^+)
Int.n-c-22	10k-1	Int.n-a-10			Et	H	H	D	C		288 (M^++1)
Int.n-c-23	10-j	Int.n-c-22			Et	H	H	S	C		290 (M^++1)
Int.n-c-24	13-h	Int.n-c-23			Et	H	Br	S	C		368 (M^+)
Int.n-c-25	10k-1	Int.n-a-11			Et	H	H	D	C		316 (M^++1)
Int.n-c-26	10-j	Int.n-c-25			Et	H	H	S	C		318 (M^++1)

[0414] [表144]

Table-Int.N-c-2

Exp.	Syn.	SM1	SM2	RyRz	Y	V_1'	V_2'	S/D	LCMS		
									method	RTime	Mass
Int.n-c-27	13-h	Int.n-c-26			Et	H	Br	S	C		396 (M^+)
Int.n-c-28	10k-1	Int.n-a-12			Et	H	H	D	C		316 (M^++1)
Int.n-c-29	10-j	Int.n-c-28			Et	H	H	S	C		318 (M^++1)
Int.n-c-30	13-h	Int.n-c-29			Et	H	Br	S	C		396 (M^+)
Int.n-c-31	10k-1	Int.n-a-13			Et	H	H	D	C		363 (M^++1)
Int.n-c-32	10-j	Int.n-c-31			Et	H	H	S	C		365 (M^++1)
Int.n-c-33	13-h	Int.n-c-32			Et	H	Br	S	C		443 (M^+)
Int.n-c-34	10k-1	Int.n-a-14			Et	H	H	D	C		364 (M^++1)
Int.n-c-35	10-j	Int.n-c-34			Et	H	H	S	C		366 (M^++1)
Int.n-c-36	13-h	Int.n-c-35			Et	H	Br	S	C		444 (M^+)
Int.n-c-37	10k-1	Int.n-a-15			Et	H	H	D	C		381 (M^++1)
Int.n-c-38	10-j	Int.n-c-37			Et	H	H	S	C		383 (M^++1)
Int.n-c-39	13-h	Int.n-c-38			Et	H	Br	S	C		461 (M^+)
Int.n-c-40	10k-1	Int.n-a-16			Et	H	H	D	C		381 (M^++1)
Int.n-c-41	10-j	Int.n-c-40			Et	H	H	S	C		383 (M^++1)
Int.n-c-42	13-h	Int.n-c-41			Et	H	Br	S	C		461 (M^+)
Int.n-c-43	10k-1	Int.n-a-17			Et	H	H	D	C		397 (M^++1)
Int.n-c-44	10-j	Int.n-c-43			Et	H	H	S	C		399 (M^++1)
Int.n-c-45	13-h	Int.n-c-44			Et	H	Br	S	C		477 (M^+)
Int.n-c-48	10-j	Int.n-c-47			Et	H	H	S	C		274 (M^+)
Int.n-c-49	13-h	Int.n-c-48			Et	H	Br	S	C		352 (M^+)
Int.n-c-50	10k-1	Int.n-a-18			Et	H	H	D	C		300 (M^++1)
Int.n-c-51	10-j	Int.n-c-50			Et	H	H	S	C		302 (M^++1)
Int.n-c-52	13-h	Int.n-c-51			Et	H	Br	S	C		380 (M^+)

[0415] 実施例N－c－1

2－[6－(ナフタレン－2－イル)－5－(ピペリジン－1－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチルの合成(化合物番号N－c－1)の合成(製造法4工程e－1)

実施例化合物A－a－1の合成法(製造法4工程e－1)に記載の手順に従って中間体n－c－3(143. 3mg)、2－ナフタレンボロン酸(254. 6mg、Ald)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0. 45ml)および$(Ph_3P)_4Pd$(65. 4mg、ナカライテスク社製)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号N－c－1;79. 4mg)を得た(但し反応は18時間行った)。

[0416] 実施例N－c－2

2－[6－(ナフタレン－2－イル)－5－(ピペリジン－1－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸(化合物番号N－b－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物N－c－1(65. 7mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0. 40ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号N－c－2;57. 7mg)を得た(但し反応は2時間行った)。

上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－N－C－1からTable－N－C－8に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。化合物の製造は、表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに示したものである。

[0417] [表145]

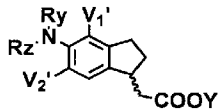


Table-N-C-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRyRz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-c-1	4e-1	Int.n-c-3	BRA1		Et	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-c-2	1-a	N-c-1			H	H	2-Nap	C		386 (M^++1)
N-c-3	4e-1	Int.n-c-3	BRA2		Et	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-c-4	1-a	N-c-3			H	H	5-Ind	C		375 (M^++1)
N-c-5	4e-1	Int.n-c-3	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-c-6	1-a	N-c-5			H	H	1Me-5-Ind	C		389 (M^++1)
N-c-7	4e-1	Int.n-c-3	BRA4		Et	H	1Et-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-c-8	1-a	N-c-7			H	H	1Et-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-c-9	4e-1	Int.n-c-3	BRA5		Et	H	1Me-4-Ind	C		417 (M^++1)
N-c-10	1-a	N-c-9			H	H	1Me-4-Ind	C		389 (M^++1)
N-c-11	4e-1	Int.n-c-3	BRA6		Et	H	1Me-6-Ind	C		417 (M^++1)
N-c-12	1-a	N-c-11			H	H	1Me-6-Ind	C		389 (M^++1)
N-c-13	4e-1	Int.n-c-3	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-c-14	1-a	N-c-13			H	H	5-1Idz	C		376 (M^++1)
N-c-15	4e-1	Int.n-c-3	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-c-16	1-a	N-c-15			H	H	1Me-5-Idz	C		390 (M^++1)
N-c-17	4e-1	Int.n-c-3	BRA9		Et	H	1Et-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-c-18	1-a	N-c-17			H	H	1Et-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-c-19	4e-1	Int.n-c-6	BRA1		Et	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-c-20	1-a	N-c-19			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-c-21	4e-1	Int.n-c-6	BRA2		Et	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-c-22	1-a	N-c-21			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)

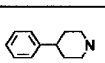
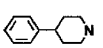
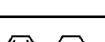
[0418] [表146]

Table-N-C-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-c-23	4e-1	Int.n-c-6	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-c-24	1-a	N-c-23			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-c-25	4e-1	Int.n-c-6	BRA4		Et	H	1Et-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-c-26	1-a	N-c-25			H	H	1Et-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-c-27	4e-1	Int.n-c-6	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-c-28	1-a	N-c-27			H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-c-29	4e-1	Int.n-c-6	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-c-30	1-a	N-c-29			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-c-31	4e-1	Int.n-c-6	BRA9		Et	H	1Et-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-c-32	1-a	N-c-31			H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-c-33	4e-1	Int.n-c-9	BRA1		Et	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-c-34	1-a	N-c-33			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-c-35	4e-1	Int.n-c-9	BRA2		Et	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-c-36	1-a	N-c-35			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-c-37	4e-1	Int.n-c-9	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-c-38	1-a	N-c-37			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-c-39	4e-1	Int.n-c-9	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-c-40	1-a	N-c-39			H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-c-41	4e-1	Int.n-c-9	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-c-42	1-a	N-c-41			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-c-43	4e-1	Int.n-c-12	BRA1		Et	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-c-44	1-a	N-c-43			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)

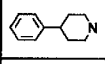
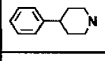
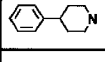
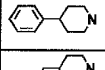
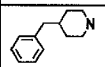
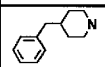
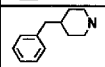
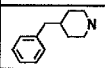
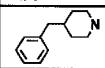
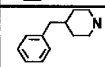
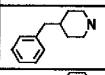
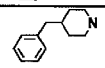
[0419] [表147]

Table-N-C-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-c-45	4e-1	Int.n-c-12	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-c-46	1-a	N-c-45			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-c-47	4e-1	Int.n-c-12	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-c-48	1-a	N-c-47			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-c-49	4e-1	Int.n-c-12	BRA9		Et	H	1Et-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-c-50	1-a	N-c-49			H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-c-51	4e-1	Int.n-c-15	BRA1		Et	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-c-52	1-a	N-c-51			H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-c-53	4e-1	Int.n-c-15	BRA2		Et	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-c-54	1-a	N-c-53			H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-c-55	4e-1	Int.n-c-15	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-c-56	1-a	N-c-55			H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-c-57	4e-1	Int.n-c-15	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-c-58	1-a	N-c-57			H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-c-59	4e-1	Int.n-c-15	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-c-60	1-a	N-c-59			H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-c-61	4e-1	Int.n-c-18	BRA1		Et	H	2-Nap	C		490 (M^++1)
N-c-62	1-a	N-c-61			H	H	2-Nap	C		462 (M^++1)
N-c-63	4e-1	Int.n-c-18	BRA2		Et	H	5-Ind	C		479 (M^++1)
N-c-64	1-a	N-c-63			H	H	5-Ind	C		451 (M^++1)
N-c-65	4e-1	Int.n-c-18	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		493 (M^++1)
N-c-66	1-a	N-c-65			H	H	1Me-5-Ind	C		465 (M^++1)

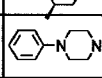
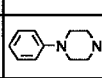
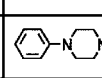
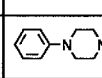
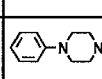
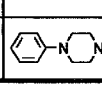
[0420] [表148]

Table-N-C-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-c-67	4e-1	Int.n-c-18	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		480 (M^++1)
N-c-68	1-a	N-c-67			H	H	5-1Idz	C		452 (M^++1)
N-c-69	4e-1	Int.n-c-18	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		494 (M^++1)
N-c-70	1-a	N-c-69			H	H	1Me-5-Idz	C		466 (M^++1)
N-c-71	4e-1	Int.n-c-21	BRA1		Et	H	2-Nap	C		504 (M^++1)
N-c-72	1-a	N-c-71			H	H	2-Nap	C		476 (M^++1)
N-c-73	4e-1	Int.n-c-21	BRA2		Et	H	5-Ind	C		493 (M^++1)
N-c-74	1-a	N-c-73			H	H	5-Ind	C		465 (M^++1)
N-c-75	4e-1	Int.n-c-21	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		507 (M^++1)
N-c-76	1-a	N-c-75			H	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
N-c-77	4e-1	Int.n-c-21	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		508 (M^++1)
N-c-78	1-a	N-c-77			H	H	1Me-5-Idz	C		480 (M^++1)
N-c-79	4e-1	Int.n-c-24	BRA1		Et	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-c-80	1-a	N-c-79			H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-c-81	4e-1	Int.n-c-24	BRA2		Et	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-c-82	1-a	N-c-81			H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-c-83	4e-1	Int.n-c-24	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		419 (M^++1)
N-c-84	1-a	N-c-83			H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-c-85	4e-1	Int.n-c-24	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-c-86	1-a	N-c-85			H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-c-87	4e-1	Int.n-c-24	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-c-88	1-a	N-c-87			H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)

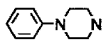
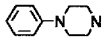
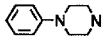
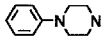
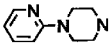
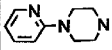
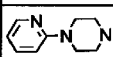
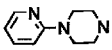
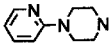
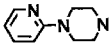
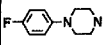
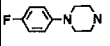
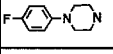
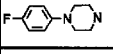
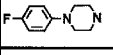
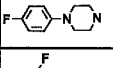
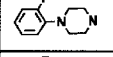
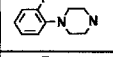
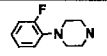
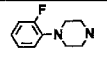
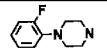
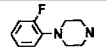
[0421] [表149]

Table-N-C-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-c-89	4e-1	Int.n-c-27	BRA1		Et	H	2-Nap	C		444 (M^++1)
N-c-90	1-a	N-c-89			H	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-c-91	4e-1	Int.n-c-27	BRA2		Et	H	5-Ind	C		433 (M^++1)
N-c-92	1-a	N-c-91			H	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-c-93	4e-1	Int.n-c-27	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		447 (M^++1)
N-c-94	1-a	N-c-93			H	H	1Me-5-Ind	C		419 (M^++1)
N-c-95	4e-1	Int.n-c-27	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		434 (M^++1)
N-c-96	1-a	N-c-95			H	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-c-97	4e-1	Int.n-c-27	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		448 (M^++1)
N-c-98	1-a	N-c-97			H	H	1Me-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-c-99	4e-1	Int.n-c-30	BRA1		Et	H	2-Nap	C		444 (M^++1)
N-c-100	1-a	N-c-99			H	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-c-101	4e-1	Int.n-c-30	BRA2		Et	H	5-Ind	C		433 (M^++1)
N-c-102	1-a	N-c-101			H	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-c-103	4e-1	Int.n-c-30	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		434 (M^++1)
N-c-104	1-a	N-c-103			H	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-c-105	4e-1	Int.n-c-33	BRA1		Et	H	2-Nap	C		491 (M^++1)
N-c-106	1-a	N-c-105			H	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
N-c-107	4e-1	Int.n-c-33	BRA2		Et	H	5-Ind	C		480 (M^++1)
N-c-108	1-a	N-c-107			H	H	5-Ind	C		452 (M^++1)
N-c-109	4e-1	Int.n-c-33	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		494 (M^++1)
N-c-110	1-a	N-c-109			H	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)

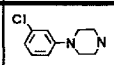
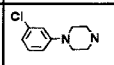
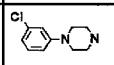
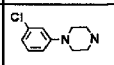
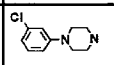
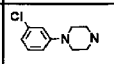
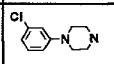
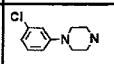
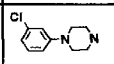
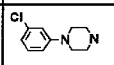
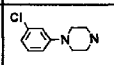
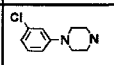
[0422] [表150]

Table-N-C-6

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-c-111	4e-1	Int.n-c-33	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		481 (M^++1)
N-c-112	1-a	N-c-111			H	H	5-1Idz	C		453 (M^++1)
N-c-113	4e-1	Int.n-c-33	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		495 (M^++1)
N-c-114	1-a	N-c-113			H	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
N-c-115	4e-1	Int.n-c-36	BRA1		Et	H	2-Nap	C		492 (M^++1)
N-c-116	1-a	N-c-115			H	H	2-Nap	C		464 (M^++1)
N-c-117	4e-1	Int.n-c-36	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		495 (M^++1)
N-c-118	1-a	N-c-117			H	H	1Me-5-Ind	C		467 (M^++1)
N-c-119	4e-1	Int.n-c-36	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		496 (M^++1)
N-c-120	1-a	N-c-119			H	H	1Me-5-Idz	C		468 (M^++1)
N-c-121	4e-1	Int.n-c-39	BRA1		Et	H	2-Nap	C		509 (M^++1)
N-c-122	1-a	N-c-121			H	H	2-Nap	C		481 (M^++1)
N-c-123	4e-1	Int.n-c-39	BRA2		Et	H	5-Ind	C		498 (M^++1)
N-c-124	1-a	N-c-123			H	H	5-Ind	C		470 (M^++1)
N-c-125	4e-1	Int.n-c-39	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		499 (M^++1)
N-c-126	1-a	N-c-125			H	H	5-1Idz	C		471 (M^++1)
N-c-127	4e-1	Int.n-c-42	BRA1		Et	H	2-Nap	C		509 (M^++1)
N-c-128	1-a	N-c-127			H	H	2-Nap	C		481 (M^++1)
N-c-129	4e-1	Int.n-c-42	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		512 (M^++1)
N-c-130	1-a	N-c-129			H	H	1Me-5-Ind	C		484 (M^++1)
N-c-131	4e-1	Int.n-c-42	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		513 (M^++1)
N-c-132	1-a	N-c-131			H	H	1Me-5-Idz	C		485 (M^++1)

[0423] [表151]

Table-N-C-7

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-c-133	4e-1	Int.n-c-45	BRA1		Et	H	2-Nap	C		526 (M^++1)
N-c-134	1-a	N-c-133			H	H	2-Nap	C		498 (M^++1)
N-c-135	4e-1	Int.n-c-45	BRA2		Et	H	5-Ind	C		515 (M^++1)
N-c-136	1-a	N-c-135			H	H	5-Ind	C		487 (M^++1)
N-c-137	4e-1	Int.n-c-45	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		529 (M^++1)
N-c-138	1-a	N-c-137			H	H	1Me-5-Ind	C		501 (M^++1)
N-c-139	4e-1	Int.n-c-45	BRA5		Et	H	1Me-4-Ind	C		529 (M^++1)
N-c-140	1-a	N-c-139			H	H	1Me-4-Ind	C		501 (M^++1)
N-c-141	4e-1	Int.n-c-45	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		516 (M^++1)
N-c-142	1-a	N-c-141			H	H	5-1Idz	C		488 (M^++1)
N-c-143	4e-1	Int.n-c-45	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		530 (M^++1)
N-c-144	1-a	N-c-143			H	H	1Me-5-Idz	C		502 (M^++1)
N-c-145	4e-1	Int.n-c-49	BRA1		Et	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-c-146	1-a	N-c-145			H	H	2-Nap	C		372 (M^++1)
N-c-147	4e-1	Int.n-c-49	BRA2		Et	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-c-148	1-a	N-c-147			H	H	5-Ind	C		361 (M^++1)
N-c-149	4e-1	Int.n-c-49	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-c-150	1-a	N-c-149			H	H	1Me-5-Ind	C		375 (M^++1)
N-c-151	4e-1	Int.n-c-49	BRA7		Et	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-c-152	1-a	N-c-151			H	H	5-1Idz	C		362 (M^++1)
N-c-153	4e-1	Int.n-c-49	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-c-154	1-a	N-c-153			H	H	1Me-5-Idz	C		376 (M^++1)

[0424] [表152]

Table-N-C-8

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-c-155	4e-1	Int.n-c-52	BRA1		Et	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-c-156	1-a	N-c-155			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-c-157	4e-1	Int.n-c-52	BRA2		Et	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-c-158	1-a	N-c-157			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-c-159	4e-1	Int.n-c-52	BRA3		Et	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-c-160	1-a	N-c-159			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-c-161	4e-1	Int.n-c-52	BRA7		Et	H	5-Ildz	C		418 (M^++1)
N-c-162	1-a	N-c-161			H	H	5-Ildz	C		390 (M^++1)
N-c-163	4e-1	Int.n-c-52	BRA8		Et	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-c-164	1-a	N-c-163			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)

[0425] 実施例N－d－1

実施例化合物N－a－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物（化合物番号N－d－1；10．3mg）を得た。

上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－N－D－1から、Table－N－D－3に示す。化合物の製造は、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。

[0426] [表153]

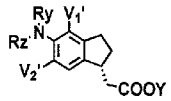


Table-N-D-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-d-1		N-a-2		H	Me	H	H	2-Nap	C		332 (M^++1)
N-d-2		N-a-4		H	Me	H	H	5-Ind	C		321 (M^++1)
N-d-3		N-a-6		H	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		335 (M^++1)
N-d-4		N-a-8		H	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		349 (M^++1)
N-d-5		N-a-10		H	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		335 (M^++1)
N-d-6		N-a-12		H	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		335 (M^++1)
N-d-7		N-a-14		H	Me	H	H	5-1Idz	C		322 (M^++1)
N-d-8		N-a-16		H	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		336 (M^++1)
N-d-9		N-a-18		H	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-d-10		N-a-20		H	Me	H	H	2Me-5-Idz	C		336 (M^++1)
N-d-11		N-a-22		H	Me	H	H	5-BF	C		322 (M^++1)
N-d-12		N-a-24		H	Me	H	H	5-Bzt	C		339 (M^++1)
N-d-13		N-a-26		H	Me	H	H	3-Qu	C		333 (M^++1)
N-d-14		N-a-28		H	Me	H	H	6-Qu	C		333 (M^++1)
N-d-15		N-a-30		Me	Me	H	H	6-IQ	C		347 (M^++1)
N-d-16		N-a-32		Me	Me	H	H	2-Nap	C		346 (M^++1)
N-d-17		N-a-34		Me	Me	H	H	5-Ind	C		335 (M^++1)
N-d-18		N-a-36		Me	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		349 (M^++1)
N-d-19		N-a-38		Me	Me	H	H	5-1Idz	C		336 (M^++1)
N-d-20		N-a-40		Me	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-d-21		N-a-42		Me	Me	H	H	6-Qu	C		347 (M^++1)
N-d-22		N-a-44		Et	Me	H	H	2-Nap	C		360 (M^++1)
N-d-23		N-a-46		Et	Me	H	H	5-Ind	C		349 (M^++1)
N-d-24		N-a-48		Et	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		363 (M^++1)
N-d-25		N-a-50		Et	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-26		N-a-52		Et	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		363 (M^++1)
N-d-27		N-a-54		Et	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		363 (M^++1)
N-d-28		N-a-56		Et	Me	H	H	5-1Idz	C		350 (M^++1)
N-d-29		N-a-58		Et	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		364 (M^++1)
N-d-30		N-a-60		Et	Me	H	H	3-Qu	C		361 (M^++1)
N-d-31		N-a-62		Et	Me	H	H	6-IQ	C		361 (M^++1)
N-d-32		N-a-64		nPr	Me	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-d-33		N-a-66		nPr	Me	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-d-34		N-a-68		nPr	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-35		N-a-70		nPr	Me	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-d-36		N-a-72		nPr	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-d-37		N-a-74		nPr	Me	H	H	5-BF	C		364 (M^++1)
N-d-38		N-a-76		nPr	Me	H	H	3-Qu	C		375 (M^++1)
N-d-39		N-a-78		iPr	Me	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-d-40		N-a-80		iPr	Me	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-d-41		N-a-82		iPr	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-42		N-a-84		iPr	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-d-43		N-a-86		iPr	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-44		N-a-88		iPr	Me	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)

[0427] [表154]

Table-N-D-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-d-45		N-a-90		iPr	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-d-46		N-a-92		nBu	Me	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-d-47		N-a-94		nBu	Me	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-48		N-a-96		nBu	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-d-49		N-a-98		nBu	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		391 (M^++1)
N-d-50		N-a-100		nBu	Me	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-d-51		N-a-102		nBu	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-d-52		N-a-104		nBu	Me	H	H	3-Qu	C		389 (M^++1)
N-d-53		N-a-106		nBu	Me	H	H	6-Qu	C		389 (M^++1)
N-d-54		N-a-108		iBu	Me	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-d-55		N-a-110		iBu	Me	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-56		N-a-112		iBu	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-d-57		N-a-114		iBu	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-d-58		N-a-116		iBu	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		391 (M^++1)
N-d-59		N-a-118		iBu	Me	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-d-60		N-a-120		iBu	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-d-61		N-a-122		iBu	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-d-62		N-a-124		iBu	Me	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-d-63		N-a-126		cPen	Me	H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-d-64		N-a-128		cPen	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-d-65		N-a-130		cPen	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-d-66		N-a-132		cPen	Me	H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-d-67		N-a-134		cPen	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-d-68		N-a-136		cPen	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-d-69		N-a-138		cHex	Me	H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-d-70		N-a-140		cHex	Me	H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-d-71		N-a-142		cHex	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-d-72		N-a-144		cHex	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		417 (M^++1)
N-d-73		N-a-146		cHex	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		417 (M^++1)
N-d-74		N-a-148		cHex	Me	H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-d-75		N-a-150		cHex	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-d-76		N-a-152		cHex	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-d-77		N-a-154		2MecHex	Me	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-d-78		N-a-156		2MecHex	Me	H	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-d-79		N-a-158		2MecHex	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-d-80		N-a-160		2MecHex	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		431 (M^++1)
N-d-81		N-a-162		2MecHex	Me	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-d-82		N-a-164		2MecHex	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-d-83		N-a-166		2Indane	Me	H	H	2-Nap	C		448 (M^++1)
N-d-84		N-a-168		2Indane	Me	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
N-d-85		N-a-170		2Indane	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
N-d-86		N-a-172		2Indane	Me	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
N-d-87		N-a-174		2Indane	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
N-d-88		N-a-176		H	Et	H	H	2-Nap	C		346 (M^++1)
N-d-89		N-a-178		H	Et	H	H	5-Ind	C		335 (M^++1)
N-d-90		N-a-180		H	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		349 (M^++1)

[0428] [表155]

Table-N-D-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-d-91		N-a-182		H	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		363 (M^++1)
N-d-92		N-a-184		H	Et	H	H	5-1Idz	C		336 (M^++1)
N-d-93		N-a-186		H	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-d-94		N-a-188		H	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		364 (M^++1)
N-d-95		N-a-190		Et	Et	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-d-96		N-a-192		Et	Et	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-d-97		N-a-194		Et	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-98		N-a-196		Et	Et	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-d-99		N-a-198		Et	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-d-100		N-a-200		Et	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-d-101		N-a-202		nPr	Et	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-d-102		N-a-204		nPr	Et	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-103		N-a-206		nPr	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-d-104		N-a-208		nPr	Et	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-d-105		N-a-210		nPr	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-d-106		N-a-212		iPr	Et	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-d-107		N-a-214		iPr	Et	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-d-108		N-a-216		iPr	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-d-109		N-a-218		iPr	Et	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-d-110		N-a-220		iPr	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-d-111		N-a-222		nBu	Et	H	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-d-112		N-a-224		nBu	Et	H	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-d-113		N-a-226		nBu	Et	H	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-d-114		N-a-228		nBu	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-d-115		N-a-230		iBu	Et	H	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-d-116		N-a-232		iBu	Et	H	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-d-117		N-a-234		iBu	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-d-118		N-a-236		iBu	Et	H	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-d-119		N-a-238		iBu	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-d-120		N-a-240		iBu	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-d-121		N-a-242		cPen	Et	H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-d-122		N-a-244		cPen	Et	H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-d-123		N-a-246		cPen	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-d-124		N-a-248		cPen	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-d-125		N-a-250		cPen	Et	H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-d-126		N-a-252		cPen	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-d-127		N-a-254		cPen	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-d-128		N-a-256		cHex	Et	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-d-129		N-a-258		cHex	Et	H	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-d-130		N-a-260		cHex	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-d-131		N-a-262		cHex	Et	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-d-132		N-a-264		cHex	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-d-133		N-a-266		2Indane	Et	H	H	2-Nap	C		462 (M^++1)
N-d-134		N-a-268		2Indane	Et	H	H	5-Ind	C		451 (M^++1)
N-d-135		N-a-270		2Indane	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		465 (M^++1)
N-d-136		N-a-272		2Indane	Et	H	H	5-1Idz	C		452 (M^++1)
N-d-137		N-a-274		2Indane	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		466 (M^++1)

[0429] 実施例N－e－1

実施例化合物N－a－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物（化合物番号N

－ｅ－１；１２．１ｍｇ）を得た。

上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる代表例をTable－Ｎ－Ｅ－１から、Table－Ｎ－Ｅ－３に示す。化合物の製造は、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。

[0430] [表156]

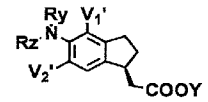


Table-N-E-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-e-1		N-a-2		H	Me	H	H	2-Nap	C		332 (M^++1)
N-e-2		N-a-4		H	Me	H	H	5-Ind	C		321 (M^++1)
N-e-3		N-a-6		H	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		335 (M^++1)
N-e-4		N-a-8		H	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		349 (M^++1)
N-e-5		N-a-10		H	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		335 (M^++1)
N-e-6		N-a-12		H	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		335 (M^++1)
N-e-7		N-a-14		H	Me	H	H	5-1Idz	C		322 (M^++1)
N-e-8		N-a-16		H	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		336 (M^++1)
N-e-9		N-a-18		H	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-e-10		N-a-20		H	Me	H	H	2Me-5-Idz	C		336 (M^++1)
N-e-11		N-a-22		H	Me	H	H	5-BF	C		322 (M^++1)
N-e-12		N-a-24		H	Me	H	H	5-Bzt	C		339 (M^++1)
N-e-13		N-a-26		H	Me	H	H	3-Qu	C		333 (M^++1)
N-e-14		N-a-28		H	Me	H	H	6-Qu	C		333 (M^++1)
N-e-15		N-a-30		Me	Me	H	H	6-IQ	C		347 (M^++1)
N-e-16		N-a-32		Me	Me	H	H	2-Nap	C		346 (M^++1)
N-e-17		N-a-34		Me	Me	H	H	5-Ind	C		335 (M^++1)
N-e-18		N-a-36		Me	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		349 (M^++1)
N-e-19		N-a-38		Me	Me	H	H	5-1Idz	C		336 (M^++1)
N-e-20		N-a-40		Me	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-e-21		N-a-42		Me	Me	H	H	6-Qu	C		347 (M^++1)
N-e-22		N-a-44		Et	Me	H	H	2-Nap	C		360 (M^++1)
N-e-23		N-a-46		Et	Me	H	H	5-Ind	C		349 (M^++1)
N-e-24		N-a-48		Et	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		363 (M^++1)
N-e-25		N-a-50		Et	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-26		N-a-52		Et	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		363 (M^++1)
N-e-27		N-a-54		Et	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		363 (M^++1)
N-e-28		N-a-56		Et	Me	H	H	5-1Idz	C		350 (M^++1)
N-e-29		N-a-58		Et	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		364 (M^++1)
N-e-30		N-a-60		Et	Me	H	H	3-Qu	C		361 (M^++1)
N-e-31		N-a-62		Et	Me	H	H	6-IQ	C		361 (M^++1)
N-e-32		N-a-64		nPr	Me	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-e-33		N-a-66		nPr	Me	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-e-34		N-a-68		nPr	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-35		N-a-70		nPr	Me	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-e-36		N-a-72		nPr	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-e-37		N-a-74		nPr	Me	H	H	5-BF	C		364 (M^++1)
N-e-38		N-a-76		nPr	Me	H	H	3-Qu	C		375 (M^++1)
N-e-39		N-a-78		iPr	Me	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-e-40		N-a-80		iPr	Me	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-e-41		N-a-82		iPr	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-42		N-a-84		iPr	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-e-43		N-a-86		iPr	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-44		N-a-88		iPr	Me	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)

[0431] [表157]

Table-N-E-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-e-45		N-a-90		iPr	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-e-46		N-a-92		nBu	Me	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-e-47		N-a-94		nBu	Me	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-48		N-a-96		nBu	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-e-49		N-a-98		nBu	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		391 (M^++1)
N-e-50		N-a-100		nBu	Me	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-e-51		N-a-102		nBu	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-e-52		N-a-104		nBu	Me	H	H	3-Qu	C		389 (M^++1)
N-e-53		N-a-106		nBu	Me	H	H	6-Qu	C		389 (M^++1)
N-e-54		N-a-108		iBu	Me	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-e-55		N-a-110		iBu	Me	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-56		N-a-112		iBu	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-e-57		N-a-114		iBu	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-e-58		N-a-116		iBu	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		391 (M^++1)
N-e-59		N-a-118		iBu	Me	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-e-60		N-a-120		iBu	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-e-61		N-a-122		iBu	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-e-62		N-a-124		iBu	Me	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-e-63		N-a-126		cPen	Me	H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-e-64		N-a-128		cPen	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-e-65		N-a-130		cPen	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-e-66		N-a-132		cPen	Me	H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-e-67		N-a-134		cPen	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-e-68		N-a-136		cPen	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-e-69		N-a-138		cHex	Me	H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-e-70		N-a-140		cHex	Me	H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-e-71		N-a-142		cHex	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-e-72		N-a-144		cHex	Me	H	H	1Me-4-Ind	C		417 (M^++1)
N-e-73		N-a-146		cHex	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		417 (M^++1)
N-e-74		N-a-148		cHex	Me	H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-e-75		N-a-150		cHex	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-e-76		N-a-152		cHex	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-e-77		N-a-154		2MecHex	Me	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-e-78		N-a-156		2MecHex	Me	H	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-e-79		N-a-158		2MecHex	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-e-80		N-a-160		2MecHex	Me	H	H	1Me-6-Ind	C		431 (M^++1)
N-e-81		N-a-162		2MecHex	Me	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-e-82		N-a-164		2MecHex	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-e-83		N-a-166		2Indane	Me	H	H	2-Nap	C		448 (M^++1)
N-e-84		N-a-168		2Indane	Me	H	H	5-Ind	C		437 (M^++1)
N-e-85		N-a-170		2Indane	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		451 (M^++1)
N-e-86		N-a-172		2Indane	Me	H	H	5-1Idz	C		438 (M^++1)
N-e-87		N-a-174		2Indane	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		452 (M^++1)
N-e-88		N-a-176		H	Et	H	H	2-Nap	C		346 (M^++1)
N-e-89		N-a-178		H	Et	H	H	5-Ind	C		335 (M^++1)
N-e-90		N-a-180		H	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		349 (M^++1)

[0432] [表158]

Table-N-E-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-e-91		N-a-182		H	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		363 (M^++1)
N-e-92		N-a-184		H	Et	H	H	5-1Idz	C		336 (M^++1)
N-e-93		N-a-186		H	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		350 (M^++1)
N-e-94		N-a-188		H	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		364 (M^++1)
N-e-95		N-a-190		Et	Et	H	H	2-Nap	C		374 (M^++1)
N-e-96		N-a-192		Et	Et	H	H	5-Ind	C		363 (M^++1)
N-e-97		N-a-194		Et	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-98		N-a-196		Et	Et	H	H	5-1Idz	C		364 (M^++1)
N-e-99		N-a-198		Et	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		378 (M^++1)
N-e-100		N-a-200		Et	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-e-101		N-a-202		nPr	Et	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-e-102		N-a-204		nPr	Et	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-103		N-a-206		nPr	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-e-104		N-a-208		nPr	Et	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-e-105		N-a-210		nPr	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)
N-e-106		N-a-212		iPr	Et	H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-e-107		N-a-214		iPr	Et	H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-e-108		N-a-216		iPr	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-e-109		N-a-218		iPr	Et	H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-e-110		N-a-220		iPr	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-e-111		N-a-222		nBu	Et	H	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-e-112		N-a-224		nBu	Et	H	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-e-113		N-a-226		nBu	Et	H	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-e-114		N-a-228		nBu	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-e-115		N-a-230		iBu	Et	H	H	2-Nap	C		402 (M^++1)
N-e-116		N-a-232		iBu	Et	H	H	5-Ind	C		391 (M^++1)
N-e-117		N-a-234		iBu	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		405 (M^++1)
N-e-118		N-a-236		iBu	Et	H	H	5-1Idz	C		392 (M^++1)
N-e-119		N-a-238		iBu	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		406 (M^++1)
N-e-120		N-a-240		iBu	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-e-121		N-a-242		cPen	Et	H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-e-122		N-a-244		cPen	Et	H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-e-123		N-a-246		cPen	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-e-124		N-a-248		cPen	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-e-125		N-a-250		cPen	Et	H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-e-126		N-a-252		cPen	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-e-127		N-a-254		cPen	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-e-128		N-a-256		cHex	Et	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-e-129		N-a-258		cHex	Et	H	H	5-Ind	C		417 (M^++1)
N-e-130		N-a-260		cHex	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-e-131		N-a-262		cHex	Et	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-e-132		N-a-264		cHex	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-e-133		N-a-266		2Indane	Et	H	H	2-Nap	C		462 (M^++1)
N-e-134		N-a-268		2Indane	Et	H	H	5-Ind	C		451 (M^++1)
N-e-135		N-a-270		2Indane	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		465 (M^++1)
N-e-136		N-a-272		2Indane	Et	H	H	5-1Idz	C		452 (M^++1)
N-e-137		N-a-274		2Indane	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		466 (M^++1)

[0433] 実施例N－f－1

実施例化合物N－b－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物（化合物番号

N－f－1；14．4mg）を得た。

上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる代表例をTable－N－F－1から、Table－N－F－5に示す。化合物の製造は、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。

[0434] [表159]

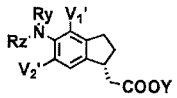


Table-N-F-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-f-1		N-b-2		Bn	H	H	H	2-Nap	C		408 (M^++1)
N-f-2		N-b-4		Bn	H	H	H	5-Ind	C		397 (M^++1)
N-f-3		N-b-6		Bn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		411 (M^++1)
N-f-4		N-b-8		Bn	H	H	H	5-1Idz	C		398 (M^++1)
N-f-5		N-b-10		Bn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		412 (M^++1)
N-f-6		N-b-12		Bn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-f-7		N-b-14		Bn	H	H	H	5-BF	C		398 (M^++1)
N-f-8		N-b-16		Bn	H	H	H	6-Qu	C		409 (M^++1)
N-f-9		N-b-18		Bn	Me	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
N-f-10		N-b-20		Bn	Me	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
N-f-11		N-b-22		Bn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
N-f-12		N-b-24		Bn	Me	H	H	5-1Idz	C		412 (M^++1)
N-f-13		N-b-26		Bn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-f-14		N-b-28		Bn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-f-15		N-b-30		Bn	Me	H	H	5-BF	C		412 (M^++1)
N-f-16		N-b-32		Bn	Et	H	H	2-Nap	C		436 (M^++1)
N-f-17		N-b-34		Bn	Et	H	H	5-Ind	C		425 (M^++1)
N-f-18		N-b-36		Bn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		439 (M^++1)
N-f-19		N-b-38		Bn	Et	H	H	5-1Idz	C		426 (M^++1)
N-f-20		N-b-40		Bn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-f-21		N-b-42		Bn	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-f-22		N-b-44		4FBn	Et	H	H	6-Qu	C		455 (M^++1)
N-f-23		N-b-46		4FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-f-24		N-b-48		4FBn	H	H	H	5-Ind	C		415 (M^++1)
N-f-25		N-b-50		4FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-f-26		N-b-52		4FBn	H	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-f-27		N-b-54		4FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-f-28		N-b-56		4FBn	Me	H	H	2-Nap	C		440 (M^++1)
N-f-29		N-b-58		4FBn	Me	H	H	5-Ind	C		429 (M^++1)
N-f-30		N-b-60		4FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-f-31		N-b-62		4FBn	Me	H	H	5-1Idz	C		430 (M^++1)
N-f-32		N-b-64		4FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-f-33		N-b-66		4FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-f-34		N-b-68		4FBn	Et	H	H	5-Ind	C		443 (M^++1)
N-f-35		N-b-70		4FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-f-36		N-b-72		4FBn	Et	H	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-f-37		N-b-74		4FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-f-38		N-b-76		2FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-f-39		N-b-78		2FBn	H	H	H	5-Ind	C		415 (M^++1)
N-f-40		N-b-80		2FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-f-41		N-b-82		2FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-f-42		N-b-84		2FBn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-f-43		N-b-86		2FBn	H	H	H	5-BF	C		416 (M^++1)
N-f-44		N-b-88		2FBn	Me	H	H	2-Nap	C		440 (M^++1)

[0435] [表160]

Table-N-F-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-f-45		N-b-90		2FBn	Me	H	H	5-Ind	C		429 (M^++1)
N-f-46		N-b-92		2FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-f-47		N-b-94		2FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-f-48		N-b-96		2FBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-f-49		N-b-98		2FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-f-50		N-b-100		2FBn	Et	H	H	5-Ind	C		443 (M^++1)
N-f-51		N-b-102		2FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-f-52		N-b-104		2FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-f-53		N-b-106		2FBn	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		472 (M^++1)
N-f-54		N-b-108		3FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-f-55		N-b-110		3FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-f-56		N-b-112		3FBn	H	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-f-57		N-b-114		3FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-f-58		N-b-116		3FBn	Me	H	H	2-Nap	C		440 (M^++1)
N-f-59		N-b-118		3FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-f-60		N-b-120		3FBn	Me	H	H	5-1Idz	C		430 (M^++1)
N-f-61		N-b-122		3FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-f-62		N-b-124		3FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-f-63		N-b-126		3FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-f-64		N-b-128		3FBn	Et	H	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-f-65		N-b-130		3FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-f-66		N-b-132		2ClBn	H	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-f-67		N-b-134		2ClBn	H	H	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-f-68		N-b-136		2ClBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-f-69		N-b-138		2ClBn	H	H	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-f-70		N-b-140		2ClBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-f-71		N-b-142		2ClBn	Me	H	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
N-f-72		N-b-144		2ClBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
N-f-73		N-b-146		2ClBn	Me	H	H	5-1Idz	C		446 (M^++1)
N-f-74		N-b-148		2ClBn	Et	H	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
N-f-75		N-b-150		2ClBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
N-f-76		N-b-152		2ClBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
N-f-77		N-b-154		4ClBn	H	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-f-78		N-b-156		4ClBn	H	H	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-f-79		N-b-158		4ClBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-f-80		N-b-160		4ClBn	H	H	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-f-81		N-b-162		4ClBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-f-82		N-b-164		4ClBn	Me	H	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
N-f-83		N-b-166		4ClBn	Me	H	H	5-Ind	C		445 (M^++1)
N-f-84		N-b-168		4ClBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
N-f-85		N-b-170		4ClBn	Me	H	H	5-1Idz	C		446 (M^++1)
N-f-86		N-b-172		4ClBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-f-87		N-b-174		4ClBn	Et	H	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
N-f-88		N-b-176		4ClBn	Et	H	H	5-Ind	C		460 (M^++1)
N-f-89		N-b-178		4ClBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
N-f-90		N-b-180		4ClBn	Et	H	H	5-1Idz	C		460 (M^++1)

[0436] [表161]

Table-N-F-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-f-91		N-b-182		4ClBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
N-f-92		N-b-184		2BrBn	Me	H	H	2-Nap	C		500 (M^+)
N-f-93		N-b-186		2BrBn	Me	H	H	5-Ind	C		489 (M^+)
N-f-94		N-b-188		2BrBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		503 (M^+)
N-f-95		N-b-190		2BrBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		517 (M^+)
N-f-96		N-b-192		2BrBn	Me	H	H	5-1Idz	C		490 (M^+)
N-f-97		N-b-194		2BrBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		504 (M^+)
N-f-98		N-b-196		2BrBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		518 (M^+)
N-f-99		N-b-198		2CF3Bn	Me	H	H	2-Nap	C		490 (M^++1)
N-f-100		N-b-200		2CF3Bn	Me	H	H	5-Ind	C		479 (M^++1)
N-f-101		N-b-202		2CF3Bn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		493 (M^++1)
N-f-102		N-b-204		2CF3Bn	Me	H	H	5-1Idz	C		480 (M^++1)
N-f-103		N-b-206		2CF3Bn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		494 (M^++1)
N-f-104		N-b-208		2,3DFBn	H	H	H	2-Nap	C		444 (M^++1)
N-f-105		N-b-210		2,3DFBn	H	H	H	5-Ind	C		433 (M^++1)
N-f-106		N-b-212		2,3DFBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		447 (M^++1)
N-f-107		N-b-214		2,3DFBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		448 (M^++1)
N-f-108		N-b-216		2,3DFBn	Me	H	H	2-Nap	C		458 (M^++1)
N-f-109		N-b-218		2,3DFBn	Me	H	H	5-Ind	C		447 (M^++1)
N-f-110		N-b-220		2,3DFBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		461 (M^++1)
N-f-111		N-b-222		2,3DFBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		462 (M^++1)
N-f-112		N-b-224		4MeBn	H	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
N-f-113		N-b-226		4MeBn	H	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
N-f-114		N-b-228		4MeBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
N-f-115		N-b-230		4MeBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-f-116		N-b-232		4MeBn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-f-117		N-b-234		4MeBn	Me	H	H	2-Nap	C		436 (M^++1)
N-f-118		N-b-236		4MeBn	Me	H	H	5-Ind	C		425 (M^++1)
N-f-119		N-b-238		4MeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		439 (M^++1)
N-f-120		N-b-240		4MeBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-f-121		N-b-242		4MeBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-f-122		N-b-244		2PhBn	Me	H	H	2-Nap	C		498 (M^++1)
N-f-123		N-b-246		2PhBn	Me	H	H	5-Ind	C		487 (M^++1)
N-f-124		N-b-248		2PhBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		501 (M^++1)
N-f-125		N-b-250		2PhBn	Me	H	H	5-1Idz	C		488 (M^++1)
N-f-126		N-b-252		2PhBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		502 (M^++1)
N-f-127		N-b-254		2PhBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		516 (M^++1)
N-f-128		N-b-256		2PhBn	Et	H	H	2-Nap	C		512 (M^++1)
N-f-129		N-b-258		2PhBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		515 (M^++1)
N-f-130		N-b-260		2PhBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		516 (M^++1)
N-f-131		N-b-262		4OMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		452 (M^++1)
N-f-132		N-b-264		4OMeBn	Me	H	H	5-Ind	C		441 (M^++1)
N-f-133		N-b-266		4OMeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		455 (M^++1)
N-f-134		N-b-268		4OMeBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		469 (M^++1)
N-f-135		N-b-270		4OMeBn	Me	H	H	5-1Idz	C		442 (M^++1)
N-f-136		N-b-272		4OMeBn	Et	H	H	2-Nap	C		466 (M^++1)

[0437] [表162]

Table-N-F-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-f-137		N-b-274		4OMeBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		470 (M^++1)
N-f-138		N-b-276		2OMeBn	H	H	H	2-Nap	C		438 (M^++1)
N-f-139		N-b-278		2OMeBn	H	H	H	5-Ind	C		427 (M^++1)
N-f-140		N-b-280		2OMeBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		441 (M^++1)
N-f-141		N-b-282		2OMeBn	H	H	H	5-1Idz	C		428 (M^++1)
N-f-142		N-b-284		2OMeBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		442 (M^++1)
N-f-143		N-b-286		2OMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		452 (M^++1)
N-f-144		N-b-288		2OMeBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		456 (M^++1)
N-f-145		N-b-290		4DMABn	H	H	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
N-f-146		N-b-292		4DMABn	H	H	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
N-f-147		N-b-294		4DMABn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
N-f-148		N-b-296		4DMABn	H	H	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
N-f-149		N-b-298		4DMABn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
N-f-150		N-b-300		4DMABn	Me	H	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
N-f-151		N-b-302		4DMABn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
N-f-152		N-b-304		4DMABn	Me	H	H	5-1Idz	C		455 (M^++1)
N-f-153		N-b-306		4DMABn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
N-f-154		N-b-308		4SMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		468 (M^++1)
N-f-155		N-b-310		4SMeBn	Me	H	H	5-Ind	C		457 (M^++1)
N-f-156		N-b-312		4SMeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		471 (M^++1)
N-f-157		N-b-314		4SMeBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		485 (M^++1)
N-f-158		N-b-316		4SMeBn	Me	H	H	5-1Idz	C		458 (M^++1)
N-f-159		N-b-318		1NapMe	Me	H	H	2-Nap	C		472 (M^++1)
N-f-160		N-b-320		1NapMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		475 (M^++1)
N-f-161		N-b-322		1NapMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		476 (M^++1)
N-f-162		N-b-324		2NapMe	Me	H	H	2-Nap	C		472 (M^++1)
N-f-163		N-b-326		2NapMe	Me	H	H	5-Ind	C		461 (M^++1)
N-f-164		N-b-328		2NapMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		475 (M^++1)
N-f-165		N-b-330		2NapMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		489 (M^++1)
N-f-166		N-b-332		2NapMe	Me	H	H	5-1Idz	C		462 (M^++1)
N-f-167		N-b-334		2NapMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		476 (M^++1)
N-f-168		N-b-336		2FRMe	Me	H	H	2-Nap	C		412 (M^++1)
N-f-169		N-b-338		2FRMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		415 (M^++1)
N-f-170		N-b-340		2FRMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-f-171		N-b-342		2FRMe	Me	H	H	5-1Idz	C		402 (M^++1)
N-f-172		N-b-344		2FRMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		416 (M^++1)
N-f-173		N-b-346		2FRMe	Et	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-f-174		N-b-348		2FRMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-f-175		N-b-350		2FRMe	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-f-176		N-b-352		2FRMe	Et	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-f-177		N-b-354		2FRMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-f-178		N-b-356		3FRMe	Me	H	H	2-Nap	C		412 (M^++1)
N-f-179		N-b-358		3FRMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		415 (M^++1)
N-f-180		N-b-360		3FRMe	Me	H	H	5-1Idz	C		402 (M^++1)
N-f-181		N-b-362		3FRMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		416 (M^++1)
N-f-182		N-b-364		3FRMe	Et	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)

[0438] [表163]

Table-N-F-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-f-183		N-b-366		3FRMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-f-184		N-b-368		3FRMe	Et	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-f-185		N-b-370		3FRMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-f-186		N-b-372		3FRMe	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-f-187		N-b-374		2TPMe	Me	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-f-188		N-b-376		2TPMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-f-189		N-b-378		2TPMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-f-190		N-b-380		2TPMe	Me	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-f-191		N-b-382		2TPMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-f-192		N-b-384		2TPMe	Et	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-f-193		N-b-386		2TPMe	Et	H	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-f-194		N-b-388		2TPMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-f-195		N-b-390		2TPMe	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		459 (M^++1)
N-f-196		N-b-392		2TPMe	Et	H	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-f-197		N-b-394		2TPMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)

[0439] 実施例N－g－1

実施例化合物N－b－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物（化合物番号N－g－1；10．1mg）を得た。

上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる代表例をTable－N－G－1から、Table－N－G－5に示す。化合物の製造は、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。

[0440] [表164]

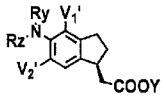


Table-N-G-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-g-1		N-b-2		Bn	H	H	H	2-Nap	C		408 (M^++1)
N-g-2		N-b-4		Bn	H	H	H	5-Ind	C		397 (M^++1)
N-g-3		N-b-6		Bn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		411 (M^++1)
N-g-4		N-b-8		Bn	H	H	H	5-1Idz	C		398 (M^++1)
N-g-5		N-b-10		Bn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		412 (M^++1)
N-g-6		N-b-12		Bn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-g-7		N-b-14		Bn	H	H	H	5-BF	C		398 (M^++1)
N-g-8		N-b-16		Bn	H	H	H	6-Qu	C		409 (M^++1)
N-g-9		N-b-18		Bn	Me	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
N-g-10		N-b-20		Bn	Me	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
N-g-11		N-b-22		Bn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
N-g-12		N-b-24		Bn	Me	H	H	5-1Idz	C		412 (M^++1)
N-g-13		N-b-26		Bn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-g-14		N-b-28		Bn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-g-15		N-b-30		Bn	Me	H	H	5-BF	C		412 (M^++1)
N-g-16		N-b-32		Bn	Et	H	H	2-Nap	C		436 (M^++1)
N-g-17		N-b-34		Bn	Et	H	H	5-Ind	C		425 (M^++1)
N-g-18		N-b-36		Bn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		439 (M^++1)
N-g-19		N-b-38		Bn	Et	H	H	5-1Idz	C		426 (M^++1)
N-g-20		N-b-40		Bn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-g-21		N-b-42		Bn	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-g-22		N-b-44		4FBn	Et	H	H	6-Qu	C		455 (M^++1)
N-g-23		N-b-46		4FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-g-24		N-b-48		4FBn	H	H	H	5-Ind	C		415 (M^++1)
N-g-25		N-b-50		4FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-g-26		N-b-52		4FBn	H	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-g-27		N-b-54		4FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-g-28		N-b-56		4FBn	Me	H	H	2-Nap	C		440 (M^++1)
N-g-29		N-b-58		4FBn	Me	H	H	5-Ind	C		429 (M^++1)
N-g-30		N-b-60		4FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-g-31		N-b-62		4FBn	Me	H	H	5-1Idz	C		430 (M^++1)
N-g-32		N-b-64		4FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-g-33		N-b-66		4FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-g-34		N-b-68		4FBn	Et	H	H	5-Ind	C		443 (M^++1)
N-g-35		N-b-70		4FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-g-36		N-b-72		4FBn	Et	H	H	5-1Idz	C		444 (M^++1)
N-g-37		N-b-74		4FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-g-38		N-b-76		2FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-g-39		N-b-78		2FBn	H	H	H	5-Ind	C		415 (M^++1)
N-g-40		N-b-80		2FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-g-41		N-b-82		2FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-g-42		N-b-84		2FBn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-g-43		N-b-86		2FBn	H	H	H	5-BF	C		416 (M^++1)
N-g-44		N-b-88		2FBn	Me	H	H	2-Nap	C		440 (M^++1)

[0441] [表165]

Table-N-G-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-g-45		N-b-90		2FBn	Me	H	H	5-Ind	C		429 (M^++1)
N-g-46		N-b-92		2FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-g-47		N-b-94		2FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-g-48		N-b-96		2FBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-g-49		N-b-98		2FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-g-50		N-b-100		2FBn	Et	H	H	5-1Ind	C		443 (M^++1)
N-g-51		N-b-102		2FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-g-52		N-b-104		2FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-g-53		N-b-106		2FBn	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		472 (M^++1)
N-g-54		N-b-108		3FBn	H	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-g-55		N-b-110		3FBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-g-56		N-b-112		3FBn	H	H	H	5-Idz	C		416 (M^++1)
N-g-57		N-b-114		3FBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-g-58		N-b-116		3FBn	Me	H	H	2-Nap	C		440 (M^++1)
N-g-59		N-b-118		3FBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-g-60		N-b-120		3FBn	Me	H	H	5-Idz	C		430 (M^++1)
N-g-61		N-b-122		3FBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-g-62		N-b-124		3FBn	Et	H	H	2-Nap	C		454 (M^++1)
N-g-63		N-b-126		3FBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		457 (M^++1)
N-g-64		N-b-128		3FBn	Et	H	H	5-Idz	C		444 (M^++1)
N-g-65		N-b-130		3FBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		458 (M^++1)
N-g-66		N-b-132		2ClBn	H	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-g-67		N-b-134		2ClBn	H	H	H	5-1Ind	C		431 (M^++1)
N-g-68		N-b-136		2ClBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-g-69		N-b-138		2ClBn	H	H	H	5-Idz	C		432 (M^++1)
N-g-70		N-b-140		2ClBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-g-71		N-b-142		2ClBn	Me	H	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
N-g-72		N-b-144		2ClBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
N-g-73		N-b-146		2ClBn	Me	H	H	5-Idz	C		446 (M^++1)
N-g-74		N-b-148		2ClBn	Et	H	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
N-g-75		N-b-150		2ClBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
N-g-76		N-b-152		2ClBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
N-g-77		N-b-154		4ClBn	H	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-g-78		N-b-156		4ClBn	H	H	H	5-1Ind	C		431 (M^++1)
N-g-79		N-b-158		4ClBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-g-80		N-b-160		4ClBn	H	H	H	5-Idz	C		432 (M^++1)
N-g-81		N-b-162		4ClBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)
N-g-82		N-b-164		4ClBn	Me	H	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
N-g-83		N-b-166		4ClBn	Me	H	H	5-1Ind	C		445 (M^++1)
N-g-84		N-b-168		4ClBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
N-g-85		N-b-170		4ClBn	Me	H	H	5-Idz	C		446 (M^++1)
N-g-86		N-b-172		4ClBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		460 (M^++1)
N-g-87		N-b-174		4ClBn	Et	H	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
N-g-88		N-b-176		4ClBn	Et	H	H	5-1Ind	C		460 (M^++1)
N-g-89		N-b-178		4ClBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
N-g-90		N-b-180		4ClBn	Et	H	H	5-Idz	C		460 (M^++1)

[0442] [表166]

Table-N-G-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-g-91		N-f-182		4ClBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
N-g-92		N-f-184		2BrBn	Me	H	H	2-Nap	C		500 (M^+)
N-g-93		N-f-186		2BrBn	Me	H	H	5-Ind	C		489 (M^+)
N-g-94		N-f-188		2BrBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		503 (M^+)
N-g-95		N-f-190		2BrBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		517 (M^+)
N-g-96		N-f-192		2BrBn	Me	H	H	5-1Idz	C		490 (M^+)
N-g-97		N-f-194		2BrBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		504 (M^+)
N-g-98		N-f-196		2BrBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		518 (M^+)
N-g-99		N-f-198		2CF3Bn	Me	H	H	2-Nap	C		490 (M^++1)
N-g-100		N-f-200		2CF3Bn	Me	H	H	5-Ind	C		479 (M^++1)
N-g-101		N-f-202		2CF3Bn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		493 (M^++1)
N-g-102		N-f-204		2CF3Bn	Me	H	H	5-1Idz	C		480 (M^++1)
N-g-103		N-f-206		2CF3Bn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		494 (M^++1)
N-g-104		N-f-208		2,3DFBn	H	H	H	2-Nap	C		444 (M^++1)
N-g-105		N-f-210		2,3DFBn	H	H	H	5-Ind	C		433 (M^++1)
N-g-106		N-f-212		2,3DFBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		447 (M^++1)
N-g-107		N-f-214		2,3DFBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		448 (M^++1)
N-g-108		N-f-216		2,3DFBn	Me	H	H	2-Nap	C		458 (M^++1)
N-g-109		N-f-218		2,3DFBn	Me	H	H	5-Ind	C		447 (M^++1)
N-g-110		N-f-220		2,3DFBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		461 (M^++1)
N-g-111		N-f-222		2,3DFBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		462 (M^++1)
N-g-112		N-f-224		4MeBn	H	H	H	2-Nap	C		422 (M^++1)
N-g-113		N-f-226		4MeBn	H	H	H	5-Ind	C		411 (M^++1)
N-g-114		N-f-228		4MeBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		425 (M^++1)
N-g-115		N-f-230		4MeBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		426 (M^++1)
N-g-116		N-f-232		4MeBn	H	H	H	1Et-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-g-117		N-f-234		4MeBn	Me	H	H	2-Nap	C		436 (M^++1)
N-g-118		N-f-236		4MeBn	Me	H	H	5-Ind	C		425 (M^++1)
N-g-119		N-f-238		4MeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		439 (M^++1)
N-g-120		N-f-240		4MeBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		440 (M^++1)
N-g-121		N-f-242		4MeBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		454 (M^++1)
N-g-122		N-f-244		2PhBn	Me	H	H	2-Nap	C		498 (M^++1)
N-g-123		N-f-246		2PhBn	Me	H	H	5-Ind	C		487 (M^++1)
N-g-124		N-f-248		2PhBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		501 (M^++1)
N-g-125		N-f-250		2PhBn	Me	H	H	5-1Idz	C		488 (M^++1)
N-g-126		N-f-252		2PhBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		502 (M^++1)
N-g-127		N-f-254		2PhBn	Me	H	H	1Et-5-Idz	C		516 (M^++1)
N-g-128		N-f-256		2PhBn	Et	H	H	2-Nap	C		512 (M^++1)
N-g-129		N-f-258		2PhBn	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		515 (M^++1)
N-g-130		N-f-260		2PhBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		516 (M^++1)
N-g-131		N-f-262		4OMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		452 (M^++1)
N-g-132		N-f-264		4OMeBn	Me	H	H	5-Ind	C		441 (M^++1)
N-g-133		N-f-266		4OMeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		455 (M^++1)
N-g-134		N-f-268		4OMeBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		469 (M^++1)
N-g-135		N-f-270		4OMeBn	Me	H	H	5-1Idz	C		442 (M^++1)
N-g-136		N-f-272		4OMeBn	Et	H	H	2-Nap	C		466 (M^++1)

[0443] [表167]

Table-N-G-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-g-137		N-b-274		4OMeBn	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		470 (M^++1)
N-g-138		N-b-276		2OMeBn	H	H	H	2-Nap	C		438 (M^++1)
N-g-139		N-b-278		2OMeBn	H	H	H	5-Ind	C		427 (M^++1)
N-g-140		N-b-280		2OMeBn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		441 (M^++1)
N-g-141		N-b-282		2OMeBn	H	H	H	5-1Idz	C		428 (M^++1)
N-g-142		N-b-284		2OMeBn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		442 (M^++1)
N-g-143		N-b-286		2OMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		452 (M^++1)
N-g-144		N-b-288		2OMeBn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		456 (M^++1)
N-g-145		N-b-290		4DMABn	H	H	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
N-g-146		N-b-292		4DMABn	H	H	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
N-g-147		N-b-294		4DMABn	H	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
N-g-148		N-b-296		4DMABn	H	H	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
N-g-149		N-b-298		4DMABn	H	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
N-g-150		N-b-300		4DMABn	Me	H	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
N-g-151		N-b-302		4DMABn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
N-g-152		N-b-304		4DMABn	Me	H	H	5-1Idz	C		455 (M^++1)
N-g-153		N-b-306		4DMABn	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
N-g-154		N-b-308		4SMeBn	Me	H	H	2-Nap	C		468 (M^++1)
N-g-155		N-b-310		4SMeBn	Me	H	H	5-Ind	C		457 (M^++1)
N-g-156		N-b-312		4SMeBn	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		471 (M^++1)
N-g-157		N-b-314		4SMeBn	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		485 (M^++1)
N-g-158		N-b-316		4SMeBn	Me	H	H	5-1Idz	C		458 (M^++1)
N-g-159		N-b-318		1NapMe	Me	H	H	2-Nap	C		472 (M^++1)
N-g-160		N-b-320		1NapMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		475 (M^++1)
N-g-161		N-b-322		1NapMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		476 (M^++1)
N-g-162		N-b-324		2NapMe	Me	H	H	2-Nap	C		472 (M^++1)
N-g-163		N-b-326		2NapMe	Me	H	H	5-Ind	C		461 (M^++1)
N-g-164		N-b-328		2NapMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		475 (M^++1)
N-g-165		N-b-330		2NapMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		489 (M^++1)
N-g-166		N-b-332		2NapMe	Me	H	H	5-1Idz	C		462 (M^++1)
N-g-167		N-b-334		2NapMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		476 (M^++1)
N-g-168		N-b-336		2FRMe	Me	H	H	2-Nap	C		412 (M^++1)
N-g-169		N-b-338		2FRMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		415 (M^++1)
N-g-170		N-b-340		2FRMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-g-171		N-b-342		2FRMe	Me	H	H	5-1Idz	C		402 (M^++1)
N-g-172		N-b-344		2FRMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		416 (M^++1)
N-g-173		N-b-346		2FRMe	Et	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)
N-g-174		N-b-348		2FRMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-g-175		N-b-350		2FRMe	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		443 (M^++1)
N-g-176		N-b-352		2FRMe	Et	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-g-177		N-b-354		2FRMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-g-178		N-b-356		3FRMe	Me	H	H	2-Nap	C		412 (M^++1)
N-g-179		N-b-358		3FRMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		415 (M^++1)
N-g-180		N-b-360		3FRMe	Me	H	H	5-1Idz	C		402 (M^++1)
N-g-181		N-b-362		3FRMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		416 (M^++1)
N-g-182		N-b-364		3FRMe	Et	H	H	2-Nap	C		426 (M^++1)

[0444] [表168]

Table-N-G-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-g-183		N-b-366		3FRMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		429 (M^++1)
N-g-184		N-b-368		3FRMe	Et	H	H	5-1Idz	C		416 (M^++1)
N-g-185		N-b-370		3FRMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		430 (M^++1)
N-g-186		N-b-372		3FRMe	Et	H	H	1Et-5-Idz	C		444 (M^++1)
N-g-187		N-b-374		2TPMe	Me	H	H	2-Nap	C		428 (M^++1)
N-g-188		N-b-376		2TPMe	Me	H	H	1Me-5-Ind	C		431 (M^++1)
N-g-189		N-b-378		2TPMe	Me	H	H	1Et-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-g-190		N-b-380		2TPMe	Me	H	H	5-1Idz	C		418 (M^++1)
N-g-191		N-b-382		2TPMe	Me	H	H	1Me-5-Idz	C		432 (M^++1)
N-g-192		N-b-384		2TPMe	Et	H	H	2-Nap	C		442 (M^++1)
N-g-193		N-b-386		2TPMe	Et	H	H	5-Ind	C		431 (M^++1)
N-g-194		N-b-388		2TPMe	Et	H	H	1Me-5-Ind	C		445 (M^++1)
N-g-195		N-b-390		2TPMe	Et	H	H	1Et-5-Ind	C		459 (M^++1)
N-g-196		N-b-392		2TPMe	Et	H	H	5-1Idz	C		432 (M^++1)
N-g-197		N-b-394		2TPMe	Et	H	H	1Me-5-Idz	C		446 (M^++1)

[0445] 実施例N－h－1

実施例化合物N－c－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物（化合物番号N－h－1；9．3mg）を得た。

上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる代表例をTable－N－H－1から、Table－N－H－4に示す。化合物の製造は、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。

[0446] [表169]

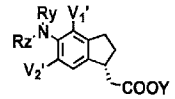
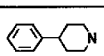
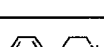
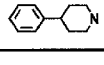
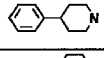
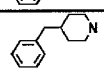


Table-N-H-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRyRz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-h-1		N-c-2			H	H	2-Nap	C		386 (M^++1)
N-h-2		N-c-4			H	H	5-Ind	C		375 (M^++1)
N-h-3		N-c-6			H	H	1Me-5-Ind	C		389 (M^++1)
N-h-4		N-c-8			H	H	1Et-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-h-5		N-c-10			H	H	1Me-4-Ind	C		389 (M^++1)
N-h-6		N-c-12			H	H	1Me-6-Ind	C		389 (M^++1)
N-h-7		N-c-14			H	H	5-1Idz	C		376 (M^++1)
N-h-8		N-c-16			H	H	1Me-5-Idz	C		390 (M^++1)
N-h-9		N-c-18			H	H	1Et-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-h-10		N-c-20			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-h-11		N-c-22			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-h-12		N-c-24			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-h-13		N-c-26			H	H	1Et-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-h-14		N-c-28			H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-h-15		N-c-30			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-h-16		N-c-32			H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-h-17		N-c-34			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-h-18		N-c-36			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-h-19		N-c-38			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-h-20		N-c-40			H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-h-21		N-c-42			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)

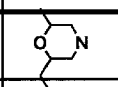
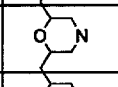
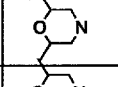
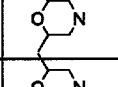
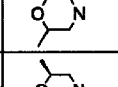
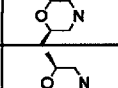
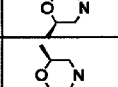
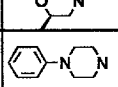
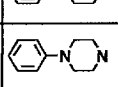
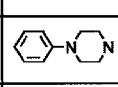
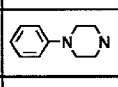
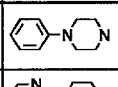
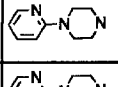
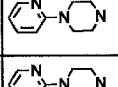
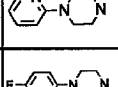
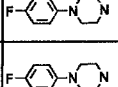
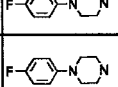
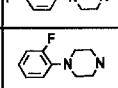
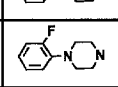
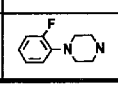
[0447] [表170]

Table-N-H-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-h-22		N-c-44			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-h-23		N-c-46			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-h-24		N-c-48			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-h-25		N-c-50			H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-h-26		N-c-52			H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-h-27		N-c-54			H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-h-28		N-c-56			H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-h-29		N-c-58			H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-h-30		N-c-60			H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-h-31		N-c-62			H	H	2-Nap	C		462 (M^++1)
N-h-32		N-c-64			H	H	5-Ind	C		451 (M^++1)
N-h-33		N-c-66			H	H	1Me-5-Ind	C		465 (M^++1)
N-h-34		N-c-68			H	H	5-1Idz	C		452 (M^++1)
N-h-35		N-c-70			H	H	1Me-5-Idz	C		466 (M^++1)
N-h-36		N-c-72			H	H	2-Nap	C		476 (M^++1)
N-h-37		N-c-74			H	H	5-Ind	C		465 (M^++1)
N-h-38		N-c-76			H	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
N-h-39		N-c-78			H	H	1Me-5-Idz	C		480 (M^++1)
N-h-40		N-c-80			H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-h-41		N-c-82			H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-h-42		N-c-84			H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-h-43		N-c-86			H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-h-44		N-c-88			H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)

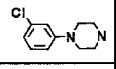
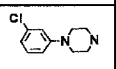
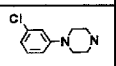
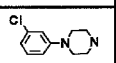
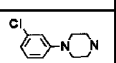
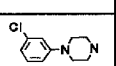
[0448] [表171]

Table-N-H-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-h-45		N-c-90			H	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-h-46		N-c-92			H	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-h-47		N-c-94			H	H	1Me-5-Ind	C		419 (M^++1)
N-h-48		N-c-96			H	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-h-49		N-c-98			H	H	1Me-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-h-50		N-c-100			H	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-h-51		N-c-102			H	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-h-52		N-c-104			H	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-h-53		N-c-106			H	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
N-h-54		N-c-108			H	H	5-Ind	C		452 (M^++1)
N-h-55		N-c-110			H	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
N-h-56		N-c-112			H	H	5-1Idz	C		453 (M^++1)
N-h-57		N-c-114			H	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
N-h-58		N-c-116			H	H	2-Nap	C		464 (M^++1)
N-h-59		N-c-118			H	H	1Me-5-Ind	C		467 (M^++1)
N-h-60		N-c-120			H	H	1Me-5-Idz	C		468 (M^++1)
N-h-61		N-c-122			H	H	2-Nap	C		481 (M^++1)
N-h-62		N-c-124			H	H	5-Ind	C		470 (M^++1)
N-h-63		N-c-126			H	H	5-1Idz	C		471 (M^++1)
N-h-64		N-c-128			H	H	2-Nap	C		481 (M^++1)
N-h-65		N-c-130			H	H	1Me-5-Ind	C		484 (M^++1)
N-h-66		N-c-132			H	H	1Me-5-Idz	C		485 (M^++1)

[0449] [表172]

Table-N-H-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-h-67		N-c-134			H	H	2-Nap	C		498 (M^++1)
N-h-68		N-c-136			H	H	5-Ind	C		487 (M^++1)
N-h-69		N-c-138			H	H	1Me-5-Ind	C		501 (M^++1)
N-h-70		N-c-140			H	H	1Me-4-Ind	C		501 (M^++1)
N-h-71		N-c-142			H	H	5-1Idz	C		488 (M^++1)
N-h-72		N-c-144			H	H	1Me-5-Idz	C		502 (M^++1)
N-h-73		N-c-146			H	H	2-Nap	C		372 (M^++1)
N-h-74		N-c-148			H	H	5-Ind	C		361 (M^++1)
N-h-75		N-c-150			H	H	1Me-5-Ind	C		375 (M^++1)
N-h-76		N-c-152			H	H	5-1Idz	C		362 (M^++1)
N-h-77		N-c-154			H	H	1Me-5-Idz	C		376 (M^++1)
N-h-78		N-c-156			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-h-79		N-c-158			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-h-80		N-c-160			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-h-81		N-c-162			H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-h-82		N-c-164			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)

[0450] 実施例N－i－1

実施例化合物N－c－2を用いキラル分取を行うことで、標記化合物（化合物番号N－h－1；9．0mg）を得た。

上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる代表例をTable－N－I－1から、Table－N－I－4に示す。化合物の製造は、HPLCにて分取をすることで目的物を得た。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。

[0451] [表173]

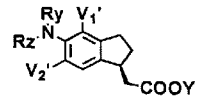
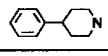
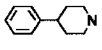
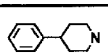
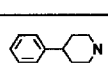
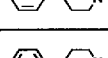
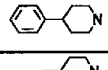
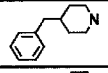
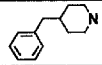
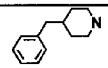


Table-N-I-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRyRz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-i-1		N-c-2			H	H	2-Nap	C		386 (M^++1)
N-i-2		N-c-4			H	H	5-Ind	C		375 (M^++1)
N-i-3		N-c-6			H	H	1Me-5-Ind	C		389 (M^++1)
N-i-4		N-c-8			H	H	1Et-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-i-5		N-c-10			H	H	1Me-4-Ind	C		389 (M^++1)
N-i-6		N-c-12			H	H	1Me-6-Ind	C		389 (M^++1)
N-i-7		N-c-14			H	H	5-1Idz	C		376 (M^++1)
N-i-8		N-c-16			H	H	1Me-5-Idz	C		390 (M^++1)
N-i-9		N-c-18			H	H	1Et-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-i-10		N-c-20			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-i-11		N-c-22			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-i-12		N-c-24			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-i-13		N-c-26			H	H	1Et-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-i-14		N-c-28			H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-i-15		N-c-30			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-i-16		N-c-32			H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-i-17		N-c-34			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-i-18		N-c-36			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-i-19		N-c-38			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-i-20		N-c-40			H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-i-21		N-c-42			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)

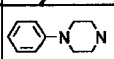
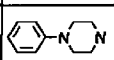
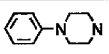
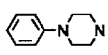
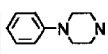
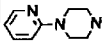
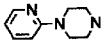
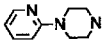
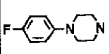
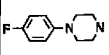
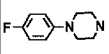
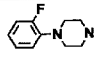
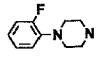
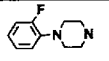
[0452] [表174]

Table-N-I-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-i-22		N-c-44			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-i-23		N-c-46			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-i-24		N-c-48			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)
N-i-25		N-c-50			H	H	1Et-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-i-26		N-c-52			H	H	2-Nap	C		414 (M^++1)
N-i-27		N-c-54			H	H	5-Ind	C		403 (M^++1)
N-i-28		N-c-56			H	H	1Me-5-Ind	C		417 (M^++1)
N-i-29		N-c-58			H	H	5-1Idz	C		404 (M^++1)
N-i-30		N-c-60			H	H	1Me-5-Idz	C		418 (M^++1)
N-i-31		N-c-62			H	H	2-Nap	C		462 (M^++1)
N-i-32		N-c-64			H	H	5-Ind	C		451 (M^++1)
N-i-33		N-c-66			H	H	1Me-5-Ind	C		465 (M^++1)
N-i-34		N-c-68			H	H	5-1Idz	C		452 (M^++1)
N-i-35		N-c-70			H	H	1Me-5-Idz	C		466 (M^++1)
N-i-36		N-c-72			H	H	2-Nap	C		476 (M^++1)
N-i-37		N-c-74			H	H	5-Ind	C		465 (M^++1)
N-i-38		N-c-76			H	H	1Me-5-Ind	C		479 (M^++1)
N-i-39		N-c-78			H	H	1Me-5-Idz	C		480 (M^++1)
N-i-40		N-c-80			H	H	2-Nap	C		388 (M^++1)
N-i-41		N-c-82			H	H	5-Ind	C		377 (M^++1)
N-i-42		N-c-84			H	H	1Me-5-Ind	C		391 (M^++1)
N-i-43		N-c-86			H	H	5-1Idz	C		378 (M^++1)
N-i-44		N-c-88			H	H	1Me-5-Idz	C		392 (M^++1)

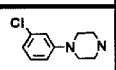
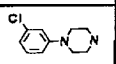
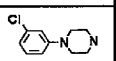
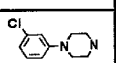
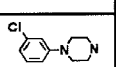
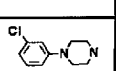
[0453] [表175]

Table-N-I-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-i-45		N-c-90			H	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-i-46		N-c-92			H	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-i-47		N-c-94			H	H	1Me-5-Ind	C		419 (M^++1)
N-i-48		N-c-96			H	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-i-49		N-c-98			H	H	1Me-5-Idz	C		420 (M^++1)
N-i-50		N-c-100			H	H	2-Nap	C		416 (M^++1)
N-i-51		N-c-102			H	H	5-Ind	C		405 (M^++1)
N-i-52		N-c-104			H	H	5-1Idz	C		406 (M^++1)
N-i-53		N-c-106			H	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
N-i-54		N-c-108			H	H	5-Ind	C		452 (M^++1)
N-i-55		N-c-110			H	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
N-i-56		N-c-112			H	H	5-1Idz	C		453 (M^++1)
N-i-57		N-c-114			H	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
N-i-58		N-c-116			H	H	2-Nap	C		464 (M^++1)
N-i-59		N-c-118			H	H	1Me-5-Ind	C		467 (M^++1)
N-i-60		N-c-120			H	H	1Me-5-Idz	C		468 (M^++1)
N-i-61		N-c-122			H	H	2-Nap	C		481 (M^++1)
N-i-62		N-c-124			H	H	5-Ind	C		470 (M^++1)
N-i-63		N-c-126			H	H	5-1Idz	C		471 (M^++1)
N-i-64		N-c-128			H	H	2-Nap	C		481 (M^++1)
N-i-65		N-c-130			H	H	1Me-5-Ind	C		484 (M^++1)
N-i-66		N-c-132			H	H	1Me-5-Idz	C		485 (M^++1)

[0454] [表176]

Table-N-I-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	Z	AR	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-i-67		N-c-134			H	H	2-Nap	C		498 (M^++1)
N-i-68		N-c-136			H	H	5-Ind	C		487 (M^++1)
N-i-69		N-c-138			H	H	1Me-5-Ind	C		501 (M^++1)
N-i-70		N-c-140			H	H	1Me-4-Ind	C		501 (M^++1)
N-i-71		N-c-142			H	H	5-1Idz	C		488 (M^++1)
N-i-72		N-c-144			H	H	1Me-5-Idz	C		502 (M^++1)
N-i-73		N-c-146			H	H	2-Nap	C		372 (M^++1)
N-i-74		N-c-148			H	H	5-Ind	C		361 (M^++1)
N-i-75		N-c-150			H	H	1Me-5-Ind	C		375 (M^++1)
N-i-76		N-c-152			H	H	5-1Idz	C		362 (M^++1)
N-i-77		N-c-154			H	H	1Me-5-Idz	C		376 (M^++1)
N-i-78		N-c-156			H	H	2-Nap	C		400 (M^++1)
N-i-79		N-c-158			H	H	5-Ind	C		389 (M^++1)
N-i-80		N-c-160			H	H	1Me-5-Ind	C		403 (M^++1)
N-i-81		N-c-162			H	H	5-1Idz	C		390 (M^++1)
N-i-82		N-c-164			H	H	1Me-5-Idz	C		404 (M^++1)

[0455] 参考例17

4－ブロモ－5－ベンジルメチルアミノ－2，3－ジヒドロインデン－1－オン（中間体n－d－1）の合成（製造法13工程h）

参考例1の中間体A－4の合成法（製造法8工程h）に記載の手順に従って、中間体n－a－1（514．9mg）およびNBS（387．5mg、WAKO）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体n－d－1；538．9mg）を得た（但し反応は室温にて1時間行った）。Mass（LCMS）：320（M^+＋1）、保持時間；5．48分（溶出条件：B）。

5－ベンジルメチルアミノ－4－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－オン（中間体n－d－2）の合成（製造法11工程e－1）

実施例化合物A－a－1の合成法（製造法4工程e－1）に記載の手順に従って中間体n－d－1（538．9mg）、2－ナフタレンボロン酸（465．4mg、TCI）、2M炭酸ナトリウム水溶液（1．5ml）および$(Ph_3P)_4Pd$（211．2mg、ナカライテスク社製）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体n－d－2；507．4mg）を得た（但し反応は12時間行った）。Mass（LCMS）：364（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

[0456] 5－メチルアミノ－4－（ナフタレン－2－イル）－2，3－ジヒドロインデン－1－オン（中間体n－d－3）の合成

実施例A－a－107の中間体A－22の合成法に記載の手順に従って、中間体n－d－2（310．4mg）、10％パラジウム炭素（37．5mg、Merck社製）を反応、処理させることで標記化合物（中間体n－d－3；251．2mg）を得た。Mass（LCMS）：274（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．N－d－1、Table－Int．N－d－2に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「BRA（番号）」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、記号「CHO（番号）」で示すホルミル試薬はTable－CHOに示す。また、「Syn」の欄が空欄のものは水素、Pd／Cを用いた還元反応をしたことを示す。

[0457] [表177]

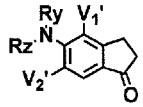


Table-Int.N-d-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.n-d-4	14n-2	Int.n-d-3	CHO3	nPr	Me	2-Nap	H	C		330 (M^++1)
Int.n-d-5	14n-2	Int.n-d-3	CHO4	iPr	Me	2-Nap	H	C		330 (M^++1)
Int.n-d-6	14n-2	Int.n-d-3	CHO5	nBu	Me	2-Nap	H	C		344 (M^++1)
Int.n-d-7	14n-2	Int.n-d-3	CHO6	iBu	Me	2-Nap	H	C		344 (M^++1)
Int.n-d-8	14n-2	Int.n-d-3	CHO7	cPen	Me	2-Nap	H	C		356 (M^++1)
Int.n-d-9	14n-2	Int.n-d-3	CHO8	cHex	Me	2-Nap	H	C		370 (M^++1)
Int.n-d-10	11e-1	Int.n-a-1	BRA2	Bn	Me	5-Ind	H	C		367 (M^++1)
Int.n-d-11		Int.n-d-10		H	Me	5-Ind	H	C		277 (M^++1)
Int.n-d-12	14n-2	Int.n-d-11	CHO3	nPr	Me	5-Ind	H	C		319 (M^++1)
Int.n-d-13	14n-2	Int.n-d-11	CHO4	iPr	Me	5-Ind	H	C		319 (M^++1)
Int.n-d-14	14n-2	Int.n-d-11	CHO5	nBu	Me	5-Ind	H	C		333 (M^++1)
Int.n-d-15	14n-2	Int.n-d-11	CHO6	iBu	Me	5-Ind	H	C		333 (M^++1)
Int.n-d-16	14n-2	Int.n-d-11	CHO7	cPen	Me	5-Ind	H	C		345 (M^++1)
Int.n-d-17	14n-2	Int.n-d-11	CHO8	cHex	Me	5-Ind	H	C		359 (M^++1)
Int.n-d-18	11e-1	Int.n-a-1	BRA3	Bn	Me	1Me-5-Ind	H	C		381 (M^++1)
Int.n-d-19		Int.n-d-18		H	Me	1Me-5-Ind	H	C		291 (M^++1)
Int.n-d-20	14n-2	Int.n-d-19	CHO3	nPr	Me	1Me-5-Ind	H	C		333 (M^++1)
Int.n-d-21	14n-2	Int.n-d-19	CHO6	iBu	Me	1Me-5-Ind	H	C		347 (M^++1)
Int.n-d-22	14n-2	Int.n-d-19	CHO7	cPen	Me	1Me-5-Ind	H	C		359 (M^++1)
Int.n-d-23	14n-2	Int.n-d-19	CHO8	cHex	Me	1Me-5-Ind	H	C		373 (M^++1)
Int.n-d-24	11e-1	Int.n-a-1	BRA4	Bn	Me	1Et-5-Ind	H	C		395 (M^++1)
Int.n-d-25		Int.n-d-24		H	Me	1Et-5-Ind	H	C		305 (M^++1)
Int.n-d-26	14n-2	Int.n-d-25	CHO4	iPr	Me	1Et-5-Ind	H	C		347 (M^++1)
Int.n-d-27	14n-2	Int.n-d-25	CHO5	nBu	Me	1Et-5-Ind	H	C		361 (M^++1)
Int.n-d-28	14n-2	Int.n-d-25	CHO6	iBu	Me	1Et-5-Ind	H	C		361 (M^++1)
Int.n-d-29	14n-2	Int.n-d-25	CHO7	cPen	Me	1Et-5-Ind	H	C		373 (M^++1)
Int.n-d-30	11e-1	Int.n-a-1	BRA8	Bn	Me	1Me-5-Idz	H	C		382 (M^++1)
Int.n-d-31		Int.n-d-30		H	Me	1Me-5-Idz	H	C		292 (M^++1)
Int.n-d-32	14n-2	Int.n-d-31	CHO3	nPr	Me	1Me-5-Idz	H	C		334 (M^++1)
Int.n-d-33	14n-2	Int.n-d-31	CHO4	iPr	Me	1Me-5-Idz	H	C		334 (M^++1)
Int.n-d-34	14n-2	Int.n-d-31	CHO5	nBu	Me	1Me-5-Idz	H	C		348 (M^++1)
Int.n-d-35	14n-2	Int.n-d-31	CHO6	iBu	Me	1Me-5-Idz	H	C		348 (M^++1)
Int.n-d-36	14n-2	Int.n-d-31	CHO7	cPen	Me	1Me-5-Idz	H	C		360 (M^++1)
Int.n-d-37	14n-2	Int.n-d-31	CHO8	cHex	Me	1Me-5-Idz	H	C		374 (M^++1)
Int.n-d-38	11e-1	Int.n-a-1	BRA9	Bn	Me	1Et-5-Idz	H	C		396 (M^++1)
Int.n-d-39		Int.n-d-38		H	Me	1Et-5-Idz	H	C		306 (M^++1)
Int.n-d-40	14n-2	Int.n-d-39	CHO3	nPr	Me	1Et-5-Idz	H	C		348 (M^++1)
Int.n-d-41	14n-2	Int.n-d-39	CHO4	iPr	Me	1Et-5-Idz	H	C		348 (M^++1)
Int.n-d-42	14n-2	Int.n-d-39	CHO8	cHex	Me	1Et-5-Idz	H	C		388 (M^++1)
Int.n-d-43	11e-1	Int.n-a-2	BRA1	Bn	Et	2-Nap	H	C		392 (M^++1)
Int.n-d-44		Int.n-d-43		H	Et	2-Nap	H	C		302 (M^++1)
Int.n-d-45	14n-2	Int.n-d-44	CHO3	nPr	Et	2-Nap	H	C		344 (M^++1)
Int.n-d-46	14n-2	Int.n-d-44	CHO4	iPr	Et	2-Nap	H	C		344 (M^++1)
Int.n-d-47	14n-2	Int.n-d-44	CHO5	nBu	Et	2-Nap	H	C		358 (M^++1)
Int.n-d-48	14n-2	Int.n-d-44	CHO6	iBu	Et	2-Nap	H	C		358 (M^++1)

[0458] [表178]

Table-Int.N-d-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.n-d-49	14n-2	Int.n-d-44	CHO7	cPen	Et	2-Nap	H	C		370 (M^++1)
Int.n-d-50	14n-2	Int.n-d-44	CHO8	cHex	Et	2-Nap	H	C		384 (M^++1)
Int.n-d-51	11e-1	Int.n-a-2	BRA2	Bn	Et	5-Ind	H	C		381 (M^++1)
Int.n-d-52		Int.n-d-51		H	Et	5-Ind	H	C		291 (M^++1)
Int.n-d-53	14n-2	Int.n-d-52	CHO3	nPr	Et	5-Ind	H	C		333 (M^++1)
Int.n-d-54	14n-2	Int.n-d-52	CHO4	iPr	Et	5-Ind	H	C		333 (M^++1)
Int.n-d-55	14n-2	Int.n-d-52	CHO5	nBu	Et	5-Ind	H	C		347 (M^++1)
Int.n-d-56	14n-2	Int.n-d-52	CHO6	iBu	Et	5-Ind	H	C		347 (M^++1)
Int.n-d-57	14n-2	Int.n-d-52	CHO7	cPen	Et	5-Ind	H	C		359 (M^++1)
Int.n-d-58	11e-1	Int.n-a-2	BRA3	Bn	Et	1Me-5-Ind	H	C		395 (M^++1)
Int.n-d-59		Int.n-d-58		H	Et	1Me-5-Ind	H	C		305 (M^++1)
Int.n-d-60	14n-2	Int.n-d-59	CHO3	nPr	Et	1Me-5-Ind	H	C		347 (M^++1)
Int.n-d-61	14n-2	Int.n-d-59	CHO4	iPr	Et	1Me-5-Ind	H	C		347 (M^++1)
Int.n-d-62	14n-2	Int.n-d-59	CHO5	nBu	Et	1Me-5-Ind	H	C		361 (M^++1)
Int.n-d-63	14n-2	Int.n-d-59	CHO6	iBu	Et	1Me-5-Ind	H	C		361 (M^++1)
Int.n-d-64	14n-2	Int.n-d-59	CHO7	cPen	Et	1Me-5-Ind	H	C		373 (M^++1)
Int.n-d-65	14n-2	Int.n-d-59	CHO8	cHex	Et	1Me-5-Ind	H	C		387 (M^++1)
Int.n-d-66	11e-1	Int.n-a-2	BRA4	Bn	Et	1Et-5-Ind	H	C		409 (M^++1)
Int.n-d-67		Int.n-d-66		H	Et	1Et-5-Ind	H	C		319 (M^++1)
Int.n-d-68	14n-2	Int.n-d-67	CHO4	iPr	Et	1Et-5-Ind	H	C		361 (M^++1)
Int.n-d-69	14n-2	Int.n-d-67	CHO5	nBu	Et	1Et-5-Ind	H	C		375 (M^++1)
Int.n-d-70	14n-2	Int.n-d-67	CHO7	cPen	Et	1Et-5-Ind	H	C		387 (M^++1)
Int.n-d-71	11e-1	Int.n-a-2	BRA8	Bn	Et	1Me-5-Idz	H	C		396 (M^++1)
Int.n-d-72		Int.n-d-71		H	Et	1Me-5-Idz	H	C		306 (M^++1)
Int.n-d-73	14n-2	Int.n-d-72	CHO3	nPr	Et	1Me-5-Idz	H	C		348 (M^++1)
Int.n-d-74	14n-2	Int.n-d-72	CHO4	iPr	Et	1Me-5-Idz	H	C		348 (M^++1)
Int.n-d-75	14n-2	Int.n-d-72	CHO5	nBu	Et	1Me-5-Idz	H	C		362 (M^++1)
Int.n-d-76	14n-2	Int.n-d-72	CHO6	iBu	Et	1Me-5-Idz	H	C		362 (M^++1)
Int.n-d-77	14n-2	Int.n-d-72	CHO7	cPen	Et	1Me-5-Idz	H	C		374 (M^++1)
Int.n-d-78	14n-2	Int.n-d-72	CHO8	cHex	Et	1Me-5-Idz	H	C		388 (M^++1)
Int.n-d-79	11e-1	Int.n-a-2	BRA9	Bn	Et	1Et-5-Idz	H	C		410 (M^++1)
Int.n-d-80		Int.n-d-79		H	Et	1Et-5-Idz	H	C		320 (M^++1)
Int.n-d-81	14n-2	Int.n-d-80	CHO3	nPr	Et	1Et-5-Idz	H	C		362 (M^++1)
Int.n-d-82	14n-2	Int.n-d-80	CHO4	iPr	Et	1Et-5-Idz	H	C		362 (M^++1)
Int.n-d-83	14n-2	Int.n-d-80	CHO5	nBu	Et	1Et-5-Idz	H	C		376 (M^++1)

[0459] 実施例N－j－1

2－[5－ベンジルメチルアミノ－4－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸エチル(化合物番号N－j－1)の合成(製造法10工程k)

参考例1の中間体A－2の合成法(製造法9工程k－1)に記載の手順に従って、中間体n－d－2(247．3mg)、ジエチルホスホノ酢酸エチル(1ml、TCI)、水素化ナトリウム(159．4mg、WAKO)を反応、処理させることで標記化合物(化合物番号N－j－1;176．4mg)を得た。

実施例N－j－2

2－[5－ベンジルメチルアミノ－4－(ナフタレン－2－イル)－2，3－ジヒドロインデン－1－イリデン]酢酸(化合物番号N－j－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物N－j－1(56．4mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0．30ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号N－j－2;21．3mg)を得た(但し反応は1時間行った)。

上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－N－J－1からTable－N－J－3に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。化合物の製造は、表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。

[0460] [表179]

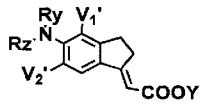


Table-N-J-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-j-1	10k-1	Int.n-d-2		Bn	Me	Et	2-Nap	H	C		448 (M^++1)
N-j-2	1-a	N-j-1		Bn	Me	H	2-Nap	H	C		420 (M^++1)
N-j-3	10k-1	Int.n-d-4		nPr	Me	Et	2-Nap	H	C		400 (M^++1)
N-j-4	1-a	N-j-3		nPr	Me	H	2-Nap	H	C		372 (M^++1)
N-j-5	10k-1	Int.n-d-5		iPr	Me	Et	2-Nap	H	C		400 (M^++1)
N-j-6	1-a	N-j-5		iPr	Me	H	2-Nap	H	C		372 (M^++1)
N-j-7	10k-1	Int.n-d-6		nBu	Me	Et	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-j-8	1-a	N-j-7		nBu	Me	H	2-Nap	H	C		386 (M^++1)
N-j-9	10k-1	Int.n-d-7		iBu	Me	Et	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-j-10	1-a	N-j-9		iBu	Me	H	2-Nap	H	C		386 (M^++1)
N-j-11	10k-1	Int.n-d-8		cPen	Me	Et	2-Nap	H	C		426 (M^++1)
N-j-12	1-a	N-j-11		cPen	Me	H	2-Nap	H	C		398 (M^++1)
N-j-13	10k-1	Int.n-d-9		cHex	Me	Et	2-Nap	H	C		440 (M^++1)
N-j-14	1-a	N-j-13		cHex	Me	H	2-Nap	H	C		412 (M^++1)
N-j-15	10k-1	Int.n-d-10		Bn	Me	Et	5-Ind	H	C		437 (M^++1)
N-j-16	1-a	N-j-15		Bn	Me	H	5-Ind	H	C		409 (M^++1)
N-j-17	10k-1	Int.n-d-12		nPr	Me	Et	5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-j-18	1-a	N-j-17		nPr	Me	H	5-Ind	H	C		361 (M^++1)
N-j-19	10k-1	Int.n-d-13		iPr	Me	Et	5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-j-20	1-a	N-j-19		iPr	Me	H	5-Ind	H	C		361 (M^++1)
N-j-21	10k-1	Int.n-d-14		nBu	Me	Et	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-22	1-a	N-j-21		nBu	Me	H	5-Ind	H	C		375 (M^++1)
N-j-23	10k-1	Int.n-d-15		iBu	Me	Et	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-24	1-a	N-j-23		iBu	Me	H	5-Ind	H	C		375 (M^++1)
N-j-25	10k-1	Int.n-d-16		cPen	Me	Et	5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-j-26	1-a	N-j-25		cPen	Me	H	5-Ind	H	C		387 (M^++1)
N-j-27	10k-1	Int.n-d-17		cHex	Me	Et	5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-j-28	1-a	N-j-27		cHex	Me	H	5-Ind	H	C		401 (M^++1)
N-j-29	10k-1	Int.n-d-18		Bn	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		451 (M^++1)
N-j-30	1-a	N-j-29		Bn	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		423 (M^++1)
N-j-31	10k-1	Int.n-d-20		nPr	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-32	1-a	N-j-31		nPr	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		375 (M^++1)
N-j-33	10k-1	Int.n-d-21		iBu	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-j-34	1-a	N-j-33		iBu	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-j-35	10k-1	Int.n-d-22		cPen	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-j-36	1-a	N-j-35		cPen	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		401 (M^++1)
N-j-37	10k-1	Int.n-d-23		cHex	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		443 (M^++1)
N-j-38	1-a	N-j-37		cHex	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-j-39	10k-1	Int.n-d-24		Bn	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		465 (M^++1)
N-j-40	1-a	N-j-39		Bn	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		437 (M^++1)
N-j-41	10k-1	Int.n-d-26		iPr	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-j-42	1-a	N-j-41		iPr	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-j-43	10k-1	Int.n-d-27		nBu	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-j-44	1-a	N-j-43		nBu	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		403 (M^++1)

[0461] [表180]

Table-N-J-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-j-45	10k-1	Int.n-d-28		iBu	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-j-46	1-a	N-j-45		iBu	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-47	10k-1	Int.n-d-29		cPen	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		443 (M^++1)
N-j-48	1-a	N-j-47		cPen	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-j-49	10k-1	Int.n-d-30		Bn	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		452 (M^++1)
N-j-50	1-a	N-j-49		Bn	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		424 (M^++1)
N-j-51	10k-1	Int.n-d-32		nPr	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-j-52	1-a	N-j-51		nPr	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		376 (M^++1)
N-j-53	10k-1	Int.n-d-33		iPr	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-j-54	1-a	N-j-53		iPr	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		376 (M^++1)
N-j-55	10k-1	Int.n-d-34		nBu	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-j-56	1-a	N-j-55		nBu	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		390 (M^++1)
N-j-57	10k-1	Int.n-d-35		iBu	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-j-58	1-a	N-j-57		iBu	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		390 (M^++1)
N-j-59	10k-1	Int.n-d-36		cPen	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
N-j-60	1-a	N-j-59		cPen	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		402 (M^++1)
N-j-61	10k-1	Int.n-d-37		cHex	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		444 (M^++1)
N-j-62	1-a	N-j-61		cHex	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		416 (M^++1)
N-j-63	10k-1	Int.n-d-38		Bn	Me	Et	1Et-5-Idz	H	C		466 (M^++1)
N-j-64	1-a	N-j-63		Bn	Me	H	1Et-5-Idz	H	C		438 (M^++1)
N-j-65	10k-1	Int.n-d-40		nPr	Me	Et	1Et-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-j-66	1-a	N-j-65		nPr	Me	H	1Et-5-Idz	H	C		390 (M^++1)
N-j-67	10k-1	Int.n-d-41		iPr	Me	Et	1Et-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-j-68	1-a	N-j-67		iPr	Me	H	1Et-5-Idz	H	C		390 (M^++1)
N-j-69	10k-1	Int.n-d-42		cHex	Me	Et	1Et-5-Idz	H	C		458 (M^++1)
N-j-70	1-a	N-j-69		cHex	Me	H	1Et-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
N-j-71	10k-1	Int.n-d-43		Bn	Et	Et	2-Nap	H	C		462 (M^++1)
N-j-72	1-a	N-j-71		Bn	Et	H	2-Nap	H	C		434 (M^++1)
N-j-73	10k-1	Int.n-d-45		nPr	Et	Et	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-j-74	1-a	N-j-73		nPr	Et	H	2-Nap	H	C		386 (M^++1)
N-j-75	10k-1	Int.n-d-46		iPr	Et	Et	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-j-76	1-a	N-j-75		iPr	Et	H	2-Nap	H	C		386 (M^++1)
N-j-77	10k-1	Int.n-d-47		nBu	Et	Et	2-Nap	H	C		428 (M^++1)
N-j-78	1-a	N-j-77		nBu	Et	H	2-Nap	H	C		400 (M^++1)
N-j-79	10k-1	Int.n-d-48		iBu	Et	Et	2-Nap	H	C		428 (M^++1)
N-j-80	1-a	N-j-79		iBu	Et	H	2-Nap	H	C		400 (M^++1)
N-j-81	10k-1	Int.n-d-49		cPen	Et	Et	2-Nap	H	C		440 (M^++1)
N-j-82	1-a	N-j-81		cPen	Et	H	2-Nap	H	C		412 (M^++1)
N-j-83	10k-1	Int.n-d-50		cHex	Et	Et	2-Nap	H	C		454 (M^++1)
N-j-84	1-a	N-j-83		cHex	Et	H	2-Nap	H	C		426 (M^++1)
N-j-85	10k-1	Int.n-d-51		Bn	Et	Et	5-Ind	H	C		451 (M^++1)
N-j-86	1-a	N-j-85		Bn	Et	H	5-Ind	H	C		423 (M^++1)
N-j-87	10k-1	Int.n-d-53		nPr	Et	Et	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-88	1-a	N-j-87		nPr	Et	H	5-Ind	H	C		375 (M^++1)
N-j-89	10k-1	Int.n-d-54		iPr	Et	Et	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-90	1-a	N-j-89		iPr	Et	H	5-Ind	H	C		375 (M^++1)
N-j-91	10k-1	Int.n-d-55		nBu	Et	Et	5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-j-92	1-a	N-j-91		nBu	Et	H	5-Ind	H	C		389 (M^++1)

[0462] [表181]

Table-N-J-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-j-93	10k-1	Int.n-d-56		iBu	Et	Et	5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-j-94	1-a	N-j-93		iBu	Et	H	5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-j-95	10k-1	Int.n-d-57		cPen	Et	Et	5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-j-96	1-a	N-j-95		cPen	Et	H	5-Ind	H	C		401 (M^++1)
N-j-97	10k-1	Int.n-d-58		Bn	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		465 (M^++1)
N-j-98	1-a	N-j-97		Bn	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		437 (M^++1)
N-j-99	10k-1	Int.n-d-60		nPr	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-j-100	1-a	N-j-99		nPr	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-j-101	10k-1	Int.n-d-61		iPr	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-j-102	1-a	N-j-101		iPr	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-j-103	10k-1	Int.n-d-62		nBu	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-j-104	1-a	N-j-103		nBu	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-105	10k-1	Int.n-d-63		iBu	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-j-106	1-a	N-j-105		iBu	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-107	10k-1	Int.n-d-64		cPen	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		443 (M^++1)
N-j-108	1-a	N-j-107		cPen	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-j-109	10k-1	Int.n-d-65		cHex	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		457 (M^++1)
N-j-110	1-a	N-j-109		cHex	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-j-111	10k-1	Int.n-d-66		Bn	Et	Et	1Et-5-Ind	H	C		479 (M^++1)
N-j-112	1-a	N-j-111		Bn	Et	H	1Et-5-Ind	H	C		451 (M^++1)
N-j-113	10k-1	Int.n-d-68		iPr	Et	Et	1Et-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-j-114	1-a	N-j-113		iPr	Et	H	1Et-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-j-115	10k-1	Int.n-d-69		nBu	Et	Et	1Et-5-Ind	H	C		445 (M^++1)
N-j-116	1-a	N-j-115		nBu	Et	H	1Et-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-j-117	10k-1	Int.n-d-70		cPen	Et	Et	1Et-5-Ind	H	C		457 (M^++1)
N-j-118	1-a	N-j-117		cPen	Et	H	1Et-5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-j-119	10k-1	Int.n-d-71		Bn	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		466 (M^++1)
N-j-120	1-a	N-j-119		Bn	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		438 (M^++1)
N-j-121	10k-1	Int.n-d-73		nPr	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-j-122	1-a	N-j-121		nPr	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		390 (M^++1)
N-j-123	10k-1	Int.n-d-74		iPr	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-j-124	1-a	N-j-123		iPr	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		390 (M^++1)
N-j-125	10k-1	Int.n-d-75		nBu	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-j-126	1-a	N-j-125		nBu	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-j-127	10k-1	Int.n-d-76		iBu	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-j-128	1-a	N-j-127		iBu	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-j-129	10k-1	Int.n-d-77		cPen	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		444 (M^++1)
N-j-130	1-a	N-j-129		cPen	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		416 (M^++1)
N-j-131	10k-1	Int.n-d-78		cHex	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		458 (M^++1)
N-j-132	1-a	N-j-131		cHex	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
N-j-133	10k-1	Int.n-d-79		Bn	Et	Et	1Et-5-Idz	H	C		480 (M^++1)
N-j-134	1-a	N-j-133		Bn	Et	H	1Et-5-Idz	H	C		452 (M^++1)
N-j-135	10k-1	Int.n-d-81		nPr	Et	Et	1Et-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-j-136	1-a	N-j-135		nPr	Et	H	1Et-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-j-137	10k-1	Int.n-d-82		iPr	Et	Et	1Et-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-j-138	1-a	N-j-135		iPr	Et	H	1Et-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-j-139	10k-1	Int.n-d-83		nBu	Et	Et	1Et-5-Idz	H	C		446 (M^++1)
N-j-140	1-a	N-j-135		nBu	Et	H	1Et-5-Idz	H	C		418 (M^++1)

[0463] 参考例18

4－ブロモ－5－(ピペリジン－1－イル)－2, 3－ジヒドロインデン－1－オン(中間体

n－e－1)の合成(製造法13工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って、中間体n－a－3(986．4mg)およびNBS(781．3mg、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体n－e－1;1．183g)を得た(但し反応は室温にて3時間行った)。Mass(LCMS):294(M^+)、保持時間;N．D(溶出条件:C)。

4－(ナフタレン－2－イル)－5－(ピペリジン－1－イル)－2，3－ジヒドロインデン－1－オン(中間体n－e－2)の合成(製造法11工程e－1)

実施例化合物A－a－1の合成法(製造法4工程e－1)に記載の手順に従って、中間体n－e－1(198．3mg)、2－ナフタレンボロン酸(267．3mg、TCI)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0．8ml)および$(Ph_3P)_4Pd$(109．2mg、ナカライテスク社製)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体n－e－2;201．1mg)を得た(但し反応は16時間行った)。Mass(LCMS):342(M^+＋1)、保持時間;N．D(溶出条件:C)。

[0464] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．N－e－1からTable－Int．N－e－4に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに示す。

[0465] [表182]

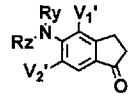
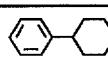
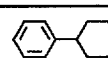
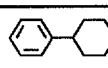
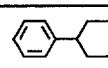
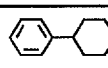
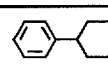
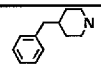
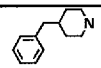
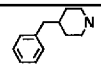
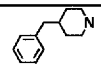
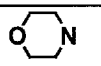
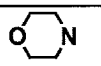
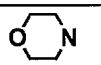
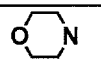
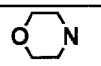
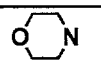
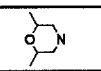


Table-Int.N-e-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	RyRz	V_1'	V_2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.n-e-3	11e-1	Int.n-e-1	BRA2		5-Ind	H	C		331 (M^++1)
Int.n-e-4	11e-1	Int.n-e-1	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		345 (M^++1)
Int.n-e-5	11e-1	Int.n-e-1	BRA4		1Et-5-Ind	H	C		359 (M^++1)
Int.n-e-6	11e-1	Int.n-e-1	BRA7		5-1Idz	H	C		332 (M^++1)
Int.n-e-7	11e-1	Int.n-e-1	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		346 (M^++1)
Int.n-e-8	11e-1	Int.n-e-1	BRA9		1Et-5-Idz	H	C		360 (M^++1)
Int.n-e-9	13-h	Int.n-a-4			Br	H	C		308 (M^+)
Int.n-e-10	11e-1	Int.n-e-8	BRA1		2-Nap	H	C		356 (M^++1)
Int.n-e-11	11e-1	Int.n-e-8	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		359 (M^++1)
Int.n-e-12	11e-1	Int.n-e-8	BRA7		5-1Idz	H	C		346 (M^++1)
Int.n-e-13	13-h	Int.n-a-5			Br	H	C		308 (M^+)
Int.n-e-14	11e-1	Int.n-e-13	BRA1		2-Nap	H	C		356 (M^++1)
Int.n-e-15	11e-1	Int.n-e-13	BRA2		5-Ind	H	C		345 (M^++1)
Int.n-e-16	11e-1	Int.n-e-13	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		359 (M^++1)
Int.n-e-17	11e-1	Int.n-e-13	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		360 (M^++1)
Int.n-e-18	11e-1	Int.n-e-13	BRA9		1Et-5-Idz	H	C		374 (M^++1)
Int.n-e-19	13-h	Int.n-a-6			Br	H	C		308 (M^+)
Int.n-e-20	11e-1	Int.n-e-19	BRA1		2-Nap	H	C		356 (M^++1)
Int.n-e-21	11e-1	Int.n-e-19	BRA2		5-Ind	H	C		345 (M^++1)
Int.n-e-22	11e-1	Int.n-e-19	BRA7		5-1Idz	H	C		346 (M^++1)

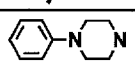
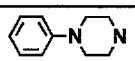
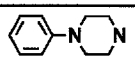
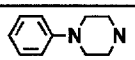
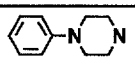
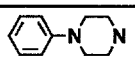
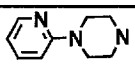
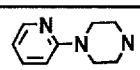
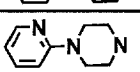
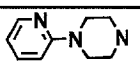
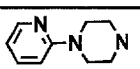
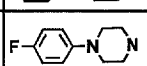
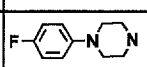
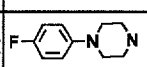
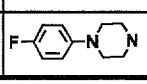
[0466] [表183]

Table-Int.N-e-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	RyRz	V_1'	V_2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.n-e-23	11e-1	Int.n-e-19	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		360 (M^++1)
Int.n-e-24	13-h	Int.n-a-7			Br	H	C		322 (M^+)
Int.n-e-25	11e-1	Int.n-e-24	BRA1		2-Nap	H	C		370 (M^++1)
Int.n-e-26	11e-1	Int.n-e-24	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		373 (M^++1)
Int.n-e-27	11e-1	Int.n-e-24	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		374 (M^++1)
Int.n-e-28	11e-1	Int.n-e-24	BRA9		1Et-5-Idz	H	C		388 (M^++1)
Int.n-e-29	13-h	Int.n-a-8			Br	H	C		370 (M^+)
Int.n-e-30	11e-1	Int.n-e-29	BRA1		2-Nap	H	C		418 (M^++1)
Int.n-e-31	11e-1	Int.n-e-29	BRA2		5-Ind	H	C		407 (M^++1)
Int.n-e-32	11e-1	Int.n-e-29	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		421 (M^++1)
Int.n-e-33	11e-1	Int.n-e-29	BRA7		5-1Idz	H	C		408 (M^++1)
Int.n-e-34	11e-1	Int.n-e-29	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		422 (M^++1)
Int.n-e-35	13-h	Int.n-a-9			Br	H	C		384 (M^+)
Int.n-e-36	11e-1	Int.n-e-35	BRA1		2-Nap	H	C		432 (M^++1)
Int.n-e-37	11e-1	Int.n-e-35	BRA2		5-Ind	H	C		421 (M^++1)
Int.n-e-38	11e-1	Int.n-e-35	BRA7		5-1Idz	H	C		422 (M^++1)
Int.n-e-39	13-h	Int.n-a-10			Br	H	C		296 (M^+)
Int.n-e-40	11e-1	Int.n-e-39	BRA1		2-Nap	H	C		344 (M^++1)
Int.n-e-41	11e-1	Int.n-e-39	BRA2		5-Ind	H	C		333 (M^++1)
Int.n-e-42	11e-1	Int.n-e-39	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		347 (M^++1)
Int.n-e-43	11e-1	Int.n-e-39	BRA7		5-1Idz	H	C		334 (M^++1)
Int.n-e-44	11e-1	Int.n-e-39	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		348 (M^++1)
Int.n-e-45	11e-1	Int.n-e-39	BRA9		1Et-5-Idz	H	C		362 (M^++1)
Int.n-e-46	13-h	Int.n-a-11			Br	H	C		324 (M^+)

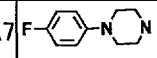
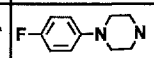
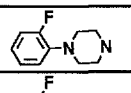
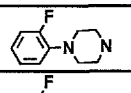
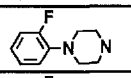
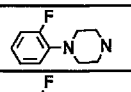
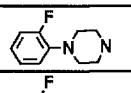
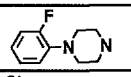
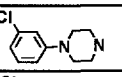
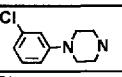
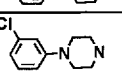
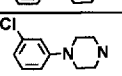
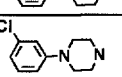
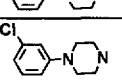
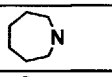
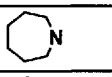
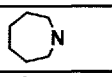
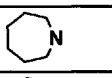
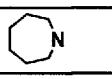
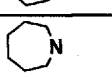
[0467] [表184]

Table-Int.N-e-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	RyRz	V_1'	V_2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.n-e-47	11e-1	Int.n-e-46	BRA1		2-Nap	H	C		372 (M^++1)
Int.n-e-48	11e-1	Int.n-e-46	BRA2		5-Ind	H	C		361 (M^++1)
Int.n-e-49	11e-1	Int.n-e-46	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		375 (M^++1)
Int.n-e-50	11e-1	Int.n-e-46	BRA7		5-1Idz	H	C		362 (M^++1)
Int.n-e-51	11e-1	Int.n-e-46	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		376 (M^++1)
Int.n-e-52	13-h	Int.n-a-12			Br	H	C		324 (M^+)
Int.n-e-53	11e-1	Int.n-e-52	BRA2		5-Ind	H	C		361 (M^++1)
Int.n-e-54	11e-1	Int.n-e-52	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		375 (M^++1)
Int.n-e-55	11e-1	Int.n-e-52	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		376 (M^++1)
Int.n-e-56	13-h	Int.n-a-13			Br	H	C		371 (M^+)
Int.n-e-57	11e-1	Int.n-e-56	BRA1		2-Nap	H	C		419 (M^++1)
Int.n-e-58	11e-1	Int.n-e-56	BRA2		5-Ind	H	C		408 (M^++1)
Int.n-e-59	11e-1	Int.n-e-56	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		422 (M^++1)
Int.n-e-60	11e-1	Int.n-e-56	BRA7		5-1Idz	H	C		409 (M^++1)
Int.n-e-61	11e-1	Int.n-e-56	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		423 (M^++1)
Int.n-e-62	13-h	Int.n-a-14			Br	H	C		372 (M^+)
Int.n-e-63	11e-1	Int.n-e-62	BRA1		2-Nap	H	C		420 (M^++1)
Int.n-e-64	11e-1	Int.n-e-62	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		423 (M^++1)
Int.n-e-65	11e-1	Int.n-e-62	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		424 (M^++1)
Int.n-e-66	11e-1	Int.n-e-62	BRA9		1Et-5-Idz	H	C		438 (M^++1)
Int.n-e-67	13-h	Int.n-a-15			Br	H	C		389 (M^+)
Int.n-e-68	11e-1	Int.n-e-67	BRA1		2-Nap	H	C		437 (M^++1)
Int.n-e-69	11e-1	Int.n-e-67	BRA2		5-Ind	H	C		426 (M^++1)
Int.n-e-70	11e-1	Int.n-e-67	BRA4		1Et-5-Ind	H	C		454 (M^++1)

[0468] [表185]

Table-Int.N-e-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	RyRz	V_1'	V_2'	LCMS		
							method	RTime	Mass
Int.n-e-71	11e-1	Int.n-e-67	BRA7		5-1Idz	H	C		427 (M^++1)
Int.n-e-72	11e-1	Int.n-e-67	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		441 (M^++1)
Int.n-e-73	13-h	Int.n-a-16			Br	H	C		389 (M^+)
Int.n-e-74	11e-1	Int.n-e-73	BRA1		2-Nap	H	C		437 (M^++1)
Int.n-e-75	11e-1	Int.n-e-73	BRA2		5-Ind	H	C		426 (M^++1)
Int.n-e-76	11e-1	Int.n-e-73	BRA4		1Et-5-Ind	H	C		454 (M^++1)
Int.n-e-77	11e-1	Int.n-e-73	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		441 (M^++1)
Int.n-e-78	11e-1	Int.n-e-73	BRA9		1Et-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
Int.n-e-79	13-h	Int.n-a-17			Br	H	C		405 (M^+)
Int.n-e-80	11e-1	Int.n-e-79	BRA1		2-Nap	H	C		453 (M^++1)
Int.n-e-81	11e-1	Int.n-e-79	BRA2		5-Ind	H	C		442 (M^++1)
Int.n-e-82	11e-1	Int.n-e-79	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		456 (M^++1)
Int.n-e-83	11e-1	Int.n-e-79	BRA7		5-1Idz	H	C		443 (M^++1)
Int.n-e-84	11e-1	Int.n-e-79	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		457 (M^++1)
Int.n-e-85	13-h	Int.n-a-18			Br	H	C		308 (M^+)
Int.n-e-86	11e-1	Int.n-a-85	BRA1		2-Nap	H	C		356 (M^++1)
Int.n-e-87	11e-1	Int.n-a-85	BRA2		5-Ind	H	C		345 (M^++1)
Int.n-e-88	11e-1	Int.n-a-85	BRA3		1Me-5-Ind	H	C		359 (M^++1)
Int.n-e-89	11e-1	Int.n-a-85	BRA7		5-1Idz	H	C		346 (M^++1)
Int.n-e-90	11e-1	Int.n-a-85	BRA8		1Me-5-Idz	H	C		360 (M^++1)

[0469] 実施例N－k－1

2－[4－(ナフタレン－2－イル)－5－(ピペリジン－1－イル)－2, 3－ジヒドロ－イリデン]酢酸エチル(化合物番号N－k－1)の合成(製造法10工程k－1)

参考例1の中間体A－2の合成法(製造法9工程k－1)に記載の手順に従って、中間体n－e－2(198. 3mg)、ジエチルホスホノ酢酸エチル(1. 2ml、TCI)、水素化

ナトリウム(160．1mg、WAKO)を反応、処理させることで標記化合物(化合物番号N－k－1;112．2mg)を得た。

実施例N－k－2

2－[4－(ナフタレン－2－イル)－5－(ピペリジン－1－イル)－2，3－ジヒドロ－イリデン]酢酸(化合物番号N－e－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物N－k－1(103．4mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0．70ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号N－k－2;89．3mg)を得た(但し反応は1時間行った)。

[0470] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－N－K－1からTable－N－K－7に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。化合物の製造は、表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。

[0471] [表186]

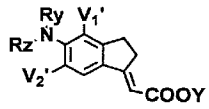


Table-N-K-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-k-1	10k-1	Int.n-e-2			Et	2-Nap	H	C		412 (M^++1)
N-k-2	1-a	N-k-1			H	2-Nap	H	C		384 (M^++1)
N-k-3	10k-1	Int.n-e-3			Et	5-Ind	H	C		401 (M^++1)
N-k-4	1-a	N-k-3			H	5-Ind	H	C		373 (M^++1)
N-k-5	10k-1	Int.n-e-4			Et	1Me-5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-k-6	1-a	N-k-5			H	1Me-5-Ind	H	C		387 (M^++1)
N-k-7	10k-1	Int.n-e-5			Et	1Et-5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-k-8	1-a	N-k-7			H	1Et-5-Ind	H	C		401 (M^++1)
N-k-9	10k-1	Int.n-e-6			Et	5-1Idz	H	C		402 (M^++1)
N-k-10	1-a	N-k-9			H	5-1Idz	H	C		374 (M^++1)
N-k-11	10k-1	Int.n-e-7			Et	1Me-5-Idz	H	C		416 (M^++1)
N-k-12	1-a	N-k-11			H	1Me-5-Idz	H	C		388 (M^++1)
N-k-13	10k-1	Int.n-e-8			Et	1Et-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
N-k-14	1-a	N-k-13			H	1Et-5-Idz	H	C		402 (M^++1)
N-k-15	10k-1	Int.n-e-10			Et	2-Nap	H	C		426 (M^++1)
N-k-16	1-a	N-k-15			H	2-Nap	H	C		398 (M^++1)
N-k-17	10k-1	Int.n-e-11			Et	1Me-5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-k-18	1-a	N-k-17			H	1Me-5-Ind	H	C		401 (M^++1)
N-k-19	10k-1	Int.n-e-12			Et	5-1Idz	H	C		416 (M^++1)
N-k-20	1-a	N-k-19			H	5-1Idz	H	C		388 (M^++1)
N-k-21	10k-1	Int.n-e-14			Et	2-Nap	H	C		426 (M^++1)
N-k-22	1-a	N-k-21			H	2-Nap	H	C		398 (M^++1)

[0472] [表187]

Table-N-K-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-k-23	10k-1	Int.n-e-15			Et	5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-k-24	1-a	N-k-23			H	5-Ind	H	C		387 (M^++1)
N-k-25	10k-1	Int.n-e-16			Et	1Me-5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-k-26	1-a	N-k-25			H	1Me-5-Ind	H	C		401 (M^++1)
N-k-27	10k-1	Int.n-e-17			Et	1Me-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
N-k-28	1-a	N-k-27			H	1Me-5-Idz	H	C		402 (M^++1)
N-k-29	10k-1	Int.n-e-18			Et	1Et-5-Idz	H	C		444 (M^++1)
N-k-30	1-a	N-k-29			H	1Et-5-Idz	H	C		416 (M^++1)
N-k-31	10k-1	Int.n-e-20			Et	2-Nap	H	C		426 (M^++1)
N-k-32	1-a	N-k-31			H	2-Nap	H	C		398 (M^++1)
N-k-33	10k-1	Int.n-e-21			Et	5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-k-34	1-a	N-k-33			H	5-Ind	H	C		387 (M^++1)
N-k-35	10k-1	Int.n-e-22			Et	5-1Idz	H	C		416 (M^++1)
N-k-36	1-a	N-k-35			H	5-1Idz	H	C		388 (M^++1)
N-k-37	10k-1	Int.n-e-23			Et	1Me-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
N-k-38	1-a	N-k-37			H	1Me-5-Idz	H	C		402 (M^++1)
N-k-39	10k-1	Int.n-e-25			Et	2-Nap	H	C		440 (M^++1)
N-k-40	1-a	N-k-39			H	2-Nap	H	C		412 (M^++1)
N-k-41	10k-1	Int.n-e-26			Et	1Me-5-Ind	H	C		443 (M^++1)
N-k-42	1-a	N-k-41			H	1Me-5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-k-43	10k-1	Int.n-e-27			Et	1Me-5-Idz	H	C		444 (M^++1)
N-k-44	1-a	N-k-43			H	1Me-5-Idz	H	C		416 (M^++1)

[0473] [表188]

Table-N-K-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-k-45	10k-1	Int.n-e-28			Et	1Et-5-Idz	H	C		458 (M^++1)
N-k-46	1-a	N-k-45			H	1Et-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
N-k-47	10k-1	Int.n-e-30			Et	2-Nap	H	C		488 (M^++1)
N-k-48	1-a	N-k-47			H	2-Nap	H	C		460 (M^++1)
N-k-49	10k-1	Int.n-e-31			Et	5-Ind	H	C		477 (M^++1)
N-k-50	1-a	N-k-49			H	5-Ind	H	C		449 (M^++1)
N-k-51	10k-1	Int.n-e-32			Et	1Me-5-Ind	H	C		491 (M^++1)
N-k-52	1-a	N-k-51			H	1Me-5-Ind	H	C		463 (M^++1)
N-k-53	10k-1	Int.n-e-33			Et	5-1Idz	H	C		478 (M^++1)
N-k-54	1-a	N-k-53			H	5-1Idz	H	C		450 (M^++1)
N-k-55	10k-1	Int.n-e-34			Et	1Me-5-Idz	H	C		492 (M^++1)
N-k-56	1-a	N-k-55			H	1Me-5-Idz	H	C		464 (M^++1)
N-k-57	10k-1	Int.n-e-36			Et	2-Nap	H	C		502 (M^++1)
N-k-58	1-a	N-k-57			H	2-Nap	H	C		474 (M^++1)
N-k-59	10k-1	Int.n-e-37			Et	5-Ind	H	C		491 (M^++1)
N-k-60	1-a	N-k-59			H	5-Ind	H	C		463 (M^++1)
N-k-61	10k-1	Int.n-e-38			Et	5-1Idz	H	C		492 (M^++1)
N-k-62	1-a	N-k-61			H	5-1Idz	H	C		464 (M^++1)
N-k-63	10k-1	Int.n-e-40			Et	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-k-64	1-a	N-k-63			H	2-Nap	H	C		386 (M^++1)
N-k-65	10k-1	Int.n-e-41			Et	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-k-66	1-a	N-k-65			H	5-Ind	H	C		375 (M^++1)

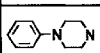
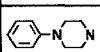
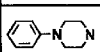
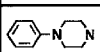
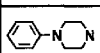
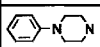
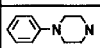
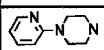
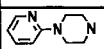
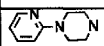
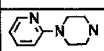
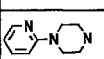
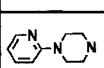
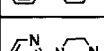
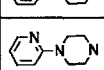
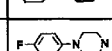
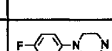
[0474] [表189]

Table-N-K-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-k-67	10k-1	Int.n-e-42			Et	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-k-68	1-a	N-k-67			H	1Me-5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-k-69	10k-1	Int.n-e-43			Et	5-1Idz	H	C		404 (M^++1)
N-k-70	1-a	N-k-69			H	5-1Idz	H	C		376 (M^++1)
N-k-71	10k-1	Int.n-e-44			Et	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-k-72	1-a	N-k-71			H	1Me-5-Idz	H	C		390 (M^++1)
N-k-73	10k-1	Int.n-e-45			Et	1Et-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-k-74	1-a	N-k-73			H	1Et-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-k-75	10k-1	Int.n-e-47			Et	2-Nap	H	C		442 (M^++1)
N-k-76	1-a	N-k-75			H	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-k-77	10k-1	Int.n-e-48			Et	5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-k-78	1-a	N-k-77			H	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-k-79	10k-1	Int.n-e-49			Et	1Me-5-Ind	H	C		445 (M^++1)
N-k-80	1-a	N-k-79			H	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-k-81	10k-1	Int.n-e-50			Et	5-1Idz	H	C		432 (M^++1)
N-k-82	1-a	N-k-81			H	5-1Idz	H	C		404 (M^++1)
N-k-83	10k-1	Int.n-e-51			Et	1Me-5-Idz	H	C		446 (M^++1)
N-k-84	1-a	N-k-83			H	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-k-85	10k-1	Int.n-e-53			Et	5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-k-86	1-a	N-k-85			H	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-k-87	10k-1	Int.n-e-54			Et	1Me-5-Ind	H	C		445 (M^++1)
N-k-88	1-a	N-k-87			H	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)

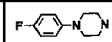
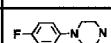
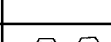
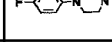
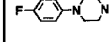
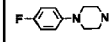
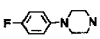
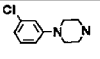
[0475] [表190]

Table-N-K-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-k-89	10k-1	Int.n-e-55			Et	1Me-5-Idz	H	C		446 (M^++1)
N-k-90	1-a	N-k-89			H	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-k-91	10k-1	Int.n-e-57			Et	2-Nap	H	C		489 (M^++1)
N-k-92	1-a	N-k-91			H	2-Nap	H	C		461 (M^++1)
N-k-93	10k-1	Int.n-e-58			Et	5-Ind	H	C		478 (M^++1)
N-k-94	1-a	N-k-93			H	5-Ind	H	C		450 (M^++1)
N-k-95	10k-1	Int.n-e-59			Et	1Me-5-Ind	H	C		492 (M^++1)
N-k-96	1-a	N-k-95			H	1Me-5-Ind	H	C		464 (M^++1)
N-k-97	10k-1	Int.n-e-60			Et	5-1Idz	H	C		479 (M^++1)
N-k-98	1-a	N-k-97			H	5-1Idz	H	C		451 (M^++1)
N-k-99	10k-1	Int.n-e-61			Et	1Me-5-Idz	H	C		493 (M^++1)
N-k-100	1-a	N-k-99			H	1Me-5-Idz	H	C		465 (M^++1)
N-k-101	10k-1	Int.n-e-63			Et	2-Nap	H	C		490 (M^++1)
N-k-102	1-a	N-k-101			H	2-Nap	H	C		462 (M^++1)
N-k-103	10k-1	Int.n-e-64			Et	1Me-5-Ind	H	C		493 (M^++1)
N-k-104	1-a	N-k-103			H	1Me-5-Ind	H	C		465 (M^++1)
N-k-105	10k-1	Int.n-e-65			Et	1Me-5-Idz	H	C		494 (M^++1)
N-k-106	1-a	N-k-105			H	1Me-5-Idz	H	C		466 (M^++1)
N-k-107	10k-1	Int.n-e-66			Et	1Et-5-Idz	H	C		508 (M^++1)
N-k-108	1-a	N-k-107			H	1Et-5-Idz	H	C		480 (M^++1)
N-k-109	10k-1	Int.n-e-68			Et	2-Nap	H	C		507 (M^++1)
N-k-110	1-a	N-k-109			H	2-Nap	H	C		479 (M^++1)

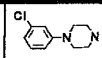
[0476] [表191]

Table-N-K-6

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-k-111	10k-1	Int.n-e-69			Et	5-Ind	H	C		496 (M^++1)
N-k-112	1-a	N-k-111			H	5-Ind	H	C		468 (M^++1)
N-k-113	10k-1	Int.n-e-70			Et	1Et-5-Ind	H	C		524 (M^++1)
N-k-114	1-a	N-k-113			H	1Et-5-Ind	H	C		496 (M^++1)
N-k-115	10k-1	Int.n-e-71			Et	5-1Idz	H	C		497 (M^++1)
N-k-116	1-a	N-k-115			H	5-1Idz	H	C		469 (M^++1)
N-k-117	10k-1	Int.n-e-72			Et	1Me-5-Idz	H	C		511 (M^++1)
N-k-118	1-a	N-k-117			H	1Me-5-Idz	H	C		483 (M^++1)
N-k-119	10k-1	Int.n-e-74			Et	2-Nap	H	C		507 (M^++1)
N-k-120	1-a	N-k-119			H	2-Nap	H	C		479 (M^++1)
N-k-121	10k-1	Int.n-e-75			Et	5-Ind	H	C		496 (M^++1)
N-k-122	1-a	N-k-121			H	5-Ind	H	C		468 (M^++1)
N-k-123	10k-1	Int.n-e-76			Et	1Et-5-Ind	H	C		524 (M^++1)
N-k-124	1-a	N-k-123			H	1Et-5-Ind	H	C		496 (M^++1)
N-k-125	10k-1	Int.n-e-77			Et	1Me-5-Idz	H	C		511 (M^++1)
N-k-126	1-a	N-k-125			H	1Me-5-Idz	H	C		483 (M^++1)
N-k-127	10k-1	Int.n-e-78			Et	1Et-5-Idz	H	C		525 (M^++1)
N-k-128	1-a	N-k-127			H	1Et-5-Idz	H	C		497 (M^++1)
N-k-129	10k-1	Int.n-e-80			Et	2-Nap	H	C		524 (M^++1)
N-k-130	1-a	N-k-129			H	2-Nap	H	C		496 (M^++1)
N-k-131	10k-1	Int.n-e-81			Et	5-Ind	H	C		513 (M^++1)
N-k-132	1-a	N-k-131			H	5-Ind	H	C		485 (M^++1)

[0477] [表192]

Table-N-K-7

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-k-133	10k-1	Int.n-e-82			Et	1Me-5-Ind	H	C		527 (M^++1)
N-k-134	1-a	N-k-133			H	1Me-5-Ind	H	C		499 (M^++1)
N-k-135	10k-1	Int.n-e-83			Et	5-1Idz	H	C		514 (M^++1)
N-k-136	1-a	N-k-135			H	5-1Idz	H	C		486 (M^++1)
N-k-137	10k-1	Int.n-e-84			Et	1Me-5-Idz	H	C		528 (M^++1)
N-k-138	1-a	N-k-137			H	1Me-5-Idz	H	C		500 (M^++1)
N-k-139	10k-1	Int.n-e-86			Et	2-Nap	H	C		426 (M^++1)
N-k-140	1-a	N-k-139			H	2-Nap	H	C		398 (M^++1)
N-k-141	10k-1	Int.n-e-87			Et	5-Ind	H	C		415 (M^++1)
N-k-142	1-a	N-k-141			H	5-Ind	H	C		387 (M^++1)
N-k-143	10k-1	Int.n-e-88			Et	1Me-5-Ind	H	C		429 (M^++1)
N-k-144	1-a	N-k-143			H	1Me-5-Ind	H	C		401 (M^++1)
N-k-145	10k-1	Int.n-e-89			Et	5-1Idz	H	C		416 (M^++1)
N-k-146	1-a	N-k-145			H	5-1Idz	H	C		388 (M^++1)
N-k-147	10k-1	Int.n-e-90			Et	1Me-5-Idz	H	C		430 (M^++1)
N-k-148	1-a	N-k-147			H	1Me-5-Idz	H	C		402 (M^++1)

[0478] 実施例N－1－1

2－[5－メチルアミノ－4－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸エチルの合成(化合物番号N－1－1)(製造法9工程j)

参考例1の中間体A－3の合成法(製造法9工程j)に記載の手順に従って実施例化合物N－j－1(70. 6mg)およびPd／C(17. 2mg、Merck社製)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号N－1－1;41. 2mg)を得た(但し反応は9時間行った)。

実施例N－1－2

2－[5－メチルアミノ－4－(ナフタレン－2－イル)－2, 3－ジヒドロ－1H－インデン－1－イル]酢酸の合成(化合物番号N－1－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物N－1－1(39．1mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0．40ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号N－1－2;30．2mg)を得た(但し反応は1時間行った)。

[0479] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－N－L－1からTable－N－L－3及びTable－N－M－1からTable－N－M－5に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。

[0480] [表193]

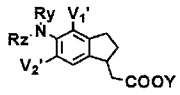


Table-N-L-1

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-I-1	9-j	N-j-1		Me	H	Et	2-Nap	H	C		360 (M^++1)
N-I-2	1-a	N-I-1		Me	H	H	2-Nap	H	C		332 (M^++1)
N-I-3	9-j	N-j-3		nPr	Me	Et	2-Nap	H	C		402 (M^++1)
N-I-4	1-a	N-I-3		nPr	Me	H	2-Nap	H	C		374 (M^++1)
N-I-5	9-j	N-j-5		iPr	Me	Et	2-Nap	H	C		402 (M^++1)
N-I-6	1-a	N-I-5		iPr	Me	H	2-Nap	H	C		374 (M^++1)
N-I-7	9-j	N-j-7		nBu	Me	Et	2-Nap	H	C		416 (M^++1)
N-I-8	1-a	N-I-7		nBu	Me	H	2-Nap	H	C		388 (M^++1)
N-I-9	9-j	N-j-9		iBu	Me	Et	2-Nap	H	C		416 (M^++1)
N-I-10	1-a	N-I-9		iBu	Me	H	2-Nap	H	C		388 (M^++1)
N-I-11	9-j	N-j-11		cPen	Me	Et	2-Nap	H	C		428 (M^++1)
N-I-12	1-a	N-I-11		cPen	Me	H	2-Nap	H	C		400 (M^++1)
N-I-13	9-j	N-j-13		cHex	Me	Et	2-Nap	H	C		442 (M^++1)
N-I-14	1-a	N-I-13		cHex	Me	H	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-I-15	9-j	N-j-15		Me	H	Et	5-Ind	H	C		349 (M^++1)
N-I-16	1-a	N-I-15		Me	H	H	5-Ind	H	C		321 (M^++1)
N-I-17	9-j	N-j-17		nPr	Me	Et	5-Ind	H	C		391 (M^++1)
N-I-18	1-a	N-I-17		nPr	Me	H	5-Ind	H	C		363 (M^++1)
N-I-19	9-j	N-j-19		iPr	Me	Et	5-Ind	H	C		391 (M^++1)
N-I-20	1-a	N-I-19		iPr	Me	H	5-Ind	H	C		363 (M^++1)
N-I-21	9-j	N-j-21		nBu	Me	Et	5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-22	1-a	N-I-21		nBu	Me	H	5-Ind	H	C		377 (M^++1)
N-I-23	9-j	N-j-23		iBu	Me	Et	5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-24	1-a	N-I-23		iBu	Me	H	5-Ind	H	C		377 (M^++1)
N-I-25	9-j	N-j-25		cPen	Me	Et	5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-I-26	1-a	N-I-25		cPen	Me	H	5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-I-27	9-j	N-j-27		cHex	Me	Et	5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-I-28	1-a	N-I-27		cHex	Me	H	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-I-29	9-j	N-j-31		nPr	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-30	1-a	N-I-29		nPr	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		377 (M^++1)
N-I-31	9-j	N-j-33		iBu	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-I-32	1-a	N-I-31		iBu	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		391 (M^++1)
N-I-33	9-j	N-j-35		cPen	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-I-34	1-a	N-I-33		cPen	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-I-35	9-j	N-j-37		cHex	Me	Et	1Me-5-Ind	H	C		445 (M^++1)
N-I-36	1-a	N-I-35		cHex	Me	H	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-I-37	9-j	N-j-41		iPr	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-I-38	1-a	N-I-37		iPr	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		391 (M^++1)
N-I-39	9-j	N-j-43		nBu	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		433 (M^++1)
N-I-40	1-a	N-I-39		nBu	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-41	9-j	N-j-45		iBu	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		433 (M^++1)
N-I-42	1-a	N-I-41		iBu	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-43	9-j	N-j-47		cPen	Me	Et	1Et-5-Ind	H	C		445 (M^++1)
N-I-44	1-a	N-I-43		cPen	Me	H	1Et-5-Ind	H	C		417 (M^++1)

[0481] [表194]

Table-N-L-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-I-45	9-j	N-j-49		Me	H	Et	1Me-5-Idz	H	C		364 (M^++1)
N-I-46	1-a	N-I-45		Me	H	H	1Me-5-Idz	H	C		336 (M^++1)
N-I-47	9-j	N-j-51		nPr	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		406 (M^++1)
N-I-48	1-a	N-I-47		nPr	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		378 (M^++1)
N-I-49	9-j	N-j-53		iPr	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		406 (M^++1)
N-I-50	1-a	N-I-49		iPr	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		378 (M^++1)
N-I-51	9-j	N-j-55		nBu	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-I-52	1-a	N-I-51		nBu	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		392 (M^++1)
N-I-53	9-j	N-j-57		iBu	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-I-54	1-a	N-I-53		iBu	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		392 (M^++1)
N-I-55	9-j	N-j-59		cPen	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-I-56	1-a	N-I-55		cPen	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-I-57	9-j	N-j-61		cHex	Me	Et	1Me-5-Idz	H	C		446 (M^++1)
N-I-58	1-a	N-I-57		cHex	Me	H	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-I-59	9-j	N-j-65		nPr	Me	Et	1Et-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-I-60	1-a	N-I-59		nPr	Me	H	1Et-5-Idz	H	C		392 (M^++1)
N-I-61	9-j	N-j-67		iPr	Me	Et	1Et-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-I-62	1-a	N-I-61		iPr	Me	H	1Et-5-Idz	H	C		392 (M^++1)
N-I-63	9-j	N-j-69		cHex	Me	Et	1Et-5-Idz	H	C		460 (M^++1)
N-I-64	1-a	N-I-63		cHex	Me	H	1Et-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-I-65	9-j	N-j-71		Bn	Et	Et	2-Nap	H	C		450 (M^++1)
N-I-66	1-a	N-I-65		Bn	Et	H	2-Nap	H	C		422 (M^++1)
N-I-67	9-j	N-j-73		nPr	Et	Et	2-Nap	H	C		402 (M^++1)
N-I-68	1-a	N-I-67		nPr	Et	H	2-Nap	H	C		374 (M^++1)
N-I-69	9-j	N-j-75		iPr	Et	Et	2-Nap	H	C		416 (M^++1)
N-I-70	1-a	N-I-69		iPr	Et	H	2-Nap	H	C		388 (M^++1)
N-I-71	9-j	N-j-77		nBu	Et	Et	2-Nap	H	C		430 (M^++1)
N-I-72	1-a	N-I-71		nBu	Et	H	2-Nap	H	C		402 (M^++1)
N-I-73	9-j	N-j-79		iBu	Et	Et	2-Nap	H	C		430 (M^++1)
N-I-74	1-a	N-I-73		iBu	Et	H	2-Nap	H	C		402 (M^++1)
N-I-75	9-j	N-j-81		cPen	Et	Et	2-Nap	H	C		442 (M^++1)
N-I-76	1-a	N-I-75		cPen	Et	H	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-I-77	9-j	N-j-87		nPr	Et	Et	5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-78	1-a	N-j-69		nPr	Et	H	5-Ind	H	C		377 (M^++1)
N-I-79	9-j	N-j-89		iPr	Et	Et	5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-80	1-a	N-I-79		iPr	Et	H	5-Ind	H	C		377 (M^++1)
N-I-81	9-j	N-j-91		nBu	Et	Et	5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-I-82	1-a	N-I-81		nBu	Et	H	5-Ind	H	C		391 (M^++1)
N-I-83	9-j	N-j-93		iBu	Et	Et	5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-I-84	1-a	N-I-83		iBu	Et	H	5-Ind	H	C		391 (M^++1)
N-I-85	9-j	N-j-95		cPen	Et	Et	5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-I-86	1-a	N-I-85		cPen	Et	H	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-I-87	9-j	N-j-99		nPr	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-I-88	1-a	N-I-87		nPr	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		391 (M^++1)
N-I-89	9-j	N-j-101		iPr	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-I-90	1-a	N-I-89		iPr	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		391 (M^++1)

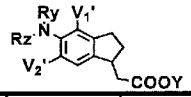
[0482] [表195]

Table-N-L-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	Ry	Rz	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
									method	RTime	Mass
N-I-91	9-j	N-j-103		nBu	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		433 (M^++1)
N-I-92	1-a	N-I-91		nBu	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-93	9-j	N-j-105		iBu	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		433 (M^++1)
N-I-94	1-a	N-I-93		iBu	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-95	9-j	N-j-107		cPen	Et	Et	1Me-5-Ind	H	C		445 (M^++1)
N-I-96	1-a	N-I-95		cPen	Et	H	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-I-97	9-j	N-j-113		iPr	Et	Et	1Et-5-Ind	H	C		433 (M^++1)
N-I-98	1-a	N-I-97		iPr	Et	H	1Et-5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-I-99	9-j	N-j-115		nBu	Et	Et	1Et-5-Ind	H	C		447 (M^++1)
N-I-100	1-a	N-I-99		nBu	Et	H	1Et-5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-I-101	9-j	N-j-117		cPen	Et	Et	1Et-5-Ind	H	C		459 (M^++1)
N-I-102	1-a	N-I-101		cPen	Et	H	1Et-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-I-103	9-j	N-j-119		Et	H	Et	1Me-5-Idz	H	C		378 (M^++1)
N-I-104	1-a	N-I-103		Et	H	H	1Me-5-Idz	H	C		350 (M^++1)
N-I-105	9-j	N-j-121		nPr	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-I-106	1-a	N-I-105		nPr	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		392 (M^++1)
N-I-107	9-j	N-j-123		iPr	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-I-108	1-a	N-I-107		iPr	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		392 (M^++1)
N-I-109	9-j	N-j-127		iBu	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		434 (M^++1)
N-I-110	1-a	N-I-109		iBu	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		406 (M^++1)
N-I-111	9-j	N-j-131		cHex	Et	Et	1Me-5-Idz	H	C		460 (M^++1)
N-I-112	1-a	N-I-111		cHex	Et	H	1Me-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-I-113	9-j	N-j-135		nPr	Et	Et	1Et-5-Idz	H	C		406 (M^++1)
N-I-114	1-a	N-I-113		nPr	Et	H	1Et-5-Idz	H	C		406 (M^++1)
N-I-115	9-j	N-j-137		iPr	Et	Et	1Et-5-Idz	H	C		406 (M^++1)
N-I-116	1-a	N-I-115		iPr	Et	H	1Et-5-Idz	H	C		406 (M^++1)
N-I-117	9-j	N-j-139		nBu	Et	Et	1Et-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-I-118	1-a	N-I-117		nBu	Et	H	1Et-5-Idz	H	C		420 (M^++1)

[0483] [表196]

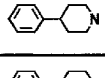
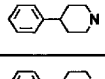
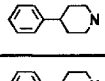
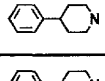
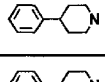
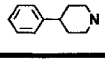
Table-N-M-1



Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-m-1	9-j	N-k-1			Et	2-Nap	H	C		414 (M^++1)
N-m-2	1-a	N-m-1			H	2-Nap	H	C		386 (M^++1)
N-m-3	9-j	N-k-3			Et	5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-m-4	1-a	N-m-3			H	5-Ind	H	C		375 (M^++1)
N-m-5	9-j	N-k-5			Et	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-m-6	1-a	N-m-5			H	1Me-5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-m-7	9-j	N-k-7			Et	1Et-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-m-8	1-a	N-m-7			H	1Et-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-m-9	9-j	N-k-9			Et	5-1Idz	H	C		404 (M^++1)
N-m-10	1-a	N-m-9			H	5-1Idz	H	C		376 (M^++1)
N-m-11	9-j	N-k-11			Et	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-m-12	1-a	N-m-11			H	1Me-5-Idz	H	C		390 (M^++1)
N-m-13	9-j	N-k-13			Et	1Et-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-m-14	1-a	N-m-13			H	1Et-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-m-15	9-j	N-k-15			Et	2-Nap	H	C		428 (M^++1)
N-m-16	1-a	N-m-15			H	2-Nap	H	C		400 (M^++1)
N-m-17	9-j	N-k-17			Et	1Me-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-m-18	1-a	N-m-17			H	1Me-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-m-19	9-j	N-k-21			Et	2-Nap	H	C		428 (M^++1)
N-m-20	1-a	N-m-19			H	2-Nap	H	C		400 (M^++1)
N-m-21	9-j	N-k-23			Et	5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-m-22	1-a	N-m-21			H	5-Ind	H	C		389 (M^++1)

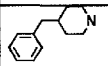
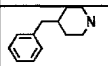
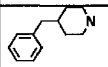
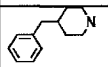
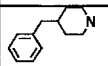
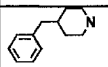
[0484] [表197]

Table-N-M-2

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-m-23	9-j	N-K-25			Et	1Me-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-m-24	1-a	N-m-23			H	1Me-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-m-25	9-j	N-k-27			Et	1Me-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-m-26	1-a	N-m-25			H	1Me-5-Idz	H	C		404 (M^++1)
N-m-27	9-j	N-k-31			Et	2-Nap	H	C		428 (M^++1)
N-m-28	1-a	N-m-27			H	2-Nap	H	C		400 (M^++1)
N-m-29	9-j	N-k-33			Et	5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-m-30	1-a	N-m-29			H	5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-m-31	9-j	N-k-35			Et	5-1Idz	H	C		418 (M^++1)
N-m-32	1-a	N-m-31			H	5-1Idz	H	C		390 (M^++1)
N-m-33	9-j	N-k-41			Et	1Me-5-Ind	H	C		445 (M^++1)
N-m-34	1-a	N-m-33			H	1Me-5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-m-35	9-j	N-k-43			Et	1Me-5-Idz	H	C		446 (M^++1)
N-m-36	1-a	N-m-35			H	1Me-5-Idz	H	C		418 (M^++1)
N-m-37	9-j	N-k-45			Et	1Et-5-Idz	H	C		460 (M^++1)
N-m-38	1-a	N-m-37			H	1Et-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-m-39	9-j	N-k-47			Et	2-Nap	H	C		490 (M^++1)
N-m-40	1-a	N-m-39			H	2-Nap	H	C		462 (M^++1)
N-m-41	9-j	N-k-49			Et	5-Ind	H	C		479 (M^++1)
N-m-42	1-a	N-m-41			H	5-Ind	H	C		451 (M^++1)
N-m-43	9-j	N-k-51			Et	1Me-5-Ind	H	C		493 (M^++1)
N-m-44	1-a	N-m-43			H	1Me-5-Ind	H	C		465 (M^++1)

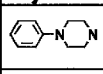
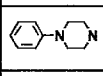
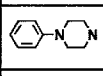
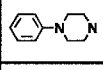
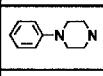
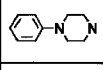
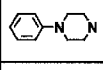
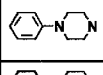
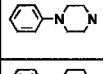
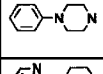
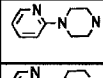
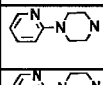
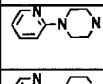
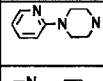
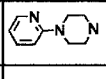
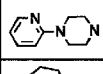
[0485] [表198]

Table-N-M-3

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-m-45	9-j	N-k-53			Et	5-1Idz	H	C		480 (M^++1)
N-m-46	1-a	N-m-45			H	5-1Idz	H	C		452 (M^++1)
N-m-47	9-j	N-k-57			Et	2-Nap	H	C		504 (M^++1)
N-m-48	1-a	N-m-47			H	2-Nap	H	C		476 (M^++1)
N-m-49	9-j	N-k-59			Et	5-Ind	H	C		493 (M^++1)
N-m-50	1-a	N-m-49			H	5-Ind	H	C		465 (M^++1)
N-m-51	9-j	N-k-61			Et	5-1Idz	H	C		494 (M^++1)
N-m-52	1-a	N-m-51			H	5-1Idz	H	C		466 (M^++1)
N-m-53	9-j	N-k-63			Et	2-Nap	H	C		416 (M^++1)
N-m-54	1-a	N-m-53			H	2-Nap	H	C		388 (M^++1)
N-m-55	9-j	N-k-67			Et	1Me-5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-m-56	1-a	N-m-55			H	1Me-5-Ind	H	C		391 (M^++1)
N-m-57	9-j	N-k-69			Et	5-1Idz	H	C		406 (M^++1)
N-m-58	1-a	N-m-57			H	5-1Idz	H	C		378 (M^++1)
N-m-59	9-j	N-k-71			Et	1Me-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-m-60	1-a	N-m-59			H	1Me-5-Idz	H	C		392 (M^++1)
N-m-61	9-j	N-k-75			Et	2-Nap	H	C		444 (M^++1)
N-m-62	1-a	N-m-61			H	2-Nap	H	C		416 (M^++1)
N-m-63	9-j	N-k-77			Et	5-Ind	H	C		433 (M^++1)
N-m-64	1-a	N-m-63			H	5-Ind	H	C		405 (M^++1)
N-m-65	9-j	N-k-79			Et	1Me-5-Ind	H	C		447 (M^++1)
N-m-66	1-a	N-m-65			H	1Me-5-Ind	H	C		419 (M^++1)

[0486] [表199]

Table-N-M-4

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-m-67	9-j	N-k-87			Et	1Me-5-Ind	H	C		447 (M^++1)
N-m-68	1-a	N-m-67			H	1Me-5-Ind	H	C		419 (M^++1)
N-m-69	9-j	N-K-89			Et	1Me-5-Idz	H	C		448 (M^++1)
N-m-70	1-a	N-m-89			H	1Me-5-Idz	H	C		420 (M^++1)
N-m-71	9-j	N-K-91			Et	2-Nap	H	C		491 (M^++1)
N-m-72	1-a	N-m-71			H	2-Nap	H	C		463 (M^++1)
N-m-73	9-j	N-K-93			Et	5-Ind	H	C		480 (M^++1)
N-m-74	1-a	N-m-73			H	5-Ind	H	C		452 (M^++1)
N-m-75	9-j	N-K-95			Et	1Me-5-Ind	H	C		494 (M^++1)
N-m-76	1-a	N-m-75			H	1Me-5-Ind	H	C		466 (M^++1)
N-m-77	9-j	N-K-97			Et	5-1Idz	H	C		481 (M^++1)
N-m-78	1-a	N-m-77			H	5-1Idz	H	C		453 (M^++1)
N-m-79	9-j	N-K-99			Et	1Me-5-Idz	H	C		495 (M^++1)
N-m-80	1-a	N-m-79			H	1Me-5-Idz	H	C		467 (M^++1)
N-m-81	9-j	N-K-101			Et	2-Nap	H	C		492 (M^++1)
N-m-82	1-a	N-m-81			H	2-Nap	H	C		464 (M^++1)
N-m-83	9-j	N-K-103			Et	1Me-5-Ind	H	C		495 (M^++1)
N-m-84	1-a	N-m-83			H	1Me-5-Ind	H	C		467 (M^++1)
N-m-85	9-j	N-K-107			Et	1Et-5-Idz	H	C		510 (M^++1)
N-m-86	1-a	N-m-85			H	1Et-5-Idz	H	C		482 (M^++1)
N-m-87	9-j	N-K-139			Et	2-Nap	H	C		428 (M^++1)
N-m-88	1-a	N-m-87			H	2-Nap	H	C		400 (M^++1)

[0487] [表200]

Table-N-M-5

Exp.	Syn.	SM1	Reagent	NRzRy	Y	V_1'	V_2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
N-m-89	9-j	N-k-141			Et	5-Ind	H	C		417 (M^++1)
N-m-90	1-a	N-m-89			H	5-Ind	H	C		389 (M^++1)
N-m-91	9-j	N-k-143			Et	1Me-5-Ind	H	C		431 (M^++1)
N-m-92	1-a	N-m-91			H	1Me-5-Ind	H	C		403 (M^++1)
N-m-93	9-j	N-k-145			Et	5-1Idz	H	C		418 (M^++1)
N-m-94	1-a	N-m-93			H	5-1Idz	H	C		390 (M^++1)
N-m-95	9-j	N-k-147			Et	1Me-5-Idz	H	C		432 (M^++1)
N-m-96	1-a	N-m-95			H	1Me-5-Idz	H	C		404 (M^++1)

[0488] 参考例19

6－ベンジルオキシ－3，4－ジヒドロナフタレン－1(2H)－オン(中間体d－1)の合成(製造法14工程f－1)

参考例2中間体A－5の合成法(製造法4工程f－1)に記載の手順に従って、6－ヒドロキシ－1テトラロン(3．23g、Ald)、ベンジルブロミド(2．37ml、TCI)を反応させ処理することで標記化合物(中間体d－1;4．37g)を得た。Mass(LCMS):253(M^+)、保持時間;4．66分(溶出条件:B)。

2－(6－ヒドロキシ－1，2，3，4－テトラヒドロナフタレン－1－イル)酢酸エチル(中間体d－2)の合成(製造法10工程k－2)

文献[Cannonら、ジャーナル オブ メディシナル ケミストリー(Journal of medicinal chemistry)813頁、1983年]に記載の手順に従って、粉末亜鉛(5．74g、WAKO)、ヨウ素(581．4mg、WAKO)のトルエン溶液(3ml)に、中間体d－1(4．37g)、ブロモ酢酸エチル(6mL)のトルエン溶液(40ml)を室温にて30分かけて滴下し、1時間攪拌した後、還流下にてさらに12時間攪拌した。

10%硫酸(5ml)を氷冷下加え30分攪拌した後、酢酸エチル(30ml×2)で抽出後、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄、乾燥し、減圧濃縮した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝7:1)で精製し、粗生成物を得た。得られた粗生成物のメタノール(20ml)に10%パラジウム炭素(286．2mg、Merck)を加え、5気圧下室温にて16時間半攪拌した。反応混合液を濾過し濾液の溶媒を減圧下留去することで標記化合物(中間体d－2;1．41g)を得た。Mass(LC

MS):N. D、保持時間;3. 85分(溶出条件:B)。

[0489] 2－(6－シクロペンチルオキシ－1, 2, 3, 4－テトラヒドロナフタレン－1－イル)酢酸エチル(中間体d－3)の合成(製造法14工程f－2)

参考例1の中間体A－1に記載の合成法(製造法4工程f－2)の手順に従って、中間体d－2(119mg)、ジターシャリーブチルアゾジカルボキシレート(238. 5mg、Ald)、トリフェニルホスフィン(276. 7mg、WAKO)、シクロペンタノール(141ul、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体d－3;142. 2mg)を得た。Mass(LCMS):N. D(M^+＋1)、保持時間;5. 97分(溶出条件:B)。

2－(7－ブロモ－6－シクロペンチルオキシ－1, 2, 3, 4－テトラヒドロナフタレン－1－イル)酢酸エチル(中間体d－4)の合成(製造法8工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って、中間体d－3(142. 2mg)およびNBS(81. 3mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体d－4;63. 2mg)を得た(但し反応は室温にて1時間15分行った)。Mass(LCMS):N. D(M^+＋1)、保持時間;6. 53分(溶出条件:A)。

[0490] 2－(5－ブロモ－6－シクロペンチルオキシ－1, 2, 3, 4－テトラヒドロナフタレン－1－イル)酢酸エチル(中間体d－5)の合成(製造法8工程h)

参考例1の中間体A―4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って中間体d－3(142. 2mg)およびNBS(81. 3mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体d－5;87. 2mg)を得た(但し反応は室温にて1時間15分行った)。Mass(LCMS):N. D(M^+＋1)、保持時間;6. 31分(溶出条件:A)。

上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int. D－1に示す。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに示したものである。

[0491] [表201]

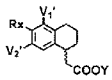


Table-Int.D-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.d-6	4f-1	Int.d-2	Hal1	BnO	Et	H	H	C		325 (M^++1)
Int.d-7	8-h	Int.d-6		BnO	Et	H	Br	C		403 (M^+)
Int.d-8	8-h	Int.d-6		BnO	Et	Br	H	C		403 (M^+)
Int.d-9	4f-2	Int.d-2	Al2	cPenMeO	Et	H	H	C		317 (M^++1)
Int.d-10	8-h	Int.d-9		cPenMeO	Et	H	Br	C		395 (M^+)
Int.d-11	8-h	Int.d-9		cPenMeO	Et	Br	H	C		395 (M^+)
Int.d-12	4f-1	Int.d-2	Hal2	cHexMeO	Et	H	H	C		331 (M^++1)
Int.d-13	8-h	Int.d-12		cHexMeO	Et	H	Br	C		409 (M^+)
Int.d-14	8-h	Int.d-12		cHexMeO	Et	Br	H	C		409 (M^+)
Int.d-15	4f-2	Int.d-2	Al3	cHexO	Et	H	H	C		317 (M^++1)
Int.d-16	8-h	Int.d-15		cHexO	Et	H	Br	C		395 (M^+)
Int.d-17	8-h	Int.d-15		cHexO	Et	Br	H	C		395 (M^+)
Int.d-18	4f-1	Int.d-2	Hal3	nPrO	Et	H	H	C		277 (M^++1)
Int.d-19	8-h	Int.d-18		nPrO	Et	H	Br	C		355 (M^+)
Int.d-20	8-h	Int.d-18		nPrO	Et	Br	H	C		355 (M^+)
Int.d-21	4f-2	Int.d-2	Hal4	iPrO	Et	H	H	C		277 (M^++1)
Int.d-22	8-h	Int.d-21		iPrO	Et	H	Br	C		355 (M^+)
Int.d-23	8-h	Int.d-21		iPrO	Et	Br	H	C		355 (M^+)

[0492] 実施例D－a－1

2－[6－シクロペンチルオキシ－7－(ナフタレン－2－イル)－1, 2, 3, 4－テトラヒドロナフタレン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号D－a－1)の合成(製造法4工程e－1)

実施例化合物A－a－1の合成法(製造法4工程e－1)に記載の手順に従って中間体d－4(46. 4mg)、2－ナフタレンボロン酸(143. 3mg、Ald)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0. 30ml)および$(Ph_3P)_4Pd$(43. 3mg、ナカライテスク社製)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号D－a－1;37. 3mg)を得た(但し反応は12時間行った)。

[0493] 実施例D－a－2

2－[6－シクロペンチルオキ－7－(ナフタレン－2－イル)－1, 2, 3, 4－テトラヒドロナフタレン－1－イル]酢酸の合成(化合物番号D－a－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物D－a－1(37. 3mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0. 25ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号D－a－2;27. 2mg)を得た(但し反応は1時間行った)。

上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－D

－a－1からTable－D－a－10に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。また、Table－Int. D－2において「Syn」の欄が空欄のものは水素、Pd／Cを用いた還元反応をしたことを示す。

[0494] [表202]

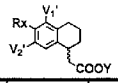


Table-Int.D-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.d-24		D-a-39		HO	Et	H	2-Nap	C		361 (M^++1)
Int.d-25		D-a-41		HO	Et	H	5-Ind	C		350 (M^++1)
Int.d-26		D-a-43		HO	Et	H	1Me-5-Ind	C		364 (M^++1)
Int.d-27		D-a-45		HO	Et	H	1Me-4-Ind	C		364 (M^++1)
Int.d-28		D-a-47		HO	Et	H	1Me-6-Ind	C		364 (M^++1)
Int.d-29		D-a-49		HO	Et	H	5-1Idz	C		351 (M^++1)
Int.d-30		D-a-51		HO	Et	H	1Me-5-Idz	C		365 (M^++1)
Int.d-31		D-a-53		HO	Et	H	1Et-5-Idz	C		379 (M^++1)
Int.d-32		D-a-55		HO	Et	H	3-Qu	C		362 (M^++1)
Int.d-33		D-a-57		HO	Et	H	6-Qu	C		362 (M^++1)
Int.d-34		D-a-59		HO	Et	H	6-IQ	C		362 (M^++1)
Int.d-35		D-a-61		HO	Et	2-Nap	H	C		361 (M^++1)
Int.d-36		D-a-63		HO	Et	5-Ind	H	C		350 (M^++1)
Int.d-37		D-a-65		HO	Et	1Me-5-Ind	H	C		364 (M^++1)
Int.d-38		D-a-67		HO	Et	1Me-6-Ind	H	C		364 (M^++1)
Int.d-39		D-a-69		HO	Et	1Me-5-Idz	H	C		365 (M^++1)
Int.d-40		D-a-71		HO	Et	1Et-5-Idz	H	C		379 (M^++1)

[0495] [表203]

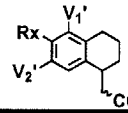


Table-D-a-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-1	4e-1	Int.d-4	BRA1	cPenO	Et	H	2-Nap	C		429 (M^++1)
D-a-2	1-a	D-a-1		cPenO	H	H	2-Nap	C		401 (M^++1)
D-a-3	4e-1	Int.d-4	BRA2	cPenO	Et	H	5-Ind	C		418 (M^++1)
D-a-4	1-a	D-a-3		cPenO	H	H	5-Ind	C		390 (M^++1)
D-a-5	4e-1	Int.d-4	BRA3	cPenO	Et	H	1Me-5-Ind	C		432 (M^++1)
D-a-6	1-a	D-a-5		cPenO	H	H	1Me-5-Ind	C		404 (M^++1)
D-a-7	4e-1	Int.d-4	BRA5	cPenO	Et	H	1Me-4-Ind	C		432 (M^++1)
D-a-8	1-a	D-a-7		cPenO	H	H	1Me-4-Ind	C		404 (M^++1)
D-a-9	4e-1	Int.d-4	BRA6	cPenO	Et	H	1Me-6-Ind	C		432 (M^++1)
D-a-10	1-a	D-a-9		cPenO	H	H	1Me-6-Ind	C		404 (M^++1)
D-a-11	4e-1	Int.d-4	BRA8	cPenO	Et	H	1Me-5-Idz	C		433 (M^++1)
D-a-12	1-a	D-a-11		cPenO	H	H	1Me-5-Idz	C		405 (M^++1)
D-a-13	4e-1	Int.d-4	BRA9	cPenO	Et	H	1Et-5-Idz	C		447 (M^++1)
D-a-14	1-a	D-a-13		cPenO	H	H	1Et-5-Idz	C		419 (M^++1)
D-a-15	4e-1	Int.d-4	BRA10	cPenO	Et	H	2Me-5-Idz	C		433 (M^++1)
D-a-16	1-a	D-a-15		cPenO	H	H	2Me-5-Idz	C		405 (M^++1)
D-a-17	4e-2	Int.d-4	Het2	cPenO	Et	H	3-Qu	C		430 (M^++1)
D-a-18	1-a	D-a-17		cPenO	H	H	3-Qu	C		402 (M^++1)
D-a-19	4e-2	Int.d-4	Het3	cPenO	Et	H	6-IQ	C		430 (M^++1)
D-a-20	1-a	D-a-19		cPenO	H	H	6-IQ	C		402 (M^++1)
D-a-21	4e-1	Int.d-5	BRA1	cPenO	Et	2-Nap	H	C		429 (M^++1)
D-a-22	1-a	D-a-21		cPenO	H	2-Nap	H	C		401 (M^++1)
D-a-23	4e-1	Int.d-5	BRA2	cPenO	Et	5-Ind	H	C		418 (M^++1)
D-a-24	1-a	D-a-23		cPenO	H	5-Ind	H	C		390 (M^++1)
D-a-25	4e-1	Int.d-5	BRA3	cPenO	Et	1Me-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
D-a-26	1-a	D-a-25		cPenO	H	1Me-5-Ind	H	C		404 (M^++1)
D-a-27	4e-1	Int.d-5	BRA6	cPenO	Et	1Me-6-Ind	H	C		432 (M^++1)
D-a-28	1-a	D-a-27		cPenO	H	1Me-6-Ind	H	C		404 (M^++1)
D-a-29	4e-1	Int.d-5	BRA7	cPenO	Et	5-1Idz	H	C		419 (M^++1)
D-a-30	1-a	D-a-29		cPenO	H	5-1Idz	H	C		391 (M^++1)
D-a-31	4e-1	Int.d-5	BRA8	cPenO	Et	1Me-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
D-a-32	1-a	D-a-31		cPenO	H	1Me-5-Idz	H	C		405 (M^++1)
D-a-33	4e-1	Int.d-5	BRA9	cPenO	Et	1Et-5-Idz	H	C		447 (M^++1)
D-a-34	1-a	D-a-33		cPenO	H	1Et-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
D-a-35	4e-1	Int.d-5	BRA11	cPenO	Et	5-BF	H	C		419 (M^++1)
D-a-36	1-a	D-a-35		cPenO	H	5-BF	H	C		391 (M^++1)
D-a-37	4e-1	Int.d-5	BRA13	cPenO	Et	6-Qu	H	C		430 (M^++1)
D-a-38	1-a	D-a-37		cPenO	H	6-Qu	H	C		402 (M^++1)
D-a-39	4e-1	Int.d-7	BRA1	BnO	Et	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
D-a-40	1-a	D-a-39		BnO	H	H	2-Nap	C		423 (M^++1)
D-a-41	4e-1	Int.d-7	BRA2	BnO	Et	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
D-a-42	1-a	D-a-41		BnO	H	H	5-Ind	C		412 (M^++1)
D-a-43	4e-1	Int.d-7	BRA3	BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
D-a-44	1-a	D-a-43		BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)

[0496] [表204]

Table-D-a-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-45	4e-1	Int.d-7	BRA4	BnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		454 (M^++1)
D-a-46	1-a	D-a-45		BnO	H	H	1Me-4-Ind	C		426 (M^++1)
D-a-47	4e-1	Int.d-7	BRA6	BnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		454 (M^++1)
D-a-48	1-a	D-a-47		BnO	H	H	1Me-6-Ind	C		426 (M^++1)
D-a-49	4e-1	Int.d-7	BRA7	BnO	Et	H	5-1Idz	C		441 (M^++1)
D-a-50	1-a	D-a-49		BnO	H	H	5-1Idz	C		413 (M^++1)
D-a-51	4e-1	Int.d-7	BRA8	BnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
D-a-52	1-a	D-a-51		BnO	H	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
D-a-53	4e-1	Int.d-7	BRA9	BnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		469 (M^++1)
D-a-54	1-a	D-a-53		BnO	H	H	1Et-5-Idz	C		441 (M^++1)
D-a-55	4e-1	Int.d-7	Het2	BnO	Et	H	3-Qu	C		452 (M^++1)
D-a-56	1-a	D-a-55		BnO	H	H	3-Qu	C		424 (M^++1)
D-a-57	4e-1	Int.d-7	BRA13	BnO	Et	H	6-Qu	C		452 (M^++1)
D-a-58	1-a	D-a-57		BnO	H	H	6-Qu	C		424 (M^++1)
D-a-59	4e-2	Int.d-7	Het3	BnO	Et	H	6-IQ	C		452 (M^++1)
D-a-60	1-a	D-a-59		BnO	H	H	6-IQ	C		424 (M^++1)
D-a-61	4e-1	Int.d-8	BRA1	BnO	Et	2-Nap	H	C		451 (M^++1)
D-a-62	1-a	D-a-61		BnO	H	2-Nap	H	C		423 (M^++1)
D-a-63	4e-1	Int.d-8	BRA2	BnO	Et	5-Ind	H	C		440 (M^++1)
D-a-64	1-a	D-a-63		BnO	H	5-Ind	H	C		412 (M^++1)
D-a-65	4e-1	Int.d-8	BRA3	BnO	Et	1Me-5-Ind	H	C		454 (M^++1)
D-a-66	1-a	D-a-65		BnO	H	1Me-5-Ind	H	C		426 (M^++1)
D-a-67	4e-1	Int.d-8	BRA6	BnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		454 (M^++1)
D-a-68	1-a	D-a-67		BnO	H	1Me-6-Ind	H	C		426 (M^++1)
D-a-69	4e-1	Int.d-8	BRA8	BnO	Et	1Me-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
D-a-70	1-a	D-a-69		BnO	H	1Me-5-Idz	H	C		427 (M^++1)
D-a-71	4e-1	Int.d-8	BRA9	BnO	Et	1Et-5-Idz	H	C		469 (M^++1)
D-a-72	1-a	D-a-71		BnO	H	1Et-5-Idz	H	C		441 (M^++1)
D-a-73	4e-1	Int.d-10	BRA1	cPenMeO	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
D-a-74	1-a	D-a-73		cPenMeO	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
D-a-75	4e-1	Int.d-10	BRA3	cPenMeO	Et	H	1Me-5-Ind	C		446 (M^++1)
D-a-76	1-a	D-a-75		cPenMeO	H	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
D-a-77	4e-1	Int.d-10	BRA8	cPenMeO	Et	H	1Me-5-Idz	C		447 (M^++1)
D-a-78	1-a	D-a-77		cPenMeO	H	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
D-a-79	4e-1	Int.d-11	BRA2	cPenMeO	Et	5-Ind	H	C		432 (M^++1)
D-a-80	1-a	D-a-79		cPenMeO	H	5-Ind	H	C		404 (M^++1)
D-a-81	4e-1	Int.d-11	BRA3	cPenMeO	Et	1Me-5-Ind	H	C		446 (M^++1)
D-a-82	1-a	D-a-81		cPenMeO	H	1Me-5-Ind	H	C		418 (M^++1)
D-a-83	4e-1	Int.d-11	BRA9	cPenMeO	Et	1Et-5-Idz	H	C		461 (M^++1)
D-a-84	1-a	D-a-83		cPenMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
D-a-85	4e-1	Int.d-13	BRA3	cHexMeO	Et	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
D-a-86	1-a	D-a-85		cHexMeO	H	H	1Me-5-Ind	C		432 (M^++1)
D-a-87	4e-1	Int.d-13	BRA9	cHexMeO	Et	H	1Et-5-Idz	C		475 (M^++1)
D-a-88	1-a	D-a-87		cHexMeO	H	H	1Et-5-Idz	C		447 (M^++1)
D-a-89	4e-1	Int.d-13	BRA13	cHexMeO	Et	H	6-Qu	C		458 (M^++1)
D-a-90	1-a	D-a-89		cHexMeO	H	H	6-Qu	C		430 (M^++1)
D-a-91	4e-2	Int.d-13	Het3	cHexMeO	Et	H	6-IQ	C		458 (M^++1)
D-a-92	1-a	D-a-91		cHexMeO	H	H	6-IQ	C		430 (M^++1)

[0497] [表205]

Table-D-a-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-93	4e-1	Int.d-14	BRA1	cHexMeO	Et	2-Nap	H	C		457 (M^++1)
D-a-94	1-a	D-a-93		cHexMeO	H	2-Nap	H	C		429 (M^++1)
D-a-95	4e-1	Int.d-14	BRA5	cHexMeO	Et	1Me-4-Ind	H	C		460 (M^++1)
D-a-96	1-a	D-a-95		cHexMeO	H	1Me-4-Ind	H	C		432 (M^++1)
D-a-97	4e-1	Int.d-14	BRA9	cHexMeO	Et	1Et-5-Idz	H	C		475 (M^++1)
D-a-98	1-a	D-a-97		cHexMeO	H	1Et-5-Idz	H	C		447 (M^++1)
D-a-99	4e-1	Int.d-16	BRA1	cHexO	Et	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
D-a-100	1-a	D-a-99		cHexO	H	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
D-a-101	4e-1	Int.d-16	BRA2	cHexO	Et	H	5-Ind	C		432 (M^++1)
D-a-102	1-a	D-a-101		cHexO	H	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
D-a-103	4e-1	Int.d-16	BRA4	cHexO	Et	H	1Et-5-Ind	C		460 (M^++1)
D-a-104	1-a	D-a-103		cHexO	H	H	1Et-5-Ind	C		432 (M^++1)
D-a-105	4e-1	Int.d-16	BRA7	cHexO	Et	H	5-1Idz	C		433 (M^++1)
D-a-106	1-a	D-a-105		cHexO	H	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
D-a-107	4e-1	Int.d-17	BRA2	cHexO	Et	5-Ind	H	C		432 (M^++1)
D-a-108	1-a	D-a-107		cHexO	H	5-Ind	H	C		404 (M^++1)
D-a-109	4e-1	Int.d-17	BRA3	cHexO	Et	1Me-5-Ind	H	C		446 (M^++1)
D-a-110	1-a	D-a-109		cHexO	H	1Me-5-Ind	H	C		418 (M^++1)
D-a-111	4e-1	Int.d-17	BRA8	cHexO	Et	1Me-5-Idz	H	C		447 (M^++1)
D-a-112	1-a	D-a-111		cHexO	H	1Me-5-Idz	H	C		419 (M^++1)
D-a-113	4e-1	Int.d-17	BRA9	cHexO	Et	1Et-5-Idz	H	C		461 (M^++1)
D-a-114	1-a	D-a-113		cHexO	H	1Et-5-Idz	H	C		433 (M^++1)
D-a-115	4e-1	Int.d-19	BRA3	nPrO	Et	H	1Me-5-Ind	C		406 (M^++1)
D-a-116	1-a	D-a-115		nPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		378 (M^++1)
D-a-117	4e-1	Int.d-19	BRA4	nPrO	Et	H	1Et-5-Ind	C		420 (M^++1)
D-a-118	1-a	D-a-117		nPrO	H	H	1Et-5-Ind	C		392 (M^++1)
D-a-119	4e-1	Int.d-19	BRA7	nPrO	Et	H	5-1Idz	C		393 (M^++1)
D-a-120	1-a	D-a-119		nPrO	H	H	5-1Idz	C		365 (M^++1)
D-a-121	4e-1	Int.d-20	BRA1	nPrO	Et	2-Nap	H	C		403 (M^++1)
D-a-122	1-a	D-a-121		nPrO	H	2-Nap	H	C		375 (M^++1)
D-a-123	4e-1	Int.d-20	BRA4	nPrO	Et	1Et-5-Ind	H	C		420 (M^++1)
D-a-124	1-a	D-a-123		nPrO	H	1Et-5-Ind	H	C		392 (M^++1)
D-a-125	4e-1	Int.d-20	BRA7	nPrO	Et	5-1Idz	H	C		393 (M^++1)
D-a-126	1-a	D-a-125		nPrO	H	5-1Idz	H	C		365 (M^++1)
D-a-127	4e-1	Int.d-22	BRA1	iPrO	Et	H	2-Nap	C		403 (M^++1)
D-a-128	1-a	D-a-127		iPrO	H	H	2-Nap	C		375 (M^++1)
D-a-129	4e-1	Int.d-22	BRA3	iPrO	Et	H	1Me-5-Ind	C		406 (M^++1)
D-a-130	1-a	D-a-129		iPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		378 (M^++1)
D-a-131	4e-1	Int.d-22	BRA7	iPrO	Et	H	5-1Idz	C		393 (M^++1)
D-a-132	1-a	D-a-131		iPrO	H	H	5-1Idz	C		365 (M^++1)
D-a-133	4e-1	Int.d-22	BRA9	iPrO	Et	H	1Et-5-Idz	C		421 (M^++1)
D-a-134	1-a	D-a-133		iPrO	H	H	1Et-5-Idz	C		393 (M^++1)
D-a-135	4e-1	Int.d-22	BRA13	iPrO	Et	H	6-Qu	C		404 (M^++1)
D-a-136	1-a	D-a-135		iPrO	H	H	6-Qu	C		376 (M^++1)
D-a-137	4e-1	Int.d-23	BRA1	iPrO	Et	2-Nap	H	C		403 (M^++1)
D-a-138	1-a	D-a-137		iPrO	H	2-Nap	H	C		375 (M^++1)
D-a-139	4e-1	Int.d-23	BRA8	iPrO	Et	1Me-5-Idz	H	C		407 (M^++1)
D-a-140	1-a	D-a-139		iPrO	H	1Me-5-Idz	H	C		379 (M^++1)

[0498] [表206]

Table-D-a-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-141	4f-2	Int.d-24	Al4	cHepO	Et	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
D-a-142	1-a	D-a-141		cHepO	H	H	2-Nap	C		429 (M^++1)
D-a-143	4f-2	Int.d-25	Al4	cHepO	Et	H	5-Ind	C		446 (M^++1)
D-a-144	1-a	D-a-143		cHepO	H	H	5-Ind	C		418 (M^++1)
D-a-145	4f-2	Int.d-27	Al4	cHepO	Et	H	1Me-4-Ind	C		460 (M^++1)
D-a-146	1-a	D-a-145		cHepO	H	H	1Me-4-Ind	C		432 (M^++1)
D-a-147	4f-2	Int.d-30	Al4	cHepO	Et	H	1Me-5-Idz	C		461 (M^++1)
D-a-148	1-a	D-a-147		cHepO	H	H	1Me-5-Idz	C		433 (M^++1)
D-a-149	4f-2	Int.d-32	Al4	cHepO	Et	H	3-Qu	C		458 (M^++1)
D-a-150	1-a	D-a-149		cHepO	H	H	3-Qu	C		430 (M^++1)
D-a-151	4f-2	Int.d-35	Al4	cHepO	Et	2-Nap	H	C		457 (M^++1)
D-a-152	1-a	D-a-151		cHepO	H	2-Nap	H	C		429 (M^++1)
D-a-153	4f-2	Int.d-37	Al4	cHepO	Et	1Me-5-Ind	H	C		460 (M^++1)
D-a-154	1-a	D-a-153		cHepO	H	1Me-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
D-a-155	4f-2	Int.d-38	Al4	cHepO	Et	1Me-6-Ind	H	C		460 (M^++1)
D-a-156	1-a	D-a-155		cHepO	H	1Me-6-Ind	H	C		432 (M^++1)
D-a-157	4f-1	Int.d-24	Hal5	nBuO	Et	H	2-Nap	C		417 (M^++1)
D-a-158	1-a	D-a-157		nBuO	H	H	2-Nap	C		389 (M^++1)
D-a-159	4f-1	Int.d-26	Hal5	nBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		420 (M^++1)
D-a-160	1-a	D-a-159		nBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		392 (M^++1)
D-a-161	4f-1	Int.d-28	Hal5	nBuO	Et	H	1Me-6-Ind	C		420 (M^++1)
D-a-162	1-a	D-a-161		nBuO	H	H	1Me-6-Ind	C		392 (M^++1)
D-a-163	4f-1	Int.d-29	Hal5	nBuO	Et	H	5-1Idz	C		407 (M^++1)
D-a-164	1-a	D-a-163		nBuO	H	H	5-1Idz	C		379 (M^++1)
D-a-165	4f-1	Int.d-31	Hal5	nBuO	Et	H	1Et-5-Idz	C		435 (M^++1)
D-a-166	1-a	D-a-165		nBuO	H	H	1Et-5-Idz	C		407 (M^++1)
D-a-167	4f-1	Int.d-36	Hal5	nBuO	Et	5-Ind	H	C		406 (M^++1)
D-a-168	1-a	D-a-167		nBuO	H	5-Ind	H	C		378 (M^++1)
D-a-169	4f-1	Int.d-37	Hal5	nBuO	Et	1Me-5-Ind	H	C		420 (M^++1)
D-a-170	1-a	D-a-169		nBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		392 (M^++1)
D-a-171	4f-1	Int.d-39	Hal5	nBuO	Et	1Me-5-Idz	H	C		421 (M^++1)
D-a-172	1-a	D-a-171		nBuO	H	1Me-5-Idz	H	C		393 (M^++1)
D-a-173	4f-1	Int.d-24	Hal6	iBuO	Et	H	2-Nap	C		417 (M^++1)
D-a-174	1-a	D-a-173		iBuO	H	H	2-Nap	C		389 (M^++1)
D-a-175	4f-1	Int.d-25	Hal6	iBuO	Et	H	5-Ind	C		406 (M^++1)
D-a-176	1-a	D-a-175		iBuO	H	H	5-Ind	C		378 (M^++1)
D-a-177	4f-1	Int.d-26	Hal6	iBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		420 (M^++1)
D-a-178	1-a	D-a-177		iBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		392 (M^++1)
D-a-179	4f-1	Int.d-31	Hal6	iBuO	Et	H	1Et-5-Idz	C		435 (M^++1)
D-a-180	1-a	D-a-179		iBuO	H	H	1Et-5-Idz	C		407 (M^++1)
D-a-181	4f-1	Int.d-36	Hal6	iBuO	Et	5-Ind	H	C		406 (M^++1)
D-a-182	1-a	D-a-181		iBuO	H	5-Ind	H	C		378 (M^++1)
D-a-183	4f-1	Int.d-37	Hal6	iBuO	Et	1Me-5-Ind	H	C		420 (M^++1)
D-a-184	1-a	D-a-183		iBuO	H	1Me-5-Ind	H	C		392 (M^++1)
D-a-185	4f-1	Int.d-40	Hal6	iBuO	Et	1Et-5-Idz	H	C		435 (M^++1)
D-a-186	1-a	D-a-185		iBuO	H	1Et-5-Idz	H	C		407 (M^++1)
D-a-187	4f-1	Int.d-25	Hal7	2FBnO	Et	H	5-Ind	C		458 (M^++1)
D-a-188	1-a	D-a-187		2FBnO	H	H	5-Ind	C		430 (M^++1)

[0499] [表207]

Table-D-a-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-189	4f-1	Int.d-27	Hal7	2FBnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		472 (M^++1)
D-a-190	1-a	D-a-189		2FBnO	H	H	1Me-4-Ind	C		444 (M^++1)
D-a-191	4f-1	Int.d-28	Hal7	2FBnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		472 (M^++1)
D-a-192	1-a	D-a-191		2FBnO	H	H	1Me-6-Ind	C		444 (M^++1)
D-a-193	4f-1	Int.d-31	Hal7	2FBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		487 (M^++1)
D-a-194	1-a	D-a-193		2FBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		459 (M^++1)
D-a-195	4f-1	Int.d-34	Hal7	2FBnO	Et	H	6-IQ	C		470 (M^++1)
D-a-196	1-a	D-a-195		2FBnO	H	H	6-IQ	C		442 (M^++1)
D-a-197	4f-1	Int.d-35	Hal7	2FBnO	Et	2-Nap	H	C		469 (M^++1)
D-a-198	1-a	D-a-197		2FBnO	H	2-Nap	H	C		441 (M^++1)
D-a-199	4f-1	Int.d-37	Hal7	2FBnO	Et	1Me-5-Ind	H	C		472 (M^++1)
D-a-200	1-a	D-a-199		2FBnO	H	1Me-5-Ind	H	C		444 (M^++1)
D-a-201	4f-1	Int.d-40	Hal7	2FBnO	Et	1Et-5-Idz	H	C		487 (M^++1)
D-a-202	1-a	D-a-201		2FBnO	H	1Et-5-Idz	H	C		459 (M^++1)
D-a-203	4f-1	Int.d-24	Hal9	4FBnO	Et	H	2-Nap	C		469 (M^++1)
D-a-204	1-a	D-a-203		4FBnO	H	H	2-Nap	C		441 (M^++1)
D-a-205	4f-1	Int.d-26	Hal9	4FBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		472 (M^++1)
D-a-206	1-a	D-a-205		4FBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		444 (M^++1)
D-a-207	4f-1	Int.d-29	Hal9	4FBnO	Et	H	5-1Idz	C		459 (M^++1)
D-a-208	1-a	D-a-207		4FBnO	H	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
D-a-209	4f-1	Int.d-37	Hal9	4FBnO	Et	1Me-5-Ind	H	C		472 (M^++1)
D-a-210	1-a	D-a-209		4FBnO	H	1Me-5-Ind	H	C		444 (M^++1)
D-a-211	4f-1	Int.d-38	Hal9	4FBnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		472 (M^++1)
D-a-212	1-a	D-a-211		4FBnO	H	1Me-6-Ind	H	C		444 (M^++1)
D-a-213	4f-1	Int.d-40	Hal9	4FBnO	Et	1Et-5-Idz	H	C		487 (M^++1)
D-a-214	1-a	D-a-213		4FBnO	H	1Et-5-Idz	H	C		459 (M^++1)
D-a-215	4f-1	Int.d-24	Hal11	3ClBnO	Et	H	2-Nap	C		485 (M^++1)
D-a-216	1-a	D-a-215		3ClBnO	H	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
D-a-217	4f-1	Int.d-26	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		488 (M^++1)
D-a-218	1-a	D-a-217		3ClBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
D-a-219	4f-1	Int.d-29	Hal11	3ClBnO	Et	H	5-1Idz	C		475 (M^++1)
D-a-220	1-a	D-a-219		3ClBnO	H	H	5-1Idz	C		447 (M^++1)
D-a-221	4f-1	Int.d-37	Hal11	3ClBnO	Et	1Me-5-Ind	H	C		488 (M^++1)
D-a-222	1-a	D-a-221		3ClBnO	H	1Me-5-Ind	H	C		460 (M^++1)
D-a-223	4f-1	Int.d-38	Hal11	3ClBnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		488 (M^++1)
D-a-224	1-a	D-a-223		3ClBnO	H	1Me-6-Ind	H	C		460 (M^++1)
D-a-225	4f-1	Int.d-40	Hal11	3ClBnO	Et	1Et-5-Idz	H	C		503 (M^++1)
D-a-226	1-a	D-a-225		3ClBnO	H	1Et-5-Idz	H	C		475 (M^++1)
D-a-227	4f-1	Int.d-25	Hal12	4MeBnO	Et	H	5-Ind	C		454 (M^++1)
D-a-228	1-a	D-a-227		4MeBnO	H	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
D-a-229	4f-1	Int.d-27	Hal12	4MeBnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		468 (M^++1)
D-a-230	1-a	D-a-229		4MeBnO	H	H	1Me-4-Ind	C		440 (M^++1)
D-a-231	4f-1	Int.d-30	Hal12	4MeBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		469 (M^++1)
D-a-232	1-a	D-a-231		4MeBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
D-a-233	4f-1	Int.d-35	Hal12	4MeBnO	Et	2-Nap	H	C		465 (M^++1)
D-a-234	1-a	D-a-233		4MeBnO	H	2-Nap	H	C		437 (M^++1)
D-a-235	4f-1	Int.d-38	Hal12	4MeBnO	Et	1Me-6-Ind	H	C		468 (M^++1)
D-a-236	1-a	D-a-235		4MeBnO	H	1Me-6-Ind	H	C		440 (M^++1)

[0500] [表208]

Table-D-a-6

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-237	4f-2	Int.d-24	AI11	4Me,cHexO	Et	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
D-a-238	1-a	D-a-237		4Me,cHexO	H	H	2-Nap	C		429 (M^++1)
D-a-239	4f-2	Int.d-28	AI11	4Me,cHexO	Et	H	1Me-6-Ind	C		460 (M^++1)
D-a-240	1-a	D-a-239		4Me,cHexO	H	H	1Me-6-Ind	C		432 (M^++1)
D-a-241	4f-2	Int.d-30	AI11	4Me,cHexO	Et	H	1Me-5-Idz	C		461 (M^++1)
D-a-242	1-a	D-a-241		4Me,cHexO	H	H	1Me-5-Idz	C		433 (M^++1)
D-a-243	4f-2	Int.d-32	AI11	4Me,cHexO	Et	H	3-Qu	C		458 (M^++1)
D-a-244	1-a	D-a-243		4Me,cHexO	H	H	3-Qu	C		430 (M^++1)
D-a-245	4f-2	Int.d-36	AI11	4Me,cHexO	Et	5-Ind	H	C		446 (M^++1)
D-a-246	1-a	D-a-245		4Me,cHexO	H	5-Ind	H	C		418 (M^++1)
D-a-247	4f-2	Int.d-37	AI11	4Me,cHexO	Et	1Me-5-Ind	H	C		460 (M^++1)
D-a-248	1-a	D-a-247		4Me,cHexO	H	1Me-5-Ind	H	C		432 (M^++1)
D-a-249	4f-2	Int.d-24	AI6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		508 (M^++1)
D-a-250	1-a	D-a-249		2(4DMAPh)EtO	H	H	2-Nap	C		480 (M^++1)
D-a-251	4f-2	Int.d-25	AI6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		497 (M^++1)
D-a-252	1-a	D-a-251		2(4DMAPh)EtO	H	H	5-Ind	C		469 (M^++1)
D-a-253	4f-2	Int.d-29	AI6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	5-1Idz	C		498 (M^++1)
D-a-254	1-a	D-a-253		2(4DMAPh)EtO	H	H	5-1Idz	C		470 (M^++1)
D-a-255	4f-2	Int.d-34	AI6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	6-IQ	C		509 (M^++1)
D-a-256	1-a	D-a-255		2(4DMAPh)EtO	H	H	6-IQ	C		481 (M^++1)
D-a-257	4f-2	Int.d-35	AI6	2(4DMAPh)EtO	Et	2-Nap	H	C		508 (M^++1)
D-a-258	1-a	D-a-257		2(4DMAPh)EtO	H	2-Nap	H	C		480 (M^++1)
D-a-259	4f-2	Int.d-36	AI6	2(4DMAPh)EtO	Et	5-Ind	H	C		497 (M^++1)
D-a-260	1-a	D-a-259		2(4DMAPh)EtO	H	5-Ind	H	C		469 (M^++1)
D-a-261	4f-2	Int.d-39	AI6	2(4DMAPh)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		512 (M^++1)
D-a-262	1-a	D-a-261		2(4DMAPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		484 (M^++1)
D-a-263	4f-2	Int.d-24	AI8	1PhEtO	Et	H	2-Nap	C		465 (M^++1)
D-a-264	1-a	D-a-263		1PhEtO	H	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
D-a-265	4f-2	Int.d-26	AI8	1PhEtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		468 (M^++1)
D-a-266	1-a	D-a-265		1PhEtO	H	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
D-a-267	4f-2	Int.d-28	AI8	1PhEtO	Et	H	1Me-6-Ind	C		468 (M^++1)
D-a-268	1-a	D-a-267		1PhEtO	H	H	1Me-6-Ind	C		440 (M^++1)
D-a-269	4f-2	Int.d-31	AI8	1PhEtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		483 (M^++1)
D-a-270	1-a	D-a-269		1PhEtO	H	H	1Et-5-Idz	C		455 (M^++1)
D-a-271	4f-2	Int.d-33	AI8	1PhEtO	Et	H	6-Qu	C		466 (M^++1)
D-a-272	1-a	D-a-271		1PhEtO	H	H	6-Qu	C		438 (M^++1)
D-a-273	4f-2	Int.d-36	AI8	1PhEtO	Et	5-Ind	H	C		454 (M^++1)
D-a-274	1-a	D-a-273		1PhEtO	H	5-Ind	H	C		426 (M^++1)
D-a-275	4f-2	Int.d-40	AI8	1PhEtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		483 (M^++1)
D-a-276	1-a	D-a-275		1PhEtO	H	1Et-5-Idz	H	C		455 (M^++1)
D-a-277	4f-2	Int.d-24	AI9	1(2FPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		483 (M^++1)
D-a-278	1-a	D-a-277		1(2FPh)EtO	H	H	2-Nap	C		455 (M^++1)
D-a-279	4f-2	Int.d-25	AI9	1(2FPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		472 (M^++1)
D-a-280	1-a	D-a-279		1(2FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		444 (M^++1)
D-a-281	4f-2	Int.d-31	AI9	1(2FPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		501 (M^++1)
D-a-282	1-a	D-a-281		1(2FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		473 (M^++1)
D-a-283	4f-2	Int.d-35	AI9	1(2FPh)EtO	Et	2-Nap	H	C		483 (M^++1)
D-a-284	1-a	D-a-283		1(2FPh)EtO	H	2-Nap	H	C		455 (M^++1)

[0501] [表209]

Table-D-a-7

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-285	4f-2	Int.d-24	Al17	1IndanO	Et	H	2-Nap	C		477 (M^++1)
D-a-286	1-a	D-a-285		1IndanO	H	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
D-a-287	4f-2	Int.d-25	Al17	1IndanO	Et	H	5-Ind	C		466 (M^++1)
D-a-288	1-a	D-a-287		1IndanO	H	H	5-Ind	C		438 (M^++1)
D-a-289	4f-2	Int.d-26	Al17	1IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		480 (M^++1)
D-a-290	1-a	D-a-289		1IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		452 (M^++1)
D-a-291	4f-2	Int.d-30	Al17	1IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		481 (M^++1)
D-a-292	1-a	D-a-291		1IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		453 (M^++1)
D-a-293	4f-2	Int.d-31	Al17	1IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		495 (M^++1)
D-a-294	1-a	D-a-293		1IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		467 (M^++1)
D-a-295	4f-2	Int.d-35	Al17	1IndanO	Et	2-Nap	H	C		477 (M^++1)
D-a-296	1-a	D-a-295		1IndanO	H	2-Nap	H	C		449 (M^++1)
D-a-297	4f-2	Int.d-39	Al17	1IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		481 (M^++1)
D-a-298	1-a	D-a-297		1IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		453 (M^++1)
D-a-299	4f-2	Int.d-24	Al18	2IndanO	Et	H	2-Nap	C		477 (M^++1)
D-a-300	1-a	D-a-299		2IndanO	H	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
D-a-301	4f-2	Int.d-26	Al18	2IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		480 (M^++1)
D-a-302	1-a	D-a-301		2IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		452 (M^++1)
D-a-303	4f-2	Int.d-29	Al18	2IndanO	Et	H	5-1Idz	C		467 (M^++1)
D-a-304	1-a	D-a-303		2IndanO	H	H	5-1Idz	C		439 (M^++1)
D-a-305	4f-2	Int.d-30	Al18	2IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		481 (M^++1)
D-a-306	1-a	D-a-305		2IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		453 (M^++1)
D-a-307	4f-2	Int.d-35	Al18	2IndanO	Et	2-Nap	H	C		477 (M^++1)
D-a-308	1-a	D-a-307		2IndanO	H	2-Nap	H	C		449 (M^++1)
D-a-309	4f-2	Int.d-37	Al18	2IndanO	Et	1Me-5-Ind	H	C		480 (M^++1)
D-a-310	1-a	D-a-309		2IndanO	H	1Me-5-Ind	H	C		452 (M^++1)
D-a-311	4f-2	Int.d-40	Al18	2IndanO	Et	1Et-5-Idz	H	C		495 (M^++1)
D-a-312	1-a	D-a-311		2IndanO	H	1Et-5-Idz	H	C		467 (M^++1)
D-a-313	4f-2	Int.d-25	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	H	5-Ind	C		496 (M^++1)
D-a-314	1-a	D-a-313		5OMe-2-IndanO	H	H	5-Ind	C		468 (M^++1)
D-a-315	4f-2	Int.d-26	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		510 (M^++1)
D-a-316	1-a	D-a-315		5OMe-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
D-a-317	4f-2	Int.d-30	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		511 (M^++1)
D-a-318	1-a	D-a-317		5OMe-2-IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		483 (M^++1)
D-a-319	4f-2	Int.d-31	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		525 (M^++1)
D-a-320	1-a	D-a-319		5OMe-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		497 (M^++1)
D-a-321	4f-2	Int.d-35	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	2-Nap	H	C		507 (M^++1)
D-a-322	1-a	D-a-321		5OMe-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		479 (M^++1)
D-a-323	4f-2	Int.d-39	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	1Me-5-Idz	H	C		511 (M^++1)
D-a-324	1-a	D-a-323		5OMe-2-IndanO	H	1Me-5-Idz	H	C		483 (M^++1)
D-a-325	4f-2	Int.d-25	Al21	5F-2-IndanO	Et	H	5-Ind	C		484 (M^++1)
D-a-326	1-a	D-a-325		5F-2-IndanO	H	H	5-Ind	C		456 (M^++1)
D-a-327	4f-2	Int.d-26	Al21	5F-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		498 (M^++1)
D-a-328	1-a	D-a-327		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		470 (M^++1)
D-a-329	4f-2	Int.d-31	Al21	5F-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		513 (M^++1)
D-a-330	1-a	D-a-329		5F-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		485 (M^++1)
D-a-331	4f-2	Int.d-35	Al21	5F-2-IndanO	Et	2-Nap	H	C		495 (M^++1)
D-a-332	1-a	D-a-331		5F-2-IndanO	H	2-Nap	H	C		467 (M^++1)

[0502] [表210]

Table-D-a-8

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-333	4f-2	Int.d-24	Al22		Et	H	2-Nap	C		491 (M^++1)
D-a-334	1-a	D-a-333			H	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
D-a-335	4f-2	Int.d-25	Al22		Et	H	5-Ind	C		480 (M^++1)
D-a-336	1-a	D-a-335			H	H	5-Ind	C		452 (M^++1)
D-a-337	4f-2	Int.d-26	Al22		Et	H	1Me-5-Ind	C		494 (M^++1)
D-a-338	1-a	D-a-337			H	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
D-a-339	4f-2	Int.d-30	Al22		Et	H	1Me-5-Idz	C		495 (M^++1)
D-a-340	1-a	D-a-339			H	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
D-a-341	4f-2	Int.d-35	Al22		Et	2-Nap	H	C		491 (M^++1)
D-a-342	1-a	D-a-341			H	2-Nap	H	C		463 (M^++1)
D-a-343	4f-2	Int.d-37	Al22		Et	1Me-5-Ind	H	C		494 (M^++1)
D-a-344	1-a	D-a-343			H	1Me-5-Ind	H	C		466 (M^++1)
D-a-345	4f-2	Int.d-40	Al22		Et	1Et-5-Idz	H	C		509 (M^++1)
D-a-346	1-a	D-a-345			H	1Et-5-Idz	H	C		481 (M^++1)
D-a-347	4f-2	Int.d-24	Al23		Et	H	2-Nap	C		491 (M^++1)
D-a-348	1-a	D-a-347			H	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
D-a-349	4f-2	Int.d-26	Al23		Et	H	1Me-5-Ind	C		494 (M^++1)
D-a-350	1-a	D-a-349			H	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
D-a-351	4f-2	Int.d-29	Al23		Et	H	5-1Idz	C		481 (M^++1)
D-a-352	1-a	D-a-351			H	H	5-1Idz	C		453 (M^++1)
D-a-353	4f-2	Int.d-35	Al23		Et	2-Nap	H	C		491 (M^++1)
D-a-354	1-a	D-a-353			H	2-Nap	H	C		463 (M^++1)
D-a-355	4f-2	Int.d-36	Al23		Et	5-Ind	H	C		480 (M^++1)
D-a-356	1-a	D-a-355			H	5-Ind	H	C		452 (M^++1)

[0503] [表211]

Table-D-a-9

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-357	4f-2	Int.d-37	AI23		Et	1Me-5-Ind	H	C		494 (M^++1)
D-a-358	1-a	D-a-357			H	1Me-5-Ind	H	C		466 (M^++1)
D-a-359	4f-2	Int.d-24	AI24	2(2MePh)EtO	Et	H	2-Nap	C		479 (M^++1)
D-a-360	1-a	D-a-359		2(2MePh)EtO	H	H	2-Nap	C		451 (M^++1)
D-a-361	4f-2	Int.d-26	AI24	2(2MePh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
D-a-362	1-a	D-a-361		2(2MePh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
D-a-363	4f-2	Int.d-30	AI24	2(2MePh)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		483 (M^++1)
D-a-364	1-a	D-a-363		2(2MePh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
D-a-365	4f-2	Int.d-31	AI24	2(2MePh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		497 (M^++1)
D-a-366	1-a	D-a-365		2(2MePh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		469 (M^++1)
D-a-367	4f-2	Int.d-35	AI24	2(2MePh)EtO	Et	2-Nap	H	C		479 (M^++1)
D-a-368	1-a	D-a-367		2(2MePh)EtO	H	2-Nap	H	C		451 (M^++1)
D-a-369	4f-2	Int.d-36	AI24	2(2MePh)EtO	Et	5-Ind	H	C		468 (M^++1)
D-a-370	1-a	D-a-369		2(2MePh)EtO	H	5-Ind	H	C		440 (M^++1)
D-a-371	4f-2	Int.d-25	AI25	2(3FPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		472 (M^++1)
D-a-372	1-a	D-a-371		2(3FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		444 (M^++1)
D-a-373	4f-2	Int.d-29	AI25	2(3FPh)EtO	Et	H	5-1Idz	C		473 (M^++1)
D-a-374	1-a	D-a-373		2(3FPh)EtO	H	H	5-1Idz	C		445 (M^++1)
D-a-375	4f-2	Int.d-31	AI25	2(3FPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		501 (M^++1)
D-a-376	1-a	D-a-375		2(3FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		473 (M^++1)
D-a-377	4f-2	Int.d-35	AI25	2(3FPh)EtO	Et	2-Nap	H	C		483 (M^++1)
D-a-378	1-a	D-a-377		2(3FPh)EtO	H	2-Nap	H	C		455 (M^++1)
D-a-379	4f-2	Int.d-36	AI25	2(3FPh)EtO	Et	5-Ind	H	C		472 (M^++1)
D-a-380	1-a	D-a-379		2(3FPh)EtO	H	5-Ind	H	C		444 (M^++1)
D-a-381	4f-2	Int.d-39	AI25	2(3FPh)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		487 (M^++1)
D-a-382	1-a	D-a-381		2(3FPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		459 (M^++1)
D-a-383	4f-2	Int.d-24	AI26	2(2ClPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		500 (M^++1)
D-a-384	1-a	D-a-383		2(2ClPh)EtO	H	H	2-Nap	C		471 (M^++1)
D-a-385	4f-2	Int.d-26	AI26	2(2ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		503 (M^++1)
D-a-386	1-a	D-a-385		2(2ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		474 (M^++1)
D-a-387	4f-2	Int.d-30	AI26	2(2ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		504 (M^++1)
D-a-388	1-a	D-a-387		2(2ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		475 (M^++1)
D-a-389	4f-2	Int.d-31	AI26	2(2ClPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		518 (M^++1)
D-a-390	1-a	D-a-389		2(2ClPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		490 (M^++1)
D-a-391	4f-2	Int.d-37	AI26	2(2ClPh)EtO	Et	1Me-5-Ind	H	C		503 (M^++1)
D-a-392	1-a	D-a-391		2(2ClPh)EtO	H	1Me-5-Ind	H	C		474 (M^++1)
D-a-393	4f-2	Int.d-39	AI26	2(2ClPh)EtO	Et	1Me-5-Idz	H	C		504 (M^++1)
D-a-394	1-a	D-a-393		2(2ClPh)EtO	H	1Me-5-Idz	H	C		475 (M^++1)
D-a-395	4f-2	Int.d-24	AI28	2(1-Nap)EtO	Et	H	2-Nap	C		515 (M^++1)
D-a-396	1-a	D-a-395		2(1-Nap)EtO	H	H	2-Nap	C		487 (M^++1)
D-a-397	4f-2	Int.d-25	AI28	2(1-Nap)EtO	Et	H	5-Ind	C		504 (M^++1)

[0504] [表212]

Table-D-a-10

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-a-398	1-a	D-a-397		2(1-Nap)EtO	H	H	5-Ind	C		476 (M^++1)
D-a-399	4f-2	Int.d-26	AI28	2(1-Nap)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		518 (M^++1)
D-a-400	1-a	D-a-399		2(1-Nap)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		490 (M^++1)
D-a-401	4f-2	Int.d-35	AI28	2(1-Nap)EtO	Et	2-Nap	H	C		515 (M^++1)
D-a-402	1-a	D-a-401		2(1-Nap)EtO	H	2-Nap	H	C		487 (M^++1)
D-a-403	4f-2	Int.d-36	AI28	2(1-Nap)EtO	Et	5-Ind	H	C		504 (M^++1)
D-a-404	1-a	D-a-403		2(1-Nap)EtO	H	5-Ind	H	C		476 (M^++1)
D-a-405	4f-2	Int.d-40	AI28	2(1-Nap)EtO	Et	1Et-5-Idz	H	C		533 (M^++1)
D-a-406	1-a	D-a-405		2(1-Nap)EtO	H	1Et-5-Idz	H	C		505 (M^++1)

[0505] 参考例20

2－[3－(シクロペンチルオキシ)フェニル]酢酸シクロプロピル(中間体e－1)の合成(製造法14工程f－1)

参考例2の中間体A－5の合成法(製造法14工程f－1)に記載の手順に従って、3－ヒドロキシフェニル酢酸(5．00g、TCI)、シクロペンチルブロミド(2．37ml、TCI)、炭酸カリウム(11．35g)を反応させ処理することで標記化合物(中間体e－1;8．00g)を得た。Mass(LCMS):289(M^++1)、保持時間;5．83分(溶出条件:B)。

2－[3－(シクロペンチルオキシ)フェニル]酢酸(中間体e－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って中間体e－1(8．00g)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(55．5ml)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体e－2;6．10g)を得た(但し反応はTHF(55ml)－メタノール(55ml)の混合溶媒中、室温にて1時間行った)。Mass(LCMS):219(M^-－1)、保持時間;4．04分(溶出条件:B)。

[0506] 2－[5－(シクロペンチルオキシ)－2－ヨードフェニル]酢酸(中間体e－3)の合成

文献[Oliveraら、ジャーナル オブ オーガニック ケミストリー(Journal of Organic Chemistry)7215頁、2002年]に記載の手順に従って、中間体e－2(6．00g)の酢酸溶液(120ml)に1塩化ヨウ素(6．63g、WAKO)の酢酸溶液(40ml)室温にて30分かけて滴下し、2時間攪拌した。水(80ml)を加えた後、2亜硫酸ナトリウムを徐々に加え、溶液が黄色に変わった後、水(150ml)を加えた。酢酸エチル(250ml×2)で抽出後、有機層を飽和食塩水で洗浄、乾燥し、減圧濃縮することで標記化合物(中間体e－3;7．79g)を得た。Mass(LCMS):345(M^-－1)、保持時間;4．79分(溶出条件:B)。

2－[5－(シクロペンチルオキシ)－2－ヨードフェニル]－N－メチルオキシ－N－アセトアミド(中間体e－4)の合成

中間体e－3(7．73g)のジクロロメタン(200ml)溶液にN，O－ジメチルヒドロキシアミン1塩酸塩(4．35g、WAKO)、1－ヒドロキシ－7－アザベンゾトリアゾール(6．08g、渡邊化学社製)、水溶性カルボジイミド1塩酸塩(8．56g、渡邊化学社製)、トリエ

チルアミン(18．58ml)を順次加え、1時間攪拌した。ジクロロメタン(100ml)を加え抽出し、有機層を10%クエン酸、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄、乾燥し、減圧濃縮することで標記化合物(中間体e－4;8．36g)を得た。Mass(LCMS):390(M^++1)、保持時間;5．18分(溶出条件:B)。

[0507] 4－シクロペンチルオキシ－シクロブチルベンゼン－1(2H)－オン(中間体e－5)の合成

文献[Aidhenら、テトラヘドロン レターズ(Tetrahedron Letters)5431頁、1992年]に記載の手順に従って、中間体e－4(8．30g)のTHF(60ml)溶液に窒素雰囲気下、－78℃にてターシャリーブチルリチウム(36．51ml、Ald)を15分かけて滴下し、そのまま8時間攪拌した。－10℃に昇温後、飽和塩化アンモニウム水溶液(150ml)を加えた後、ジクロロメタン(300ml×2)にて抽出し、有機層を乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝2:1)で精製し、標記化合物(中間体e－5;1．00g)を得た。Mass(LCMS):203(M^++1)、保持時間;4．70分(溶出条件:B)。

2－(4－シクロペンチルオキシ－シクロブチルベンゼン－1(2H)－イリデン)酢酸エチル(中間体e－6)の合成(製造法9工程k－3)

ジエチルホスホノ酢酸エチル(25ml、TCI)のDME溶液に氷冷下、水素化ナトリウム(0．78g、WAKO)を加え10分間攪拌した後、中間体e－5(989mg)のDME溶液(50ml)を滴下した。室温にて2時間攪拌した後、氷冷下塩化アンモニウム水溶液(75ml)を加えた。水(25ml)を加え、酢酸エチル(150ml×2)にて抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄、洗浄、乾燥し、有機層を乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル＝3:1)で精製し、標記化合物(中間体e－6;772．1mg)を得た。Mass(LCMS):273(M^++1)、保持時間;6．00分(溶出条件:B)。

[0508] 2－(4－シクロペンチルオキシ－1，2－ジヒドロシクロブチルベンゼン－1－イル)酢酸エチル(中間体e－7)の合成(製造法9工程j)

参考例1の中間体a－3の合成法(製造法9工程j)に記載の手順に従って、中間体e－6(387．1mg)、10%パラジウム炭素(100mg、Merck社製)を反応、処理させる

ことで標記化合物(中間体e－7;325．3mg)を得た。Mass(LCMS):275(M^++1)、保持時間;5．69分(溶出条件:B)。

2－(5－ブロモ－4－シクロペンチルオキシ－1，2－ジヒドロシクロブチルベンゼン－1－イル)酢酸エチル(中間体e－8)の合成(製造法8工程h)

参考例1の中間体A－4の合成法(製造法8工程h)に記載の手順に従って、中間体e－7(220mg)およびNBS(157mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体e－8;241．4mg)を得た(但し反応は室温にて1時間行った)。Mass(LCMS):353(M^++1)、保持時間;5．15分(溶出条件:B)。

[0509] 参考例21

2－[3－(ベンジルオキシ)フェニル]酢酸ベンジル(中間体e－9)の合成(製造法14工程f－1)

参考例2の中間体A－5の合成法(製造法14工程f－1)に記載の手順に従って、3－ヒドロキシフェニル酢酸(5．04g、TCI)、ベンジルブロミド(3．76ml、TCI)、炭酸カリウム(12．11g)を反応させ処理することで標記化合物(中間体e－9;8．23g)を得た。Mass(LCMS):333(M^++1)、保持時間;N．D(溶出条件:C)。

2－[3－(ベンジルオキシ)フェニル]酢酸(中間体e－10)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って中間体e－9(8．23g)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(62．2ml)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体e－10;6．24g)を得た[但し反応はTHF(55ml)－メタノール(55ml)の混合溶媒中、室温にて1時間行った]。Mass(LCMS):243(M^++1)、保持時間;N．D(溶出条件:C)。

[0510] 2－[5－(ベンジルオキシ)－2－ヨードフェニル]酢酸(中間体e－11)の合成

参考例20の中間体e－3の合成法に記載の手順に従って、中間体e－10(6．24g)、1塩化ヨウ素(6．93g、WAKO)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体e－11;7．92g)を得た。Mass(LCMS):367(M^-—1)、保持時間;N．D(溶出条件:C)。

2－[5－(ベンジルオキシ)－2－ヨードフェニル]－N－メチルオキシ－N－アセトアミド(中間体e－12)の合成

参考例20の中間体e－4の合成法に記載の手順に従って、中間体E－11（7．90g）、N，O－ジメチルヒドロキシアミン1塩酸塩（4．65g、WAKO）、1－ヒドロキシ－7－アザベンゾトリアゾール（6．22g、渡邊化学社製）、水溶性カルボジイミド1塩酸塩（8．76g、渡邊化学社製）、トリエチルアミン（18．97ml）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体e－12；8．73g）を得た。Mass（LCMS）：428（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

4－ベンジルオキシ－シクロブチルベンゼン－1（2H）－オン（中間体e－13）の合成

参考例20中間体e－5の合成法（製造法1工程a）に記載の手順に従って、中間体E－12（8．70g）、ターシャリーブチルリチウム（37．21ml、Ald）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体e－13；2．03g）を得た。Mass（LCMS）：225（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

[0511] 2－（4－ベンジルオキシ－シクロブチルベンゼン－1（2H）－イリデン）酢酸エチル（中間体e－14）の合成（製造法9工程k－3）

参考例20の中間体e－6の合成法（製造法9工程k－3）に記載の手順に従って、ジエチルホスホノ酢酸エチル（25ml、TCI）、水素化ナトリウム（1．02g、WAKO）、中間体E－13（2．00g）を反応させ処理することにより標記化合物（中間体e－14；1．87g）を得た。Mass（LCMS）：295（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

2－（1，2－ジヒドロシクロブチルベンゼン－4－ヒドオキシ－1－イル）酢酸エチル（中間体e－15）の合成（製造法9工程j）

参考例1の中間体A－3の合成法（製造法9工程j）に記載の手順に従って、中間体e－14（387．1mg）、10％パラジウム炭素（100mg、Merck社製）を反応、処理させることで標記化合物（中間体e－15；194．3mg）を得た。（但し反応は30分間行った。）Mass（LCMS）：297（M^+＋1）、保持時間；N．D（溶出条件：C）。

[0512] 上記を含む、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる中間体の代表例をTable－Int．E－1に示す。表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」；原料化合物及び「Reagent」；試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal（番号）」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al（番号）」で示すアルコール試薬はTable

－Alに示したものである。

[0513] [表213]

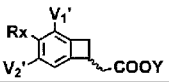


Table-Int.E-1

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.e-16	4f-1	Int.e-15	Hal1	BnO	Et	H	H	C		297 (M^++1)
Int.e-17	8-h	Int.e-16		BnO	Et	H	Br	C		375 (M^+)
Int.e-18	4f-2	Int.e-15	Al2	cPenMeO	Et	H	H	C		289 (M^++1)
Int.e-19	8-h	Int.e-18		cPenMeO	Et	H	Br	C		367 (M^+)
Int.e-20	4f-1	Int.e-15	Hal2	cHexMeO	Et	H	H	C		303 (M^++1)
Int.e-21	8-h	Int.e-20		cHexMeO	Et	H	Br	C		381 (M^+)
Int.e-22	4f-2	Int.e-15	Al3	cHexO	Et	H	H	C		289 (M^++1)
Int.e-23	8-h	Int.e-22		cHexO	Et	H	Br	C		367 (M^+)
Int.e-24	4f-1	Int.e-15	Hal3	nPrO	Et	H	H	C		249 (M^++1)
Int.e-25	8-h	Int.e-24		nPrO	Et	H	Br	C		327 (M^+)
Int.e-26	4f-1	Int.e-15	Hal4	iPrO	Et	H	H	C		249 (M^++1)
Int.e-27	8-h	Int.e-26		iPrO	Et	H	Br	C		327 (M^+)

[0514] 実施例E－a－1

2－[4－(シクロペンチルオキシ)－5－(ナフタレン－2－イル)－1，2－ジヒドロシクロブチルベンゼン－1－イル]酢酸エチル(化合物番号E－a－1)の合成製造法4工程e－1)

実施例化合物A－a－1の合成法(製造法4工程e－1)に記載の手順に従って中間体e－8(176．9mg)、2－ナフタレンボロン酸(154．2mg、Ald)、2M炭酸ナトリウム水溶液(1．2ml)および$(Ph_3P)_4Pd$(184．9mg、ナカライテスク社製)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号E－a－1;151．3mg)を得た(但し反応は6時間行った)。

実施例E－a－2

2－[4－(シクロペンチルオキシ)－5－(ナフタレン－2－イル)－1，2－ジヒドロシクロブチルベンゼン－1－イル]酢酸の合成(化合物番号E－a－2)の合成(製造法1工程a)

実施例化合物A－a－2の合成法(製造法1工程a)に記載の手順に従って実施例化合物E－a－1(151．3mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0．78ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号E－a－2;132．2mg)を得た(但し反応は1時間行った)。

[0515] 上記の実施例を含め、本明細書に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable－E

－a－1からTable－E－a－8及び中間体Table－Int. E－2に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」は上述の合成法のうち該当する方法を記号で表し、「SM」;原料化合物及び「Reagent」;試薬を示す。なお「Reagent」の欄に記した記号「Hal(番号)」で示すハライド試薬はTable－Halに、記号「Al(番号)」で示すアルコール試薬はTable－Alに、記号「BRA(番号)」で示すボロン酸試薬はTable－BRAに、「Het(番号)」で示すブロモヘテロ環試薬はTable－Hetに示したものである。また、「Syn」の欄が空欄のものは水素、Pd／Cを用いた還元反応をしたことを示す。

[0516] [表214]

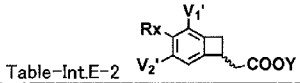
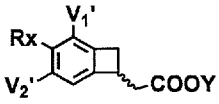


Table-Int.E-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
Int.e-28		E-a-21		HO	Et	H	2-Nap	C		333 (M^++1)
Int.e-29		E-a-23		HO	Et	H	5-Ind	C		322 (M^++1)
Int.e-30		E-a-25		HO	Et	H	1Me-5-Ind	C		336 (M^++1)
Int.e-31		E-a-27		HO	Et	H	1Me-4-Ind	C		336 (M^++1)
Int.e-32		E-a-29		HO	Et	H	1Me-6-Ind	C		336 (M^++1)
Int.e-33		E-a-31		HO	Et	H	5-1Idz	C		323 (M^++1)
Int.e-34		E-a-33		HO	Et	H	1Me-5-Idz	C		337 (M^++1)
Int.e-35		E-a-35		HO	Et	H	1Et-5-Idz	C		351 (M^++1)
Int.e-36		E-a-37		HO	Et	H	3-Qu	C		334 (M^++1)
Int.e-37		E-a-39		HO	Et	H	6-Qu	C		334 (M^++1)
Int.e-38		E-a-41		HO	Et	H	6-IQ	C		334 (M^++1)

[0517] [表215]

Table-E-a-1 

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
E-a-1	4e-1	Int.e-8	BRA1	cPenO	Et	H	2-Nap	C		401 (M^++1)
E-a-2	1-a	E-a-1		cPenO	H	H	2-Nap	C		373 (M^++1)
E-a-3	4e-1	Int.e-8	BRA2	cPenO	Et	H	5-Ind	C		390 (M^++1)
E-a-4	1-a	E-a-3		cPenO	H	H	5-Ind	C		362 (M^++1)
E-a-5	4e-1	Int.e-8	BRA3	cPenO	Et	H	1Me-5-Ind	C		404 (M^++1)
E-a-6	1-a	E-a-5		cPenO	H	H	1Me-5-Ind	C		376 (M^++1)
E-a-7	4e-1	Int.e-8	BRA5	cPenO	Et	H	1Me-4-Ind	C		404 (M^++1)
E-a-8	1-a	E-a-7		cPenO	H	H	1Me-4-Ind	C		376 (M^++1)
E-a-9	4e-1	Int.e-8	BRA6	cPenO	Et	H	1Me-6-Ind	C		404 (M^++1)
E-a-10	1-a	E-a-9		cPenO	H	H	1Me-6-Ind	C		376 (M^++1)
E-a-11	4e-1	Int.e-8	BRA8	cPenO	Et	H	1Me-5-Idz	C		405 (M^++1)
E-a-12	1-a	E-a-11		cPenO	H	H	1Me-5-Idz	C		377 (M^++1)
E-a-13	4e-1	Int.e-8	BRA9	cPenO	Et	H	1Et-5-Idz	C		419 (M^++1)
E-a-14	1-a	E-a-13		cPenO	H	H	1Et-5-Idz	C		391 (M^++1)
E-a-15	4e-1	Int.e-8	BRA10	cPenO	Et	H	2Me-5-Idz	C		405 (M^++1)
E-a-16	1-a	E-a-15		cPenO	H	H	2Me-5-Idz	C		377 (M^++1)
E-a-17	4e-2	Int.e-8	Het2	cPenO	Et	H	3-Qu	C		402 (M^++1)
E-a-18	1-a	E-a-17		cPenO	H	H	3-Qu	C		374 (M^++1)
E-a-19	4e-2	Int.e-8	Het3	cPenO	Et	H	6-IQ	C		402 (M^++1)
E-a-20	1-a	E-a-19		cPenO	H	H	6-IQ	C		374 (M^++1)
E-a-21	4e-1	Int.e-17	BRA1	BnO	Et	H	2-Nap	C		423 (M^++1)
E-a-22	1-a	E-a-21		BnO	H	H	2-Nap	C		395 (M^++1)
E-a-23	4e-1	Int.e-17	BRA2	BnO	Et	H	5-Ind	C		412 (M^++1)
E-a-24	1-a	E-a-23		BnO	H	H	5-Ind	C		384 (M^++1)
E-a-25	4e-1	Int.e-17	BRA3	BnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)
E-a-26	1-a	E-a-25		BnO	H	H	1Me-5-Ind	C		398 (M^++1)
E-a-27	4e-1	Int.e-17	BRA5	BnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		426 (M^++1)
E-a-28	1-a	E-a-27		BnO	H	H	1Me-4-Ind	C		398 (M^++1)
E-a-29	4e-1	Int.e-17	BRA6	BnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		426 (M^++1)
E-a-30	1-a	E-a-29		BnO	H	H	1Me-6-Ind	C		398 (M^++1)
E-a-31	4e-1	Int.e-17	BRA7	BnO	Et	H	5-1Idz	C		413 (M^++1)
E-a-32	1-a	E-a-31		BnO	H	H	5-1Idz	C		385 (M^++1)
E-a-33	4e-1	Int.e-17	BRA8	BnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
E-a-34	1-a	E-a-33		BnO	H	H	1Me-5-Idz	C		399 (M^++1)
E-a-35	4e-1	Int.e-17	BRA9	BnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		441 (M^++1)
E-a-36	1-a	E-a-35		BnO	H	H	1Et-5-Idz	C		413 (M^++1)
E-a-37	4e-2	Int.e-17	Het2	BnO	Et	H	3-Qu	C		424 (M^++1)
E-a-38	1-a	E-a-37		BnO	H	H	3-Qu	C		396 (M^++1)
E-a-39	4e-1	Int.e-17	BRA13	BnO	Et	H	6-Qu	C		424 (M^++1)
E-a-40	1-a	E-a-39		BnO	H	H	6-Qu	C		396 (M^++1)
E-a-41	4e-2	Int.e-17	Het3	BnO	Et	H	6-IQ	C		424 (M^++1)
E-a-42	1-a	E-a-41		BnO	H	H	6-IQ	C		396 (M^++1)
E-a-43	4e-1	Int.e-19	BRA1	cPenMeO	Et	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
E-a-44	1-a	E-a-43		cPenMeO	H	H	2-Nap	C		387 (M^++1)

[0518] [表216]

Table-E-a-2

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
E-a-45	4e-1	Int.e-19	BRA2	cPenMeO	Et	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
E-a-46	1-a	E-a-45		cPenMeO	H	H	5-Ind	C		376 (M^++1)
E-a-47	4e-1	Int.e-19	BRA3	cPenMeO	Et	H	1Me-5-Ind	C		418 (M^++1)
E-a-48	1-a	E-a-47		cPenMeO	H	H	1Me-5-Ind	C		390 (M^++1)
E-a-49	4e-1	Int.e-19	BRA8	cPenMeO	Et	H	1Me-5-Idz	C		419 (M^++1)
E-a-50	1-a	E-a-49		cPenMeO	H	H	1Me-5-Idz	C		391 (M^++1)
E-a-51	4e-1	Int.e-21	BRA3	cHexMeO	Et	H	1Me-5-Ind	C		432 (M^++1)
E-a-52	1-a	E-a-51		cHexMeO	H	H	1Me-5-Ind	C		404 (M^++1)
E-a-53	4e-1	Int.e-21	BRA7	cHexMeO	Et	H	5-1Idz	C		419 (M^++1)
E-a-54	1-a	E-a-53		cHexMeO	H	H	5-1Idz	C		391 (M^++1)
E-a-55	4e-1	Int.e-21	BRA9	cHexMeO	Et	H	1Et-5-Idz	C		447 (M^++1)
E-a-56	1-a	E-a-55		cHexMeO	H	H	1Et-5-Idz	C		419 (M^++1)
E-a-57	4e-1	Int.e-21	BRA13	cHexMeO	Et	H	6-Qu	C		430 (M^++1)
E-a-58	1-a	E-a-57		cHexMeO	H	H	6-Qu	C		402 (M^++1)
E-a-59	4e-2	Int.e-21	Het3	cHexMeO	Et	H	6-IQ	C		430 (M^++1)
E-a-60	1-a	E-a-59		cHexMeO	H	H	6-IQ	C		402 (M^++1)
E-a-61	4e-1	Int.e-23	BRA1	cHexO	Et	H	2-Nap	C		415 (M^++1)
E-a-62	1-a	E-a-61		cHexO	H	H	2-Nap	C		387 (M^++1)
E-a-63	4e-1	Int.e-23	BRA2	cHexO	Et	H	5-Ind	C		404 (M^++1)
E-a-64	1-a	E-a-63		cHexO	H	H	5-Ind	C		376 (M^++1)
E-a-65	4e-1	Int.e-23	BRA4	cHexO	Et	H	1Et-5-Ind	C		432 (M^++1)
E-a-66	1-a	E-a-65		cHexO	H	H	1Et-5-Ind	C		404 (M^++1)
E-a-67	4e-1	Int.e-23	BRA7	cHexO	Et	H	5-1Idz	C		405 (M^++1)
E-a-68	1-a	E-a-67		cHexO	H	H	5-1Idz	C		377 (M^++1)
E-a-69	4e-1	Int.e-25	BRA1	nPrO	Et	H	2-Nap	C		375 (M^++1)
E-a-70	1-a	E-a-69		nPrO	H	H	2-Nap	C		347 (M^++1)
E-a-71	4e-1	Int.e-25	BRA3	nPrO	Et	H	1Me-5-Ind	C		378 (M^++1)
E-a-72	1-a	E-a-71		nPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		350 (M^++1)
E-a-73	4e-1	Int.e-25	BRA4	nPrO	Et	H	1Et-5-Ind	C		392 (M^++1)
E-a-74	1-a	E-a-73		nPrO	H	H	1Et-5-Ind	C		364 (M^++1)
E-a-75	4e-1	Int.e-25	BRA7	nPrO	Et	H	5-1Idz	C		365 (M^++1)
E-a-76	1-a	E-a-75		nPrO	H	H	5-1Idz	C		337 (M^++1)
E-a-77	4e-1	Int.e-27	BRA1	iPrO	Et	H	2-Nap	C		375 (M^++1)
E-a-78	1-a	E-a-77		iPrO	H	H	2-Nap	C		347 (M^++1)
E-a-79	4e-1	Int.e-27	BRA3	iPrO	Et	H	1Me-5-Ind	C		378 (M^++1)
E-a-80	1-a	E-a-79		iPrO	H	H	1Me-5-Ind	C		350 (M^++1)
E-a-81	4e-1	Int.e-27	BRA7	iPrO	Et	H	5-1Idz	C		365 (M^++1)
E-a-82	1-a	E-a-81		iPrO	H	H	5-1Idz	C		337 (M^++1)
E-a-83	4e-1	Int.e-27	BRA9	iPrO	Et	H	1Et-5-Idz	C		393 (M^++1)
E-a-84	1-a	E-a-83		iPrO	H	H	1Et-5-Idz	C		365 (M^++1)
E-a-85	4e-1	Int.e-27	BRA13	iPrO	Et	H	6-Qu	C		376 (M^++1)
E-a-86	1-a	E-a-85		iPrO	H	H	6-Qu	C		348 (M^++1)
E-a-87	4f-2	Int.e-28	Al4	cHepO	Et	H	2-Nap	C		429 (M^++1)
E-a-88	1-a	E-a-87		cHepO	H	H	2-Nap	C		401 (M^++1)
E-a-89	4f-2	Int.e-29	Al4	cHepO	Et	H	5-Ind	C		418 (M^++1)
E-a-90	1-a	E-a-89		cHepO	H	H	5-Ind	C		390 (M^++1)
E-a-91	4f-2	Int.e-31	Al4	cHepO	Et	H	1Me-4-Ind	C		432 (M^++1)
E-a-92	1-a	E-a-91		cHepO	H	H	1Me-4-Ind	C		404 (M^++1)

[0519] [表217]

Table-E-a-3

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
E-a-93	4f-2	Int.e-34	Al4	cHepO	Et	H	1Me-5-Idz	C		433 (M^++1)
E-a-94	1-a	E-a-93		cHepO	H	H	1Me-5-Idz	C		405 (M^++1)
E-a-95	4f-2	Int.e-36	Al4	cHepO	Et	H	3-Qu	C		430 (M^++1)
E-a-96	1-a	E-a-95		cHepO	H	H	3-Qu	C		402 (M^++1)
E-a-97	4f-1	Int.e-28	Hal5	nBuO	Et	H	2-Nap	C		389 (M^++1)
E-a-98	1-a	E-a-97		nBuO	H	H	2-Nap	C		361 (M^++1)
E-a-99	4f-1	Int.e-30	Hal5	nBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		392 (M^++1)
E-a-100	1-a	E-a-99		nBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		364 (M^++1)
E-a-101	4f-1	Int.e-32	Hal5	nBuO	Et	H	1Me-6-Ind	C		392 (M^++1)
E-a-102	1-a	E-a-101		nBuO	H	H	1Me-6-Ind	C		364 (M^++1)
E-a-103	4f-1	Int.e-33	Hal5	nBuO	Et	H	5-1Idz	C		379 (M^++1)
E-a-104	1-a	E-a-103		nBuO	H	H	5-1Idz	C		351 (M^++1)
E-a-105	4f-1	Int.e-35	Hal5	nBuO	Et	H	1Et-5-Idz	C		407 (M^++1)
E-a-106	1-a	E-a-105		nBuO	H	H	1Et-5-Idz	C		379 (M^++1)
E-a-107	4f-1	Int.e-37	Hal5	nBuO	Et	H	6-Qu	C		390 (M^++1)
E-a-108	1-a	E-a-107		nBuO	H	H	6-Qu	C		362 (M^++1)
E-a-109	4f-1	Int.e-28	Hal6	iBuO	Et	H	2-Nap	C		389 (M^++1)
E-a-110	1-a	E-a-109		iBuO	H	H	2-Nap	C		361 (M^++1)
E-a-111	4f-1	Int.e-29	Hal6	iBuO	Et	H	5-Ind	C		378 (M^++1)
E-a-112	1-a	E-a-111		iBuO	H	H	5-Ind	C		350 (M^++1)
E-a-113	4f-1	Int.e-30	Hal6	iBuO	Et	H	1Me-5-Ind	C		392 (M^++1)
E-a-114	1-a	E-a-113		iBuO	H	H	1Me-5-Ind	C		364 (M^++1)
E-a-115	4f-1	Int.e-35	Hal6	iBuO	Et	H	1Et-5-Idz	C		407 (M^++1)
E-a-116	1-a	E-a-115		iBuO	H	H	1Et-5-Idz	C		379 (M^++1)
E-a-117	4f-1	Int.e-36	Hal6	iBuO	Et	H	3-Qu	C		390 (M^++1)
E-a-118	1-a	E-a-117		iBuO	H	H	3-Qu	C		362 (M^++1)
E-a-119	4f-1	Int.e-29	Hal7	2FBnO	Et	H	5-Ind	C		430 (M^++1)
E-a-120	1-a	E-a-119		2FBnO	H	H	5-Ind	C		402 (M^++1)
E-a-121	4f-1	Int.e-31	Hal7	2FBnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		444 (M^++1)
E-a-122	1-a	E-a-121		2FBnO	H	H	1Me-4-Ind	C		416 (M^++1)
E-a-123	4f-1	Int.e-32	Hal7	2FBnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		444 (M^++1)
E-a-124	1-a	E-a-123		2FBnO	H	H	1Me-6-Ind	C		416 (M^++1)
E-a-125	4f-1	Int.e-35	Hal7	2FBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		459 (M^++1)
E-a-126	1-a	E-a-125		2FBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		431 (M^++1)
E-a-127	4f-1	Int.e-38	Hal7	2FBnO	Et	H	6-IQ	C		442 (M^++1)
E-a-128	1-a	E-a-127		2FBnO	H	H	6-IQ	C		414 (M^++1)
E-a-129	4f-1	Int.e-28	Hal9	4FBnO	Et	H	2-Nap	C		441 (M^++1)
E-a-130	1-a	E-a-129		4FBnO	H	H	2-Nap	C		413 (M^++1)
E-a-131	4f-1	Int.e-30	Hal9	4FBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		444 (M^++1)
E-a-132	1-a	E-a-131		4FBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		416 (M^++1)
E-a-133	4f-1	Int.e-33	Hal9	4FBnO	Et	H	5-1Idz	C		431 (M^++1)
E-a-134	1-a	E-a-133		4FBnO	H	H	5-1Idz	C		403 (M^++1)
E-a-135	4f-1	Int.e-34	Hal9	4FBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		445 (M^++1)
E-a-136	1-a	E-a-135		4FBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		417 (M^++1)
E-a-137	4f-1	Int.e-28	Hal11	3ClBnO	Et	H	2-Nap	C		457 (M^++1)
E-a-138	1-a	E-a-137		3ClBnO	H	H	2-Nap	C		429 (M^++1)
E-a-139	4f-1	Int.e-30	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Me-5-Ind	C		460 (M^++1)
E-a-140	1-a	E-a-139		3ClBnO	H	H	1Me-5-Ind	C		432 (M^++1)

[0520] [表218]

Table-E-a-4

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
E-a-141	4f-1	Int.e-31	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		460 (M^++1)
E-a-142	1-a	E-a-141		3ClBnO	H	H	1Me-4-Ind	C		432 (M^++1)
E-a-143	4f-1	Int.e-32	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Me-6-Ind	C		460 (M^++1)
E-a-144	1-a	E-a-143		3ClBnO	H	H	1Me-6-Ind	C		432 (M^++1)
E-a-145	4f-1	Int.e-33	Hal11	3ClBnO	Et	H	5-1Idz	C		447 (M^++1)
E-a-146	1-a	E-a-145		3ClBnO	H	H	5-1Idz	C		419 (M^++1)
E-a-147	4f-1	Int.e-35	Hal11	3ClBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		475 (M^++1)
E-a-148	1-a	E-a-147		3ClBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		447 (M^++1)
E-a-149	4f-1	Int.e-37	Hal11	3ClBnO	Et	H	6-Qu	C		458 (M^++1)
E-a-150	1-a	E-a-149		3ClBnO	H	H	6-Qu	C		430 (M^++1)
E-a-151	4f-1	Int.e-29	Hal12	4MeBnO	Et	H	5-Ind	C		426 (M^++1)
E-a-152	1-a	E-a-151		4MeBnO	H	H	5-Ind	C		398 (M^++1)
E-a-153	4f-1	Int.e-31	Hal12	4MeBnO	Et	H	1Me-4-Ind	C		440 (M^++1)
E-a-154	1-a	E-a-153		4MeBnO	H	H	1Me-4-Ind	C		412 (M^++1)
E-a-155	4f-1	Int.e-34	Hal12	4MeBnO	Et	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
E-a-156	1-a	E-a-155		4MeBnO	H	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
E-a-157	4f-1	Int.e-35	Hal12	4MeBnO	Et	H	1Et-5-Idz	C		455 (M^++1)
E-a-158	1-a	E-a-157		4MeBnO	H	H	1Et-5-Idz	C		427 (M^++1)
E-a-159	4f-1	Int.e-38	Hal12	4MeBnO	Et	H	6-IQ	C		438 (M^++1)
E-a-160	1-a	E-a-159		4MeBnO	H	H	6-IQ	C		410 (M^++1)
E-a-161	4f-2	Int.e-28	Al11	4Me,cHexO	Et	H	2-Nap	C		429 (M^++1)
E-a-162	1-a	E-a-161		4Me,cHexO	H	H	2-Nap	C		401 (M^++1)
E-a-163	4f-2	Int.e-29	Al11	4Me,cHexO	Et	H	5-Ind	C		418 (M^++1)
E-a-164	1-a	E-a-163		4Me,cHexO	H	H	5-Ind	C		390 (M^++1)
E-a-165	4f-2	Int.e-31	Al11	4Me,cHexO	Et	H	1Me-4-Ind	C		432 (M^++1)
E-a-166	1-a	E-a-165		4Me,cHexO	H	H	1Me-4-Ind	C		404 (M^++1)
E-a-167	4f-2	Int.e-34	Al11	4Me,cHexO	Et	H	1Me-5-Idz	C		433 (M^++1)
E-a-168	1-a	E-a-167		4Me,cHexO	H	H	1Me-5-Idz	C		405 (M^++1)
E-a-169	4f-2	Int.e-36	Al11	4Me,cHexO	Et	H	3-Qu	C		430 (M^++1)
E-a-170	1-a	E-a-169		4Me,cHexO	H	H	3-Qu	C		402 (M^++1)
E-a-171	4f-2	Int.e-38	Al11	4Me,cHexO	Et	H	6-IQ	C		430 (M^++1)
E-a-172	1-a	E-a-171		4Me,cHexO	H	H	6-IQ	C		402 (M^++1)
E-a-173	4f-2	Int.e-28	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		480 (M^++1)
E-a-174	1-a	E-a-173		2(4DMAPh)EtO	H	H	2-Nap	C		452 (M^++1)
E-a-175	4f-2	Int.e-29	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		469 (M^++1)
E-a-176	1-a	E-a-175		2(4DMAPh)EtO	H	H	5-Ind	C		441 (M^++1)
E-a-177	4f-2	Int.e-30	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		483 (M^++1)
E-a-178	1-a	E-a-177		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		455 (M^++1)
E-a-179	4f-2	Int.e-35	Al6	2(4DMAPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		498 (M^++1)
E-a-180	1-a	E-a-179		2(4DMAPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		470 (M^++1)
E-a-181	4f-2	Int.e-28	Al7	1PhEtO	Et	H	2-Nap	C		437 (M^++1)
E-a-182	1-a	E-a-181		1PhEtO	H	H	2-Nap	C		409 (M^++1)
E-a-183	4f-2	Int.e-30	Al7	1PhEtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		440 (M^++1)
E-a-184	1-a	E-a-183		1PhEtO	H	H	1Me-5-Ind	C		412 (M^++1)
E-a-185	4f-2	Int.e-34	Al7	1PhEtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		441 (M^++1)
E-a-186	1-a	E-a-185		1PhEtO	H	H	1Me-5-Idz	C		413 (M^++1)
E-a-187	4f-2	Int.e-37	Al7	1PhEtO	Et	H	6-Qu	C		438 (M^++1)
E-a-188	1-a	E-a-187		1PhEtO	H	H	6-Qu	C		410 (M^++1)

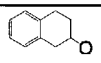
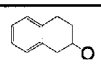
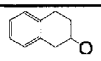
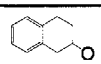
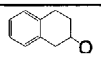
[0521] [表219]

Table-E-a-5

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
E-a-189	4f-1	Int.e-28	Al9	1(2FPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		455 (M^++1)
E-a-190	1-a	E-a-189		1(2FPh)EtO	H	H	2-Nap	C		427 (M^++1)
E-a-191	4f-1	Int.e-29	Al9	1(2FPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		444 (M^++1)
E-a-192	1-a	E-a-191		1(2FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		416 (M^++1)
E-a-193	4f-1	Int.e-33	Al9	1(2FPh)EtO	Et	H	5-1Idz	C		445 (M^++1)
E-a-194	1-a	E-a-193		1(2FPh)EtO	H	H	5-1Idz	C		417 (M^++1)
E-a-195	4f-1	Int.e-35	Al9	1(2FPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		473 (M^++1)
E-a-196	1-a	E-a-195		1(2FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		445 (M^++1)
E-a-197	4f-1	Int.e-36	Al9	1(2FPh)EtO	Et	H	3-Qu	C		456 (M^++1)
E-a-198	1-a	E-a-197		1(2FPh)EtO	H	H	3-Qu	C		428 (M^++1)
E-a-199	4f-1	Int.e-28	Al17	1IndanO	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
E-a-200	1-a	E-a-199		1IndanO	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
E-a-201	4f-2	Int.e-29	Al17	1IndanO	Et	H	5-Ind	C		438 (M^++1)
E-a-202	1-a	E-a-201		1IndanO	H	H	5-Ind	C		410 (M^++1)
E-a-203	4f-2	Int.e-30	Al17	1IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		452 (M^++1)
E-a-204	1-a	E-a-203		1IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		424 (M^++1)
E-a-205	4f-2	Int.e-34	Al17	1IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		453 (M^++1)
E-a-206	1-a	E-a-205		1IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
E-a-207	4f-2	Int.e-35	Al17	1IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		467 (M^++1)
E-a-208	1-a	E-a-207		1IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		439 (M^++1)
E-a-209	4f-2	Int.e-37	Al17	1IndanO	Et	H	6-Qu	C		450 (M^++1)
E-a-210	1-a	E-a-209		1IndanO	H	H	6-Qu	C		422 (M^++1)
E-a-211	4f-2	Int.e-28	Al18	2IndanO	Et	H	2-Nap	C		449 (M^++1)
E-a-212	1-a	E-a-211		2IndanO	H	H	2-Nap	C		421 (M^++1)
E-a-213	4f-2	Int.e-30	Al18	2IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		452 (M^++1)
E-a-214	1-a	E-a-213		2IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		424 (M^++1)
E-a-215	4f-2	Int.e-33	Al18	2IndanO	Et	H	5-1Idz	C		439 (M^++1)
E-a-216	1-a	E-a-215		2IndanO	H	H	5-1Idz	C		411 (M^++1)
E-a-217	4f-2	Int.e-34	Al18	2IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		453 (M^++1)
E-a-218	1-a	E-a-217		2IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		425 (M^++1)
E-a-219	4f-2	Int.e-38	Al18	2IndanO	Et	H	6-IQ	C		450 (M^++1)
E-a-220	1-a	E-a-219		2IndanO	H	H	6-IQ	C		422 (M^++1)
E-a-221	4f-2	Int.e-29	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	H	5-Ind	C		468 (M^++1)
E-a-222	1-a	E-a-221		5OMe-2-IndanO	H	H	5-Ind	C		440 (M^++1)
E-a-223	4f-2	Int.e-30	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		482 (M^++1)
E-a-224	1-a	E-a-223		5OMe-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
E-a-225	4f-2	Int.e-34	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Idz	C		483 (M^++1)
E-a-226	1-a	E-a-225		5OMe-2-IndanO	H	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
E-a-227	4f-2	Int.e-35	Al19	5OMe-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		497 (M^++1)
E-a-228	1-a	E-a-227		5OMe-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		469 (M^++1)
E-a-229	4f-2	Int.e-28	Al21	5F-2-IndanO	Et	H	2-Nap	C		467 (M^++1)
E-a-230	1-a	E-a-229		5F-2-IndanO	H	H	2-Nap	C		439 (M^++1)
E-a-231	4f-2	Int.e-30	Al21	5F-2-IndanO	Et	H	1Me-5-Ind	C		470 (M^++1)
E-a-232	1-a	E-a-231		5F-2-IndanO	H	H	1Me-5-Ind	C		442 (M^++1)
E-a-233	4f-2	Int.e-35	Al21	5F-2-IndanO	Et	H	1Et-5-Idz	C		485 (M^++1)
E-a-234	1-a	E-a-233		5F-2-IndanO	H	H	1Et-5-Idz	C		457 (M^++1)
E-a-235	4f-2	Int.e-28	Al22		Et	H	2-Nap	C		463 (M^++1)

[0522] [表220]

Table-E-a-6

Exp.	Syn.	SM	Reagent	Rx	Y	V1'	V2'	LCMS		
								method	RTime	Mass
E-a-236	1-a	E-a-235			H	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
E-a-237	4f-2	Int.e-29	Al22		Et	H	5-Ind	C		452 (M^++1)
E-a-238	1-a	E-a-237			H	H	5-Ind	C		424 (M^++1)
E-a-239	4f-2	Int.e-31	Al22		Et	H	1Me-4-Ind	C		466 (M^++1)
E-a-240	1-a	E-a-239			H	H	1Me-4-Ind	C		438 (M^++1)
E-a-241	4f-2	Int.e-34	Al22		Et	H	1Me-5-Idz	C		467 (M^++1)
E-a-242	1-a	E-a-241			H	H	1Me-5-Idz	C		439 (M^++1)
E-a-243	4f-2	Int.e-36	Al22		Et	H	3-Qu	C		464 (M^++1)
E-a-244	1-a	E-a-243			H	H	3-Qu	C		436 (M^++1)
E-a-245	4f-2	Int.e-28	Al23		Et	H	2-Nap	C		463 (M^++1)
E-a-246	1-a	E-a-245			H	H	2-Nap	C		435 (M^++1)
E-a-247	4f-2	Int.e-30	Al23		Et	H	1Me-5-Ind	C		466 (M^++1)
E-a-248	1-a	E-a-247			H	H	1Me-5-Ind	C		438 (M^++1)
E-a-249	4f-2	Int.e-38	Al23		Et	H	6-IQ	C		464 (M^++1)
E-a-250	1-a	E-a-249			H	H	6-IQ	C		436 (M^++1)
E-a-251	4f-2	Int.e-30	Al24	2(2MePh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		454 (M^++1)
E-a-252	1-a	E-a-251		2(2MePh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		426 (M^++1)
E-a-253	4f-2	Int.e-34	Al24	2(2MePh)EtO	Et	H	1Me-5-Idz	C		455 (M^++1)
E-a-254	1-a	E-a-253		2(2MePh)EtO	H	H	1Me-5-Idz	C		427 (M^++1)
E-a-255	4f-2	Int.e-35	Al24	2(2MePh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		469 (M^++1)
E-a-256	1-a	E-a-255		2(2MePh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		441 (M^++1)
E-a-257	4f-2	Int.e-29	Al25	2(3FPh)EtO	Et	H	5-Ind	C		444 (M^++1)
E-a-258	1-a	E-a-257		2(3FPh)EtO	H	H	5-Ind	C		416 (M^++1)
E-a-259	4f-2	Int.e-35	Al25	2(3FPh)EtO	Et	H	1Et-5-Idz	C		473 (M^++1)
E-a-260	1-a	E-a-259		2(3FPh)EtO	H	H	1Et-5-Idz	C		445 (M^++1)
E-a-261	4f-2	Int.e-28	Al26	2(2ClPh)EtO	Et	H	2-Nap	C		472 (M^++1)
E-a-262	1-a	E-a-261		2(2ClPh)EtO	H	H	2-Nap	C		443 (M^++1)
E-a-263	4f-2	Int.e-30	Al26	2(2ClPh)EtO	Et	H	1Me-5-Ind	C		475 (M^++1)
E-a-264	1-a	E-a-263		2(2ClPh)EtO	H	H	1Me-5-Ind	C		446 (M^++1)
E-a-265	4f-2	Int.e-28	Al28	2(1-Nap)EtO	Et	H	2-Nap	C		487 (M^++1)
E-a-266	1-a	E-a-265		2(1-Nap)EtO	H	H	2-Nap	C		459 (M^++1)
E-a-267	4f-2	Int.e-29	Al28	2(1-Nap)EtO	Et	H	5-Ind	C		476 (M^++1)
E-a-268	1-a	E-a-267		2(1-Nap)EtO	H	H	5-Ind	C		448 (M^++1)

[0523] [試験例]

1. IL－1β刺激MG－63細胞からのPGE$_2$産生抑制作用

(1)測定方法

炎症性の刺激物質であるインターロイキン(IL)－1βによるPGE$_2$産生に対する抑制作用を以下の方法で調べた。ヒト骨肉腫細胞株であるMG－63細胞(大日本製薬より購入)を10%牛胎児血清(BioFluid社製)を含むEMEM培地(GIBCO社製)に懸濁して96ウェル培養プレートに2×10^4細胞／ウェルになるように播種した後一晩培養し、0．5%牛胎児血清を含むEMEM培地に交換し、被験化合物をウェルに加え、さらに炎症性の刺激剤としてヒトインターロイキン－1β(ENDOGEN社製)を1ng／mlになるように加えた。さらに18時間培養した後、培養上清を回収し、培養上清中のPGE$_2$濃度をEIA kit(CAYMAN社製)を用いて測定した。刺激剤を加えないウェルを陰性対照とし、刺激剤だけを加えたウェルを陽性対照として、被験化合物を加えたウェルのPGE$_2$産生量からPGE$_2$産生抑制率を以下の数式により計算して求めた。

[数1]

$$\text{ＰＧＥ}_2\text{産生抑制率（%）} = \left(1 - \frac{\text{Ｃ} - \text{Ｂ}}{\text{Ａ} - \text{Ｂ}}\right) \times 100$$

Ａ：陽性対照のＰＧＥ$_2$産生量

Ｂ：陰性対照のＰＧＥ$_2$産生量

Ｃ：被験化合物添加ウェルのＰＧＥ$_2$産生量

また化合物の細胞障害作用について上清回収後の細胞を用いてメチレンブルー取り込み法により調べた。すなわち上清回収後の細胞をグルタールアルデヒドで固定し、0．05%メチレンブルー溶液で染色した後、細胞に取り込まれたメチレンブルーを0．3N塩酸で抽出し、抽出液の670nmの吸光度を測定した。上記陽性対照のウェルの吸光値を100%として被験化合物のウェルの吸光値が80%未満になるときを被験化合物に細胞障害作用陽性と判定した。

[0524] (2)測定結果

被験化合物(化合物番号A－a－1～294、A－b－1～612、A－c－1～181A－d－1～A－d－189、B－a－1～414、B－b－1～236、247～291、303～348、B

－c－1～140、151～194、203～232、B－d－1～63、69～85、88～100、B－e－1～63、69～85、88～100、
Ca－a－1～636、Ca－b－1～488、Ca－c－1～488、N－a－1～274、N－b－1～394、N－c－1～164、N－d－1～136、N－e－1～136、N－f－1～197、N－g－1～197、N－h－1～82、N－i－1～82、N－j－1～140、N－k－1～148、N－l－1～118、N－m－96、は、IL－1βによるPGE_2の産生を1．0μMで50%以上抑制した。またこの濃度ではいずれの被験化合物も細胞障害作用は示さなかった。

従って、本発明の新規な置換二環式環状誘導体またはその塩は、炎症性のプロスタグランジン産生を抑制のための医薬の有効成分として有用である。

[0525] 2．IgE刺激RBL－2H3細胞からのPGD_2およびLTB_4の産生抑制作用

(1)測定方法

アレルギー性の刺激剤であるIgE抗体によるPGD_2およびLTB_4の産生に対する抑制を以下の方法で調べた。ラットマストサイトーマ株であるRBL－2H3細胞(ATCCより購入)を10%牛胎児血清(BioFluid社製)を含むDEMEM培地(GIBCO社製)に懸濁して48ウェル培養プレートに2×10^4細胞／ウェルになるように播種した後一晩培養し、ジニトロフェニル化BSA(以下、DNP－BSA)に対するIgE抗血清を加えて30分間培養した後、0．5%牛胎児血清を含むDEMEM培地に交換し、被験化合物をウェルに加え、さらに刺激剤としてDNP－BSAを100ng／mlになるように加えた。刺激剤を加えた10分後に培養上清を回収し、培養上清中のPGD_2濃度およびLTB_4濃度をそれぞれEIA kit(CAYMAN社製)を用いて測定した。刺激剤を加えないウェルを陰性対照とし、刺激剤だけを加えたウェルを陽性対照として、被験化合物を加えたウェルのメディエーター産生量からメディエーター産生抑制率を以下の数式2により計算して求めた。

[数2]

$$PGD_2\text{または}LTB_4\text{産生抑制率（\%）} = \left(1 - \frac{C - B}{A - B}\right) \times 100$$

A：陽性対照のPGD_2またはLTB_4産生量
B：陰性対照のPGD_2またはLTB_4産生量
C：被験化合物添加ウェルのPGD_2またはLTB_4産生量

化合物の細胞障害作用については上記と同様に上清回収後の細胞を用いてメチレンブルー取り込み法により調べた。

[0526] (2)測定結果

本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物は、IgE刺激によるPGD_2およびLTB_4の産生を1．0μMで50%以上抑制した。またこの濃度ではいずれの被験化合物も細胞障害作用は示さなかった。従って、本発明の新規な置換二環式環状誘導体またはその塩は、アレルギー性のプロスタグランジンおよびロイコトリエン産生に対する抑制作用を示し、それらの産生抑制のための医薬の有効成分として有用である。

[0527] 3．マウスザイモザン刺激足浮腫反応に対する抑制効果

(1)測定方法

炎症性の刺激剤であるザイモザンによる足浮腫に対する抑制効果を以下の方法で調べた。ICR雌性マウス(6～7週齢)を一群8匹として試験に用いた。被験化合物を0．5%メチルセルロースを含む精製水に懸濁または溶解し、試験動物に0．1～500mg／10ml／kgになるように経口投与した。対照群には被験化合物無添加の0．5%メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。被験化合物投与1時間後にマウス右後肢の足蹠皮下に生理食塩水(大塚製薬工場製)に1mg／mlになるように懸濁したザイモザン液を0．02ml投与した。ザイモザン液を投与してから1および2時間後に右後肢の足蹠の容積をマウス後肢足浮腫容積測定装置(ユニコム社製)を用いて測定した。このときの足蹠の容積とあらかじめ測定しておいた被験化合物投与前の足蹠容積との差を浮腫容積とした。

ザイモザン投与後1時間および2時間の浮腫容積について、横軸を時間および縦

軸を浮腫容積としてプロットしたグラフを作成し、以下の数式により2時間までの浮腫容積AUC(エリア・アンダー・ザ・カーヴ)を計算して求めた。

[数3]

浮腫容積ＡＵＣ（μｌ・時間）　＝　１／２×１×Ａ＋１×（Ａ＋Ｂ）／２

Ａ：ザイモザン投与１時間目の浮腫容積

Ｂ：ザイモザン投与２時間目の浮腫容積

被験化合物による浮腫の抑制率は以下の数式により計算して求めた。

[数4]

$$\text{浮腫抑制率（\%）} = \left(1 - \frac{B}{A}\right) \times 100$$

Ａ：陽性対照の浮腫容積ＡＵＣ

Ｂ：被験化合物投与群の浮腫容積ＡＵＣ

[0528] (2)測定結果

本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物は、ザイモザン皮下投与による足浮腫を0．1～500mg／kgの経口投与で陽性対照群に比べ抑制した。

従って、本発明の新規な置換二環式環状誘導体またはその塩は、炎症性の刺激剤であるザイモザンによる足浮腫に対して抑制作用を示すことから、炎症性疾患の予防および／または治療のための医薬の有効成分として有用である。

[0529] 4．マウスIgE刺激足浮腫反応に対する抑制効果

(1)測定方法

アレルギー性の刺激剤であるIgE抗体による足浮腫に対する抑制を以下の方法で調べた。C57BL／6雄性マウス(9～11週齢)を一群5匹として試験に用いた。前日に抗DNP－BSA　IgE血清を20μlマウスの右後肢足蹠に皮下投与した。被験化合物を0．5%メチルセルロースを含む精製水に懸濁または溶解し、試験動物に0．1～500mg／10ml／kgになるように経口投与した。対照群には被験化合物無添加の0．5%メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。被験化合物投与2時間後に生理食塩水(大塚製薬工場製)に2．5μg／mlになるように溶解したDNP－BS

A溶液0．2mlを静脈内に投与した。DNP－BSAを投与してから10分、15分、20分および30分後に右後肢の足蹠の厚さをデジタルチックネスゲージ(MITSUTOYO社製)を用いて測定した。このときの足蹠の厚さとあらかじめ測定しておいた被験化合物投与前の厚さとの差を浮腫厚とした。

DNP－BSA投与後10分、15分、20分および30分後の浮腫厚について、横軸を時間および縦軸を浮腫厚としてプロットしたグラフを作成し、以下の数式により2時間までの浮腫厚AUCを計算して求めた。

[数5]

浮腫厚ＡＵＣ（ｍｍ・分）　＝　１／２×１０×Ａ＋５×（Ａ＋Ｂ）／２
＋５×（Ｂ＋Ｃ）／２＋１０×（Ｃ＋Ｄ）／２

Ａ：ＤＮＰ－ＢＳＡ投与１０分目の浮腫厚
Ｂ：ＤＮＰ－ＢＳＡ投与１５分目の浮腫厚
Ｃ：ＤＮＰ－ＢＳＡ投与２０分目の浮腫厚
Ｄ：ＤＮＰ－ＢＳＡ投与３０分目の浮腫厚

被験化合物による浮腫の抑制率は以下の数式により計算して求めた。

[数6]

$$\text{浮腫抑制率（\%）} = \left(1 - \frac{B}{A}\right) \times 100$$

Ａ：陽性対照の浮腫厚ＡＵＣ
Ｂ：被験化合物投与群の浮腫厚ＡＵＣ

[0530] (2)測定結果

本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物は、IgE刺激による足浮腫すなわち抗DNP－BSA IgE血清で感作したマウスにDNP－BSAを投与したときにおこる足浮腫を0．1～500mg／kgの経口投与で陽性対照群に比べ抑制した。

従って、本発明の新規な置換二環式環状誘導体またはその塩は、アレルギー性の刺激剤であるIgE抗体による足浮腫に対して抑制作用を示すことからアレルギー性疾患の予防および／または治療のための医薬の有効成分として有用である。

[0531] 5．マウス酢酸ライジング反応に対する抑制効果

(1)測定方法

急性疼痛のモデルである酢酸ライジング反応に対する抑制効果を以下の方法で調べた。ICR雌性マウス(6週齢)を一群8匹として試験に用いた。被験化合物を0．5%メチルセルロースを含む精製水に懸濁または溶解し、試験動物に0．1～500mg／10ml／kgになるように経口投与した。対照群には被験化合物無添加の0．5%メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。被験化合物を投与して1時間後にマウスの腹腔内に0．9%酢酸水を5ml／kgになるように投与し、酢酸水投与直後から15分間のライジング回数を数えた。対照群に対する抑制率を以下の数式を用いて計算して求めた。

[数7]

$$\text{ライジング抑制率（%）} = \left(1 - \frac{B}{A} \right) \times 100$$

A：陽性対照群のライジング回数

B：被験化合物投与群のライジング回数

[0532] (2)測定結果

本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物は、酢酸水投与によるライジングを0．1～500mg／kgの経口投与で陽性対照群に比べ抑制した。

酢酸を腹腔内に投与したときに起きるライジング反応は、プロスタグランジンの産生によって起こることが明らかにされている[Matsumotoら、ヨーロピアン・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー(Eur. J. Pharmacol)、1998年、352巻、47頁]、[Uenoら、バイオケミカル・ファーマコロジー(Biochem. Pharmacol)、2001年、15巻、157頁]。

従って、本発明の新規な置換二環式環状誘導体またはその塩は、プロスタグランジンによって起こる急性疼痛の予防および／または治療のための医薬の有効成分として有用である。

[0533] 6．ラットアジュバント関節炎に対する予防および治療効果

(1)測定方法

自己免疫性疾患の一つでありまた慢性炎症疾患である慢性関節リウマチの病態モデルであるラットアジュバント関節炎における足浮腫に対する抑制効果を以下の方法で調べた。Lewis雌性ラット(8週令)を一群6匹として試験に用いた。試験動物右後肢足蹠皮下にアジュバントとしてM. tuberclulosis H37 RA(DIFCO社製)を10mg／ml含む流動パラフィンを50μl投与して免疫した。被験化合物を0．5%メチルセルロースを含む精製水に懸濁または溶解し、試験動物に0．1～500mg／5ml／kgになるように経口投与した。投与は免疫後12日目から一日2回、14日間投与を行った。対照群には被験化合物無添加の0．5%メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。アジュバントを投与してから2または3日おきにアジュバントを投与していない左後肢の足蹠の容積をラット後肢足浮腫容積測定装置(ユニコム社製)を用いて測定した。浮腫抑制率は以下の数式を用い計算して求めた。

[数8]

$$\text{浮腫抑制率（%）} = \left(1 - \frac{(D - C) / C}{(B - A) / A} \right) \times 100$$

A：アジュバント投与直前の陽性対照の左後肢足蹠容積

B：各測定日における陽性対照の左後肢足蹠容積

C：アジュバント投与直前の被験化合物投与群の左後肢足蹠容積

D：各測定日における被験化合物投与群の左後肢足蹠容積

[0534] (2)測定結果

本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物は、アジュバント関節炎における足浮腫に対し陽性対照群に比べて抑制した。

従って、本発明の新規な置換二環式環状誘導体またはその塩は、慢性関節リウマチの、また自己免疫性疾患の予防および／または治療のための医薬の有効成分として有用である。

[0535] 7. ラット肺線維症に対する効果

(1)測定方法

肺線維症の病態モデルであるブレオマイシン誘発ラット肺線維症モデルにおける肺

線維化抑制効果について以下の方法で調べた。BN雌性ラット(7週令)を一群7匹として試験に用いた。試験動物をケタミン及びキシラジンで麻酔して気管を露出し、気管内に生理食塩水(大塚製薬工場製)に溶解した125μg／0．1mlのブレオマイシン(日本化薬)溶液を注射器を用いて注入した。陰性対照群には0．1mlの生理食塩水を気管内に投与した。

被験化合物を0．5%メチルセルロースを含む精製水に懸濁又は溶解し、試験動物に10mg、30mg、100mg又は300mg／5ml／kgになるように経口投与した。被験化合物の投与はブレオマイシンを投与した日から一日1回から2回、21日間行った。陽性対照群には被験化合物無添加の0．5%メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。ブレオマイシンを投与してから21日目にラットを犠牲死させ、肺を中性緩衝ホルマリンで固定し、病理組織標本を作製した。病理組織標本の染色はアザン法で行った。

肺の組織標本の観察を行い、肉芽組織形成と膠原線維増生を指標として線維化の程度を次のようにスコア化した。すなわち、－:異常なし、±:ごく軽度の変化、＋:軽度の変化、＋＋:中等度の変化、＋＋＋:高度の変化とした。

[0536] (2)測定結果

陰性対照群の線維化スコアは－であり、肺の線維化は認められなかった。陽性対照群の線維化スコアの中央値は＋＋～＋＋＋であり、肺の線維化が認められた。本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物を投与した群の肺の線維化スコアの中央値は、±から＋であり、陽性対照群に比べて線維化が軽度であった。従って、本発明の新規な置換二環式環状誘導体またはその塩は肺線維症の予防及び／又は治療のための医薬の有効成分として有用であり、また4型PLA_2阻害化合物は肺線維症の予防及び／又は治療(進行防止を含む)のための医薬の有効成分としても有用である。

産業上の利用可能性

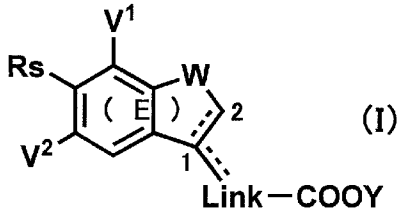
[0537] 本発明の新規な置換二環式環状誘導体またはその塩は優れたプロスタグランジン産生抑制作用及びロイコトリエン産生抑制作用を有しており、これらの脂質メディエーターに起因する各種の炎症性疾患、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患、疼痛、線

維症などの予防及び／又は治療のための医薬の有効成分として好適に利用できる。

請求の範囲

[1] 一般式(I):

[化1]



(I)

[式中、＿＿は、単結合又は二重結合を示し(但し、環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合、及び環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が共に二重結合を示すことはなく、またLinkが単結合を示すとき環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合は単結合を示す);

Linkは、単結合を示すか、あるいは炭素数1～2個の直鎖状の飽和又は不飽和炭化水素を示し;

Wは、単結合、メチレン基、酸素原子、イオウ原子、又はN(Rw)を示し;

Rwは、水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は－A^6－Qpを示し;

A^6は、単結合又はメチレン基を示し;

Qpはフェニル基を示し、該フェニル基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されていてもよく;

T^1は、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、水酸基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、ニトロ基、炭素数1～4個のアルコキシ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示し;

Rsは、－D－Rx又は－N(Ry)(Rz)を示し;

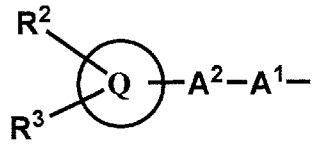
Dは、単結合、酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、－$S(O)_2$－、又は－C(O)－を示し;

Rxは、炭素数3～8個の直鎖状又は分枝鎖状飽和アルキル基を示すか、あるいは次式:

R^1－A^a－ (Ra)

で表されるRa、次式:

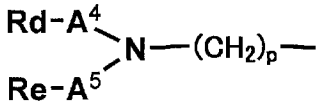
[化2]



(Rb)

で表されるRb、又は次式:

[化3]



(Rc)

で表されるRcを示し;

Ra中のA^aは、単結合、炭素数1～3個のアルキレン(aa)、又は炭素数2～3個のアルケニレン(aa')を示し、アルキレン(aa)及びアルケニレン(aa')はそれぞれ独立に炭素数1～4個の低級アルキル基で置換されていてもよく;

R^1は、炭素数3～7個の環状飽和アルキル基又は炭素数6～8個の縮合環式飽和アルキル基を示し、R^1は1個又は同一若しくは異なる2個以上の炭素数1～4の低級アルキル基で置換されていてもよく;

Rb中のQは、部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環(q)を示し、環上の任意の位置でA^2と結合し、複素環(q)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含み;

A^1は、単結合、炭素数1～3個のアルキレン(a1)、又は炭素数2～3個のアルケニレン(a1')を示し、アルキレン(a1)及びアルケニレン(a1')はそれぞれ独立に炭素数1～4個の低級アルキル基又はフェニル基で置換されていてもよく;

A^2は、単結合、酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、$-S(O)_2-$、又は－N(R^4)－を示し(ただしA^2が酸素原子、イオウ原子、－S(O)－、$-S(O)_2-$、又は－N(R^4)－を示すときには、A^1はエチレン又はトリメチレンを示す);

R^2及びR^3は、それぞれ独立に水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状

飽和アルキル基、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、－OR^5、－$N(R^6)(R^{6'})$、－$NHCOR^7$、－$NHSO_2R^8$、又は－A^6－Qaを示すか、あるいはそれらが互いに繋がってメチレンジオキシ基を示し；

Qaは、部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環（qa）を示し、環上の任意の位置でA^6と結合し、1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されていてもよく、複素環（qa）は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含み；

R^4及びR^6は、それぞれ独立に水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示し；

R^5及びR^7は、それぞれ独立に水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は－A^6－Qaを示し；

R^8は、炭素数1～4個の低級アルキル基を示し；

$R^{6'}$は、R^6と同義であるか、あるいはR^6と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示し；

Rc中のpは、2～4のいずれかの整数を示し；

A^4は、単結合、メチレン、又はエチレンを示し；

A^5は、－C(O)－、－C(S)－、又は－$S(O)_2$－を示し；

Rdは、水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又はQaを示し；

Reは、炭素数1～8個のアルキル基、－A^6－Qa、－$(CH_2)_iR^{14}$、－OR^{28}、－SR^{28}、又は－$N(R^{29})(R^{30})$を示し；

iは1～3のいずれかの整数を示し；

R^{14}は、水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、カルボキシル基、又は炭素数1～4個のN, N－ジアルキルカルバモイル基を示し；

R^{28}は、炭素数1～8個のアルキル基又は－A^6－Qaを示し；

R^{29}は、炭素数1～8個のアルキル基、炭素数1～4個のアルコキシカルボニル基、又は－A^6－Qaを示し；

R^{30}は、水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示すか、あるいはR^{29}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロア

ルキル基又はモルホリノ基を示し;

Rzは、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、エチル基、又は－A^5－Reを示し;

Ryは、水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は－A^6－Qpを示すか、あるいはRzと繋がって窒素原子とともに原子数3～7の飽和又は不飽和の環状置換基(qy)を形成し、環状置換基(qy)は、該窒素原子とは別に窒素原子、酸素原子、又はイオウ原子のいずれか1個含んでもよく、さらに環状置換基(qy)は、1個又は同一若しくは異なる2個のRfで置換されてもよく;

Rfは、炭素数1～8個のアルキル基又は－A^6－Qpを示し;

V^1及びV^2は、これらの一方はZxを示し、且つそのときの他方はARを示し;

Zxは、水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、－OR^9、又は－N(Rn^1)(Rn^2)を示し;

R^9は、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は－A^6－Qpを示し;

Rn^1は、水素原子又は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基を示し;

Rn^2は、Rn^1と同義であるか、あるいは－COR^{23}若しくは－SO_2R^{24}を示すか、又はRn^1と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成し;

R^{23}は、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数1～4個の低級アルコキシ基、－O－A^6－Qp、又は－N(R^{25})(R^{26})を示し;

R^{25}は、水素原子又は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基を示し;

R^{26}は、R^{25}と同義であるか、あるいはR^{25}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成し;

R^{24}は、炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示し;

ARは、部分不飽和又は完全不飽和である縮合二環式の炭素環又は複素環(ar)を示し、1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよく;

複素環(ar)は、窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又

は異なる環構成ヘテロ原子を1～4個含み；

Xaは、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝鎖状飽和アルキル基、炭素数3～7個の環状飽和アルキル基、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、－$(CH_2)_i R^{14}$、－OR^{10}、－$N(R^{11})(R^{12})$、－SO_2R^{13}、又は－COR^{27}を示し；

R^{10}は、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基又は－$(CH_2)_i R^{14}$を示し；

R^{11}は、水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を示し；

R^{12}は、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、－COR^{15}、又は－SO_2R^{16}を示すか、あるいはR^{11}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示し；

R^{15}は、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、アミノ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基、又は－A^6－Qa示し；

R^{13}及びR^{16}はそれぞれ独立に炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示し；

R^{27}は、水素原子、水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示し；

Yは、水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、－$(CH_2)_m N(R^{18})(R^{19})$、又は－$C(R^{20})_2 OC(O)A^3R^{21}$を示し；

mは、整数2又は3を示し；

R^{18}は、R^{19}と同じであるか、あるいはR^{19}と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示し；

R^{19}は、メチル基、エチル基、又はプロピル基を示し；

R^{20}は、水素原子、メチル基、エチル基、又はプロピル基を示し；

R^{21}は、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数3～6個の環状飽和アルキル基、又はフェニル基を示し；

A^3は、単結合又は酸素原子を示す。]で表される化合物〔以下、単に「本発明化合物(I)」と称することがある〕又はその塩。

[2] V^1がZxであり、V^2がARである請求項1に記載の化合物又はその塩。

[3] 環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkはCH_2であるか、又は環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkはCHであり;
Wがメチレン基である請求項1又は2に記載の化合物又はその塩。

[4] 環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり;
LinkがCH_2であり;
Wがメチレン基である請求項1又は2に記載の化合物又はその塩。

[5] ARがナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1，8〕ナフチリジン、〔1，5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン、チエノ〔3，2－c〕ピリジン、チエノ〔3，2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1，3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの環の残基(上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていて

もよい)である請求項1から4のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[6] ARがナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾフラン－2－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－2－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－イル基、インドール－6－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、ベンゾチアゾール－5－イル基、ベンゾチアゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール－4－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－5－イル基、キノリン－7－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－7－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、1H－インダゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－5－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－4－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－6－イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール－7－イル基、2H－インダゾール－5－イル基、2H－インダゾール－4－イル基、2H－インダゾール－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－7－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－4－イル基、イソキノリン－6－イル基、イソキノリン－3－イル基、イソキノリン－5－イル基、イソキノリン－7－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－5－イル基、シンノリン－6－イル基、シンノリン－5－イル基、キナゾリン－6－イル基、キナゾリン－7－イル基、キナゾリン－5－イル基、キノキサリン－2－イル基、キノキサリン－6－イル基、キノキサリン－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－5－イル基、1H－ベンゾイミダゾール－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－4－イル基、ベンゾオキサゾール－7－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン－6－イル基、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール－5－イル基、ベンゾ〔1，2

, 5]チアジアゾール－4－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－5－イル基、1H－ベンゾトリアゾール－4－イル基、1, 3－ジヒドロピロロ[2, 3－b]ピリジン－5－イル基、1, 3－ジヒドロピロロ[2, 3－b]ピリジン－4－イル基、1, 3－ジヒドロベンゾイミダゾール－5－イル基、1, 3－ジヒドロベンゾイミダゾール－4－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－6－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－7－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－5－イル基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール－4－イル基、フタラジン－6－イル基、フタラジン－5－イル基、[1, 8]ナフチリジン－3－イル基、[1, 8]ナフチリジン－4－イル基、[1, 5]ナフチリジン－3－イル基、[1, 5]ナフチリジン－4－イル基、1H－ピロロ[3, 2－c]ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ[3, 2－c]ピリジン－4－イル基、1H－ピロロ[2, 3－c]ピリジン－5－イル基、1H－ピロロ[2, 3－c]ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ[4, 3－b]ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ[4, 3－b]ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ[4, 3－c]ピリジン－6－イル基、1H－ピラゾロ[4, 3－c]ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－c]ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－c]ピリジン－4－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－b]ピリジン－5－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－b]ピリジン－4－イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3－a]ピリジン－6－イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3－a]ピリジン－7－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－2－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－3－イル基、チエノ[3, 2－c]ピリジン－6－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－2－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－3－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－5－イル基、チエノ[3, 2－b]ピリジン－6－イル基、1H－チエノ[3, 2－c]ピラゾール－5－イル基、1H－チエノ[3, 2－c]ピラゾール－4－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール－7－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－5－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－4－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－6－イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール－7－イル基、インドリジン－7－イル基、インドリジン－6－イル基、インドリジン－8－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－5－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－4－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－6－イル基、1H－ピラゾロ[3, 4－d]チアゾール－5－イル基、2H－イソインドー

ル－５－イル基、2H－イソインドール－４－イル基、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，５－a〕ピリミジン－６－イル基、1H－ピラゾロ〔3，４－b〕ピラジン－５－イル基、1H－イミダゾ〔4，５－b〕ピラジン－５－イル基、7H－プリン－２－イル基、4H－クロメン－６－イル基、又は4H－クロメン－５－イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかの基である請求項1から4のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[7] ARがナフタレン－２－イル基、６－ヒドロキシナフタレン－２－イル基、６－メトキシナフタレン－２－イル基、６－（２－ヒドロキシエチルオキシ）ナフタレン－２－イル基、６－アミノナフタレン－２－イル基、６－（N－メチルアミノ）ナフタレン－２－イル基、６－（N，N－ジメチルアミノ）ナフタレン－２－イル基、６－（２－ヒドロキシエチルアミノ）ナフタレン－２－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－５－イル基、２－メチルベンゾ〔b〕フラン－５－イル基、３－メチルベンゾ〔b〕フラン－５－イル基、2，３－ジメチルベンゾ〔b〕フラン－５－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－５－イル基、２－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－５－イル基、３－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－５－イル基、2，３－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－５－イル基、1H－インドール－５－イル基、２－メチル－1H－インドール－５－イル基、３－メチル－1H－インドール－５－イル基、2，３－ジメチル－1H－インドール－５－イル基、１－メチル－1H－インドール－５－イル基、1，２－ジメチル－1H－インドール－５－イル基、1，３－ジメチル－1H－インドール－５－イル基、1，2，３－トリメチル－1H－インドール－５－イル基、１－エチル－1H－インドール－５－イル基、１－エチル－２－メチル－1H－インドール－５－イル基、１－エチル－３－メチル－1H－インドール－５－イル基、１－エチル－2，３－ジメチル－1H－インドール－５－イル基、１－プロピル－1H－インドール－５－イル基、２－メチル－１－プロピル－1H－インドール－５－イル基、３－メチル－１－プロピル－1H－インドール－５－イル基、2，３－ジメチル－１－プロピル－1H－インドール－５－イル基、１－（２－ヒドロキシエチル）－1H－インドール－５－イル基、１－（２－ヒドロキシエチル）－２－メチル－1H－インドール－５－イル基、１－（２－ヒドロキシエチル）－３－メチル－1H－インドール－５－イル基、2，３－ジメチル－１－（２－ヒドロキシエチル）－1H－インドール－５－イル基、ベンゾチアゾール－６－イル基、２－メチルベン

ゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基である請求項1から4のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[8] ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N，N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基

、又はベンゾオキサゾール－５－イル基のいずれかの基である請求項1から4のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[9] Rb中のQが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基、4H－クロメニル基、ジヒドロベンゾジオキシル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ピロロピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、チエノピリジニル基、チエノピラゾリル基、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール基、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール基、又はジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール基（上記の基は環上の任意の位置でA^2と結合する）のいずれかの基であり；

Qaはフェニル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、又はインダゾリル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のT^1で置換されていてもよく、環上の任意の位置でA^6と結合する）のいずれかの基である請求項1から8のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[10] Dが単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかである請求項1から9のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[11] Dが単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエ

チル基のいずれかの基であるか、あるいはRbであり；

Qが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり；

A^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－のいずれかであり；

A^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、又はメチルトリメチレン基のいずれかであり（但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－であるとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、エテニレン基、トリメチレン基、又はメチルトリメチレン基のいずれかであり）；

R^2及びR^3がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり；

Rsが、－N（Ry）（Rz）であるときのRzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基であり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基であるときRyは水素原子以外の置換基であり）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－1－イル基、イミダゾール－1－イル基、ピラゾール－1－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ば

れる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよい請求項1から9のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[12] Dが単結合、又は酸素原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの基であるか、あるいはRbであり；

Qが、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかの基であり；

A^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－のいずれかであり；

A^1が、A^2が単結合であるとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかであり、またA^2が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－であるときエチレン基であり；

R^2及びR^3がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかであり；

Rsが、－N（Ry）（Rz）であるときのRzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基であり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基を示すときRyは水素原子以外の置換基である）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）が、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から

選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよい請求項1から9のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[13] Dが単結合、又は酸素原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－（2－フルオロフェニル）エチル基、1－（3－フルオロフェニル）エチル基、1－（4－フルオロフェニル）エチル基、1－（2－クロロフェニル）エチル基、1－（3－クロロフェニル）エチル基、1－（4－クロロフェニル）エチル基、1－（2－メトキシフェニル）エチル基、1－（3－メトキシフェニル）エチル基、1－（4－メトキシフェニル）エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフル

オロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり；

－N(Ry)(Rz)が、N，N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N，N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキ

シル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3，5－ジフルオロ

フェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニ

ルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメ

チル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかである請求項1から9のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[14] Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかである請求項1から13のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[15] Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである請求項1から14のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

[16] 環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合又は二重結合のいずれかであり;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2又はCH_2CH_2のいずれかであり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;
Wが、メチレン基であり;
Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;
Dが、単結合、酸素原子、又はイオウ原子のいずれかであり;
Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2－シクロペンチルエチル基、2－シクロヘキシルエチル基、又は2－シクロヘプチルエチル基のいずれかであるか、あるいはRbであり;
Qが、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基のいずれかの基であり;
A^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかあり;

A^1が、単結合、メチレン基、メチルメチレン基、エチルメチレン基、フェニルメチレン基、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかであり（但しA^2が酸素原子、イオウ原子、－N（メチル）－、又は－N（エチル）－のいずれかあるとき、A^1は、エチレン基、メチルエチレン基、ジメチルエチレン基、エチルエチレン基、フェニルエチレン基、トリメチレン基、メチルトリメチレン基のいずれかである）；

R^2及びR^3が、それぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、N，N－ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基のいずれかであり；

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか（但し、Rzがメチル基、又はエチル基であるときRyは水素原子以外の置換基である）、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、ピペラジノ基、ホモピペラジノ基、ピロール－１－イル基、イミダゾール－１－イル基、ピラゾール－１－イル基、又はチオモルフォリノ基から選ばれる環状置換基（qy）を形成してもよく、環状置換基（qy）が、1個又は同一若しくは異なる2個の炭素数1～8個のアルキル基、フェニル基、又はフェニルメチル基（但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい）で置換されてもよく；

V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N－エチルアミノ基、N－プロピルアミノ基、N－イソプロピルアミノ基、又はN，N－ジメチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ－1H－キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H－インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H－インダゾール

、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ－2H－イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H－ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H－ピロロ〔3，2－b〕ピリジン、ベンゾ〔1，2，5〕チアジアゾール、1H－ベンゾトリアゾール、1，3－ジヒドロピロロ〔2，3－b〕ピリジン、1，3－ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ－3H－ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1，8〕ナフチリジン、〔1，5〕ナフチリジン、1H－ピロロ〔3，2－c〕ピリジン、1H－ピロロ〔2，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－b〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔4，3－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－c〕ピリジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピリジン、〔1，2，4〕トリアゾロ〔4，3－a〕ピリジン、チエノ〔3，2－c〕ピリジン、チエノ〔3，2－b〕ピリジン、1H－チエノ〔3，2－c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1，3－ジヒドロインドール、1H－ピラゾロ〔3，4－d〕チアゾール、2H－イソインドール、〔1，2，4〕トリアゾロ〔1，5－a〕ピリミジン、1H－ピラゾロ〔3，4－b〕ピラジン、1H－イミダゾ〔4，5－b〕ピラジン、7H－プリン、又は4H－クロメンのいずれかの残基（上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）であり；

Xaが、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2－カルボキシエチル基、N，N－ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2－カルボキシエチルオキシ基、N，N－ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン－2－カルボキシアミノ基、2－ヒドロキシアセチルアミノ基、2－アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N，N－ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N－メチルスルファモイル基、N，N－ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN，N－ジメチルカルバモイル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、又は炭素数1～4個の低級アルキル基のいずれかである請求項1に記載の化合物又はその塩。

[17] 環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり;
環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがCH_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;
Wがメチレン基であり;
Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;
Dは、単結合、又は酸素原子のいずれかであり;
Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの置換基であるか、先に示したRbであり;
Qが、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかであり;
A^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり;
A^1が、A^2が単結合であるとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかであり、またA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであるときエチレン基であり;
R^2及びR^3がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかであり;
Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり;
Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであり(但し、Rzがメチル基、又はエチル基のいずれかであるときRyは水素原子以外の置換基である)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若

しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく;

V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、ナフタレン－1－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾフラン－4－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－4－イル基、インドール－5－イル基、インドール－4－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、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、ジヒドロ－1H－キノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1H－インダゾール－4－イル基、イミダゾ〔1,2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2,3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、ジヒドロ－2H－イソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基及びベンゾオキサゾール－5－イル基(上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい)のいずれかの置換基であり;

Xaが、オキソ基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N,N－ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、又はカルボキシル基のいずれかであり;

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである請求項1に記載の化合物又はその塩。

[18] 環(E)上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合、又は二重結合のいずれかであり;

環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であるときLinkがC

H_2であり、また環(E)上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が二重結合であるときLinkがCHであり;

Wがメチレン基であり;

Rsが、－D－Rxあるいは－N(Ry)(Rz)のいずれかであり;

Dが、単結合、又は酸素原子のいずれかであり;

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニ

ルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－[4－(N，N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり；

－N(Ry)(Rz)が、N，N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N，N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミ

ノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2，5－ジフルオロフェニ

ルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピロリジノ基、3, 4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ

基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2, 6－ジメチルピペリジノ基、3, 5－ジメチルピペリジノ基、4, 4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3, 5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－

ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかであり;

V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N－メチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、6－(2－ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－(2－ヒドロキシエチル)

－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2，3－ジメチル－1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2，3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1，2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1，2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2，3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1，2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかの基であり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである請求項1に記載の化合物又はその塩。

[19] 環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2であり；

Wがメチレン基であり；

Rsが、－D－Rxあるいは－N（Ry）（Rz）のいずれかであり；

Dが、単結合、又は酸素原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基のいずれかの置換基であるか、Rbであり；

Qが、フェニル基、2－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、又はインダン－2－イル基のいずれかであり；

A^2が、単結合、酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－のいずれかであり；

A^1が、A^2が単結合であるとき単結合であるか、あるいはメチレン基、メチルメチレン基、又はエチレン基のいずれかであり、またA^2が酸素原子、イオウ原子、－N(メチル)－、又は－N(エチル)－であるときエチレン基であり；

R^2及びR^3がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基のいずれかであり；

Rzが、Rxと同義であるか、あるいはメチル基、又はエチル基のいずれかであり；

Ryが、水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、又はイソペンチル基のいずれかであるか(但し、Rzがメチル基、又はエチル基であるときRyは水素原子以外の置換基である)、Rzと繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、又はピペラジノ基から選ばれる環状置換基(qy)を形成してもよく、環状置換基(qy)が、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、又はフェニルメチル基(但し、フェニル基、およびフェニルメチル基のベンゼン環は、1個又は同一若しくは異なる2個のメチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、水酸基、メトキシ基、ジメチルアミノ基からなる群から選ばれる置換基で置換されてもよい)で置換されてもよく；

V^1がZxであり、V^2がARであり；

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり；

ARが、ナフタレン－2－イル基、ベンゾフラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－6－イル基、キノリン－3－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基のいずれかであり（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）のいずれかの置換基であり；

Xaが、オキソ基、メチル基、エチル基、プロピル基、2－ヒドロキシエチル基、水酸基、メトキシ基、2－ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、N－メチルアミノ基、N，N－ジメチルアミノ基、2－ヒドロキシエチルアミノ基、又はカルボキシル基のいずれかであり；

Yが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである請求項1に記載の化合物又はその塩。

[20] 環（E）上の1位の環構成炭素原子と2位の環構成炭素原子の結合が単結合であり；

環（E）上の1位の環構成炭素原子とLink部位との結合が単結合であり；

LinkがCH_2であり；

Wがメチレン基であり；

Rsが、－D－Rxあるいは－N（Ry）（Rz）のいずれかであり；

Dが、単結合、又は酸素原子のいずれかであり；

Rxが、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、イソペンチル基、2－エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、フェニル基、2－メチルフェニル基、4－メチルフェニル基、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－チエニル基、3－チエニル基、2－フリル基、3－フリル基、インダン－2－イル基、4－メチルインダン－2－イル基、5－メチルインダン－2－イル基、4，7－ジメチルインダン－2－イル基、5，6－ジメチルインダン－2－イル基、4－フルオロインダン－2－イル基、5－フルオロインダン－2－イル基、4，7－ジフルオロインダン－2－イル基、5，6－ジフルオロインダン－2－イル基、4－クロロインダン－2－イル基、5－クロロインダン－2－イル基、4，7－ジクロロインダン－2－イル基、5，

6－ジクロロインダン－2－イル基、4－ヒドロキシインダン－2－イル基、5－ヒドロキシインダン－2－イル基、4，7－ジヒドロキシインダン－2－イル基、5，6－ジヒドロキシインダン－2－イル基、4－メトキシインダン－2－イル基、5－メトキシインダン－2－イル基、4，7－ジメトキシインダン－2－イル基、5，6－ジメトキシインダン－2－イル基、1－フェニルエチル基、1－(2－フルオロフェニル)エチル基、1－(3－フルオロフェニル)エチル基、1－(4－フルオロフェニル)エチル基、1－(2－クロロフェニル)エチル基、1－(3－クロロフェニル)エチル基、1－(4－クロロフェニル)エチル基、1－(2－メトキシフェニル)エチル基、1－(3－メトキシフェニル)エチル基、1－(4－メトキシフェニル)エチル基、ベンジル基、2－メチルフェニルメチル基、3－メチルフェニルメチル基、4－メチルフェニルメチル基、2，3－ジメチルフェニルメチル基、3，5－ジメチルフェニルメチル基、2－フルオロフェニルメチル基、3－フルオロフェニルメチル基、4－フルオロフェニルメチル基、2－クロロフェニルメチル基、3－クロロフェニルメチル基、4－クロロフェニルメチル基、2，3－ジフルオロフェニルメチル基、2，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，5－ジフルオロフェニルメチル基、3，4－ジフルオロフェニルメチル基、2，3－ジクロロフェニルメチル基、2，4－ジクロロフェニルメチル基、2，5－ジクロロフェニルメチル基、2，6－ジクロロフェニルメチル基、3，4－ジクロロフェニルメチル基、3，5－ジクロロフェニルメチル基、3，6－ジクロロフェニルメチル基、2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2－ヒドロキシフェニルメチル基、3－ヒドロキシフェニルメチル基、4－ヒドロキシフェニルメチル基、2－メトキシフェニルメチル基、3－メトキシフェニルメチル基、4－メトキシフェニルメチル基、2－(2－メチルフェニル)エチル基、2－(3－メチルフェニル)エチル基、2－(4－メチルフェニル)エチル基、2－(2－メトキシフェニル)エチル基、2－(3－メトキシフェニル)エチル基、2－(4－メトキシフェニル)エチル基、2－(2－フルオロフェニル)エチル基、2－(3－フルオロフェニル)エチル基、2－(4－フルオロフェニル)エチル基、2－(2－クロロフェニル)エチル基、2－(3－クロロフェニル)エチル基、2－(4－クロロフェニル)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－

[4－(N, N－ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2－フェニルオキシエチル基、2－(2－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(3－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(4－クロロフェニルオキシ)エチル基、2－(フェニルチオ)エチル基、2－(N－フェニル－N－メチルアミノ)エチル基、又は2－(N－エチル－N－フェニルアミノ)エチル基のいずれかであり;

置換基－N(Ry)(Rz)が、N, N－ジメチルアミノ基、N－エチル－N－メチルアミノ基、N, N－ジエチルアミノ基、N－メチル－N－プロピルアミノ基、N－エチル－N－プロピルアミノ基、N－イソプロピル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソプロピルアミノ基、N－ブチルアミノ基、N－ブチル－N－メチルアミノ基、N－ブチル－N－エチルアミノ基、N－イソブチルアミノ基、N－イソブチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソブチルアミノ基、N－イソペンチルアミノ基、N－イソペンチル－N－メチルアミノ基、N－エチル－N－イソペンチルアミノ基、N－(2－エチルブチル)アミノ基、N－(2－エチルブチル)－N－メチルアミノ基、N－シクロペンチルアミノ基、N－シクロペンチル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘキシルアミノ基、N－シクロヘキシル－N－メチルアミノ基、N－シクロヘプチルアミノ基、N－(シクロペンチルメチル)アミノ基、N－(シクロペンチルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)アミノ基、N－(シクロヘキシルメチル)－N－メチルアミノ基、N－フェニルアミノ基、N－(2－メチルフェニル)アミノ基、N－(4－メチルフェニル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニル)アミノ基、N－(2－クロロフェニル)アミノ基、N－(3－クロロフェニル)アミノ基、N－(4－クロロフェニル)アミノ基、N－(インダン－2－イル)アミノ基、N－(1－フェニルエチル)アミノ基、N－[1－(2－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－フルオロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(2－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(3－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－[1－(4－クロロフェニル)エチル]アミノ基、N－ベンジルアミノ基、N－ベンジル－N－メチルアミノ基、N－ベンジル－N－エチルアミノ基、N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(2－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(3－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(3－メ

チルフェニルメチル)アミノ基、N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－メチル－N－(4－メチルフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－フルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)アミノ基、N－(4－クロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジフルオロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)アミノ基、N－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)－N－メチルアミノ基、N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[2－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[3－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、N－メチル－N－[4－(トリフルオロメチル)フェニルメチル]アミノ基、ピロリジノ基、2－メチルピロリジノ基、3－メチルピロリジノ基、2, 5－ジメチルピ

ロリジノ基、3，4－ジメチルピロリジノ基、ピペリジノ基、2－メチルピペリジノ基、3－メチルピペリジノ基、4－メチルピペリジノ基、4－エチルピペリジノ基、4－プロピルピペリジノ基、4－イソプロピルピペリジノ基、4－ブチルピペリジノ基、4－イソブチルピペリジノ基、4－シクロペンチルピペリジノ基、4－シクロヘキシルピペリジノ基、4－(シクロペンチルメチル)ピペリジノ基、4－(シクロヘキシルメチル)ピペリジノ基、4－フェニルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペリジノ基、4－ベンジルピペリジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，5－ジメチルフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，5－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，4－ジフルオロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，3－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2，6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，4－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，5－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3，6－ジクロロフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペリジノ基、2，6－ジメチルピペリジノ基、3，5－ジメチルピペリジノ基、4，4－ジメチルピペリジノ基、ホモピペリジノ基、モルホリノ基、3，5－ジメチルモルホリノ基、4－フェニルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(4－メチルフェニル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－フ

ルオロフェニル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニル)ピペラジノ基、4－ベンジルピペラジノ基、4－(2－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－メチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジメチルフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－フルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(4－クロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジフルオロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 3－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 4－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 5－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3, 6－ジクロロフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(2－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、4－(3－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基、又は4－(4－メトキシフェニルメチル)ピペラジノ基のいずれかであり;

V^1がZxであり、V^2がARであり;

Zxが、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、又はN－メチルアミノ基のいずれかであり;

ARが、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－(N, N－ジメチルアミノ)ナフタレン－2－イル基、ベンゾ[b]フラン－5－イル基、ベンゾ[b]チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダ

ゾール－５－イル基、１－エチル－1Ｈ－インダゾール－５－イル基、イソキノリン－６－イル基、１－オキソ－１，２－ジヒドロイソキノリン－６－イル基、シンノリン－６－イル基、又はベンゾオキサゾール－５－イル基のいずれかであり；

Ｙが、水素原子、メチル基、又はエチル基のいずれかである請求項1に記載の化合物又はその塩。

[21] 請求項1から20のいずれか1項に記載の化合物又は薬理学的に許容されるその塩を有効成分として含む医薬。

[22] 請求項1から20のいずれか1項に記載の化合物又は薬理学上許容されるその塩を有効成分として含むプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生抑制剤。

[23] プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生により惹起される疾患の予防及び／又は治療のための請求項21に記載の医薬。

[24] 哺乳動物の炎症性疾患の予防及び／又は治療のための請求項21に記載の医薬。

[25] 哺乳動物の自己免疫疾患の予防及び／又は治療のための請求項21に記載の医薬。

[26] 哺乳動物のアレルギー性疾患の予防及び／又は治療のための請求項21に記載の医薬。

[27] 哺乳動物の解熱及び／又は鎮痛のための請求項21に記載の医薬。

[28] 哺乳動物における急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態の予防及び／又は治療のための医薬組成物であって、上記予防及び／又は治療に有効な量の請求項1から20のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩と薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。

[29] 哺乳動物における急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態の予防及び／又は治療方法であって、上記予防及び／又は治療に有効な量の請求項1から20のいずれか1項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩を該哺乳動物に投与する工程を含む方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2007/056791

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
See extra sheet.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
See extra sheet.

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched
Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2007
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2007 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2007

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CA(STN), REGISTRY(STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2004/011446 A1 (BAYER PHARMACEUTICALS CORP.), 05 February, 2004 (05.02.04), & AU 2003-263814 A1	1,3,4,9,10, 14,15,21
A	JP 5-502222 A (American Home Products Corp.), 22 April, 1993 (22.04.93), & WO 91/06537 A2 & EP 502106 A1	1-28

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
19 April, 2007 (19.04.07)	01 May, 2007 (01.05.07)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2007/056791

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

C07C69/616(2006.01)i, *A61K31/216*(2006.01)i, *A61K31/343*(2006.01)i, *A61K31/357*(2006.01)i, *A61K31/381*(2006.01)i, *A61K31/404*(2006.01)i, *A61K31/415*(2006.01)i, *A61K31/4155*(2006.01)i, *A61K31/4164*(2006.01)i, *A61K31/4184*(2006.01)i, *A61K31/428*(2006.01)i, *A61K31/44*(2006.01)i, *A61K31/4406*(2006.01)i, *A61K31/4409*(2006.01)i, *A61K31/451*(2006.01)i, *A61K31/47*(2006.01)i, *A61K31/472*(2006.01)i, *A61K31/495*(2006.01)i, *A61K31/496*(2006.01)i, *A61K31/5375*(2006.01)i, *A61K31/5377*(2006.01)i, *A61P9/00*(2006.01)i, *A61P17/00*(2006.01)i, *A61P19/02*(2006.01)i, *A61P21/00*(2006.01)i, *A61P25/00*(2006.01)i, *A61P25/04*(2006.01)i, *A61P29/00*(2006.01)i, *A61P29/02*(2006.01)i, *A61P31/00*(2006.01)i, *A61P35/00*(2006.01)i, *A61P37/02*(2006.01)i, *A61P37/08*(2006.01)i, *A61P43/00*(2006.01)i, *C07C69/618*(2006.01)i, *C07C69/736*(2006.01)i, *C07C217/76*(2006.01)i, *C07C229/42*(2006.01)i, *C07C229/50*(2006.01)i, *C07D209/18*(2006.01)i, *C07D211/14*(2006.01)i, *C07D213/30*(2006.01)i, *C07D213/55*(2006.01)i, *C07D215/14*(2006.01)i, *C07D217/00*(2006.01)i, *C07D231/54*(2006.01)i, *C07D265/30*(2006.01)i, *C07D277/62*(2006.01)i, *C07D295/14*(2006.01)i, *C07D307/54*(2006.01)i, *C07D307/80*(2006.01)i, *C07D319/20*(2006.01)i, *C07D333/24*(2006.01)i, *C07D333/60*(2006.01)i, *C07D401/10*(2006.01)i, *C07D401/12*(2006.01)i, *C07D401/14*(2006.01)i, *C07D403/10*(2006.01)i, *C07D403/12*(2006.01)i, *C07D405/10*(2006.01)i, *C07D405/12*(2006.01)i, *C07D409/10*(2006.01)i

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED
Minimum documentation searched (International Patent Classification (IPC))

C07C69/616, A61K31/216, A61K31/343, A61K31/357, A61K31/381, A61K31/404, A61K31/415, A61K31/4155, A61K31/4164, A61K31/4184, A61K31/428, A61K31/44, A61K31/4406, A61K31/4409, A61K31/451, A61K31/47, A61K31/472, A61K31/495, A61K31/496, A61K31/5375, A61K31/5377, A61P9/00, A61P17/00, A61P19/02, A61P21/00, A61P25/00, A61P25/04, A61P29/00, A61P29/02, A61P31/00, A61P35/00, A61P37/02, A61P37/08, A61P43/00, C07C69/618, C07C69/736, C07C217/76, C07C229/42, C07C229/50, C07D209/18, C07D211/14, C07D213/30, C07D213/55, C07D215/14, C07D217/00, C07D231/54, C07D265/30, C07D277/62, C07D295/14, C07D307/54, C07D307/80, C07D319/20, C07D333/24, C07D333/60, C07D401/10, C07D401/12, C07D401/14, C07D403/10, C07D403/12, C07D405/10, C07D405/12, C07D409/10

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2007/056791

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. [X] Claims Nos.: 29
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Claim 29 pertains to methods for treatment of the human body or animal body by therapy and thus relates to a subject matter which this International Searching Authority is not required, under the provisions of Article 17(2)(a)(i) of the PCT (continued to extra sheet)

2. [ ] Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. [ ] Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. [ ] As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. [ ] As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.

3. [ ] As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. [ ] No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

the

[ ] The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, payment of a protest fee..

[ ] The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.

[ ] No protest accompanied the payment of additional search fees.

Continuation of Box No.II-1 of continuation of first sheet(2)

and Rule 39.1(iv) of the Regulations under the PCT, to search.

国際調査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ２００７／０５６７９１

Ａ．　発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　特別ページ参照

Ｂ．　調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　特別ページ参照

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	１９２２－１９９６年
日本国公開実用新案公報	１９７１－２００７年
日本国実用新案登録公報	１９９６－２００７年
日本国登録実用新案公報	１９９４－２００７年

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CA(STN)
REGISTRY(STN)

Ｃ．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求の範囲の番号
Ｘ	ＷＯ　２００４／０１１４４６　Ａ１（BAYER PHARMACEUTICALS CORPORATION）２００４．０２．０５　＆　ＡＵ　２００３－２６３８１４　Ａ１	1,3,4,9,10,14,15,21
Ａ	ＪＰ　５－５０２２２２　Ａ（アメリカン・ホーム・プロダクツ・コーポレイション）１９９３．０４．２２　＆　ＷＯ　９１／０６５３７　Ａ２　＆　ＥＰ　５０２１０６　Ａ１	１－２８

☐　Ｃ欄の続きにも文献が列挙されている。

☐　パテントファミリーに関する別紙を参照。

＊　引用文献のカテゴリー
「Ａ」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「Ｅ」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「Ｌ」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「Ｏ」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「Ｐ」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献
「Ｔ」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「Ｘ」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Ｙ」特に関連のある文献であって、当該文献と他の１以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「＆」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日
１９．０４．２００７	０１．０５．２００７

国際調査機関の名称及びあて先
日本国特許庁（ＩＳＡ／ＪＰ）
郵便番号１００－８９１５
東京都千代田区霞が関三丁目４番３号

特許庁審査官（権限のある職員）　４Ｈ　９１６５
吉住　和之
電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４４３

発明の属する分野の分類
C07C69/616(2006.01)i, A61K31/216(2006.01)i, A61K31/343(2006.01)i,
A61K31/357(2006.01)i, A61K31/381(2006.01)i, A61K31/404(2006.01)i,
A61K31/415(2006.01)i, A61K31/4155(2006.01)i, A61K31/4164(2006.01)i,
A61K31/4184(2006.01)i, A61K31/428(2006.01)i, A61K31/44(2006.01)i,
A61K31/4406(2006.01)i, A61K31/4409(2006.01)i, A61K31/451(2006.01)i,
A61K31/47(2006.01)i, A61K31/472(2006.01)i, A61K31/495(2006.01)i,
A61K31/496(2006.01)i, A61K31/5375(2006.01)i, A61K31/5377(2006.01)i,
A61P9/00(2006.01)i, A61P17/00(2006.01)i, A61P19/02(2006.01)i, A61P21/00(2006.01)i,
A61P25/00(2006.01)i, A61P25/04(2006.01)i, A61P29/00(2006.01)i, A61P29/02(2006.01)i,
A61P31/00(2006.01)i, A61P35/00(2006.01)i, A61P37/02(2006.01)i, A61P37/08(2006.01)i,
A61P43/00(2006.01)i, C07C69/618(2006.01)i, C07C69/736(2006.01)i,
C07C217/76(2006.01)i, C07C229/42(2006.01)i, C07C229/50(2006.01)i,
C07D209/18(2006.01)i, C07D211/14(2006.01)i, C07D213/30(2006.01)i,
C07D213/55(2006.01)i, C07D215/14(2006.01)i, C07D217/00(2006.01)i,
C07D231/54(2006.01)i, C07D265/30(2006.01)i, C07D277/62(2006.01)i,
C07D295/14(2006.01)i, C07D307/54(2006.01)i, C07D307/80(2006.01)i,
C07D319/20(2006.01)i, C07D333/24(2006.01)i, C07D333/60(2006.01)i,
C07D401/10(2006.01)i, C07D401/12(2006.01)i, C07D401/14(2006.01)i,
C07D403/10(2006.01)i, C07D403/12(2006.01)i, C07D405/10(2006.01)i,
C07D405/12(2006.01)i, C07D409/10(2006.01)i

調査を行った最小限資料
C07C69/616, A61K31/216, A61K31/343, A61K31/357, A61K31/381, A61K31/404, A61K31/415, A61K31/4155, A61K31/4164, A61K31/4184, A61K31/428, A61K31/44, A61K31/4406, A61K31/4409, A61K31/451, A61K31/47, A61K31/472, A61K31/495, A61K31/496, A61K31/5375, A61K31/5377, A61P9/00, A61P17/00, A61P19/02, A61P21/00, A61P25/00, A61P25/04, A61P29/00, A61P29/02, A61P31/00, A61P35/00, A61P37/02, A61P37/08, A61P43/00, C07C69/618, C07C69/736, C07C217/76, C07C229/42, C07C229/50, C07D209/18, C07D211/14, C07D213/30, C07D213/55, C07D215/14, C07D217/00, C07D231/54, C07D265/30, C07D277/62, C07D295/14, C07D307/54, C07D307/80, C07D319/20, C07D333/24, C07D333/60, C07D401/10, C07D401/12, C07D401/14, C07D403/10, C07D403/12, C07D405/10, C07D405/12, C07D409/10

国際調査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ２００７／０５６７９１

第Ⅱ欄　請求の範囲の一部の調査ができないときの意見（第１ページの２の続き）

法第8条第3項（ＰＣＴ17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

１．☑ 請求の範囲 ２９ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。
つまり、
請求の範囲２９は、治療による人体又は動物の体の処置方法であり、ＰＣＴ第１７条（２）（ａ）（ｉ）及びＰＣＴ規則３９．１（ｖ）により、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。

２．☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

３．☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であってＰＣＴ規則6.4(a)の第２文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第Ⅲ欄　発明の単一性が欠如しているときの意見（第１ページの３の続き）

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

１．☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。

２．☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。

３．☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。

４．☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

☐ 追加調査手数料及び、該当する場合には、異議申立手数料の納付と共に、出願人から異議申立てがあった。

☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあったが、異議申立手数料が納付命令書に示した期間内に支払われなかった。

☐ 追加調査手数料の納付を伴う異議申立てがなかった。