

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2007 年 11 月 29 日 (29.11.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/136125 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 213/69 (2006.01) A61P 17/14 (2006.01)
 A61K 8/49 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)
 A61K 31/366 (2006.01) A61Q 7/00 (2006.01)
 A61K 31/4412 (2006.01) C07D 213/82 (2006.01)
 A61K 31/4704 (2006.01) C07D 215/22 (2006.01)
 A61K 31/473 (2006.01) C07D 215/38 (2006.01)
 A61P 9/04 (2006.01) C07D 219/06 (2006.01)
 A61P 13/12 (2006.01) C07D 309/36 (2006.01)

Yoshitaka) [JP/JP]; 〒5600013 大阪府豊中市上野東
3-5-7 1 Osaka (JP).(74) 代理人: 榎本雅之, 外(ENOMOTO, Masayuki et al.);
〒5418550 大阪府大阪市中央区北浜四丁目 5 番 3 3 号
住友化学知財センター株式会社内 Osaka (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, 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.

(21) 国際出願番号: PCT/JP2007/060746

(22) 国際出願日: 2007 年 5 月 21 日 (21.05.2007)

(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 2006-141219 2006 年 5 月 22 日 (22.05.2006) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友化
学株式会社 (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY,
LIMITED) [JP/JP]; 〒1048260 東京都中央区新川二丁
目 2 7 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

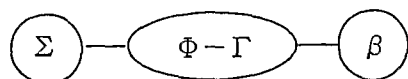
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 白木宏明 (SHI-
RAKI, Hiroaki) [JP/US]; 20852 メリーランド州ロック
ビル 198 ハルパイン通り Apt 1178 Maryland
(US). 高橋 淳也 (TAKAHASHI, Junya) [JP/JP]; 〒
6660262 兵庫県川辺郡猪名川町伏見台 4-3-8 4
Hyogo (JP). 東清史 (HIGASHI, Kiyoshi) [JP/JP]; 〒
5420012 大阪府大阪市中央区谷町 6-2-33-
706 Osaka (JP). 冨ヶ原 祥隆 (TOMIGAHARA,(84) 指定国 (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,
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).

添付公開書類:

— 国際調査報告書
— 電子形式により別個に公開された明細書の配列表部
分、請求に基づき国際事務局から入手可能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。

(54) Title: COMPOUND HAVING HETEROCYCLIC RING AND USE THEREOF

(54) 発明の名称: 含複素環化合物及びその用途



(I)

(57) Abstract: Disclosed are: a composition for inhibiting the
transcription of an extracellular matrix gene, comprising a com-
pound having a heterocyclic ring represented by the formula (I)
and an inert carrier; and others.(57) 要約: 本発明は、式 (I) で示される含複素環化
合物と不活性担体とを含有することを特徴とする細胞外マトリックス遺伝子転写抑制組成物等に関する。

WO 2007/136125 A1

明細書
含複素環化合物及びその用途

技術分野

5 本発明は、含複素環化合物及びその用途等に関する。

背景技術

肝硬変、慢性膵炎、スキルス胃癌、間質性肺疾患、喘息、慢性閉塞性肺疾患、糸球体腎炎、ループス腎炎、尿細管間質性腎炎、I g A腎症、腎硬化症、糖尿病性腎症、遺伝性腎疾患、心筋線維症、心不全、P T C A後の再狭窄、動脈硬化、骨髓線維症、関節リウマチ、炎症後の過形成痕跡、術後の瘢痕や熱傷性瘢痕、アトピー性皮膚炎、肥厚性瘢痕、子宮筋腫、前立腺肥大症、強皮症、アルツハイマー病、硬化性腹膜炎、糖尿病性網膜症、I型糖尿病においては、コラーゲン及びフィブロネクチンに代表されるような細胞外マトリックスの過度の集積により組織が線維化して硬化し、その結果、臓器・組織の機能低下や瘢痕形成等に至る。このような細胞外マトリックスの過度の集積は、細胞外マトリックスの生合成と分解とのバランスの破綻に基づく細胞外マトリックスの産生亢進によって導かれる。実際、線維化した組織においては、コラーゲン遺伝子（特にI型コラーゲン、III型コラーゲン、IV型コラーゲン）や、フィ
10 ブロネクチン遺伝子、ラミニン遺伝子、プロテオグリカン遺伝子等といった細胞外マトリックス遺伝子の発現量が増加していることが観察されている[例えば、J. Invest. Dermatol., 94, 365, (1990); Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 88, 6642, (1991); J. Am. Soc. Nephrol., 15, 2637, (2004); Cardiovasc. Pathol., 13, 119, (2004); Clin. Nephrol., 44, 211, (1995); 及びJ. Hepatol., 29, 263, (1998)参照]。
20 また、線維化した組織においては、サイトカインの1種であるT G F - β の量が上昇していることも観察されている（例えば、J. Invest. Dermatol., 94, 365, (1990); 及びProc. Natl. Acad. Sci. USA, 88, 6642, (1991)参照）。T G F - β は、細胞外マトリックス遺伝子の発現量を増加させ、細胞外マトリックスタ

25

ンパクの産生亢進、ひいては、組織の線維化に関与していることが示唆されている（例えば、J. Invest. Dermatol., 94, 365, (1990); 及び
 Lab. Invest., 63, 171, (1990) 参照）。さらに、組織線維化のモデル動物に対し、抗 TGF- β 抗体や可溶性 TGF- β 受容体を投与することにより、組織の
 5 線維化が改善され、それに伴い組織機能が改善されることが明らかにされており（例えば、Diabetes, 45, 522-530, (1996); Proc. Natl. Acad. Sci. USA
 , 96, 12719-12724, (1999); 及び Proc. Natl. Acad. Sci. USA , 97, 8015-8020,
 (2000) 参照）、また TGF- β の細胞内シグナル伝達に対し、抑制的に働く化合物を投与することにより、組織の線維化が改善され、それに伴い組織機能が
 10 改善されることも知られている（例えば、Autoimmunity, 35, 277-282, (2002);
 J. Hepatol., 37, 331-339, (2002); 及び Life Sci., 71, 1559-1606, (2002) 参照）。

一方、左室拡張不全等の心不全や糖尿病性腎症や腎硬化症等の腎不全の病因は、高血圧状態の心臓線維化がその 1 つとされている。

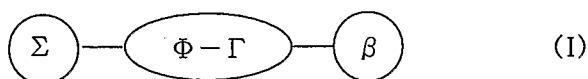
15 発明の開示

本発明は、組織における細胞外マトリックス遺伝子の発現量を減少させ、細胞外マトリックス蓄積量を低下させることにより、組織の線維化を改善させる薬剤（即ち、細胞外マトリックス蓄積抑制剤や、線維症治療剤又は心不全治療剤）開発や提供を可能とすることを目的とする。

20

即ち、本発明は、

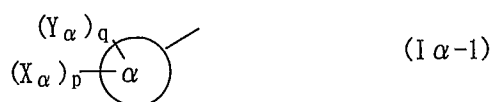
1. 式 (I)



[式中、

I. Σ は、

25 式 (I α -1)

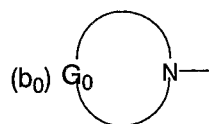


[式中、

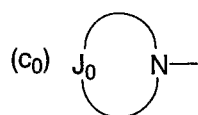
1. α は、芳香族 5 員環、又は、芳香族 6 員環を表し、 $(Y_\alpha)_q$ において、 Y_α は、下記の X_0 群又は Y_0 群の基を表し、 q は、0、1、2 又は 3 を表して、 q が 2 以上のとき、 Y_α は同一又は相異なり、 q が 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_α は、 Z_0 群の基をなして α 環と縮環してもよく、 $(X_\alpha)_p$ において、 X_α は、下記の X_0 群、 Y_0 群及び Z_0 群に属さない置換基を表し、 p は、0、1、2 又は 3 を表し、 p が 2 以上のとき、 X_α は同一又は相異なり、 p と q との和は 3 以下である。
- (1) X_0 群： M_a - 基 [M_a は、 R_b - 基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d - 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又は C1-C10 アルキレン基を表す。)、 HO R_d - 基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - R_d - 基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - O - R_d - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e O - CO - R_d - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 HO - CO - $CH=CH$ - 基、 R_e R_e' N - R_d - 基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - N R_e' - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_b O - CO - N (R_e) - R_d - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e R_e' N - CO - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e R_e' N - CO - N R_e'' - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e

と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。) 、 $R_e R_e' N - C(=NR_e'') - NR_e''' - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。) 、 $R_b - SO_2 - NR_e - R_d$ - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。) 、 $R_e R_e' N - SO_2 - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。) 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

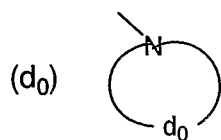
2. Y_0 群: $M_{b_0} - R_d$ - 基 [M_{b_0} は、 M_{c_0} - 基 { M_{c_0} は、 $M_{d_0} - R_d'$ - 基 { M_{d_0} は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい6-10員環のアリール基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい5-10員環のヘテロアリール基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい不飽和結合を含んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、



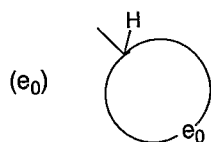
(b_0) - 基 ((b_0) において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5~14員の炭化水素環又は複素環をなす。)、



(c_0) - 基 ((c_0) において、 J_0 は、窒素原子を含んでもよく、芳香族5-7員環をなす。)、



- (d_0) - 基 { d_0 は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ - 基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。 } 、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5 - 12 員の炭化水素環をなす。 } 又は



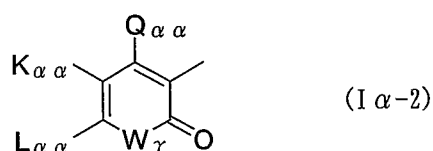
- 10 (e_0) - 基 { e_0 は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) 、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5 - 12 員の炭化水素環をなす。 } を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。 } を表す。 } 、 $M_{c_0} - B_a$ - 基 (M_{c_0} 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。) 、
 15 $M_{c_0} - CO$ - 基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} - CO - O$ - 基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} O - CO$ - 基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} R_e N$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} - CO - NR_e$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} O - CO - NR_e$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} R_e N - CO$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} R_e N - CO - NR_e'$ - 基 (M_{c_0} 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} R_e N - C(=NR_e')$ - NR_e'' - 基 (M_{c_0} 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_{c_0} - SO_2 - NR_e$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_{c_0} R_e N - SO_2$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
 20
 25

」である。

3. Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であって、 α 環と縮環する基である。]

で示される基、

式 (I α -2)



10 [式中、

1. $K_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(I- $\alpha\alpha$) - 基

[(I- $\alpha\alpha$) は、式 (I- $\alpha\alpha$)



15 [式中、 $\alpha\alpha$ は、芳香族 5 員環又は芳香族 6 員環を表し、 Y_α 及び q は、前記と同一の意味を表し、 q が 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_α は、 Z_0 群 (Z_0 群は、前記と同一の意味を表す。) の基をなして $\alpha\alpha$ 環と縮環してもよい。]

で示される基を表す。]を表す。

2. $L_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、(I- $\alpha\alpha$) - 基 ((I- $\alpha\alpha$) は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10アルキル基、(I- $\alpha\alpha$) - 基 ((I- $\alpha\alpha$) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C4-C10アルケニル基、又は、(I- $\alpha\alpha$) - 基 ((I- $\alpha\alpha$) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C4-C10アルキニル基を表し、 $K_{\alpha\alpha}$ と $L_{\alpha\alpha}$ とは、置換基を有してもよい C4-C10アルケニレン基をなすことがある。

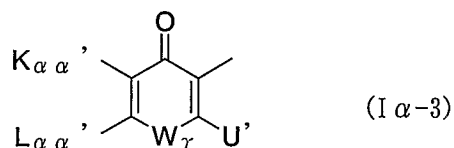
3. $Q_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよい

アミノ基を表す。

4. W_γ は、酸素原子又は $-NT_\gamma-$ 基 (T_γ は、窒素原子上の置換基を表す。) を表す。]

で示される基、

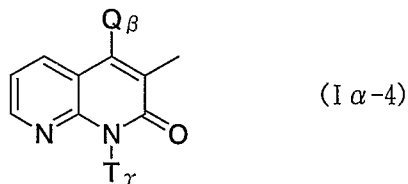
5 式 (I α -3)



[式中、 $K_{\alpha\alpha'}$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、(I- $\alpha\alpha$)-基 (I- $\alpha\alpha$) は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 $L_{\alpha\alpha'}$ は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 $K_{\alpha\alpha'}$ と $L_{\alpha\alpha'}$ とは、置換基を有してもよいC3-C10アルキレン基又は置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 W_γ は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、又は、

式 (I α -4)

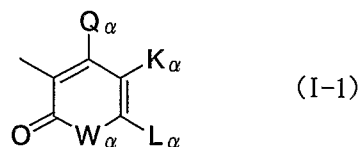


[式中、 Q_β は、置換されてもよい水酸基を表し、 T_γ は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基を表す。

I I. β は、

式 (I-1)



[式中、

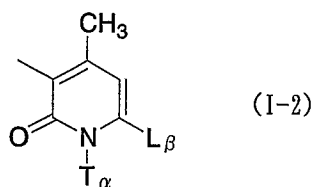
(1) Q_{α} は、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表す。

(2) W_{α} は、酸素原子又は $-NT_{\alpha}-$ 基 (T_{α} は、水素原子、又は、窒素原子上の置換基を表す。) を表す。

- 5 (3) K_{α} 及び L_{α} は、同一又は相異なり、水素原子、又は、炭素原子上の置換基を表し、 K_{α} と L_{α} とは、置換基を有してもよいC3-C10アルキレン基又は置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基、

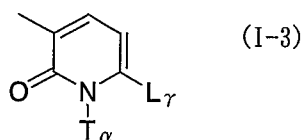
式 (I-2)



- 10 [式中、 T_{α} は、前記と同一の意味を表し、 L_{β} は水酸基又はメチル基を表す。]

で示される基、

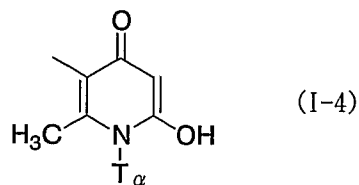
式 (I-3)



- 15 [式中、 T_{α} は、前記と同一の意味を表し、 L_{γ} は、C1-C10アルキル基を表す。]

で示される基、

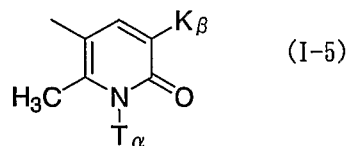
式 (I-4)



[式中、 T_{α} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

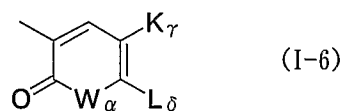
式 (I-5)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 K_β は、シアノ基又は $UOCO-$ 基 (U は、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。) を表す。]

で示される基、

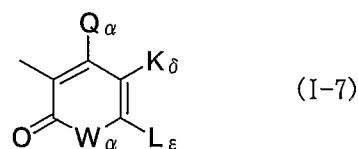
5 式 (I-6)



[式中、 W_α は、前記と同一の意味を表し、 K_γ と L_δ とは、置換基を有してもよい C3-C10 アルキレン基又は置換基を有してもよい C4-C10 アルケニレン基をなす。]

10 で示される基、

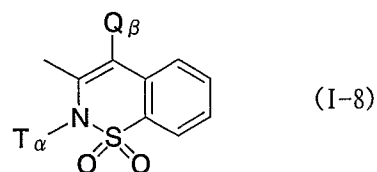
式 (I-7)



[式中、 Q_α 及び W_α は、前記と同一の意味を表し、 K_δ と L_ϵ とは、 $-V_\alpha = V_\alpha' - V_\alpha'' = V_\alpha''' -$ 基 (V_α 、 V_α' 、 V_α'' 及び V_α''' は、同一又は相異なり、置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、 V_α 、 V_α' 、 V_α'' 及び V_α''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。) をなす。]

で示される基、

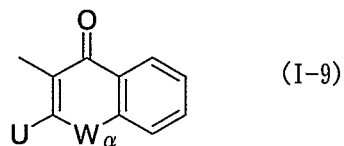
式 (I-8)



[式中、 T_α 及び Q_β は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

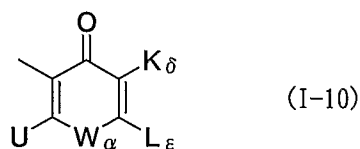
式 (I-9)



5 [式中、U 及び W_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

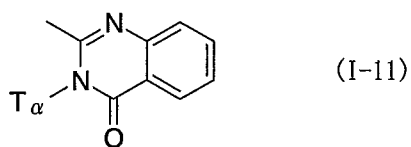
式 (I-10)



[式中、U、 W_α 、 K_δ 及び L_ϵ は、前記と同一の意味を表す。]

10 で示される基、

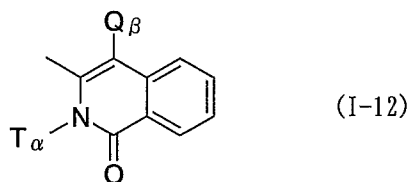
式 (I-11)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

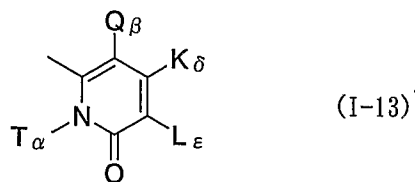
15 式 (I-12)



[式中、 T_α 及び Q_β は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

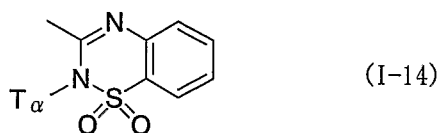
式 (I-13)



[式中、 T_α 、 Q_β 、 K_δ 及び L_ϵ は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

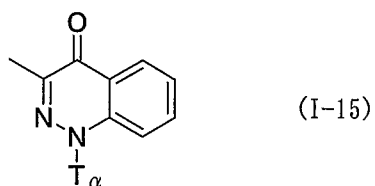
式 (I-14)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

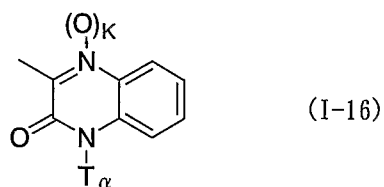
式 (I-15)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

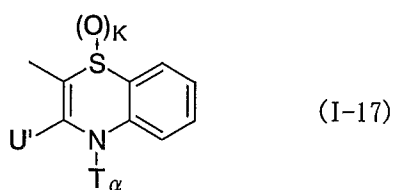
式 (I-16)



10 [式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

で示される基、又は、

式 (I-17)



[式中、 T_α 、 U' 及び K は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基を表す。

III. $\Phi-\Gamma$ において、

Φ は Σ に結合する原子又は基を表し、 Γ は、 β に結合する原子又は基を表し、

5 $\Phi-\Gamma$ は、

式 ($\Phi\Gamma-1$)



(式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 R' は、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

10

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-2$)



(式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び CR_{IV} は、同一又は相異なり、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。)

15

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-3$)



[式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R'-CO-$ 基 (R' は、C1-C10 アルキル基を表す。) 又は $R_{II}-O-C(=O)-$ 基 (R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

20

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-4$)



25 (式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-5$)



[式中、 $X_{I\ I}$ は、オキシ基、 $-NR_I-$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

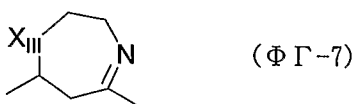
5 式 ($\Phi\Gamma-6$)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-7$)



10 [式中、 $X_{I\ I\ I}$ は、オキシ基、チオ基、 $-NR_I-$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-8$)



15 [式中、 $X_{I\ V}$ は、 $-NR_I-$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]
前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-9$)



20 (式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

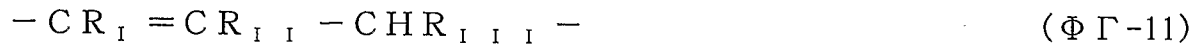
式 ($\Phi\Gamma-10$)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

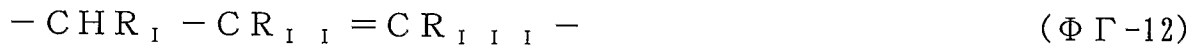
式 (ΦΓ-11)



5 (式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

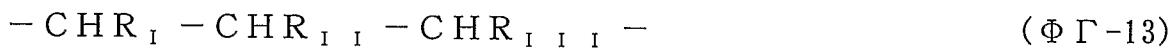
式 (ΦΓ-12)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (ΦΓ-13)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

15 式 (ΦΓ-14)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

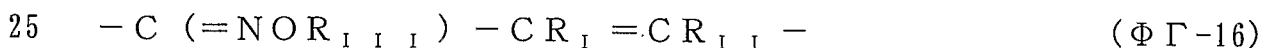
20 式 (ΦΓ-15)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (ΦΓ-16)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (ΦΓ-17)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-18)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

5 で示される基、

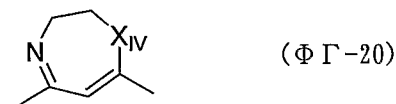
式 (Φ Γ-19)



(式中、 $X_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

10 式 (Φ Γ-20)



(式中、 $X_{I\ V}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-21)

15 $-CO-CH R_I-CH R_{I\ I}-$ (Φ Γ-21)

(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

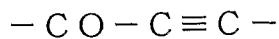
式 (Φ Γ-22)

$-C(=NOR_{I\ I\ I})-CH R_I-CH R_{I\ I}-$ (Φ Γ-22)

20 (式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

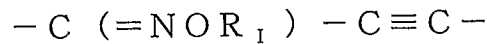
式 (Φ Γ-23)



(Φ Γ-23)

で示される基、

式 (Φ Γ-24)

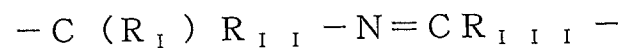


(Φ Γ-24)

5 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-25)

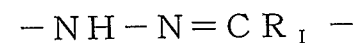


(Φ Γ-25)

(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (Φ Γ-26)

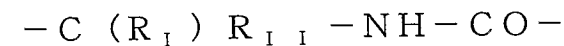


(Φ Γ-26)

(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

15 式 (Φ Γ-27)

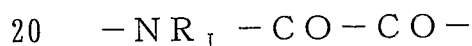


(Φ Γ-27)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-28)

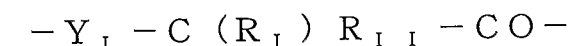


(Φ Γ-28)

(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-29)



(Φ Γ-29)

25 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

で示される基、

式 (Φ Γ-30)



で示される基を表す。

式 ($\Phi \Gamma-31$)



5 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma-32$)



10 [式中、 Y_{II} は、オキシ基、チオ基、又は、 $-\text{NR}_I-$ 基 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

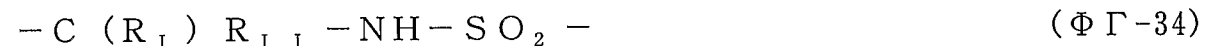
式 ($\Phi \Gamma-33$)



(式中、 R' は、前記と同一の意味を表す。)

15 で示される基、又は、

式 ($\Phi \Gamma-34$)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基を表す。

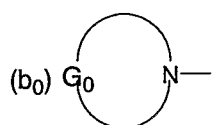
20 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なってもよいことを意味するものである。]

25 で示される含複素環化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする細胞外マトリックス遺伝子転写抑制組成物；

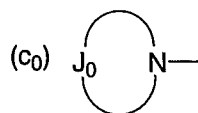
2. 式 (II)

$$\textcircled{\Sigma} - \textcircled{\Phi - \Gamma} - \textcircled{\beta} \quad (\text{II})$$

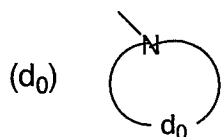
- 一の意味を表す。)、 $R_e - CO - NR_e' - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b O - CO - N(R_e) - R_d$ - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N - CO - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N - CO - NR_e'' - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N - C(=NR_e'') - NR_e''' - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b - SO_2 - NR_e - R_d$ - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N - SO_2 - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。
2. Y_0 群: $M_{b_0} - R_d$ - 基 [M_{b_0} は、 M_{c_0} - 基 (M_{c_0} は、 $M_{d_0} - R_d'$ - 基 (M_{d_0} は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい6-10員環のアリール基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい5-10員環のヘテロアリール基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよい不飽和結合を含んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、



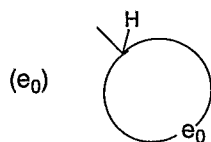
(b_0) - 基 ((b_0) において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5~14員の炭化水素環又は複素環をなす。)、



(c₀) -基 ((c₀) において、J₀ は、窒素原子を含んでもよく、芳香族 5 - 7 員環をなす。)、



(d₀) -基 { d₀ は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に
5 、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 { R₁ は、水素原子、又は、C1-C10アルキ
ル基、又は、ハロゲン原子若しくは R₂ - B₁ -基 (R₂ は、C1-C10アルキ
基、C3-C10アルケニル基又は C3-C10アルキニル基を表し、B₁ は、オキシ基、
チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換された C2-C10アル
キル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。 } 、
10 スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5 - 12 員の炭化
水素環をなす。 } 又は



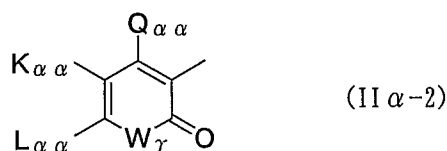
(e₀) -基 { e₀ は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基
、-NR₁-基 (R₁ は、前記と同一の意味を表す。) 、スルフィニル基若し
15 くはスルホニル基で置換されてもよい 5 - 12 員の炭化水素環をなす。 } を表
し、R_d' は、R_d と同一又は相異なり、R_d と同一の意味を表す。 } を表す
。 } 、M_{c0} - B_a -基 (M_{c0} 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。) 、
M_{c0} - CO-基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。) 、M_{c0} - CO-
O-基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。) 、M_{c0} O - CO-基 (M_c
20 ₀ は、前記と同一の意味を表す。) 、M_{c0} R_e N-基 (M_{c0} 及び R_e は、
前記と同一の意味を表す。) 、M_{c0} - CO - NR_e -基 (M_{c0} 及び R_e は

、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} O-CO-NR_e$ -基 (M_{c0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} R_e N-CO$ -基 (M_{c0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} R_e N-CO-NR_e'$ -基 (M_{c0} 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} R_e N-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_{c0} 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0}-SO_2-NR_e$ -基 (M_{c0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $M_{c0} R_e N-SO_2$ -基 (M_{c0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]
] である。

10 3. Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であって、 α 環と縮環する基である。]

15 で示される基、

式 (II α -2)



[式中、

1. $K_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(II - $\alpha\alpha$) -基

20 [(II - $\alpha\alpha$) は、式 (II - $\alpha\alpha$)



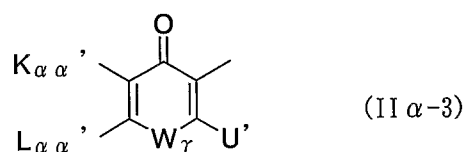
[式中、 $\alpha\alpha$ は、芳香族 5 員環又は芳香族 6 員環を表し、 Y_α 及び q は、前記と同一の意味を表し、 q が 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_α は、 Z_0 群 (Z_0 群は、前記と同一の意味を表す。) の基をなして $\alpha\alpha$ 環と縮環してもよい。]

で示される基を表す。]を表す。

2. $L_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、 $(II-\alpha\alpha)$ - 基 ($(II-\alpha\alpha)$ は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、 $(II-\alpha\alpha)$ - 基 ($(II-\alpha\alpha)$ は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルケニル基、又は、 $(II-\alpha\alpha)$ - 基 ($(II-\alpha\alpha)$ は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルキニル基を表し、 $K_{\alpha\alpha}$ と $L_{\alpha\alpha}$ とは、置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。
3. $Q_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表す。
- 10 4. W_r は、酸素原子又は $-NT_r$ - 基 (T_r は、窒素原子上の置換基を表す。) を表す。]

で示される基、

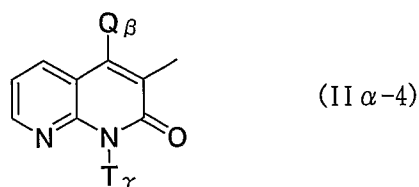
式 (II α -3)



- [式中、 $K_{\alpha\alpha}'$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、 $(II-\alpha\alpha)$ - 基 ($(II-\alpha\alpha)$ は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 $L_{\alpha\alpha}'$ は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 $K_{\alpha\alpha}'$ と $L_{\alpha\alpha}'$ とは、置換基を有してもよいC3-C10アルキレン基又は置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 W_r は、前記と同一の意味を表す。]

- 20 で示される基、又は、

式 (II α -4)



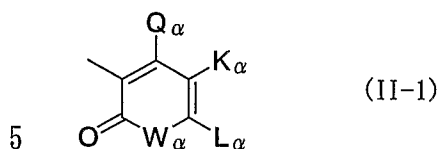
[式中、 Q_{β} は、置換されてもよい水酸基を表し、 T_r は、前記と同一の意味

を表す。]

で示される基を表す。

II. β は、

式 (II-1)



[式中、

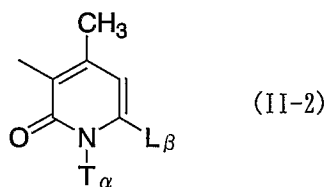
(1) Q_α は、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表す。

10 (2) W_α は、酸素原子又は $-NT_\alpha-$ 基 (T_α は、水素原子、又は、窒素原子上の置換基を表す。) を表す。

(3) K_α 及び L_α は、同一又は相異なり、水素原子、又は、炭素原子上の置換基を表し、 K_α と L_α とは、置換基を有してもよい C3-C10 アルキレン基又は置換基を有してもよい C4-C10 アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基、

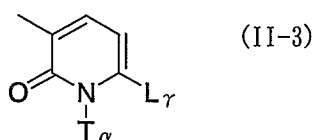
15 式 (II-2)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 L_β は水酸基又はメチル基を表す。]

で示される基、

式 (II-3)

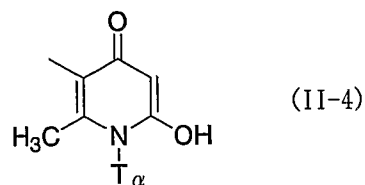


20 [式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 L_γ は、C1-C10 アルキル基を表す

。]

で示される基、

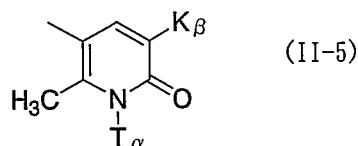
式(II-4)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

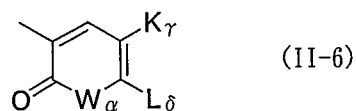
式(II-5)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 K_β は、シアノ基又は $\text{UOCO}-$ 基 (U は、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。) を表す。]

で示される基、

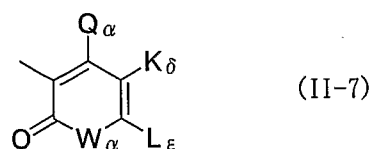
10 式(II-6)



[式中、 W_α は、前記と同一の意味を表し、 K_γ と L_δ とは、置換基を有してもよい C3-C10 アルキレン基又は置換基を有してもよい C4-C10 アルケニレン基をなす。]

15 で示される基、

式(II-7)

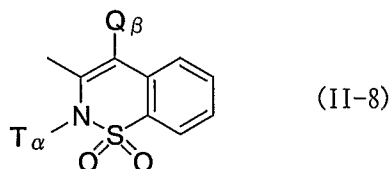


[式中、 Q_α 及び W_α は、前記と同一の意味を表し、 K_δ と L_ϵ とは、 $-\text{V}_\alpha$ 、 $-\text{V}_\alpha'$ 、 $-\text{V}_\alpha''$ 、 $-\text{V}_\alpha'''$ 基 (V_α 、 V_α' 、 V_α'' 及び V_α''' 、

’ は、同一又は相異なり、置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、 V_{α} 、 V_{α}' 、 V_{α}'' 及び V_{α}''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。) をなす。]

で示される基、

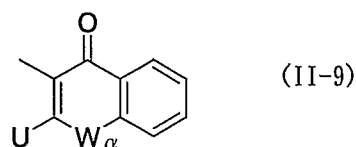
5 式 (II-8)



[式中、 T_{α} 及び Q_{β} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

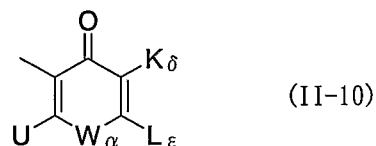
式 (II-9)



10 [式中、U 及び W_{α} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

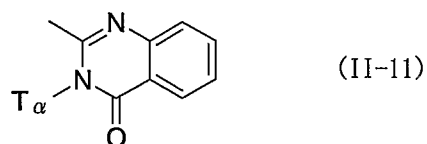
式 (II-10)



[式中、U、 W_{α} 、 K_{δ} 及び L_{ϵ} は、前記と同一の意味を表す。]

15 で示される基、

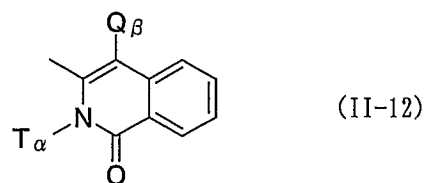
式 (II-11)



[式中、 T_{α} は、前記と同一の意味を表す。]

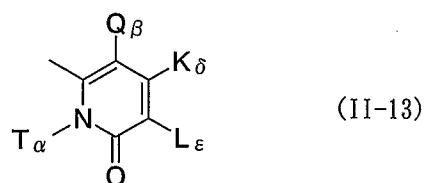
で示される基、

式(II-12)

[式中、 T_α 及び Q_β は、前記と同一の意味を表す。]

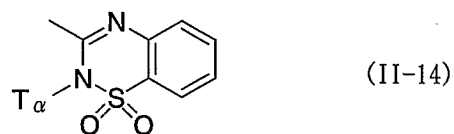
で示される基、

式(II-13)

5 [式中、 T_α 、 Q_β 、 K_δ 及び L_ϵ は、前記と同一の意味を表す。]

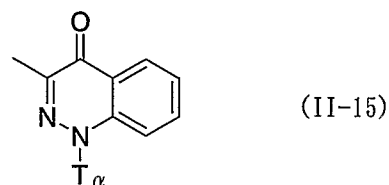
で示される基、

式(II-14)

[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

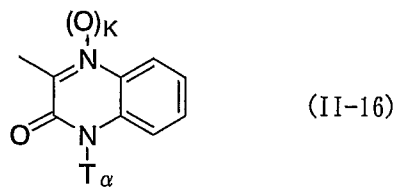
で示される基、

10 式(II-15)

[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

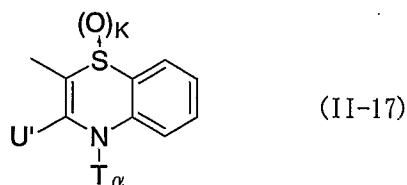
式(II-16)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

で示される基、又は、

式 (II-17)



[式中、 T_α 、 U' 及び K は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基を表す。

III. $\Phi-\Gamma$ において、

Φ は Σ に結合する原子又は基を表し、 Γ は、 β に結合する原子又は基を表し、 $\Phi-\Gamma$ は、

式 ($\Phi\Gamma-1$)

10 $-\text{CR}=\text{CR}'-\text{CO}-$ ($\Phi\Gamma-1$)

(式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 R' は、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

で示される基、

15 式 ($\Phi\Gamma-2$)

$-\text{CR}_I=\text{CR}_{II}-\text{CR}_{III}=\text{CR}_{IV}-\text{CO}-$ ($\Phi\Gamma-2$)

(式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び R_{IV} は、同一又は相異なり、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。)

で示される基、

20 式 ($\Phi\Gamma-3$)

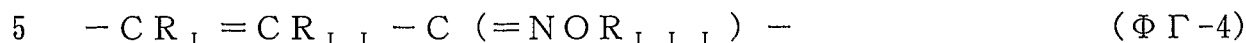
$-\text{CR}_I=\text{CX}_I-\text{CO}-$ ($\Phi\Gamma-3$)

[式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R''-\text{CO}-$ 基 (R''

’ は、C1-C10アルキル基を表す。) 又は $R_{I\ I} - O - C(=O) -$ 基 ($R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (Φ Γ-4)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-5)



10 [式中、 $X_{I\ I}$ は、オキシ基、 $-N R_I -$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-C O R'') -$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (Φ Γ-6)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

15 で示される基、

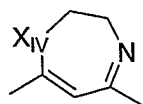
式 (Φ Γ-7)



[式中、 $X_{I\ I\ I}$ は、オキシ基、チオ基、 $-N R_I -$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-C O R'') -$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

20 で示される基、

式 (Φ Γ-8)



(ΦΓ-8)

[式中、 X_{Iv} は、 $-NR_I-$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR''')$ 基 (R''' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]
] 前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

5 式 (ΦΓ-9)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

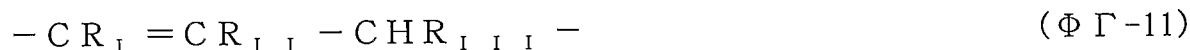
式 (ΦΓ-10)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

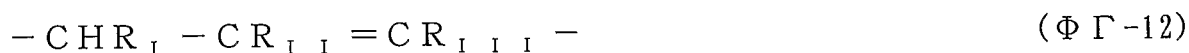
式 (ΦΓ-11)



15 (式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (ΦΓ-12)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

20 で示される基、

式 (ΦΓ-13)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

25 式 (ΦΓ-14)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-15$)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-16$)



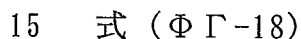
で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-17$)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

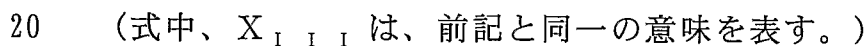
で示される基、



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

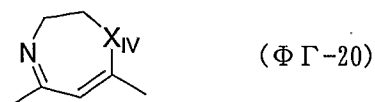
で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-19$)



で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-20$)



(式中、 X_{IV} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

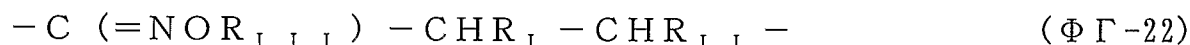
式 (Φ Γ-21)



5 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-22)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (Φ Γ-23)



で示される基、

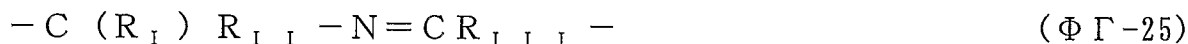
式 (Φ Γ-24)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-25)



20 (式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-26)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

25 で示される基、

式 (Φ Γ-27)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma-28$)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma-29$)



10 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma-30$)



15 で示される基を表す。

式 ($\Phi \Gamma-31$)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

20 式 ($\Phi \Gamma-32$)



[式中、 Y_{II} は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I$ 基 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

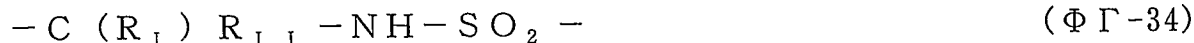
25 式 ($\Phi \Gamma-33$)



(式中、 R'' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

式 (Φ Γ-34)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基を表す。

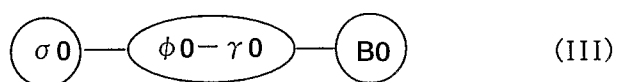
5 但し、 p 及び q が同時に 0 になることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっ

10 ていてもよいことを意味するものである。]

で示される含複素環化合物；

3. 式 (III)



[式中、

I. $\sigma 0$ は、

15 式 (IIIA 0-1)



[式中、

1. $A 0$ は、芳香族 5 員環、又は、芳香族 6 員環を表す。

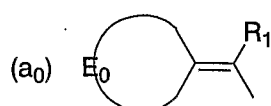
2. $(X_{A0})_p$ において、 X_{A0} は、下記の A_0 群から N_0 群までのいずれかの群に含まれる基を表し、 p は、0、1、2 又は 3 を表し、 p が 2 以上のと

20 き、 X_{A0} は、同一又は相異なる。

(1) A_0 群: $D_1 - R_4$ - 基 [D_1 は、 $(R_1 - (O)_k -) A_1 N - (O)_k$ - 基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又

はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表し、 k は、0又は1を表し、 A_1 は、 $R_3 - (CHR_0)_m - (B_2 - B_3)_m$ - 基 (R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニル基を表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、0又は1を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ - 基 (R_1' は、 R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 n は、0又は1を表す。) を表し、 B_3 は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。) を表し、 k' は、0又は1を表す。) を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表す。但し、 $R_0' R_0'' N - R_4$ - 基 (R_0' 及び R_0'' は、 R_0 と同一又は相異なり、 R_0 と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) を除く。]、 $D_2 - R_4$ - 基 [D_2 は、シアノ基、 $R_1 R_1' NC(=N - (O)_n - A_1)$ - 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N = C(-OR_2)$ - 基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $NH_2 - CS$ - 基を表し、 R_4 は前記と同一の意味を表す。]、 $D_3 - R_4$ - 基 (D_3 は、ニトロ基又は $R_1 OSO_2$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 OSO_2$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) である。

(2) B_0 群:

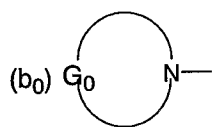


(a_0) - 基

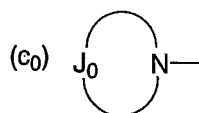
((a_0))において、 E_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、芳香族又は非芳香族の、5～14員の炭化水素環又は複素環をなし、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)である。

- (3) C_0 群：ハロゲン原子、 R_2-B_1 -基(R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基[D_4 は、水酸基又は A_1-O -基(A_1 は、前記と同一の意味を表す。)]を表し、 R_4 は前記と同一の意味を表す。]
 5、 D_5 -基[D_5 は、 $O=C(R_3)$ -基(R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -
 10 基{ R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ -基(R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)]を表す。}
 15、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ -基(D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)又は $R_1 A_1 N-N=C(R_3)$ -基(R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)]
 20、 $R_1 A_1 N-O-R_4$ -基(R_1 、 A_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1(A_1-(O)_n-)$ N -基(R_1 、 A_1 及び n は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 -基(D_2 は、前記と同一の意味を表す。)又は D_3 -基(D_3 は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC2-C10アルケニル基
 25 である。

(4) D_0 群：



((b_0))- R_4 -基((b_0))において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5～14員の炭化水素環又は複素環をなす。)



(c₀) - R₄ - 基

((c₀))において、J₀は、窒素原子を含んでもよく、芳香族5-7員環をなし、R₄は、前記と同一の意味を表す。)、ハロゲン原子、R₂-B₁-R₄-基(R₂、B₁及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、D₄-R₄-基(D₄及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、D₅-基(D₅は、前記と同一の意味を表す。)、D₁-R₄-基(D₁及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、D₂-基(D₂は、前記と同一の意味を表す。))又はD₃-R₄-基(D₃及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC2-C10アルキニル基

10 である。

(5)E₀群：A₂-CO-R₅-基

である。但し、A₂が水酸基のとき、R₅がビニレン基ではない。

[A₂は、

(i)A₃-B₄-基

15 {A₃は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、R_{a0}-(R₄)_m-基(R_{a0}は、置換されてもよい5-7員環のアリール基又はヘテロアリール基を表し、R₄及びmは前記と同一の意味を表す。)、又は、(b₀)-R₄-基((b₀)及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、(c₀)-R₄-基((c₀)及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、R₂-B₁-R₄-基(R₂、B₁及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、D₄-R₄-基(D₄及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、D₅-基(D₅は、前記と同一の意味を表す。)、D₁-R₄-基(D₁及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)、D₂-基(D₂は、前記と同一の意味を表す。))、D₃-R₄-基(D₃及びR₄は、前記と同一の意味を表す。)若しくはA₄-SO₂-R₄

20

25

一基 $\{A_4$ は、 (b_0) 一基 $((b_0))$ は、前記と同一の意味を表す。)、 (c_0) 一基 $((c_0))$ は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 R_1' N$ 一基 $(R_1$ 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} で置換された C1-C10 アルキル基を表し、

5 B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)$ 一基 $(R_1$ 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。}、

(ii) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ 一基 $(R_1, B_4$ 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表

10 す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4$ 一基 $(D_2, R_4$ 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、

(iii) $R_2 - SO_2 - NR_1$ 一基 $(R_2$ は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、

(iv) (b_0) 一基 $((b_0))$ は、前記と同一の意味を表す。)、

15 (v) (c_0) 一基 $((c_0))$ は、前記と同一の意味を表す。) 又は

(vi) $R_1 A_1 N - NR_1'$ 一基 $(R_1, A_1$ 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_5 は、ハロゲン原子で置換されてもよい C2-C10 アルケニレン基、又は、C2-C10 アルキニレン基を表す。]

(6) F_0 群: $A_5 - B_5 - R_6$ 一基 [A_5 は、 D_4 一基 $(D_4$ は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 一基 $(D_1$ は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3 一基 $(D_3$ は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4 - SO_2$ 一基 $(A_4$ は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルキル基、又は、 $R_2 - B_1$ 一基 $(R_2$ 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 一基 $(D_2$ は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 一基 $(D_5$ は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_2 - CO$ 一基 $(A_2$ は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C1-C10 アルキル基を表し、 B_5 は、 B_1 一基 $(B_1$ は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-NA_1$ 一基 $(A_1$ は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_6 は、単結合又は C1-C10 アルキレン基を表す。]

である。

(7) G_0 群: $A_6 - B_5 - R_6$ - 基

[A_6 は、 $(a_0) - R_4$ - 基 ((a_0) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニル基、又は、ハロゲン原子、 $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは $A_2 - CO$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子、 $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。))、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは $A_2 - CO$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC2-C10アルキニル基、又は、 (b_0) - 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、 (c_0) - 基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 - 基 (D_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 D_1 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC3-C10アルケニル基、又は、 D_4 - 基 (D_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 D_1 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC3-C10アルキニル基を表し、 B_5 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(8) H_0 群:

$D_2 - N(-O)_n - A_1 - R_6$ - 基 (D_2 、 n 、 A_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、シアノ基を除く。)、 $R_1(R_1'(O)_n)N - CR_1'' = N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_1' 、 n 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 R_1'' は、 R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表す。)、 $R_1 - (O)_n - N = CR_1' - NR_2 - R_6$ - 基 (R_1 、 n 、 R_1' 、 R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_3 - NR_1 - CO - NR_1' - R_6$ - 基 (R_2

、 B_3 、 R_1 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。) 、 $D_2-CO-NR_1-R_6$ -基 (D_2 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2-COCO-NR_1-R_6$ -基 (A_2 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)

5 である。

(9) I_0 群：

$A_7-B_6-N((O)_n R_1)-R_6$ -基 [A_7 は、ハロゲン原子で置換されてもよい C2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2-B_1-R_4$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 -基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0)-R_4$ -基 (b_0) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0)-R_4$ -基 (c_0) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2-R_4 -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 -基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4-SO_2-R_4$ -基 (A_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)] 又は A_2-CO-R_4 -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8-CS-N((O)_n R_1)-R_6$ -基 [A_8 は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10アルキル基を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、

$A_7'-B_2'-B_3-N((O)_n R_1)-R_6$ -基 [A_7' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよい C3-C10アルキニル基、 $R_2-B_1-R_4'$ -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 D_4-R_4' -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4' -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0)-R_4'$ -基 (b_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_1)-R_4'$ -基 (b_1) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)]、

c_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0) - R_4' -$ 基 (c_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4 -$ 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4' -$ 基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $A_2 - CO - R_4 -$ 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) を表し、 B_2' は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n, R_1')$ -基 (n' は、 n と同一又は相異なり、 n と同一の意味を表し、 R_1' は、前記と同一の意味を表す。)) を表し、 B_3 、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。] $A_8' - B_2' - CS - N((O)_n, R_1) - R_6 -$ 基 [A_8' は、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 B_2' は、前記と同一の意味を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。] $A_8' - S - B_3' - N((O)_n, R_1) - R_6 -$ 基 [A_8' 、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_3' は、カルボニル基又はスルホニル基を表す。] 又は $A_7'' - SO_2 - N((O)_n, R_1) - R_6 -$ 基 [A_7'' は、C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4' -$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4' -$ 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4 -$ 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4' -$ 基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0) - R_4' -$ 基 (b_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0) - R_4' -$ 基 (c_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4 -$ 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $NO_2 - R_4 -$ 基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $A_2 - CO - R_4 -$ 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

$(10) J_0$ 群: $A_7 - CO -$ 基 (A_7 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $A_9 - CS -$ 基 (A_9 は、 A_7 又は A_8 を表す。)、又は、 $A_9' (O)_m$

$N=C(A_9)$ - 基 (A_9' は、 A_7' 又は A_8' を表し、 m 及び A_9 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 D_2-CO - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 A_2-COCO - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $A_9-CO-B_1'-R_6$ - 基 (A_9 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_1' は、オキシ基又はチオ基を表す。但し、 B_1' がオキシ基のとき、 A_9 は、 A_8 ではない。)、又は、 $A_9-CS-B_1'-R_6$ - 基 (A_9 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $A_7''-SO_2-B_1'-R_6$ - 基 (A_7'' 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $A_8-SO_2-B_1'-R_6$ - 基 (A_8 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は、水素原子となることはない。)、又は、 $A_9'-B_2'-B_3-B_1'-R_6$ - 基 (A_9' 、 B_2' 、 B_3 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 (b_0) - 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、若しくは (c_0) - 基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルケニル基である。

(11) K_0 群: $A_{10}-N((O)_n R_1)-CO-R_6$ - 基 [A_{10} は、水素原子 (但し、 n は 0 ではない。)、 $A_7''-SO_2$ - 基 (A_7'' は、前記と同一の意味を表す。)、 A_8-SO_2 - 基 (A_8 は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は、水素原子とはならない。)、 $A_9'O$ - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n は 1 ではない。)、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n が 0 のとき、 A_8' を除く。)、 R_2OCH_2 - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 A_2-CO-R_4 - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、又は $A_2-CO-CH(CH_2CO-A_2)$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。)] を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(12) L_0 群: $A_{10}'-N((O)_n R_1)-SO_2-R_6$ - 基 [A_{10}' は、水素原子 (但し、 n は 0 ではない。)、 $A_9'O$ - 基 (A_9' は、前記

と同一の意味を表す。但し、 n は1ではない。)、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n が0のとき、 A_8' を除く。)、 R_2 - CO - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 A_2 - CO - R_4 - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は A_2 - CO - CH (CH_2 CO - A_2) - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 A_9'' R_1 N - SO₂ - N ((O) _{n} R_1') - R_6 - 基 [A_9'' は、水素原子又は A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_1 、 n 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。] 又は (b_0) - SO₂ - N ((O) _{n} R_1') - R_6 - 基 [(b_0)、 n 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(13) M_0 群: R_1 (R_2 S) C = N - R_6 - 基 (R_1 、 R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 R_2 B (R_2' B') C = N - R_6 - 基 (R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 R_2' は、 R_2 と同一又は相異なり、 R_2 と、同一の意味を表し、B 及び B' は、同一又は相異なり、オキシ基又はチオ基を表す。)、 R_1 R_1' N - (R_2 S) C = N - R_6 - 基 (R_1 、 R_1' 、 R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 R_1 N = C (S R_2) - N R_2' - R_6 - 基 (R_1 、 R_2 、 R_2' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。) 又は R_1 (R_1' O) N - R_6 - 基 (R_1 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)

である。

(14) N_0 群: A_{11} - P (=O) (OR₁') - R_4 - 基 [A_{11} は、 R_1 - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 R_1 O - R_6 - 基 (R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。) 又は R_1 OCO - CH R_0 - 基 (R_1 及び R_0 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_1' 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

3. (Y_{A0}) _{q} において、 Y_{A0} は、下記の X_0 群及び Y_0 群の基を表し、

q は、0、1、2又は3を表し、 p (p は、前記と同一の意味を表す。)と q との和は3以下であり、 q が2以上のとき、 Y_{A0} は同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_{A0} は、 Z_0 群の基をなして、 A_0 環と縮環してもよい。

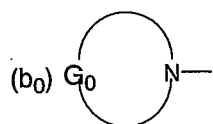
5 (1) X_0 群:

M_a -基 [M_a は、 R_b -基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d -基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-O-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_e R_e' N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b O-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-C(=NR_e'')$ - $NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意

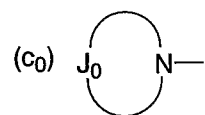
味を表す。)、 $R_e R_{e'} N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 $R_{e'}$ 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

(2) Y_0 群:

- 5 $M_{b_0}-R_d$ -基 [M_{b_0} は、 M_{c_0} -基 { M_{c_0} は、 $M_{d_0}-R_d'$ -基 { M_{d_0} は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい6-10員環のアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい5-10員環のヘテロアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい不飽和結合を含
- 10 んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、

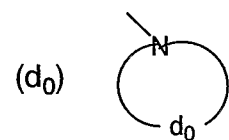


(b_0)-基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、



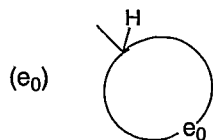
(c_0)-基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表す。)、

15



(d_0)-基 { d_0 は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。} 又は

20

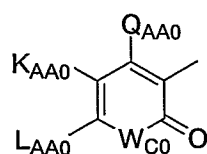


(e_0) - 基 { e_0 は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5 - 12 員の炭化水素環をなす。} を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。
 5 。 }、 $M_{c_0} - B_a$ -基 (M_{c_0} 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} - CO$ -基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} - CO - O$ -基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} O - CO$ -基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} R_e N$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} - CO - NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} O - CO - NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} R_e N - CO$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} R_e N - CO - NR_e'$ -基 (M_{c_0} 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} R_e N - C(=NR_e') - NR_e''$ -基 (M_{c_0} 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} - SO_2 - NR_e$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)
 10 又は $M_{c_0} R_e N - SO_2$ -基 (M_{c_0} 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
 15] である。

(3) Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5 - 12 員環の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であって、A0環と縮環する基である。]

で示される基、

25 式 (IIIA0-2)



(IIIA 0-2)

[式中、

1. K_{AA0} は、水素原子、ハロゲン原子、又は、 $(III-AA0)-$ 基
 $[(III-AA0)]$ は、式 $(III-AA0)$



(III-AA 0)

- 5 [式中、 $AA0$ は、芳香族 5 員環又は芳香族 6 員環を表し、 Y_{A0} 及び q は、前記と同一の意味を表し、 q が 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_{A0} は、 Z_0 群の基をなして $AA0$ 環と縮環してもよい。]
 で示される基を表す。]を表す。

2. L_{AA0} は、水素原子、 $C1-C10$ アルキル基、 $(III-AA0)-$ 基 ($(III-AA0)$ は、前記と同一の意味を表す。) で置換された $C2-C10$ アルキル基、 $(III-AA0)-$ 基 ($(III-AA0)$ は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい $C4-C10$ アルケニル基、又は、 $(III-AA0)-$ 基 ($(III-AA0)$ は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい $C4-C10$ アルキニル基を表し、 K_{AA0} と L_{AA0} とは、単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい $C4-C10$ アルケニレン基をなすことがある。

3. Q_{AA0} は、
 水素原子、又は、 $Q_{A0}-$ 基
 $[Q_{A0}]$ は、
 20 水酸基、 $(b_0)-$ 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、
 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 及び B_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)-$ 基 (m 及び R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、

$A_7' - SO_2 - B_c$ - 基 (A_7' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、

$A_8 - SO_2 - B_c$ - 基 (A_8 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、

5 $R_1 R_1' - N - SO_2 - B_c$ - 基 (R_1 、 R_1' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、

$(b_0) - SO_2 - B_c$ - 基 ((b_0) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、

$A_9' - B_c$ - 基 (A_9' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、

10 $D_5 - R_4 - B_c$ - 基 (D_5 、 R_4 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)

、

$M_{c0} - B_3 - B_c$ - 基 (M_{c0} 、 B_3 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は

$M_{c0} - B_c$ - 基 (M_{c0} 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)

15 を表す。]

である。

4. W_{c0} は、酸素原子又は

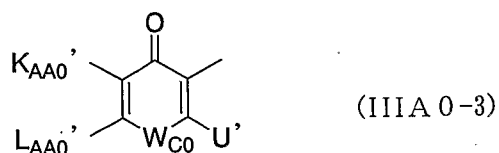
$-NT_{c0}$ - 基 [T_{c0} は、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_{c0}

20 c_0 - 基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

である。]

で示される基、

式(IIIA 0-3)



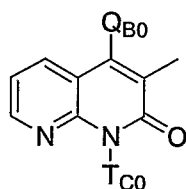
[式中、 K_{AA0}' は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、(III-AA0) -

25 基 ((III-AA0) は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 L_{AA0}' は、水

素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 $K_{A A 0}'$ と $L_{A A 0}'$ とは、C3-C10アルキレン基又は単数又は同一又は相異なる複数の M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 $W_{C 0}$ は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、又は、

式 (IIIA 0-4)



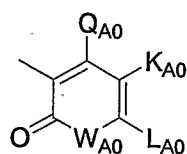
(IIIA 0-4)

[式中、 $T_{C 0}$ は、前記と同一の意味を表し、 $Q_{B 0}$ は、水酸基、 $A_9 - B_6 - O -$ 基 (A_9 及び B_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_7'' - SO_2 - O -$ 基 (A_7'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8 - SO_2 - O -$ 基 (A_8 は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_1' N - SO_2 - O -$ 基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0) - SO_2 - O -$ 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_9' - O -$ 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4 - O -$ 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{C 0} - B_3 - O -$ 基 ($M_{C 0}$ 及び B_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_{C 0} - O -$ 基 ($M_{C 0}$ は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基を表す。

II. B 0 は、

式 (III-1)



(III-1)

[式中、

(1) $Q_{A 0}$ は、前記と同一の意味を表す。

(2) W_{A0} は、酸素原子又は
 $-NT_{A0}-$ 基 [T_{A0} は、水素原子、 A_9' -基 (A_9' は、前記と同一の
 意味を表す。)、 D_5-R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す
 。) 又は M_{C0} -基 (M_{C0} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

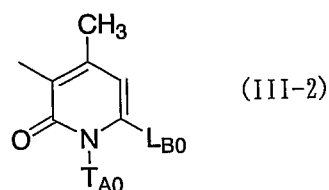
5 である。

(3) K_{A0} は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_{A0}
 L_{A0} は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_{B0} -基 (M_{B0} は、前記と同一の
 意味を表す。) を表し、 K_{A0} と L_{A0} とは、C3-C10アルキレン基、又は、単
 数又は同一又は相異なる複数の M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。

10) で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基、

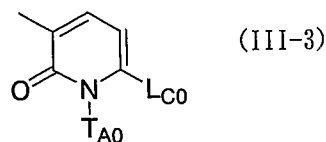
式 (III-2)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 L_{B0} は水酸基又はメチル基を
 表す。]

15 で示される基、

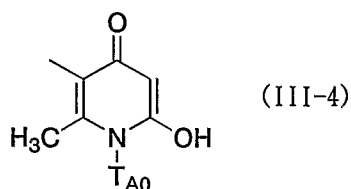
式 (III-3)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 L_{C0} は、C1-C10アルキル基を
 表す。]

で示される基、

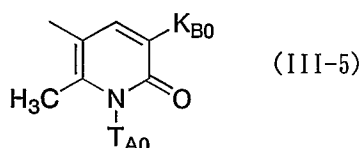
20 式 (III-4)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

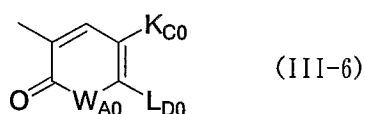
式 (III-5)



- 5 [式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 K_{B0} は、シアノ基又は UOC O - 基 (U は、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表す。) を表す。]

で示される基、

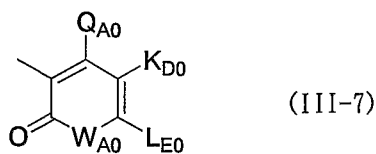
式 (III-6)



- 10 [式中、 W_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 K_{C0} と L_{D0} とは、 $C3-C10$ アルキレン基又は単数又は同一又は相異なる複数の M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい $C4-C10$ アルケニレン基をなす。]

で示される基、

式 (III-7)

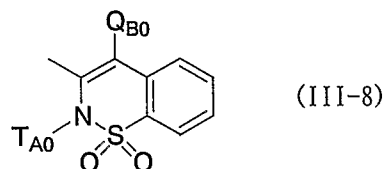


- 15 [式中、 Q_{A0} 及び W_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 K_{D0} と L_{E0} とは、
 $-V_{A0} = V_{A0}' - V_{A0}'' = V_{A0}'''$ - 基 { V_{A0} 、 V_{A0}' 、 V_{A0}'' 及び V_{A0}''' } は、同一又は相異なり、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいメチン基、又は、
 20 V_{A0} 、 V_{A0}' 、 V_{A0}'' 及び V_{A0}''' のうち少なくとも一つは $-N$

＝基を表す。} をなす。]

で示される基、

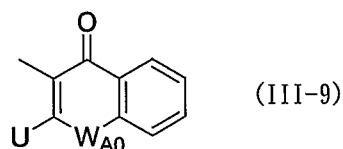
式 (III-8)



[式中、T_{A 0} 及び Q_{B 0} は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

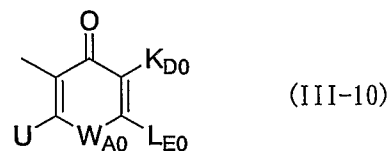
式 (III-9)



[式中、U 及び W_{A 0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

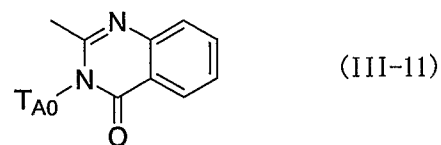
10 式 (III-10)



[式中、U、W_{A 0}、K_{D 0} 及び L_{E 0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

式 (III-11)

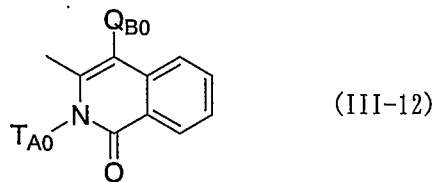


15

[式中、T_{A 0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

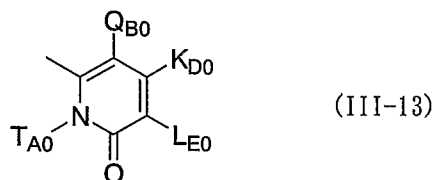
式 (III-12)



[式中、 T_{A0} 及び Q_{B0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

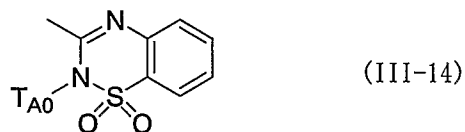
式(III-13)



[式中、 T_{A0} 、 Q_{B0} 、 K_{D0} 及び L_{E0} は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

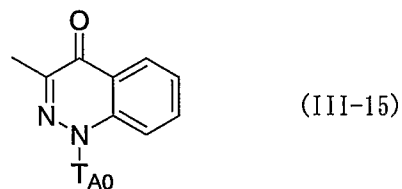
式(III-14)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

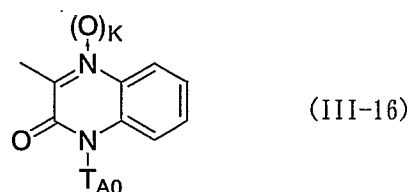
式(III-15)



10 [式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

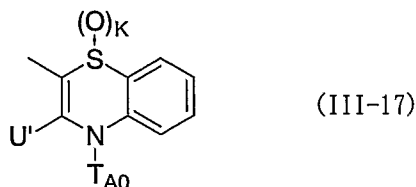
式(III-16)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

で示される基、又は、

式(III-17)



[式中、 T_{A0} 、 U' 及び K は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基を表す。

III. $\phi 0 - \gamma 0$ において、

$\phi 0$ は $\sigma 0$ に結合する原子又は基を表し、 $\gamma 0$ は、 $B 0$ に結合する原子又は基を表し、

$\phi 0 - \gamma 0$ は、

10 式 ($\phi \gamma 0-1$)



(式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 R' は、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

15 で示される基、

式 ($\phi \gamma 0-2$)



(式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び CR_{IV} は、同一又は相異なり、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。)

20 で示される基、

式 ($\phi \gamma 0-3$)

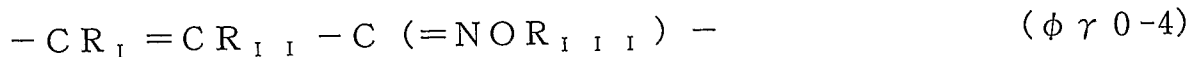


[式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R''-CO-$ 基 (R'' は、C1-C10 アルキル基を表す。) 又は $R_{II}-O-C(=O)-$ 基 (R_{II}

25 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (φ γ 0-4)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

5 で示される基、

式 (φ γ 0-5)



[式中、 X_{II} は、オキシ基、 $-N R_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N (-C O R'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

10 で示される基、

式 (φ γ 0-6)



(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-7)



15 [式中、 X_{III} は、オキシ基、チオ基、 $-N R_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N (-C O R'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (φ γ 0-8)



20 [式中、 X_{IV} は、 $-N R_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N (-C O R'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。

] 前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

式 (φ γ 0-9)



5 (式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

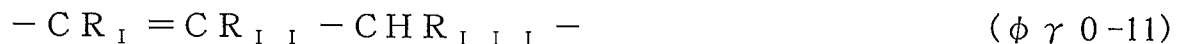
式 (φ γ 0-10)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

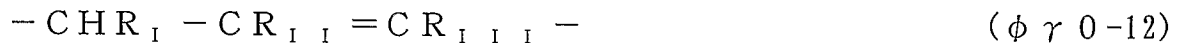
式 (φ γ 0-11)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

15 式 (φ γ 0-12)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-13)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-14)



25 (式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

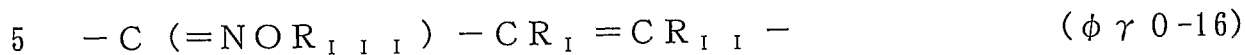
式 (φ γ 0-15)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\gamma\ 0-16$)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\gamma\ 0-17$)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 ($\phi\gamma\ 0-18$)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\gamma\ 0-19$)



15 (式中、 $X_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\gamma\ 0-20$)



(式中、 $X_{I\ V}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

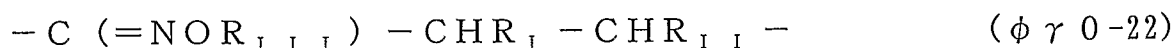
20 式 ($\phi\gamma\ 0-21$)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-22)



5 (式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-23)



で示される基、

10 式 (φ γ 0-24)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-25)

15 $-C(R_I)R_{II}-N=CR_{III}- \quad (\phi \gamma 0-25)$

(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-26)



20 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-27)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

25 で示される基、

式 (φ γ 0-28)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-29)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の
5 意味を表す)

で示される基、

式 (φ γ 0-30)



で示される基を表す。

10 式 (φ γ 0-31)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-32)

15 $-Y_{I\ I} - CO-NH- \quad (\phi \gamma 0-32)$

[式中、 $Y_{I\ I}$ は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I$ 基 (式中、 R_I は、
前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

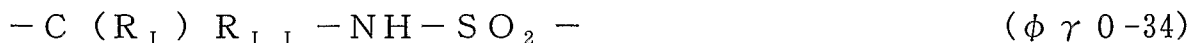
式 (φ γ 0-33)

20 $-NR'' - SO_2 - NH- \quad (\phi \gamma 0-33)$

(式中、 R'' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

式 (φ γ 0-34)



25 (式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基を表す。

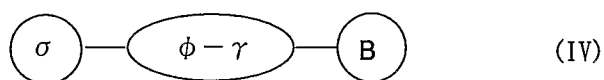
但し、 p 及び q が同時に 0 になることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」と

は、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっているてもよいことを意味するものである。]

5 示される含複素環化合物；

4. 式 (IV)



[式中、

I. σ は、

式 (IVA-1)

10



[式中、

1. A は、芳香族 5 員環、又は、芳香族 6 員環を表す。

2. $(X_A)_p$ において、 X_A は、下記の A 群から N 群までのいずれかの群に含まれる基を表し、p は、0、1、2 又は 3 を表し、p が 2 以上のとき、 X_A

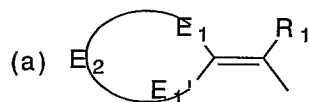
15 は、同一又は相異なる。

(1) A 群： $D_1 - R_4$ - 基 [D_1 は、 $(R_1 - (O)_k -) A_1 N - (O)_k$ - 基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又は C3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)} で置換された C2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表し、k は、0 又は 1 を表し、 A_1 は、 $R_3 - (CH R_0)_m - (B_2 - B_3)_m$ - 基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を

20

表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、
 又は、C2-C10アルキニル基を表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又は
 C2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、0 又は 1 を表し、 B_2 は、単結合、オキ
 シ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ - 基 (R_1' は、 R_1 と同一又は相
 5 異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 n は、0 又は 1 を表す。) を表し、 B_3 は
 、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 m' は、0 又は
 1 を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は 0 となりかつ R_3 が水素原子とな
 ることはない。) を表し、 k' は、0 又は 1 を表す。) を表し、 R_4 は、C1-C10
 アルキレン基を表す。但し、 R_0' 、 R_0'' 、 $N-R_4$ - 基 (R_0' 及び R_0''
 10 $'$ は、 R_0 と同一又は相異なり、 R_0 と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と
 同一の意味を表す。) を除く。]、 D_2-R_4 - 基 [D_2 は、シアノ基、 R_1
 $R_1'NC(=N-(O)_n-A_1)$ - 基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、
 前記と同一の意味を表す。)、 $A_1N=C(-OR_2)$ - 基 (A_1 及び R_2 は
 、前記と同一の意味を表す。) 又は NH_2-CS - 基を表し、 R_4 は前記と同
 15 一の意味を表す。]、 D_3-R_4 - 基 [D_3 は、ニトロ基又は R_1OSO_2 -
 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味
 を表す。] 又は R_1OSO_2 - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) であ
 る。

(2) B 群:



20

(a) - 基

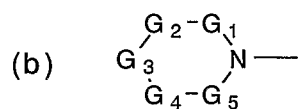
[(a) において、 E_1 及び E_1' は、C1-C10アルキル基若しくはC1-C10アル
 コキシ基で置換されてもよいメチレン基、又は、カルボニル基を表す。但し、
 E_1 及び E_1' は、同時にカルボニル基となることはない。 E_2 は、オキシ基
 25 、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1'$ - 基 (R_1' は
 、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルキレン基、又は

、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1'$ ー基 (R_1' は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C3-C10 アルケニレン基を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

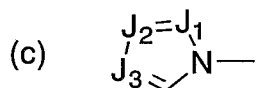
- 5 (3) C 群: ハロゲン原子、 R_2-B_1 ー基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 ー基 [D_4 は、水酸基又は A_1-O ー基 (A_1 は、前記と同一の意味を表す。)] を表し、 R_4 は前記と同一の意味を表す。]、 D_5 ー基 [D_5 は、 $O=C(R_3)$ ー基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)]、 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ ー基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ ー基 { R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ ー基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。)] を表す。}、 $D_2-R_4-(O)_n-N=C(R_3)$ ー基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)] 又は $R_1 A_1 N-N=C(R_3)$ ー基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)] を表す。]
- 10 $R_1 A_1 N-O-R_4$ ー基 (R_1 、 A_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1(A_1-(O)_n-N)$ ー基 (R_1 、 A_1 及び n は、前記と同一の意味を表す。)]、 D_2 ー基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)] 又は D_3 ー基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。)] で置換された C2-C10 アルケニル基
- 15 である。

(4) D 群:



- (b) $-R_4$ ー基 [(b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ ー基 (R_1 は、前記と同一の意味を表
- 25

す。)で置換されてもよいC1-C10アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ 基(R_1 は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。]、



5 (c) $-R_4$ 基

((c)において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、ハロゲン原子、 $R_2-B_1-R_4$ 基(R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 基(D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 基(D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 基(D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 基(D_2 は、前記と同一の意味を表す。))又は D_3-R_4 基(D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC2-C10アルキニル基である。

15 (5)E群： A_2-CO-R_5 基

である。但し、 A_2 が水酸基のとき、 R_5 がビニレン基ではない。

[A_2 は、

(i) A_3-B_4 基

{ A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ 基(R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b) $-R_4$ 基((b)及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) $-R_4$ 基((c)及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2-B_1-R_4$ 基(

- R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ - 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)
- 5 若しくは $A_4 - SO_2 - R_4$ - 基 { A_4 は、(b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 R_1' N$ - 基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)} を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。} で置換された C1-C10 アルキル基を表し、
- 10 B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)$ - 基 (R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。}、
- (ii) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ - 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。)
- 15 又は $D_2 - R_4 - B_4$ - 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、
- (iii) $R_2 - SO_2 - NR_1$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、
- (iv) (b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、
- 20 (v) (c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は
- (vi) $R_1 A_1 N - NR_1'$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_5 は、ハロゲン原子で置換されてもよい C2-C10 アルケニレン基、又は、C2-C10 アルキニレン基を表す。]
- (6) F 群: $A_5 - B_5 - R_6$ - 基 [A_5 は、 D_4 - 基 (D_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。)
- 25 若しくは $A_4 - SO_2$ - 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルキル基、又は、 $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は

、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)
) 若しくは A_2 - CO - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) で置換され
 れたC1-C10アルキル基を表し、 B_5 は、 B_1 - 基 (B_1 は、前記と同一の意味
 を表す。) 又は $-NA_1$ - 基 (A_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、
 5 R_6 は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。]

である。

(7) G群: $A_6 - B_5 - R_6$ - 基

[A_6 は、(a) - R_4 - 基 ((a) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。
)、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニル基、又は、ハロゲン
 10 原子、 $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5
 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一
 の意味を表す。) 若しくは A_2 - CO - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。
) で置換されたC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子、 $R_2 - B_1$ - 基
 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と
 15 同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。) 若し
 くは A_2 - CO - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC2-C10
 アルキニル基、又は、(b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、
 (c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 - 基 (D_4 は、前
 記と同一の意味を表す。)、 D_1 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。)
 20 若しくは D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC3-C10
 アルケニル基、又は、 D_4 - 基 (D_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1
 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは D_3 - 基 (D_3 は、前記
 と同一の意味を表す。) で置換されたC3-C10アルキニル基を表し、 B_5 及び R
 $_6$ は、前記と同一の意味を表す。]

25 である。

(8) H群:

$D_2 - N(- (O)_n - A_1) - R_6$ - 基 (D_2 、 n 、 A_1 及び R_6 は、前記
 と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。但し

、シアノ基を除く。)、 $R_1 (R_1' (O)_n) N - C R_1'' = N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_1' 、 n 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 R_1'' は、 R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表す。)、 $R_1 - (O)_n - N = C R_1' - N R_2 - R_6$ - 基 (R_1 、 n 、 R_1' 、 R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 - B_3 - N R_1 - C O - N R_1' - R_6$ - 基 (R_2 、 B_3 、 R_1 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - C O - N R_1 - R_6$ - 基 (D_2 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。))又は $A_2 - C O C O - N R_1 - R_6$ - 基 (A_2 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。))

10 である。

(9) I 群:

$A_7 - B_6 - N ((O)_n R_1) - R_6$ - 基 [A_7 は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4$ - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 $(b) - R_4$ - 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 $(c) - R_4$ - 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 $D_2 - R_4$ - 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 $D_3 - R_4$ - 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 $A_4 - S O_2 - R_4$ - 基 (A_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))又は $A_2 - C O - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8 - C S - N ((O)_n R_1) - R_6$ - 基 [A_8 は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_7' - B_2' - B_3 - N ((O)_n R_1) - R_6$ - 基 [A_7' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよ

いC3-C10アルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4'$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 $D_4 - R_4'$ - 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4'$ - 基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b) - R_4'$ - 基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4'$ - 基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ - 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4'$ - 基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 B_2' は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n, R_1')$ - 基 (n' は、 n と同一又は相異なり、 n と同一の意味を表し、 R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 B_3 、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8' - B_2' - CS - N((O)_n, R_1) - R_6$ - 基 [A_8' は、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 B_2' は、前記と同一の意味を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8' - S - B_3' - N((O)_n, R_1) - R_6$ - 基 [A_8' 、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_3' は、カルボニル基又はスルホニル基を表す。] 又は $A_7'' - SO_2 - N((O)_n, R_1) - R_6$ - 基 [A_7'' は、C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4'$ - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4'$ - 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4'$ - 基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b) - R_4'$ - 基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4'$ - 基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ - 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $NO_2 - R_4$ - 基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(10) J 群: $A_7 - CO -$ 基 (A_7 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、
 $A_9 - CS -$ 基 (A_9 は、 A_7 又は A_8 を表す。)、又は、 $A_9' (O)_m N$
 $= C(A_9) -$ 基 (A_9' は、 A_7' 又は A_8' を表し、 m 及び A_9 は、前記
5 と同一の意味を表す。)、又は、 $D_2 - CO -$ 基 (D_2 は、前記と同一の意味
を表す。)、又は、 $A_2 - COCO -$ 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。
)、又は、 $A_9 - CO - B_1' - R_6 -$ 基 (A_9 及び R_6 は、前記と同一の意
味を表し、 B_1' は、オキシ基又はチオ基を表す。但し、 B_1' がオキシ基の
とき、 A_9 は、 A_8 ではない。)、又は、 $A_9 - CS - B_1' - R_6 -$ 基 (A
10 $_9$ 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $A_7'' -$
 $SO_2 - B_1' - R_6 -$ 基 (A_7'' 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の
意味を表す。)、又は、 $A_8 - SO_2 - B_1' - R_6 -$ 基 (A_8 、 B_1' 及び
 R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は、水素原子となることは
ない。)、又は、 $A_9' - B_2' - B_3 - B_1' - R_6 -$ 基 (A_9' 、 B_2'
15 B_3 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。)、又は、(b)
-基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは (c) -基 ((c) は
、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルケニル基
である。

(11) K 群: $A_{10} - N((O)_n R_1) - CO - R_6 -$ 基 [A_{10} は、水
20 素原子 (但し、 n は 0 ではない。)、 $A_7'' - SO_2 -$ 基 (A_7'' は、前
記と同一の意味を表す。)、 $A_8 - SO_2 -$ 基 (A_8 は、前記と同一の意味を
表す。但し、 A_8 は、水素原子とはならない。)、 $A_9' O -$ 基 (A_9' は、
前記と同一の意味を表す。但し、 n は 1 ではない。)、 $A_9' -$ 基 (A_9' は
、前記と同一の意味を表す。但し、 n が 0 のとき、 A_8' を除く。)、 $R_2 O$
25 $CH_2 -$ 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_2 - CO - R_4 -$ 基 (
 A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - CO - CH(CH_2$
 $CO - A_2) -$ 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及
び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(12) L群: $A_{10}' - N((O)_n R_1) - SO_2 - R_6$ - 基 [A_{10}' は、水素原子 (但し、 n は 0 ではない。)、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n は 1 ではない。)、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n が 0 のとき、 A_8' を除く。)、 $R_2 - CO$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)] 又は $A_2 - CO - CH(CH_2 CO - A_2)$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]
 10 $A_9'' R_1 N - SO_2 - N((O)_n R_1') - R_6$ - 基 [A_9'' は、水素原子又は A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_1 、 n 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。] 又は $(b) - SO_2 - N((O)_n R_1') - R_6$ - 基 [(b)、 n 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

15 (13) M群: $R_1 (R_2 S) C = N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 B (R_2' B') C = N - R_6$ - 基 (R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 R_2' は、 R_2 と同一又は相異なり、 R_2 と、同一の意味を表し、 B 及び B' は、同一又は相異なり、オキシ基又はチオ基を表す。)、 $R_1 R_1' N - (R_2 S) C = N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_1' 、 R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 N = C(SR_2) - N R_2' - R_6$ - 基 (R_1 、 R_2 、 R_2' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)] 又は $R_1 (R_1' O) N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)]
 20

である。

25 (14) N群: $A_{11} - P(=O)(OR_1') - R_4$ - 基 [A_{11} は、 R_1 - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 O - R_6$ - 基 (R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)] 又は $R_1 OCO - CHR_0$ - 基 (R_1 及び R_0 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_1' 及び R_4 は、前記と同一

の意味を表す。]

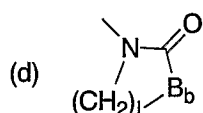
である。

3. $(Y_A)_q$ において、 Y_A は、下記の X 群又は Y 群の基を表し、 q は、0、1、2 又は 3 を表し、 p (p は、前記と同一の意味を表す。) と q との和は 3 以下であり、 q が 2 以上のとき、 Y_A は、同一又は相異なり、 q が 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_A は、Z 群の基をなして、A 環と縮環してもよい。

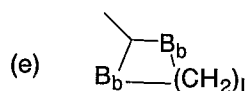
(1) X 群: M_a - 基 [M_a は、 R_b - 基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 R_c - B_a - R_d - 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又は C1-C10 アルキレン基を表す。)、 $HO-R_d$ - 基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d - 基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-O-CO-R_d$ - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ - 基、 $R_e R_e' N-R_d$ - 基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b O-CO-N(R_e)-R_d$ - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-NR_e''-R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-C(=NR_e''')-NR_e''''-R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表

し、 R_e ' ' ' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。) 、 $R_b - SO_2 - NR_e - R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。) 、 $R_e R_e' N - SO_2 - R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。) 、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキ
5 ニル基を表す。]である。

(2) Y群: $M_b - R_d$ -基 [M_b は、 M_c -基 { M_c は、 $M_d - R_d'$ -基 { M_d は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい
フェニル基、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されても
よいピリジル基、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換され
10 てもよいナフチル基、(b) -基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。) 、
(c) -基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 、



(d) -基 (l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。
。)又は



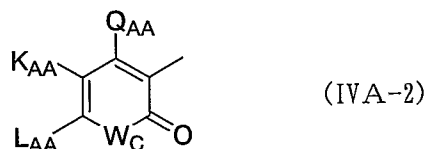
(e) -基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、
 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。} 、 $M_c - B_a$ -基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c - CO$ -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c - CO - O$ -基 (M_c は、前記と同一
20 の意味を表す。) 、 $M_c O - CO$ -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。
) 、 $M_c R_e N$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c - CO - NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c O - CO - NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c R_e N - CO$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 、 $M_c R_e N - CO - NR_e'$ -基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)
25

、 $M_c R_e N-C(=NR_e')-NR_e''$ -基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c-SO_2-NR_e$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) 又は $M_c R_e N-SO_2$ -基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。] である。

(3) Z 群: $-Y_a''=C(Y_a)-Y_a'$ -基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基、又は、C1-C10 アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10 アルキル基で置換されてもよい イミノ基を表し、 Y_a'' は、 $-N=$ 基又はメチン基を表す。)、C3-C10 アルキレン基又は $-Y_b=Y_b'-Y_b''=Y_b'''$ -基 [Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 及び Y_b''' は、同一又は相異なり、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表す。]

で示される基、

15 式 (IVA-2)



[式中、

1. K_{AA} は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(IV-AA)-基

[(IV-AA)は、式(IV-AA)



20 [式中、AAは、芳香族5員環又は芳香族6員環を表し、 Y_A 及びqは、前記と同一の意味を表し、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_A は、 Z_0 群の基をなしてAA環と縮環してもよい。]

で示される基を表す。]を表す。

2. L_{AA} は、水素原子、C1-C10 アルキル基、(IV-AA)-基 ((IV-AA)は、

前記と同一の意味を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、(IV-A A) - 基
 ((IV-A A) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アル
 ケニル基、又は、(IV-A A) - 基 ((IV-A A) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルキニル基を表し、 $K_{A A}$ と $L_{A A}$ とは、単数又
 5 は同一又は相異なる複数の M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。

3. $Q_{A A}$ は、

水素原子、又は、 Q_A - 基

[Q_A は、

10 水酸基、(b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、

$A_9 - B_6 - B_c$ - 基 [A_9 及び B_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_c は、
 オキシ基又は $-N((O)_m R_1)$ - 基 (m 及び R_1 は、前記と同一の意味を
 表す。) を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではな
 い。]

15 $A_7' - SO_2 - B_c$ - 基 (A_7' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。
 。)、

$A_8 - SO_2 - B_c$ - 基 (A_8 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、
 A_8 は水素原子とはならない。)、

20 $R_1 R_1' - N - SO_2 - B_c$ - 基 (R_1 、 R_1' 及び B_c は、前記と同一の意
 味を表す。)、

(b) - $SO_2 - B_c$ - 基 ((b) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)

,

$A_9' - B_c$ - 基 (A_9' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、

$D_5 - R_4 - B_c$ - 基 (D_5 、 R_4 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)

25 、

$M_c - B_3 - B_c$ - 基 (M_c 、 B_3 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)

又は

$M_c - B_c$ - 基 (M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)

を表す。]

である。

4. W_C は、酸素原子又は

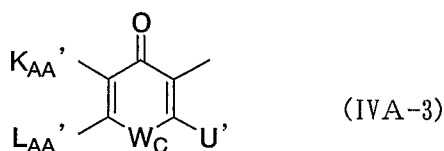
— $N T_C$ —基 [T_C は、 A_9 '—基 (A_9 ' は、前記と同一の意味を表す。)]

5、 D_5 — R_4 —基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_C —
基 (M_C は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

である。]

で示される基、

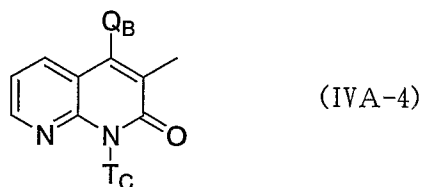
式 (IVA-3)



10 [式中、 K_{AA} ' は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、(III-AA)—基 (III-AA) は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 L_{AA} ' は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 K_{AA} ' と L_{AA} ' とは、C3-C10アルキレン基又は単数又は同一又は相異なる複数の M_a —基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、 U' は、
15 水素原子又はメチル基を表し、 W_C は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、又は、

式 (IVA-4)



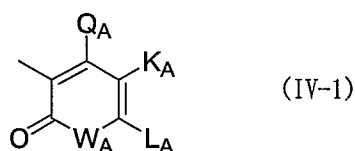
[式中、 T_C は、前記と同一の意味を表し、 Q_B は、水酸基、 A_9 — B_6 —O—
—基 (A_9 及び B_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 A_7 ' '— SO_2 —O—
20 —基 (A_7 ' ' は、前記と同一の意味を表す。)、 A_8 — SO_2 —O—基 (A_8 は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 R_1 R_1 '— N — SO_2 —O—基 (R_1 及び R_1 ' は、前記と同一の意味を表す。]

）、（b）-SO₂-O-基（（b）'は、前記と同一の意味を表す。）、A₉'-O-基（A₉'は、前記と同一の意味を表す。）、D₅-R₄-O-基（D₅及びR₄は、前記と同一の意味を表す。）、M_c-B₃-O-基（M_c及びB₃は、前記と同一の意味を表す。）又はM_c-O-基（M_cは、前記と同一の意味を表す。）を表す。]

で示される基を表す。

II. Bは、

式（IV-1）



10 [式中、

(1) Q_A は、前記と同一の意味を表す。

(2) W_A は、酸素原子又は

-NT_A-基 [T_A は、水素原子、A₉'-基（A₉'は、前記と同一の意味を表す。）、D₅-R₄-基（D₅及びR₄は、前記と同一の意味を表す。）

15 又はM_c-基（M_cは、前記と同一の意味を表す。）を表す。]

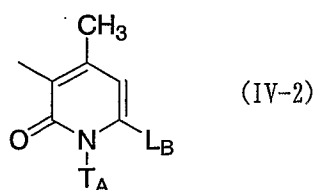
である。

(3) K_A は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、L_A は、水素原子、C1-C10アルキル基又はM_b-基（M_bは、前記と同一の意味を表す。）を表し、K_AとL_Aとは、C3-C10アルキレン基、又は、単数又は同一又は

20 は相異なる複数のM_a-基（M_aは、前記と同一の意味を表す。）で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基、

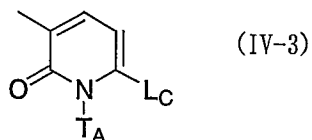
式（IV-2）



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表し、 L_B は水酸基又はメチル基を表す。]

で示される基、

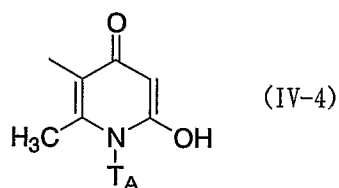
式 (IV-3)



5 [式中、 T_A は、前記と同一の意味を表し、 L_C は、C1-C10アルキル基を表す。]

で示される基、

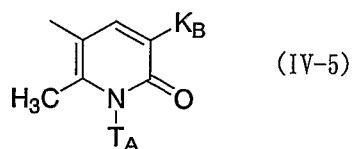
式 (IV-4)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表す。]

10 で示される基、

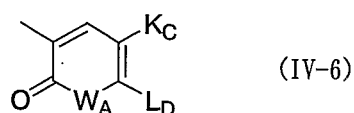
式 (IV-5)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表し、 K_B は、シアノ基又は $UOCO-$ 基 (U は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。)を表す。]

15 で示される基、

式 (IV-6)

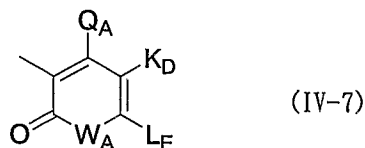


[式中、 W_A は、前記と同一の意味を表し、 K_C と L_D とは、C3-C10アルキレン基又は単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基 (M_a は、前記と同一の意

味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなす。]

で示される基、

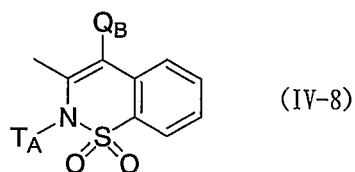
式 (IV-7)



- 5 [式中、 Q_A 及び W_A は、前記と同一の意味を表し、 K_D と L_E とは、 $-V_A = V_A' - V_A'' = V_A'''$ -基 { V_A 、 V_A' 、 V_A'' 及び V_A''' } は、同一又は相異なり、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、 V_A 、 V_A' 、 V_A'' 及び V_A''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。] をなす。]

- 10 で示される基、

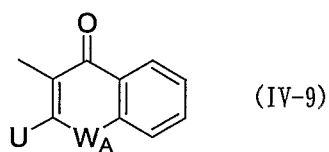
式 (IV-8)



[式中、 T_A 及び Q_B は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

式 (IV-9)

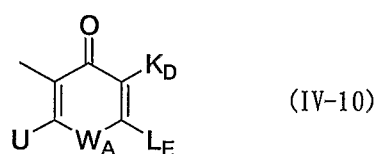


15

[式中、 U 及び W_A は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

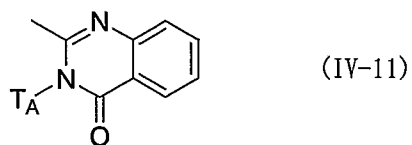
式 (IV-10)



[式中、 U 、 W_A 、 K_D 及び L_E は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

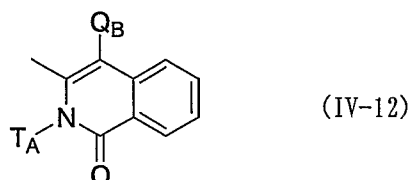
式 (IV-11)



5 [式中、 T_A は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

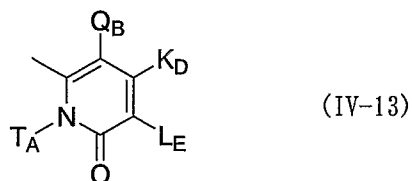
式 (IV-12)



[式中、 T_A 及び Q_B は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

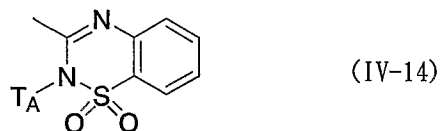
10 式 (IV-13)



[式中、 T_A 、 Q_B 、 K_D 及び L_E は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

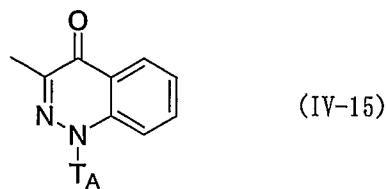
式 (IV-14)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表す。]

15 で示される基、

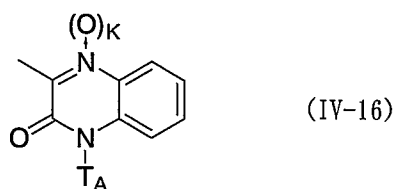
式 (IV-15)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

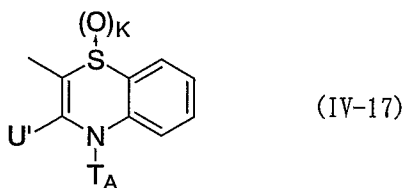
式 (IV-16)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

5 で示される基、又は、

式 (IV-17)



[式中、 T_A 、 U' 及び K は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基を表す。

I I I. $\phi - \gamma$ において、

10 ϕ は σ に結合する原子又は基を表し、 γ は、 B に結合する原子又は基を表し、 $\phi - \gamma$ は、

式 ($\phi \gamma - 1$)



(式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 R' は
15 、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma - 2$)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 、 $R_{I\ I\ I}$ 及び $CR_{I\ v}$ は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。)

で示される基、

5 式 ($\phi\gamma-3$)



[式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R'' - CO-$ 基 (R'' は、C1-C10アルキル基を表す。) 又は $R_{I\ I} - O - C(=O) -$ 基 ($R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

10 で示される基、

式 ($\phi\gamma-4$)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

15 式 ($\phi\gamma-5$)



[式中、 $X_{I\ I}$ は、オキシ基、 $-NR_I-$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

20 式 ($\phi\gamma-6$)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\gamma-7$)



[式中、 $X_{I I I}$ は、オキシ基、チオ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

5 式 ($\phi \gamma$ -8)



[式中、 $X_{I V}$ は、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]
] 前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

10 式 ($\phi \gamma$ -9)



(式中、 R_I 及び $R_{I I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

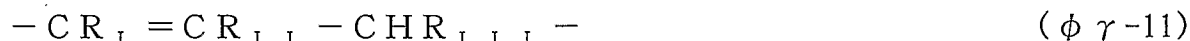
式 ($\phi \gamma$ -10)



(式中、 R_I 、 $R_{I I}$ 及び $R_{I I I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma$ -11)



で示される基、

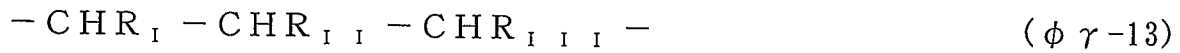
式 ($\phi \gamma$ -12)



(式中、 R_I 、 $R_{I I}$ 及び $R_{I I I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

25 で示される基、

式 ($\phi \gamma$ -13)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\ \gamma-14$)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\ \gamma-15$)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\ \gamma-16$)



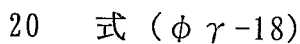
で示される基、

式 ($\phi\ \gamma-17$)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

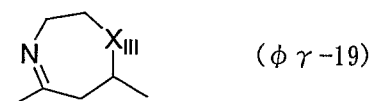
で示される基、



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

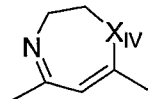
式 ($\phi\ \gamma-19$)



(式中、 $X_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\gamma$ -20)



($\phi\gamma$ -20)

(式中、 $X_{I\ V}$ は、前記と同一の意味を表す。)

5 で示される基、

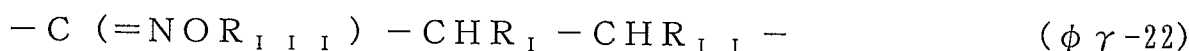
式 ($\phi\gamma$ -21)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

10 式 ($\phi\gamma$ -22)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\gamma$ -23)



で示される基、

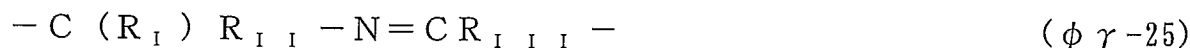
式 ($\phi\gamma$ -24)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

20 で示される基、

式 ($\phi\gamma$ -25)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

25 式 ($\phi\gamma$ -26)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma$ -27)



5 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma$ -28)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 ($\phi \gamma$ -29)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

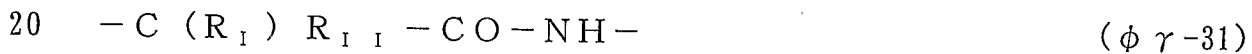
15 で示される基、

式 ($\phi \gamma$ -30)



で示される基を表す。

式 ($\phi \gamma$ -31)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma$ -32)



25 [式中、 Y_{II} は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I$ 基 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 ($\phi \gamma$ -33)



(式中、R' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

式 ($\phi \gamma - 34$)



(式中、R₁ 及び R₁₁ は、前記と同一の意味を表す。)

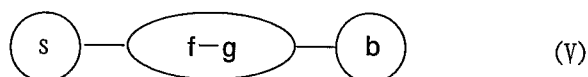
で示される基を表す。

但し、p 及び q が同時に 0 になることはない。

- 10 尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっていることもよいことを意味するものである。]

で示される含複素環化合物；

15 5. 式 (V)



[式中、

I. s は、

式 (Va-1)



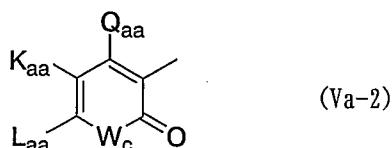
- 20 [式中、a は、ベンゼン環、ピリジン環、チオフェン環、フラン環、ピロール環、ピラゾール環、1, 2, 3-トリアゾール環、テトラゾール環、イソオキサゾール環、チアゾール環、ピリダジン環又はピリミジン環を表し、X_a は、シアノ基で置換されたC1-C10アルキル基、又は、テトラヒドロピラン-4-イ

リデン基で置換されたC1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはシアノ
 基で置換されたC2-C10アルケニル基、又は、C1-C10アルコキシカルボニル基で
 置換されたC2-C10アルケニル基、又は、ヒドロキシ基で置換されたC3-C10アル
 キニル基、又は、 $a_0 - r_1 - b - r_1'$ - 基 { a_0 は、C1-C10アルキルチオ
 5 基で置換されたメチル基、C1-C10アルキルスルフィニル基で置換されたメチル
 基、C1-C10アルキルスルホニル基で置換されたメチル基、C2-C10アルケニル基
 、C2-C10アルキニル基、 $r_2 O - CO -$ 基 (r_2 は、C1-C10アルキル基又は水
 酸基で置換されたC2-C10アルキル基を表す。) 、カルボキシ基、 $r r' N - C$
 O - 基 (r 及び r' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C10アルキル基を
 10 表す。) 、 $a_1 - NH - CO -$ 基 (a_1 は、C1-C10アルコキシ基で置換された
 C2-C10アルキル基を表す。) 、 $a_1' - CO -$ 基 (a_1' は、モルホリノ基を
 表す。) 、 $r r' N - CH_2 -$ 基 (r 及び r' は、前記と同一の意味を表す。
) 、 $r_0 - (O)_1 - CONH - CH_2 -$ 基 (r_0 は、C1-C10アルキル基を表
 し、 1 は0又は1を表す。) 、 $r - OCH_2 -$ 基 (r は、前記と同一の意味を
 15 表す。) 、 $r_0 - CO -$ 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。) 、シアノ基
 又はスルホメチル基を表し、 r_1 は、C1-C10アルキレン基を表し、 r_1' は、
 単結合又はC1-C10アルキレン基を表し、 b は、オキシ基、チオ基、スルフィニ
 ル基、スルホニル基又はメチル基で置換されてもよいイミノ基を表す。} 、又
 は、 $a_2 - y - CO - NH -$ 基 (a_2 は、C1-C10アルコキシ基で置換された
 20 C2-C10アルキル基を表し、 y は、オキシ基又はイミノ基を表す。) 、又は、 r
 O - COCO - NH - 基 (r は、前記と同一の意味を表す。) 、又は、 $a_3 -$
 $z - NH -$ 基 (a_3 は、C2-C10アルケニル基、又は、C1-C10アルコキシ基、C1-C10
 アルコキシカルボニル基、カルボキシ基若しくはシアノ基で置換されたC1-C10
 アルキル基を表し、 z は、カルボニル基又はスルホニル基を表す。) 、又は、
 25 $a_4 - N r' CO -$ 基 { a_4 は、C1-C10アルコキシ基、又は、C3-C10アルケニ
 ルオキシ基、又は、 $r_0 - SO_2 -$ 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。) 、
 又は、水酸基若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されたC2-C10アルキル基、
 又は、 $r_0 r_0' N -$ 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表し、 r_0' は、 r_0

- と同一又は相異なり、 r_0 と同一の意味を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、 $rO-CO-$ 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)、シアノ基若しくはアミノカルボニル基で置換されたC1-C10アルキル基、又は、 $rO-CO-(rO-COCH_2)CH-$ 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 r' は、前記と同一の意味を表す。}、又は、 a_5-NHSO_2- 基 (a_5 は、C1-C10アルコキシ基で置換されたC2-C10アルキル基を表す。)、又は、 $r_0ON=CH-$ 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $r_0NHCSNH-$ 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $r_0NHC(-Sr_0')=N-$ 基 (r_0 及び r_0' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(rO)_2P(=O)CH_2-$ 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 p は、0、1、2又は3を表し、 p が2以上のとき、 X_a は、同一又は相異なり、
- Y_a は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニル基、又は、2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル基、又は、[1,3]ジオキサラン-2-イル基、又は、モルホリノ基で置換されたC1-C10アルコキシ基、又は、 $a_0'-b'-$ 基 (a_0' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 b' は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)、又は、ニトロ基、又は、シアノ基、又は、 $rO-CO-$ 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $r_0r_0'N-$ 基 (r_0 及び r_0' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $r_0CO-NH-$ 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $r_0r_0'NCONH-$ 基 (r_0 及び r_0' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $rr'NCO-$ 基 (r 及び r' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、水酸基を表し、 q は、0、1、2又は3を表し、 q が2以上のとき、 Y_a は、同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している Y_a は、 a 環と縮環して4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン環をなしてもよい。]

で示される基、

式 (V a -2)



[式中、

- 5 1. K_{aa} は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(V-a a) - 基

[(V-a a) は、式 (V-a a)



[式中、aa は、チオフェン環、フラン環、ピロール環、チアゾール環、ベンゼン環又はピリジン環を表し、 Y_a 及び q は、前記と同一の意味を表す。] で示される基を表す。]

- 10 2. L_{aa} は、水素原子、C1-C10アルキル基、(V-a a) - 基 ((V-a a) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、(V-a a) - 基 ((V-a a) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルケニル基、又は、(V-a a) - 基 ((V-a a) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルキニル基を表し、 K_{aa} と L_{aa} とは、ハロゲン原子、
- 15 C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。

3. Q_{aa} は、水素原子、 $r_a - O -$ 基 { r_a は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基、又は、 $r_o r_o' N - CH_2 -$ 基 (r_o 及び r_o' は、前記と同一の意味を表す。)、

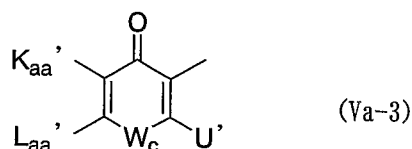
- 20 $r O CH_2 -$ 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)、 $r_o - CO -$ 基 (r_o は、前記と同一の意味を表す。)、C1-C10アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、アミノカルボニル基若しくはシアノ基で置換されたC1-C10アルキル基、又は、 $r_3 - r_1 -$ 基 (r_3 は、フェニル基又はピリジル基を表し、 r_1 は、C1-C10アルキレン基を表す。) を表す。}、又は、ピペリジノ基、又は、モル

ホリノ基、又は、 r_4 r_4' N-基 (r_4 及び r_4' は、同一又は相異なり、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基、又は、C1-C10アルコキシ基で置換されたC2-C10アルキル基を表す。但し、同時に水素原子となることはない。) である。

- 5 4. W_c は、酸素原子又は-N T_c -基 [T_c は、 r_b -基 (r_b は、 r_a と同一又は相異なり、 r_a と同一の意味を表す。) 又は r_3' -基 (r_3' は、 r_3 と同一又は相異なり、 r_3 と同一の意味を表す。) を表す。但し、水素原子となることはない。] である。]

で示される基、

10 式 (Va-3)

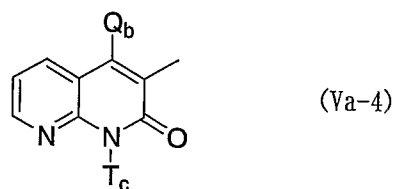


[式中、 $K_{aa'}$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、(V-a a)-基 ((V-a a) は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 $L_{aa'}$ は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 $K_{aa'}$ と $L_{aa'}$ とは、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 W_c は、前記と同一の意味を表す。]

- 15

で示される基、又は、

式 (Va-4)



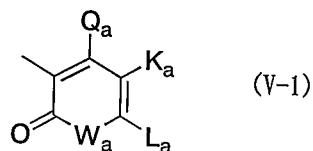
[式中、 T_c は、前記と同一の意味を表し、 Q_b は、 r_a -O-基 (r_a は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

- 20

で示される基を表す。

I I. b は、

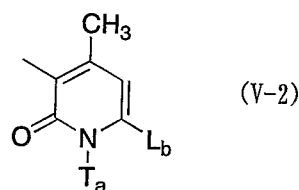
式 (V-1)



- 5 [式中、 Q_a は、 r_a -O-基 (r_a は、前記と同一の意味を表す。)、又は、
 、ピペリジノ基、又は、モルホリノ基、又は、 r_4 r_4' N-基 (r_4 及び r_4'
 は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 W_a は、酸素原子又は-N T_a
 10 -基 [T_a は、 r_b -基 (r_b は、 r_a と同一又は相異なり、 r_a と同一の意
 味を表す。)又は r_3' -基 (r_3' は、 r_3 と同一又は相異なり、 r_3 と同
 一の意味を表す。)を表す。]を表し、 K_a は、水素原子、ハロゲン原子又は
 C1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 K_a
 と L_a とは、C3-C10アルキレン基又は1, 3-ブタジエニレン基をなすこと
 がある。]

で示される基、

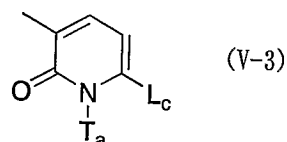
式 (V-2)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表し、 L_b は水酸基又はメチル基を表す。
 。]

- 15 で示される基、

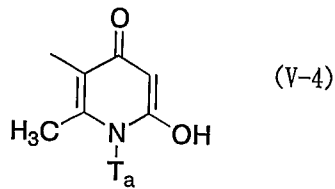
式 (V-3)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表し、 L_c は、C1-C10アルキル基を表す。
 。]

で示される基、

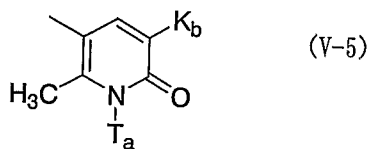
- 20 式 (V-4)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

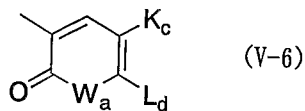
式 (V-5)



5 [式中、 T_a は、前記と同一の意味を表し、 K_b は、シアノ基又は $UOCO-$ 基 (U は、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。) を表す。]

で示される基、

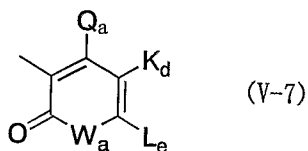
式 (V-6)



[式中、 W_a は、前記と同一の意味を表し、 K_c と L_d とは、C3-C10 アルキレン基又は C4-C10 アルケニレン基をなす。]

10 で示される基、

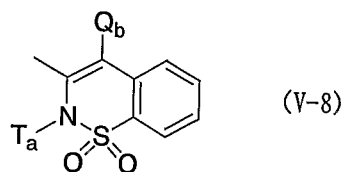
式 (V-7)



15 [式中、 Q_a 及び W_a は、前記と同一の意味を表し、 K_d と L_e とは、 $-V_a = V_a' - V_a'' = V_a''' -$ 基 (V_a 、 V_a' 、 V_a'' 及び V_a''' は、同一又は相異なり、メチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、 V_a 、 V_a' 、 V_a'' 及び V_a''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。) をなす。]

で示される基、

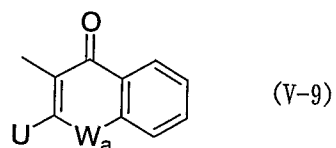
式 (V-8)



[式中、 T_a 及び Q_b は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、又は、

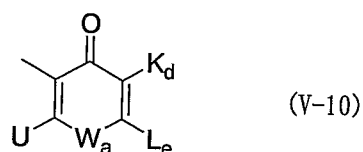
式 (V-9)



[式中、 U 及び W_a は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

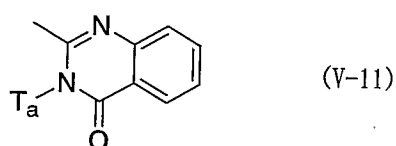
式 (V-10)



[式中、 U 、 W_a 、 K_d 及び L_e は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

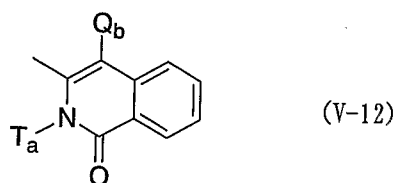
10 式 (V-11)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

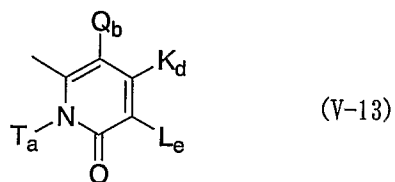
式 (V-12)



15 [式中、 T_a 及び Q_b は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

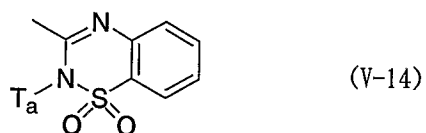
式 (V-13)



[式中、 T_a 、 Q_b 、 K_d 及び L_e は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

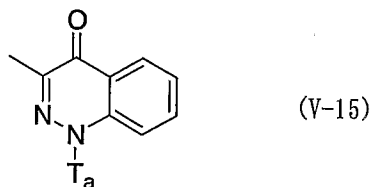
5 式 (V-14)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

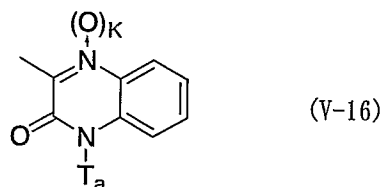
式 (V-15)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表す。]

10 で示される基、

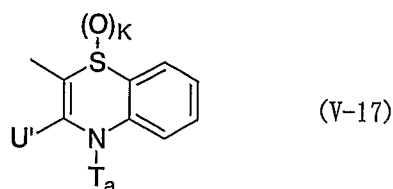
式 (V-16)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

で示される基、又は、

式 (V-17)



[式中、 T_a 及び K は、前記と同一の意味を表し、 U' は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基を表す。

III. $f-g$ において、

- 5 f は s に結合する原子又は基を表し、 g は、 b に結合する原子又は基を表し、 $f-g$ は、

式 ($f-g-1$)



- (式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表し、 R' は、
10 水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

で示される基、

式 ($f-g-2$)



- 15 (式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び CR_{IV} は、同一又は相異なり、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表す。)

で示される基、

式 ($f-g-3$)



- 20 [式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R''-CO-$ 基 (R'' は、 $C1-C10$ アルキル基を表す。) 又は $R_{II}-O-C(=O)-$ 基 (R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 ($f-g-4$)

- 25 $-CR_I=CR_{II}-C(=NOR_{III})-$ ($f-g-4$)

(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (fg-5)



5 [式中、 X_{II} は、オキシ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (fg-6)



(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

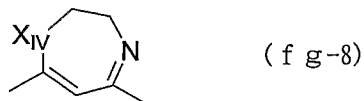
式 (fg-7)



[式中、 X_{III} は、オキシ基、チオ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

15 で示される基、

式 (fg-8)



[式中、 X_{IV} は、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

20 で示される基、

式 (fg-9)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

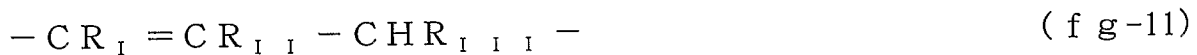
式 (f g-10)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

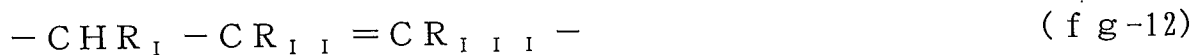
で示される基、

式 (f g-11)



で示される基、

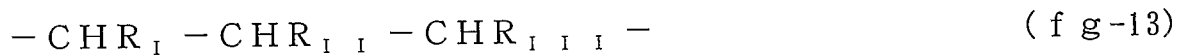
式 (f g-12)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

15 　で示される基、

式 (f g-13)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

20 　式 (f g-14)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

25 　式 (f g-15)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (f g-16)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、



5 式 (f g-17)

(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (f g-18)



(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (f g-19)



(式中、 X_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (f g-20)



15 (式中、 X_{IV} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

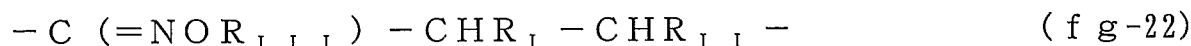
式 (f g-21)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

20 で示される基、

式 (f g-22)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{IIII} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (fg-23)



で示される基、

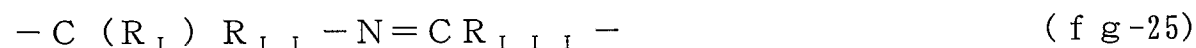
式 (fg-24)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

10 　で示される基、

式 (fg-25)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{IIII} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

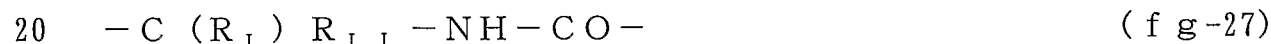
15 　式 (fg-26)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (fg-27)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

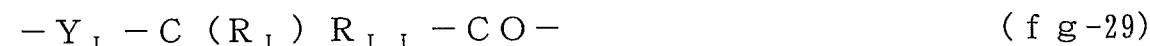
式 (fg-28)



25 　(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (fg-29)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

で示される基、

式 (f g-30)



で示される基を表す。

式 (f g-31)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

10 　で示される基、

式 (f g-32)



[式中、 $Y_{I\ I}$ は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I$ 基 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

15 　で示される基、

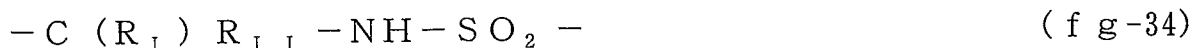
式 (f g-33)



(式中、 R'' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

20 　式 (f g-34)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基を表す。

但し、 p 及び q が同時に 0 になることはない。

25 　尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」と

は、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示

し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一である

が、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっ

ていてもよいことを意味するものである。]

で示される含複素環化合物；

6. 前項 2～5 記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする細胞外マトリックス遺伝子転写抑制組成物；

5 7. 前項 5 記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする細胞外マトリックス遺伝子転写抑制組成物；

8. 細胞外マトリックス遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物の使用；

10 9. 細胞外マトリックス遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、前項 2～5 記載の化合物の使用；

10. 細胞外マトリックス遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、前項 5 記載の化合物の使用；

11. 細胞外マトリックス遺伝子の発現量を減少させて細胞外マトリックス蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための有効成分として

15 の、前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物の使用；

12. 細胞外マトリックス遺伝子の発現量を減少させて細胞外マトリックス蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための有効成分としての、前項 2～5 記載の化合物の使用；

20 13. 有効量の、前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物を、組織の線維化を改善させる処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする組織線維化改善方法；

14. 有効量の前項 2～5 記載の化合物を、組織の線維化を改善させる処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする組織線維化改善方法；

25 15. 前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項 2～5 記載の化合物と、不活性担体とを含有することを特徴とする慢性腎不全治療剤；

16. 慢性腎不全を治療するための有効成分としての、前項 1 記載の組成物に

有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項 2 ～ 5 記載の化合物の使用；

- 1 7. 有効量の、前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項 2 ～ 5 記載の化合物を、慢性腎不全治療処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする慢性腎不全治療方法；

1 8. 前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項 2 ～ 5 記載の化合物と、不活性担体とを含有することを特徴とする心不全治療剤；

- 1 9. 心不全を治療するための有効成分としての、前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項 2 ～ 5 記載の化合物の使用；

2 0. 有効量の、前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項 2 ～ 5 記載の化合物を、心不全治療処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする心不全治療方法；

- 2 1. 前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする TGF- β 作用抑制組成物；

2 2. 前項 2 ～ 5 記載の化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする TGF- β 作用抑制組成物；

- 2 3. TGF- β の作用を抑制するための有効成分としての、前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物の使用；

2 4. TGF- β の作用を抑制するための有効成分としての、前項 2 ～ 5 記載の化合物の使用；

- 2 5. 前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項 2 ～ 5 記載の化合物と、不活性担体とを含有することを特徴とする養毛組成物；

2 6. TGF- β による毛髪退行期への移行促進を阻害して毛髪成長期の延長を導くことにより養毛効果を得るための有効成分としての、前項 1 記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項 2 ～ 5 記載の

化合物の使用；及び

27. 有効量の、前項1記載の組成物に有効成分として含有されるシンナモイル化合物、又は、前項2～5記載の化合物を、養毛処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする養毛方法；

5 等を提供するものである。

発明を実施するための形態

以下、本発明を詳細に説明する。

10 本発明において、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシ基、アルコシカルボニル基、アルキルチオ基、アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基及びアルキレン基における飽和炭化水素基は、分枝していてもよく、またその炭素原子の一部又は全部で環を形成してもよく、アルケニル基、アルケニルオキシ基、アルキニル基、アルキニルオキシ基、アルケニレン基及びアルキニレン基における不飽和炭化水素基は、分枝をもっているとしてもよく、またその炭素原子の一部又は全部で環を形成してもよく、その不飽和結合数は単数又は複
15 数である。

本発明において、アルキル基としては、例えば、メチル基、エチル基、イソプロピル基、シクロヘキシル基、シクロプロピルメチル基等があげられ、ハロアルキル基としては、例えば、2, 2, 2-トリフルオロエチル基等があげられ、アルコキシ基としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、シクロペンチルオキシ基、2-シクロヘキシルエトキシ等があげられ、アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ基等があげられ、アルキルスルフィニル基としては、例えば、メチルスルフィニル基等があげられ、アルキルスルホニル基としては、例えば、メチルスルホニル基等があげられ、アルキレン基としては、例えば、メチレン基、エチルエチレン基、1, 4-シクロヘキシレン基等があげられ、
25 、アルケニル基としては、例えば、ビニル基、2-プロペニル基、3-メチル-2-ブテニル基、1, 3-ブタジエニル基、3-シクロヘキセニル基等があげられ、アルキニル基としては、例えば、エチニル基、2-プロピニル基

、2-ペンテン-4-イニル基等があげられ、アルケニレン基としては、例えば、ビニレン基、プロペニレン、1,3-ブタジエニレン基等があげられ、アルキニレン基としては、例えば、エチニレン基、プロピニレン基等があげられる。

5 本発明において、ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子があげられる。

本発明において、ピリジル基は、2-ピリジル基、3-ピリジル基及び4-ピリジル基を含み、フリル基は、2-フリル基及び3-フリル基を含み、チエニル基は、2-チエニル基及び3-チエニル基を含み、ナフチル基は、1-ナ
10 フチル基及び2-ナフチル基を含む。

式(I)、(II)、(III)、(IV)及び(V)で示される含複素環化合物(以下、各々、化合物(I)、(II)、(III)、(IV)及び(V)と記すこともある)において、 α 環、A0環、A環及びa環が窒素原子を有する芳香族6員
15 環の場合は、そのN-オキシドも含む。

化合物(I)～(V)の Σ 環、 σ 0環、 σ 環及びs環において、芳香族5員環としては、例えば、チオフエン環、フラン環、ピロール環、イミダゾール環、ピラゾール環、1,2,3-トリアゾール環、1,2,4-トリアゾール環、テトラゾール環、オキサゾール環、イソオキサゾール環、チアゾール環、イソ
20 チアゾール環、フラザン環、1,2,5-チアジアゾール環等があげられ、芳香族6員環としては、例えば、ベンゼン環、ピリジン環、ピリダジン環、ピリミジン環、ピラジン環、1,3,5-トリアジン環、1,2,4-トリアジン環等があげられる。

25 式(I)～(V)で示される含複素環化合物(以下、化合物(I)～(V)と記すこともある)は、それらの薬理学上許容されうる塩も、同時に表す。薬理学上許容されうる塩とは、化合物(I)～(V)(以下、本発明化合物と記すこともある)の、無機酸との塩、有機酸との塩、無機塩基との塩又は有機塩基との

塩を表す。無機酸との塩とは、例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩等があげられ、有機酸との塩とは、例えば、酢酸塩、安息香酸塩等があげられ、無機塩基との塩とは、例えば、カリウム塩、ナトリウム塩等があげられ、有機塩基との塩とは、例えば、ピリジン塩、モルホリン塩等があげられる。

5

化合物 (I) 及び (II) の Y_a のとりうる置換基 Y_0 群において、「6-10員環のアリール基」とは、単環又は縮合環の芳香族炭化水素環をなす基を表し、例えば、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、6-インダニル基等があげられ、「5-10員環のヘテロアリール基」とは、単環又は縮合環の芳香族複素環をなす基を表し、例えば、2-フリル基、3-フリル基、2-チエニル基、3-チエニル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-キノリル基等があげられ、「不飽和結合を含んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基」とは、単環又は縮合環を含み、2-シクロヘキセニル基、2-モルホリニル基、4-ピペリジル基等があげられ、これらは単数又は同一又は相異なる複数の前記の M_a -基で置換されてもよい。

10

15

化合物 (I) 及び (II) の Y_a のとりうる置換基 Z_0 群において、「A環と縮環する基」は、ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基から選ばれる、単数又は同一又は相異なる複数の原子又は基を有してもよい。

20

化合物 (III) の X_{A_0} のとりうる置換基 E_0 群の R_{a_0} において、「置換されてもよい5-7員環のアリール基又はヘテロアリール基」とは、単環又は縮合環の芳香族炭化水素環をなす基又は単環又は縮合環の芳香族複素環をなす基を表し、例えば、フェニル基、1-ナフチル基、2-ナフチル基、6-インダニル基、2-フリル基、3-フリル基、2-チエニル基、3-チエニル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-キノリル基等があげられ、これらは単数又は同一又は相異なる複数の前記の M_a -基で置換されてもよい。

25

化合物 (I)、(II) 及び (III) の、 Y_a 及び Y_{A_0} のとりうる置換基 Y_0 群の (d_0) において、「カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)

- 5、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5-12 員の炭化水素環をなす」は、炭素原子の一つ又は複数が、カルボニル基又はチオカルボニル基で置き換えられ、更に、炭素原子の一つ又は複数が、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基から選ばれた、単数又は同一又は相異なる複数の基で置き換えられてもよい 5-12 員の炭化水素環をなすことを表す。

- 化合物 (I)、(II) 及び (III) の、 Y_a 及び Y_{A_0} のとりうる置換基 Y_0 群の (e_0) において、「カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5-12 員の炭化水素環をなす。」とは、炭素原子の一つ又は複数が、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基から選ばれた、単数又は同一又は相異なる複数の基で置き換えられてもよい 5-12 員の炭化水素環をなすことを表す。

- 20 化合物 (IV) の、 X_A のとりうる置換基 B 群の (a) において、「オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1'$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C2-C10 アルキレン基」とは、炭素原子の一つ又は複数が、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1'$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表す。) から選
- 25 ばれた、単数又は同一又は相異なる複数の基で置き換えられてもよい C2-C10 アルキレン基を表し、また「オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1'$ -基 (R_1' は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C3-C10 アルケニレン基」とは、炭素原子の一つ又は複数が、オキシ

基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) から選ばれた、単数又は同一又は相異なる複数の基で置き換えられてもよいC3-C10アルケニレン基を表す。

化合物 (IV) の、 X_A のとりうる置換基D群の (b) において、「メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC1-C10アルキレン基」とは、炭素原子の一つ又は複数がメチル基で置換されてもよい、又は、炭素原子の一つ又は複数が、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) から選ばれた、単数又は同一又は相異なる複数の基で置き換えられてもよいC2-C10アルキレン基を表し、「メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC2-C10アルケニレン基」とは、炭素原子の一つ又は複数がメチル基で置換されてもよい、又は、炭素原子の一つ又は複数が、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) から選ばれた、単数又は同一又は相異なる複数の基で置き換えられてもよいC2-C10アルケニレン基を表す。

化合物 (I) 及び (II) の Y_a のとりうる X_0 群、 Y_0 群及び Z_0 群に属する基を、各々、下記の表 2 4、表 2 5 及び表 2 6 に例示する。

化合物 (III) の X_{A_0} のとりうる A_0 群、 B_0 群、 C_0 群、 D_0 群、 E_0 群、 F_0 群、 G_0 群、 H_0 群、 I_0 群、 J_0 群、 K_0 群、 L_0 群、 M_0 群及び N_0 群に属する基を、各々、下記の表 1、表 2、表 3、表 4、表 5 ~ 8、表 9 ~ 1 2、表 1 3 ~ 1 6、表 1 7、表 1 8、表 1 9、表 2 0、表 2 1、表 2 2 及び表 2 3 に例示し、 Y_{A_0} のとりうる X_0 群、 Y_0 群及び Z_0 群に属する基を、各々、下記の表 2 4、表 2 5 及び表 2 6 に例示し、 Q_{A_0} 及び T_{A_0} を、各々、下記の表 2 7 ~ 表 2 8 及び表 2 9 に例示する。

化合物 (IV) の X_A のとりうる A 群、B 群、C 群、D 群、E 群、F 群、G 群

、H群、I群、J群、K群、L群、M群及びN群に属する基を、各々、下記の表1、表2、表3、表4、表5～8、表9～12、表13～16、表17、表18、表19、表20、表21、表22及び表23に例示し、Y_AのとりうるX群、Y群及びZ群に属する基を、各々、下記の表24、表25及び表26に例示し、Q_A及びT_Aを、各々、下記の表27～表28及び表29に例示する。

前記の、A₀群～N₀群及びA群～N群に属する基を、以下の表1～表23に例示するが、幾何異性が可能な基の場合はその全ての幾何異性体を意味し、互変異性が可能な基の場合はその全ての互変異性体を意味する。

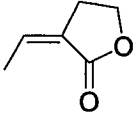
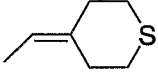
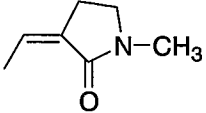
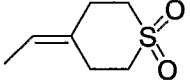
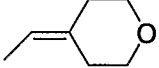
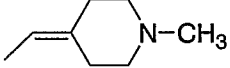
A₀群及びA群に属する基を、表1に例示する。

表1

No.	基
A-1	$-\text{CH}_2\text{ONH}_2$
A-2	$-\text{CH}_2\text{ON}(\text{CH}_3)_2$
A-3	$-\text{CH}_2\text{ONHCOCH}_3$
A-4	$-\text{CH}_2\text{NHOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
A-5	$-\text{CH}_2\text{CN}$
A-6	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
A-7	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$
A-8	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{NCH}_2\text{C}\equiv\text{CH})\text{N}(\text{CH}_3)_2$
A-9	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{NH})\text{NHCOCH}_3$
A-10	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{NOCOCH}_3)-\text{NH}_2$
A-11	$-\text{CH}_2\text{C}(=\text{NCOCH}_3)-\text{OCH}_3$
A-12	$-\text{CH}_2\text{CSNH}_2$
A-13	$-\text{CH}_2\text{NO}_2$
A-14	$-\text{CH}_2\text{SO}_3\text{H}$
A-15	$-\text{SO}_3\text{H}$

B₀ 群及びB群に属する基を、表2に例示する。

表2

No.	基	No.	基
B-1		B-4	
B-2		B-5	
B-3		B-6	

C₀ 群及びC群に属する基を、表3に例示する。

表 3

No.	基
C-1	$-\text{CH}=\text{CF}_2$
C-2	$-\text{CH}=\text{CHOCH}_3$
C-3	$-\text{CH}=\text{CHSCH}_3$
C-4	$-\text{CH}=\text{CHSOCH}_3$
C-5	$-\text{CH}=\text{CHSO}_2\text{CH}_3$
C-6	$-\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{OH}$
C-7	$-\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{OCOCH}_3$
C-8	$-\text{CH}=\text{CHCHO}$
C-9	$-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{NCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
C-10	$-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{NOH}$
C-11	$-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{NOCH}_2\text{COOCH}_3$
C-12	$-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{NOCH}_2\text{CN}$
C-13	$-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{NN}(\text{CH}_3)_2$
C-14	$-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{NNHCOCH}_3$
C-15	$-\text{CH}=\text{CHCOCH}_3$
C-16	$-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$
C-17	$-\text{CH}=\text{CHCOCF}_3$
C-18	$-\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{ON}(\text{CH}_3)_2$
C-19	$-\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{ON}(\text{SO}_2\text{CH}_3)\text{CH}_3$
C-20	$-\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)_2$
C-21	$-\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{N}(\text{OH})\text{CH}_3$
C-22	$-\text{CH}=\text{CHNHCOCH}_3$
C-23	$-\text{CH}=\text{CHCN}$
C-24	$-\text{CH}=\text{CHC}(=\text{NH})\text{N}(\text{CH}_3)_2$
C-25	$-\text{CH}=\text{CHC}(=\text{NH})\text{NHOCH}_3$
C-26	$-\text{CH}=\text{CHCSNH}_2$
C-27	$-\text{CH}=\text{CHNO}_2$
C-28	$-\text{CH}=\text{CHSO}_3\text{H}$

D₀ 群及びD群に属する基を、表4に例示する。

表4

No.	基
D-1	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{N}$ 
D-2	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{N}$ 
D-3	$-\text{C}\equiv\text{CI}$
D-4	$-\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{SCH}_3$
D-5	$-\text{C}\equiv\text{CC}(\text{CH}_3)_2\text{OH}$
D-6	$-\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{OCOOCH}_3$
D-7	$-\text{C}\equiv\text{CCH}=\text{NCH}_3$
D-8	$-\text{C}\equiv\text{CCH}=\text{NOCH}_3$
D-9	$-\text{C}\equiv\text{CCH}=\text{NN}(\text{CH}_3)_2$
D-10	$-\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{ON}(\text{CH}_3)_2$
D-11	$-\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
D-12	$-\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$

E₀ 群及びE群に属する基を、表5～表8に例示する。

表 5

No.	基
E-1	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_3$
E-2	$-\text{CH}=\text{CHCOOC}_2\text{H}_5$
E-3	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
E-4	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CF}_3$
E-5	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
E-6	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
E-7	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2-\text{N}$ 
E-8	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2-\text{N}$ 
E-9	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
E-10	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$
E-11	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}_3$
E-12	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$
E-13	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
E-14	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
E-15	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{COCH}_3$
E-17	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{ON}(\text{CH}_3)_2$
E-18	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
E-19	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{OC}_2\text{H}_5)\text{C}_2\text{H}_5$
E-20	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOCH}_3$
E-21	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$
E-22	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
E-23	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOSCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
E-24	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCONHC}_2\text{H}_5$
E-25	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCON}(\text{CH}_3)_2$

表 6

No.	基
E-26	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCON}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
E-27	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCSNHCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
E-28	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NH}\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
E-29	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
E-30	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$
E-31	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_3\text{H}$
E-32	$-\text{CH}=\text{CHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{-N}$ 
E-33	$-\text{CH}=\text{CHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
E-34	$-\text{CH}=\text{CHCOSCH}_3$
E-35	$-\text{CH}=\text{CHCON}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
E-36	$-\text{CH}=\text{CHCON}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
E-37	$-\text{CH}=\text{CHCONHOCH}_3$
E-38	$-\text{CH}=\text{CHCONHOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
E-39	$-\text{CH}=\text{CHCOOCH}_2\text{COOCH}_3$
E-40	$-\text{CH}=\text{CHCOSCH}_2\text{COOCH}_3$
E-41	$-\text{CH}=\text{CHCONHCH}_2\text{COOCH}_3$
E-42	$-\text{CH}=\text{CHCONHCH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$
E-43	$-\text{CH}=\text{CHCONHCH}_2\text{CN}$
E-44	$-\text{CH}=\text{CHCONHCH}_2\text{C}(=\text{NH})\text{N}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
E-45	$-\text{CH}=\text{CHCONHCH}_2\text{C}(=\text{NH})\text{NHOH}$

表 7

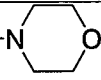
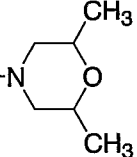
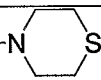
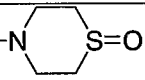
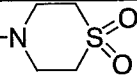
No.	基
E-46	$-\text{CH}=\text{CHCONHSO}_2\text{CH}_3$
E-47	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
E-48	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
E-49	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
E-50	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
E-51	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
E-52	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
E-53	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
E-54	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
E-55	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 

表 8

No.	基
E-56	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \diagdown \quad \diagup \end{array} \text{N}-\text{CH}_3$
E-57	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \diagdown \quad \diagup \end{array}$
E-58	$-\text{CH}=\text{CHCO}-\text{N}^{\text{H}}-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}$
E-59	$-\text{CH}=\text{CHCONHN}(\text{CH}_3)_2$
E-60	$-\text{CH}=\text{CHCONHNHCOOC}_2\text{H}_5$
E-61	$-\text{CH}=\text{CHCONHNHCSNH}(\text{c})\text{C}_6\text{H}_{11}$
E-62	$-\text{CH}=\text{CFCOOCH}_3$

F₀ 群及びF群に属する基を、表9～表12に例示する。

表 9

No.	基
F-1	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
F-2	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
F-3	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
F-4	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCON}(\text{CH}_3)_2$
F-5	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{ONH}_2$
F-6	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
F-7	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
F-8	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
F-9	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$
F-10	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOCH}_3$
F-11	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$
F-12	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOO}(\text{t})\text{C}_4\text{H}_9$
F-13	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOSCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
F-14	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_3$
F-15	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCON}(\text{CH}_3)_2$
F-16	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCON}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
F-17	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCSNHCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
F-18	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$
F-19	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_3\text{H}$
F-20	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_3\text{H}$
F-21	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_3\text{H}$
F-22	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NH}\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
F-23	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2-\text{N}$ 
F-24	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
F-25	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$

表 10

No.	基
F-26	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}_3$
F-27	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$
F-28	$-\text{OCH}_2\text{CN}$
F-29	$-\text{OCH}_2\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$
F-30	$-\text{OCH}_2\text{CSNH}_2$
F-31	$-\text{OCH}_2\text{COCH}_3$
F-32	$-\text{OCH}_2\text{COCF}_3$
F-33	$-\text{OCH}_2\text{CHO}$
F-34	$-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{NOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
F-35	$-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{NN}(\text{CH}_3)_2$
F-36	$-\text{OCH}_2\text{COOH}$
F-37	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_3$
F-38	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
F-39	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
F-40	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
F-41	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2-\text{N}$ 
F-42	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2-\text{N}$ 
F-43	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
F-44	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$
F-45	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}_3$
F-46	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$
F-47	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
F-48	$-\text{OCH}_2\text{COO}(\text{CH}_2)_9\text{OH}$
F-49	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{OSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
F-50	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{COCH}_3$

表 1 1

No.	基
F-51	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{ON}(\text{CH}_3)_2$
F-52	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
F-53	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{OC}_2\text{H}_5)\text{C}_2\text{H}_5$
F-54	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOCH}_3$
F-55	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$
F-56	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
F-57	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOSCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
F-58	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCONHC}_2\text{H}_5$
F-59	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCON}(\text{CH}_3)_2$
F-60	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCON}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
F-61	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCSNHCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
F-62	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NH}\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
F-63	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{CN}$
F-64	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$
F-65	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_3\text{H}$
F-66	$-\text{OCH}_2\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2-\text{N}$ 
F-67	$-\text{OCH}_2\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
F-68	$-\text{OCH}_2\text{COSCH}_3$
F-69	$-\text{OCH}_2\text{CONH}_2$
F-70	$-\text{OCH}_2\text{CONHCH}_3$
F-71	$-\text{OCH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$
F-72	$-\text{OCH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
F-73	$-\text{OCH}_2\text{CON}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
F-74	$-\text{OCH}_2\text{CONHOCH}_3$
F-75	$-\text{OCH}_2\text{CONHOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$

表 1 2

No.	基
F-76	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_2\text{COOCH}_3$
F-77	$-\text{OCH}_2\text{COSCH}_2\text{COOCH}_3$
F-78	$-\text{OCH}_2\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$
F-79	$-\text{OCH}_2\text{CONHCH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$
F-80	$-\text{OCH}_2\text{CONHCH}_2\text{CN}$
F-81	$-\text{OCH}_2\text{CONHCH}_2\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$
F-82	$-\text{OCH}_2\text{CONHSO}_2\text{CH}_3$
F-83	$-\text{OCH}_2\text{CO}-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \\ \text{S} \end{array}$
F-84	$-\text{OCH}_2\text{CONHN}(\text{CH}_3)_2$
F-85	$-\text{OCH}_2\text{CONHNHCOOC}_2\text{H}_5$
F-86	$-\text{OCH}_2\text{CONHNHCSNH}(\text{c})\text{C}_6\text{H}_{11}$
F-87	$-\text{SCH}_2\text{CN}$
F-88	$-\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{COOCH}_3$
F-89	$-\text{CH}_2\text{SOCH}_2\text{COOCH}_3$
F-90	$-\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_2\text{COOCH}_3$
F-91	$-\text{NHCH}_2\text{COOCH}_3$
F-92	$-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
F-93	$-\text{N}(\text{COCH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
F-94	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{COOCH}_3$
F-95	$-\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{COOH}$
F-96	$-\text{CH}_2\text{SOCH}_2\text{COOH}$
F-97	$-\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_2\text{COOH}$

G₀ 群及びG群に属する基を、表13～表16に例示する。

表 1 3

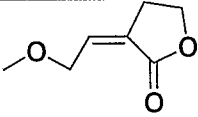
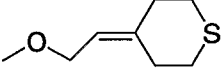
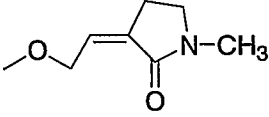
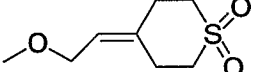
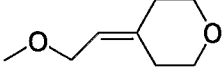
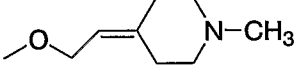
No.	基	No.	基
G-1		G-4	
G-2		G-5	
G-3		G-6	
No.	基		
G-7	$-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$		
G-8	$-\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$		
G-9	$-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CHCl}$		
G-10	$-\text{SCH}=\text{CHOCH}_3$		
G-11	$-\text{SO}_2\text{CH}=\text{CHOCH}_3$		
G-12	$-\text{OCH}=\text{CHCOCH}_3$		
G-13	$-\text{OCH}=\text{CHCHO}$		
G-14	$-\text{OCH}=\text{CHCH}=\text{NCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$		
G-15	$-\text{OCH}=\text{CHCH}=\text{NOCH}_3$		
G-16	$-\text{OCH}=\text{CHCH}=\text{NN}(\text{CH}_3)_2$		
G-17	$-\text{OCH}=\text{CHCN}$		
G-18	$-\text{OCH}=\text{CHC}(=\text{NH})\text{NH}_2$		
G-19	$-\text{OCH}=\text{CHCOOH}$		
G-20	$-\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CCOOH}$		

表 1 4

No.	基
G-21	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_3$
G-22	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
G-23	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
G-24	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
G-25	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2-\text{N}$ 
G-26	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2-\text{N}$ 
G-27	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
G-28	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$
G-29	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}_3$
G-30	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$
G-31	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
G-32	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
G-33	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{COCH}_3$
G-34	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{ON}(\text{CH}_3)_2$
G-35	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
G-36	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{OC}_2\text{H}_5)_2$
G-37	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOCH}_3$
G-38	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$
G-39	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
G-40	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOSCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
G-41	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCONHC}_2\text{H}_5$
G-42	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCON}(\text{CH}_3)_2$
G-43	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCON}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
G-44	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCSNHCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$
G-45	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
G-46	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$
G-47	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$
G-48	$-\text{OCH}=\text{CHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_3\text{H}$

表 1 5

No.	基
G-49	$-\text{OCH}=\text{CHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2-\text{N}$ 
G-50	$-\text{OCH}=\text{CHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
G-51	$-\text{OCH}=\text{CHCOSCH}_3$
G-52	$-\text{OCH}=\text{CHCON}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
G-53	$-\text{OCH}=\text{CHCON}(\text{OCH}_3)\text{CH}_3$
G-54	$-\text{OCH}=\text{CHCONHOCH}_3$
G-55	$-\text{OCH}=\text{CHCONHOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
G-56	$-\text{OCH}=\text{CHCONHCH}_2\text{COOCH}_3$
G-57	$-\text{OCH}=\text{CHCONHCH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$
G-58	$-\text{OCH}=\text{CHCONHSO}_2\text{CH}_3$
G-59	$-\text{OCH}=\text{CHCO}-\text{N}$ 
G-60	$-\text{OCH}=\text{CHCONHN}(\text{CH}_3)_2$
G-61	$-\text{OCH}=\text{CHCONHNHCOOC}_2\text{H}_5$
G-62	$-\text{OCH}=\text{CHCONHNHCSNH}(\text{c})\text{C}_6\text{H}_{11}$
G-63	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2-\text{N}$ 
G-64	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2-\text{N}$ 
G-65	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{OCH}_3$
G-66	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{SCH}_3$
G-67	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{SOCH}_3$
G-68	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$
G-69	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{OH}$
G-70	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{OCOCH}_3$

表 1 6

No.	基
G-71	$-\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{OH}$
G-72	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{ON}(\text{CH}_3)_2$
G-73	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
G-74	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)_2$
G-75	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{N}(\text{OH})\text{CH}_3$
G-76	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{NO}_2$
G-77	$-\text{OCH}=\text{CHCH}_2\text{SO}_3\text{H}$
G-78	$-\text{SCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
G-79	$-\text{SOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
G-80	$-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
G-81	$-\text{SCH}=\text{CHCOOH}$
G-82	$-\text{CH}_2\text{NHCH}=\text{CHCOOH}$
G-83	$-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
G-84	$-\text{CH}_2\text{OCH}=\text{CHCOOH}$

H₀ 群及びH群に属する基を、表 1 7 に例示する。

表 17

No.	基
H-1	$-\text{CH}_2\text{NHCN}$
H-2	$-\text{N}(\text{COCH}_3)\text{CN}$
H-3	$-\text{NHC}(\text{=NH})\text{NHOH}$
H-4	$-\text{NHC}(\text{=NH})\text{N}(\text{CH}_2\text{CH=CH}_2)\text{CH}_3$
H-5	$-\text{C}(\text{=NH})\text{NHCH}_2\text{CH=CH}_2$
H-6	$-\text{N=CHN}(\text{CH}_3)_2$
H-7	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
H-8	$-\text{NHCONHCOCH}_3$
H-9	$-\text{NHCONHSO}_2\text{CH}_3$
H-10	$-\text{NHCOCN}$
H-11	$-\text{NHCOCOOCH}_3$
H-12	$-\text{NHCOCOOH}$

I₀ 群及び I 群に属する基を、表 18 に例示する。

表 18

No.	基
I-1	$-\text{NHCOCH}=\text{CH}_2$
I-2	$-\text{NHCSCH}=\text{CH}_2$
I-3	$-\text{NHCOCF}=\text{CH}_2$
I-4	$-\text{NHCO}\equiv\text{CH}$
I-5	$-\text{NHCOCH}_2\text{OCH}_3$
I-6	$-\text{NHCOCH}_2\text{SCH}_3$
I-7	$-\text{NHCOCH}_2\text{COCH}_3$
I-8	$-\text{NHCOCH}_2\text{OH}$
I-9	$-\text{NHCOCH}_2\text{ONH}_2$
I-10	$-\text{NHCOCH}_2\text{N}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
I-11	$-\text{NHCOCH}_2\text{NHCOCH}_3$
I-12	$-\text{NHCOCH}_2\text{COOCH}_3$
I-13	$-\text{NHCOCH}_2\text{CN}$
I-14	$-\text{NHCOCH}_2\text{NO}_2$
I-15	$-\text{NHCOCH}_2\text{SO}_3\text{H}$
I-16	$-\text{NHCOCH}_2\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
I-17	$-\text{NHCSCH}_3$
I-18	$-\text{NHCSCH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
I-19	$-\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
I-20	$-\text{NHCOOCH}_2\text{CN}$
I-21	$-\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$
I-22	$-\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOCH}_3$
I-23	$-\text{NH}(\text{CS})\text{OCH}_3$
I-24	$-\text{NH}(\text{CO})\text{SCH}_3$
I-24	$-\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
I-25	$-\text{NHCSNHCH}_3$
I-26	$-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
I-27	$-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
I-28	$-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
I-29	$-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{COCH}_3$
I-30	$-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CN}$
I-31	$-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$
I-32	$-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{COOH}$
I-33	$-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

J₀ 群及び J 群に属する基を、表 19 に例示する。

表 19

No.	基
J-1	$-\text{COCH}=\text{CH}_2$
J-2	$-\text{COC}\equiv\text{CH}$
J-3	$-\text{COC}\equiv\text{CCF}_3$
J-4	$-\text{COCH}_2\text{SCH}_3$
J-5	$-\text{COCH}_2\text{OH}$
J-6	$-\text{COCH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
J-7	$-\text{CSCH}_3$
J-8	$-\text{CSCF}_3$
J-9	$-\text{CH}=\text{NCH}_3$
J-10	$-\text{CH}=\text{NOCH}_3$
J-11	$-\text{COCN}$
J-12	$-\text{COC}(=\text{NH})\text{NH}_2$
J-13	$-\text{COCOOCH}_3$
J-14	$-\text{CH}_2\text{OCON}(\text{CH}_3)_2$

5 K₀ 群及び K 群に属する基を、表 20 に例示する。

表 2 0

No.	基
K-1	$-\text{CONHSO}_2\text{CH}_3$
K-2	$-\text{CONHOH}$
K-3	$-\text{CONHOCH}_3$
K-4	$-\text{CONHOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
K-5	$-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
K-6	$-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
K-7	$-\text{CONHCH}_2\text{OCH}_3$
K-8	$-\text{CONHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
K-9	$-\text{CONHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
K-10	$-\text{CONHCH}_2\text{CN}$
K-11	$-\text{CONHCH}_2\text{COOH}$
K-12	$-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$
K-13	$-\text{CONHCH}_2\text{CONH}_2$
K-14	$-\text{CONHCH}_2\text{CONHCH}_3$
K-15	$-\text{CONHCH}_2\text{CONH}(\text{CH}_3)_2$
K-16	$-\text{CONHCH}(\text{CH}_2\text{COOH})\text{COOH}$
K-17	$-\text{CONHCH}(\text{CH}_2\text{COOCH}_3)\text{COOCH}_3$
K-18	$-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$

L₀ 群及びL群に属する基を、表 2 1 に例示する。

表 2 1

No.	基
L-1	$-\text{SO}_2\text{NHOH}$
L-2	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_3$
L-3	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
L-4	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
L-5	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
L-6	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
L-7	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CN}$
L-8	$-\text{SO}_2\text{NHCOCH}_3$
L-9	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{COOH}$
L-10	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{COOCH}_3$
L-11	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CONH}_2$
L-12	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CONHCH}_3$
L-13	$-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$
L-14	$-\text{SO}_2\text{NHCH}(\text{CH}_2\text{COOH})\text{COOH}$
L-15	$-\text{NHSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$

M₀ 群及びM群に属する基を、表 2 2 に例示する。

表 2 2

N o .	基
M-1	$-\text{N}=\text{C}(-\text{SCH}_3)\text{CH}_3$
M-2	$-\text{N}=\text{C}(-\text{OCH}_3)\text{OCH}_3$
M-3	$-\text{N}=\text{C}(-\text{SCH}_3)\text{OCH}_3$
M-4	$-\text{N}=\text{C}(-\text{SCH}_3)\text{SCH}_3$
M-5	$-\text{N}=\text{C}(-\text{SCH}_3)\text{NHCH}_3$
M-6	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{C}(-\text{SCH}_3)=\text{NCH}_3$
M-7	$-\text{N}(\text{CH}_3)\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
M-8	$-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2)\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$

N₀ 群及びN群に属する基を、表 2 3 に例示する。

表 2 3

N o .	基
N-1	$-\text{CH}_2\text{P}(=\text{O})(\text{OH})_2$
N-2	$-\text{CH}_2\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)_2$
N-3	$-\text{CH}_2\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)-\text{CH}_3$
N-4	$-\text{CH}_2\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)-\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_3$
N-5	$-\text{CH}_2\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
N-6	$-\text{CH}_2\text{P}(=\text{O})(\text{OCH}_3)-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$

5

前記の、X₀ 群～Z₀ 群及びX群～Z群に属する基を、以下の表 2 4～表 2 5 に例示するが、幾何異性が可能な基の場合はその全ての幾何異性体を意味し、互変異性が可能な基の場合はその全ての互変異性体を意味する。

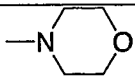
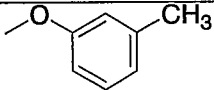
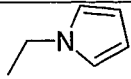
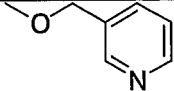
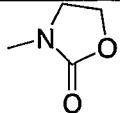
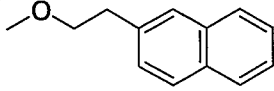
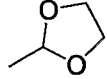
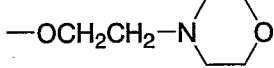
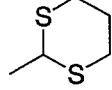
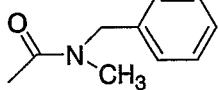
X₀ 群及びX群に属する基を、表 2 4 に例示する。

表 2 4

N o .	基	N o .	基
X-1	$-\text{CH}_3$	X-18	$-\text{OCF}_2\text{CHF}_2$
X-2	$-\text{C}_2\text{H}_5$	X-19	$-\text{SCF}_3$
X-3	$-\text{CF}_3$	X-20	$-\text{CH}_2\text{OCH}_3$
X-4	$-\text{CH}=\text{CHCH}_3$	X-21	$-\text{COCH}_3$
X-5	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	X-22	$-\text{OCOCH}_3$
X-6	$-\text{C}\equiv\text{CH}$	X-23	$-\text{COOH}$
X-7	$-\text{F}$	X-24	$-\text{COOCH}_3$
X-8	$-\text{Cl}$	X-25	$-\text{CH}=\text{CHCOOH}$
X-9	$-\text{Br}$	X-26	$-\text{N}(\text{CH}_3)_2$
X-10	$-\text{NO}_2$	X-27	$-\text{NHCOCH}_3$
X-11	$-\text{CN}$	X-28	$-\text{NHCOOCH}_3$
X-12	$-\text{OCH}_3$	X-29	$-\text{CONH}_2$
X-13	$-\text{SCH}_3$	X-30	$-\text{CON}(\text{CH}_3)_2$
X-14	$-\text{SOC}_4\text{H}_9$	X-31	$-\text{NHCON}(\text{CH}_3)_2$
X-15	$-\text{SO}_2\text{C}_4\text{H}_9$	X-32	$-\text{NHC}(\text{=NH})\text{NH}_2$
X-16	$-\text{OCHF}_2$	X-33	$-\text{NHSO}_2\text{CF}_3$
X-17	$-\text{OCF}_3$	X-34	$-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$

Y₀ 群及びY群に属する基を、表 2 5 に例示する。

表 2 5

No.	基	No.	基
Y-1		Y-6	
Y-2		Y-7	
Y-3		Y-8	
Y-4		Y-9	
Y-5		Y-10	

Z₀ 群又は Z 群と縮環した α 環、A₀ 環又は A 環を、表 2 6 ~ 表 2 8 に例示する。

表 2 6

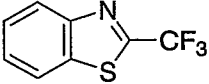
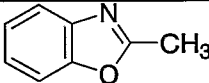
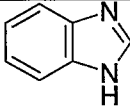
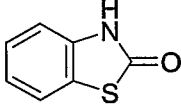
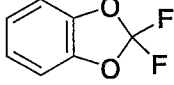
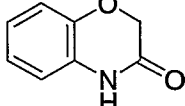
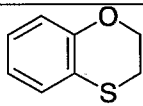
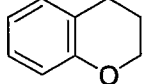
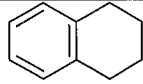
No.	Z ₀ 群又は Z 群	Z ₀ 群又は Z 群と縮環した α 環、A ₀ 環又は A 環
Z-1	$-\text{N}=\text{C}(-\text{CF}_3)-\text{S}-$	
Z-2	$-\text{N}=\text{C}(-\text{CH}_3)-\text{O}-$	
Z-3	$-\text{N}=\text{C}-\text{NH}-$	
Z-4	$-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{S}-$	
Z-5	$-\text{O}-\text{CF}_2-\text{O}-$	
Z-6	$-\text{O}-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}-$	
Z-7	$-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{S}-$	
Z-8	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-$	
Z-9	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$	

表 2 7

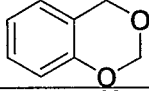
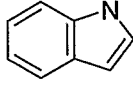
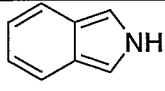
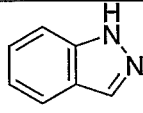
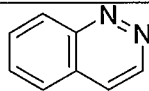
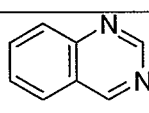
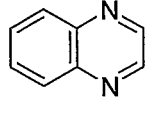
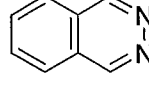
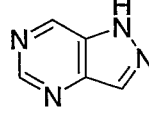
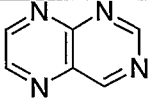
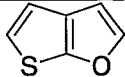
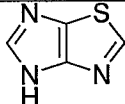
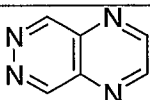
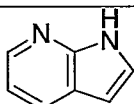
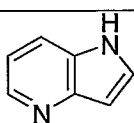
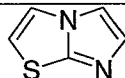
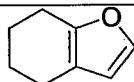
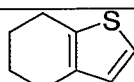
No.	Z ₀ 群又は Z 群	Z ₀ 群又は Z 群と縮環した α 環、A ₀ 環又は A 環
Z-10	$-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$	
Z-11	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$	
Z-12	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$	
Z-13	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$	
Z-14	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$	
Z-15	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$	
Z-16	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$	
Z-17	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$	
Z-18	$-\text{CH}=\text{N}-\text{CH}=\text{N}-$	

表 28

No.	Z ₀ 群又は Z 群	Z ₀ 群又は Z 群と縮環した α 環、A ₀ 環又は A 環
Z-19	$-\text{N}=\text{CH}-\text{CH}=\text{N}-$	
Z-20	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{S}-$	
Z-21	$-\text{N}=\text{CH}-\text{NH}-$	
Z-22	$-\text{CH}=\text{N}-\text{N}=\text{CH}-$	
Z-23	$-\text{N}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$	
Z-24	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{N}-$	
Z-25	$-\text{CH}=\text{CH}-\text{S}-$	
Z-26	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	
Z-27	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$	

Q_{A0} 及び Q_A を、表 29～表 30 に例示する。

表 2 9

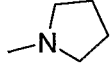
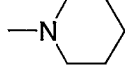
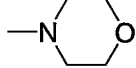
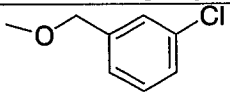
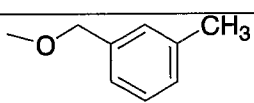
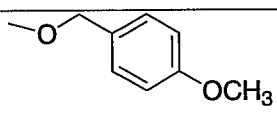
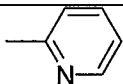
No.	基
Q-1	$-\text{OH}$
Q-2	
Q-3	
Q-4	
Q-5	$-\text{OCOCH}_3$
Q-6	$-\text{OSO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Q-7	$-\text{NHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
Q-8	$-\text{NHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
Q-9	$-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
Q-10	$-\text{OCH}_3$
Q-11	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2(\text{c})\text{C}_6\text{H}_{11}$
Q-12	$-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
Q-13	$-\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
Q-14	$-\text{OCH}_2\text{COOH}$
Q-15	$-\text{OCH}_2\text{COOCH}_3$

表 3 0

No.	基
Q-16	$-\text{OCH}_2\text{CONH}_2$
Q-17	$-\text{OCH}_2\text{CN}$
Q-18	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
Q-19	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
Q-20	$-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
Q-21	$-\text{OCH}_2\text{COCH}_3$
Q-22	$-\text{OCOC}_6\text{H}_5$
Q-23	$-\text{OCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$
Q-24	
Q-25	
Q-26	

T_{A0} 及び T_A を、表 3 1 に例示する。

表 3 1

No.	基
T-1	$-\text{H}$
T-2	$-\text{CH}_3$
T-3	$-\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{c})\text{C}_6\text{H}_{11}$
T-4	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
T-5	$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
T-6	$-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$
T-7	$-\text{CH}_2\text{COOH}$
T-8	$-\text{CH}_2\text{COOCH}_3$
T-9	$-\text{CH}_2\text{CONH}_2$
T-10	$-\text{CH}_2\text{CN}$
T-11	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$
T-12	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
T-13	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$
T-14	$-\text{CH}_2\text{COCH}_3$
T-15	$-\text{CH}_2\text{CF}_3$
T-16	$-\text{Ph}$
T-17	

化合物 (II) として、

例えば、

5 Σ が、前記の式 (II α -1) で示される基であり、かつ、

$\Phi-\Gamma$ が、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CBr}=\text{CHCO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ で示される基、

—CH=CH—CH₂—で示される基、

—CH₂—CH=CH—で示される基、

—CH₂—CH₂—CH₂—で示される基、

—CO—CH=CH—で示される基、

5 —NH₂—N=CH—で示される基、

—CH₂—NH—CO—で示される基、

—CH₂—CO—NH—で示される基、又は、

—NH—CO—NH—で示される基であり、かつ、

βが、前記の式(II-1)で示される基の場合があげられる。

10 また例えば、

Σが、式(IIα-1)で示される基であってαがベンゼン環であり、かつ、

Φ—Γが、

—CH=CH—CH=CH—CO—で示される基、

—CBr=CHCO—で示される基、

15 —CH₂—CH₂—CO—で示される基、

—CH=CH—CH₂—で示される基、

—CH₂—CH=CH—で示される基、

—CH₂—CH₂—CH₂—で示される基、

—CO—CH=CH—で示される基、

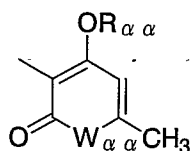
20 —NH₂—N=CH—で示される基、

—CH₂—NH—CO—で示される基、

—CH₂—CO—NH—で示される基、又は、

—NH—CO—NH—で示される基であり、かつ、

βが、式(II'-1)



(II'-1)

25 [式中、R_{αα}は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、W_{αα}は、酸素原

子又は $-NT_{\alpha\alpha}-$ 基 ($T_{\alpha\alpha}$ は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。) を表す。]

で示される基である場合があげられる。

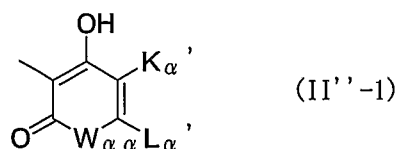
更に例えば、

- 5 Σ が、式 (II α -1) で示される基であって α がベンゼン環であり、かつ、
 $\Phi-\Gamma$ が、
 $-CH=CH-CH=CH-CO-$ で示される基、
 $-CBr=CHCO-$ で示される基、
 $-CH_2-CH_2-CO-$ で示される基、
- 10 $-CH=CH-CH_2-$ で示される基、
 $-CH_2-CH=CH-$ で示される基、
 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ で示される基、
 $-CO-CH=CH-$ で示される基、
 $-NH_2-N=CH-$ で示される基、
- 15 $-CH_2-NH-CO-$ で示される基、
 $-CH_2-CO-NH-$ で示される基、又は、
 $-NH-CO-NH-$ で示される基であり、かつ、
 β が、前記の式 (II' -1) で示される基であって、 $R_{\alpha\alpha}$ が、水素原子又はメ
チル基であり、 $W_{\alpha\alpha}$ が、酸素原子又は $-NT_{\alpha\alpha}-$ 基 ($T_{\alpha\alpha}$ は、前記と同
20 一の意味を表す。) をであって、かつ $T_{\alpha\alpha}$ が水素原子又はメチル基である場
合があげられる。

また、化合物 (II) として、

具体的には、

- 25 Σ が、式 (II α -1) で示される基であって α がベンゼン環であり、かつ、
 $\Phi-\Gamma$ が、 $-CH_2-CH_2-CO-$ で示される基、又は、 $-NH-CO-NH-$ で示される基であり、かつ、
 β が、式 (II'' -1)



[式中、 $W_{\alpha\alpha}$ は、前記と同一の意味を表し、 K_{α}' は、水素原子を表し、 L_{α}' は、C1-C10アルキル基を表し、 K_{α}' と L_{α}' とは、C4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基である場合があげられる。

5 また具体的には、

Σ が、式 (II α -1) で示される基であって α がベンゼン環であり、かつ、

$\Phi-\Gamma$ が、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

10 β が、前記の式 (II''-1) で示される基であって、 $W_{\alpha\alpha}$ が $-\text{NT}_{\alpha\alpha}-$ 基 (式中、 $T_{\alpha\alpha}$ は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ K_{α}' が水素原子であって L_{α}' が C1-C10アルキル基である場合があげられる。

更に具体的には、

Σ が、式 (II α -1) で示される基であって α がベンゼン環であり、かつ、

15 $\Phi-\Gamma$ が、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

β が、前記の式 (II''-1) で示される基であって、 $W_{\alpha\alpha}$ が $-\text{NT}_{\alpha\alpha}-$ 基 (式中、 $T_{\alpha\alpha}$ は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ K_{α}' と L_{α}' とが C4-C10アルケニレン基をなす場合があげられる。

一層具体的には、

20 Σ が、式 (II α -1) で示される基であって α がベンゼン環であり、かつ、

$\Phi-\Gamma$ が、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

25 β が、前記の式 (II''-1) で示される基であって、 $W_{\alpha\alpha}$ が $-\text{NT}_{\alpha\alpha}-$ 基 (式中、 $T_{\alpha\alpha}$ は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ $T_{\alpha\alpha}$ が水素原子又はメチル基であって、かつ K_{α}' が水素原子であって L_{α}' がメチル基であ

る場合があげられる。

より一層具体的には、

Σ が、式 (II α -1) で示される基であって α がベンゼン環であり、かつ、

$\Phi - \Gamma$ が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH} - \text{CO} - \text{N}$

5 $\text{H}-$ で示される基であり、かつ、

β が、前記の式 (II' -1) で示される基であって、 $\text{W}_{\alpha\alpha}$ が $-\text{NT}_{\alpha\alpha}-$ 基 (式中、 $\text{T}_{\alpha\alpha}$ は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ $\text{T}_{\alpha\alpha}$ が水素原子又はメチル基であって、かつ $\text{K}_{\alpha'}$ と $\text{L}_{\alpha'}$ とが1, 3-ブタジエニレン基をなす場合があげられる。

10

化合物 (III) として、

例えば、

$\sigma 0$ が式 (IIIA 0-1) で示される基であり、かつ、

$\phi 0 - \gamma 0$ が、

15 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CB r}=\text{CHCO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2 -$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

20 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$ で示される基、

$-\text{CO}-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{NH}_2 - \text{N}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{NH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{CO}-\text{NH}-$ で示される基、又は、

25 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

$\text{B } 0$ が、前記の式 (III-1) で示される基の場合があげられる。

また例えば、

$\sigma 0$ が式 (IIIA 0-1) で示される基であって $\text{A } 0$ がベンゼン環であり、かつ、

$\phi 0 - \gamma 0$ が、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CBr}=\text{CHCO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ で示される基、

5 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ で示される基、

$-\text{CO}-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

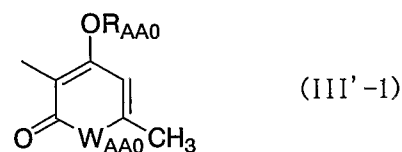
$-\text{NH}_2-\text{N}=\text{CH}-$ で示される基、

10 $-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基、又は、

$-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

B 0 が、式 (III' -1)



15 [式中、 R_{AA0} は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 W_{AA0} は、酸素原子又は $-\text{NT}_{AA0}-$ 基 (T_{AA0} は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。)を表す。]

で示される基である場合があげられる。

更に例えば、

$\sigma 0$ が式 (IIIA 0 -1) で示される基であってA 0 がベンゼン環であり、かつ、

20 $\phi 0 - \gamma 0$ が、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CBr}=\text{CHCO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ で示される基、

25 $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

—CH₂—CH₂—CH₂—で示される基、

—CO—CH=CH—で示される基、

—NH₂—N=CH—で示される基、

—CH₂—NH—CO—で示される基、

5 —CH₂—CO—NH—で示される基、又は、

—NH—CO—NH—で示される基であり、かつ、

B₀が、前記の式(III'-1)で示される基であって、R_{AA0}が、水素原子又はメチル基であり、W_{AA0}が、酸素原子又は—NT_{AA0}—基(T_{AA0}は、前記と同一の意味を表す。)であって、かつT_{AA0}が水素原子又はメチル基である場合があげられる。

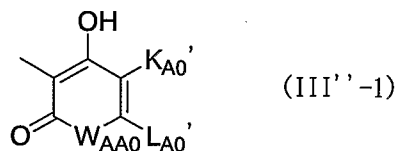
また化合物(III)として、

具体的には、

σ₀が式(IIIA0-1)で示される基であってA₀がベンゼン環であり、かつ、

15 φ₀—γ₀が、—CH₂—CH₂—CO—で示される基、又は、—NH—CO—NH—で示される基であり、かつ、

B₀が、式(III''-1)



[式中、W_{AA0}は、前記と同一の意味を表し、K_{A0}'は、水素原子を表し、L_{A0}'は、C1-C10アルキル基を表し、K_{A0}'とL_{A0}'とは、C4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基である場合があげられる。

また具体的には、

σ₀が式(IIIA0-1)で示される基であってA₀がベンゼン環であり、かつ、

φ₀—γ₀が、—CH₂—CH₂—CO—で示される基、又は、—NH—CO—

25 —NH—で示される基であり、かつ、

B₀が、前記の式(III''-1)で示される基であって、W_{AA0}が-N T_{AA}₀-基(式中、T_{AA0}は、前記と同一の意味を表す。)であって、かつK_{A0}'が水素原子であってL_{A0}'がC1-C10アルキル基である場合があげられる。

更に具体的には、

- 5 σ₀が式(IIIA0-1)で示される基であってA₀がベンゼン環であり、かつ、
φ₀-γ₀が、-CH₂-CH₂-CO-で示される基、又は、-NH-CO-NH-で示される基であり、かつ、

- B₀が、前記の式(III''-1)で示される基であって、W_{AA0}が-N T_{AA}₀-基(式中、T_{AA0}は、前記と同一の意味を表す。)であって、かつK_{A0}'
10 とL_{A0}'とがC4-C10アルケニレン基をなす場合があげられる。

一層具体的には、

σ₀が式(IIIA0-1)で示される基であってA₀がベンゼン環であり、かつ、
φ₀-γ₀が、-CH₂-CH₂-CO-で示される基、又は、-NH-CO-NH-で示される基であり、かつ、

- 15 B₀が、前記の式(III''-1)で示される基であって、W_{AA0}が-N T_{AA}₀-基(式中、T_{AA0}は、前記と同一の意味を表す。)であって、かつT_{AA0}が水素原子又はメチル基であって、かつK_{A0}'が水素原子であってL_{A0}'がメチル基である場合があげられる。

より一層具体的には、

- 20 σ₀が式(IIIA0-1)で示される基であってA₀がベンゼン環であり、かつ、
φ₀-γ₀が、-CH₂-CH₂-CO-で示される基、又は、-NH-CO-NH-で示される基であり、かつ、

- B₀が、前記の式(III''-1)で示される基であって、W_{AA0}が-N T_{AA}₀-基(式中、T_{AA0}は、前記と同一の意味を表す。)であって、かつK_{A0}'
25 とL_{A0}'とが1, 3-ブタジエニレン基をなす場合があげられる。

化合物(IV)として、

例えば、

σ が式 (IVA-1) で示される基であり、かつ、

$\phi - \gamma$ が、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CBr}=\text{CHCO}-$ で示される基、

5 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ で示される基、

$-\text{CO}-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

10 $-\text{NH}_2-\text{N}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基、又は、

$-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

B が、前記の式 (IV-1) で示される基の場合があげられる。

15 また例えば、

σ が式 (IVA-1) で示される基であって A がベンゼン環であり、かつ、

$\phi - \gamma$ が、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CBr}=\text{CHCO}-$ で示される基、

20 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ で示される基、

$-\text{CO}-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

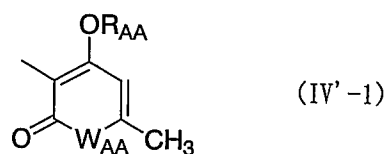
25 $-\text{NH}_2-\text{N}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基、又は、

$-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

Bが、式 (IV' -1)



[式中、 R_{AA} は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 W_{AA} は、酸素原子又は $-NT_{AA}-$ 基 (T_{AA} は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。)を表す。]

5 で示される基である場合があげられる。

更に例えば、

σ が式 (IVA-1) で示される基であってAがベンゼン環であり、かつ、 $\phi-\gamma$ が、

$-CH=CH-CH=CH-CO-$ で示される基、

10 $-CB_r=CHCO-$ で示される基、

$-CH_2-CH_2-CO-$ で示される基、

$-CH=CH-CH_2-$ で示される基、

$-CH_2-CH=CH-$ で示される基、

$-CH_2-CH_2-CH_2-$ で示される基、

15 $-CO-CH=CH-$ で示される基、

$-NH_2-N=CH-$ で示される基、

$-CH_2-NH-CO-$ で示される基、

$-CH_2-CO-NH-$ で示される基、又は、

$-NH-CO-NH-$ で示される基であり、かつ、

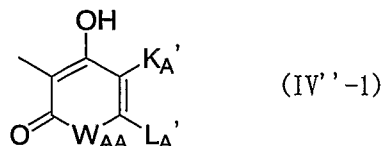
20 Bが、前記の式 (IV' -1) で示される基であって、 R_{AA} が、水素原子又はメチル基であり、 W_{AA} が、酸素原子又は $-NT_{AA}-$ 基 (T_{AA} は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ T_{AA} が水素原子又はメチル基である場合があげられる。

25 また化合物 (IV) として、

具体的には、

σ が式 (IVA-1) で示される基であって A がベンゼン環であり、かつ、
 $\phi - \gamma$ が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{N}$
 $\text{H}-$ で示される基であり、かつ、

5 B が、式 (IV''-1)



[式中、 W_{AA} は、前記と同一の意味を表し、 K_A' は、水素原子を表し、 L_A' は、C1-C10アルキル基を表し、 K_A' と L_A' とは、C4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基である場合があげられる。

10 また具体的には、

σ が式 (IVA-1) で示される基であって A がベンゼン環であり、かつ、
 $\phi - \gamma$ が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{N}$
 $\text{H}-$ で示される基であり、かつ、

B が、前記の式 (IV''-1) で示される基であって、 W_{AA} が $-\text{NT}_{AA}-$ 基 (15
 式中、 T_{AA} は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ K_A' が水素原子
 であって L_A' が C1-C10アルキル基である場合があげられる。

更に具体的には、

σ が式 (IVA-1) で示される基であって A がベンゼン環であり、かつ、
 $\phi - \gamma$ が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{N}$
 20 $\text{H}-$ で示される基であり、かつ、

B が、前記の式 (IV''-1) で示される基であって、 W_{AA} が $-\text{NT}_{AA}-$ 基 (20
 式中、 T_{AA} は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ K_A' と L_A' と
 が C4-C10アルケニレン基をなす場合があげられる。

一層具体的には、

25 σ が式 (IVA-1) で示される基であって A がベンゼン環であり、かつ、

$\phi - \gamma$ が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

B が、前記の式 (IV' '-1) で示される基であって、 $\text{W}_{\text{A A}}$ が $-\text{NT}_{\text{A A}}-$ 基 (式中、 $\text{T}_{\text{A A}}$ は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ $\text{T}_{\text{A A}}$ が水素原子又はメチル基であって、かつ K_{A}' が水素原子であって L_{A}' がメチル基である場合があげられる。

より一層具体的には、

σ が式 (IVA-1) で示される基であって A がベンゼン環であり、かつ、

$\phi - \gamma$ が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

B が、前記の式 (IV' '-1) で示される基であって、 $\text{W}_{\text{A A}}$ が $-\text{NT}_{\text{A A}}-$ 基 (式中、 $\text{T}_{\text{A A}}$ は、前記と同一の意味を表す。) であって、かつ K_{A}' と L_{A}' とが 1, 3-ブタジエニレン基をなす場合があげられる。

15 化合物 (V) として、

例えば、

s が式 (Va-1) で示される基であり、かつ、

f - g が、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-\text{CO}-$ で示される基、

20 $-\text{CBr}=\text{CHCO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2 -$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 -$ で示される基、

25 $-\text{CO}-\text{CH}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{NH}_2 - \text{N}=\text{CH}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{NH}-\text{CO}-$ で示される基、

$-\text{CH}_2 - \text{CO}-\text{NH}-$ で示される基、又は、

—NH—CO—NH—で示される基であり、かつ、
bが、前記の式(V-1)で示される基の場合があげられる。

また例えば、

sが式(Va-1)で示される基であってaがベンゼン環であり、かつ、

5 f—gが、

—CH=CH—CH=CH—CO—で示される基、

—CB_r=CHCO—で示される基、

—CH₂—CH₂—CO—で示される基、

—CH=CH—CH₂—で示される基、

10 —CH₂—CH=CH—で示される基、

—CH₂—CH₂—CH₂—で示される基、

—CO—CH=CH—で示される基、

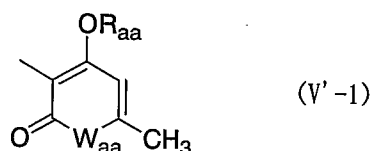
—NH₂—N=CH—で示される基、

—CH₂—NH—CO—で示される基、

15 —CH₂—CO—NH—で示される基、又は、

—NH—CO—NH—で示される基であり、かつ、

bが、式(V'-1)



[式中、R_{aa}は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、W_{aa}は、酸素原子又は—NT_{aa}—基(T_{aa}は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。)を表す。]

で示される基である場合があげられる。

更に例えば、

sが式(Va-1)で示される基であってaがベンゼン環であり、かつ、

f—gが、

25 —CH=CH—CH=CH—CO—で示される基、

—CBr=CHCO—で示される基、

—CH₂—CH₂—CO—で示される基、

—CH=CH—CH₂—で示される基、

—CH₂—CH=CH—で示される基、

5 —CH₂—CH₂—CH₂—で示される基、

—CO—CH=CH—で示される基、

—NH₂—N=CH—で示される基、

—CH₂—NH—CO—で示される基、

—CH₂—CO—NH—で示される基、又は、

10 —NH—CO—NH—で示される基であり、かつ、

bが、前記の式(V'-1)で示される基であって、R_{aa}が、水素原子又はメチル基であり、W_{aa}が、酸素原子又は—NT_{aa}—基(T_{aa}は、前記と同一の意味を表す。)であって、かつT_{aa}が水素原子又はメチル基である場合があげられる。

15

また化合物(V)として、

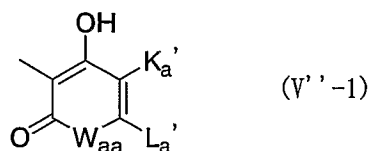
具体的には、

sが式(Va-1)で示される基であってaがベンゼン環であり、かつ、

f-gが、—CH₂—CH₂—CO—で示される基、又は、—NH—CO—N

20 H—で示される基であり、かつ、

bが、式(V''-1)



[式中、W_{aa}は、前記と同一の意味を表し、K_a'は、水素原子を表し、L_a'は、C1-C10アルキル基を表し、K_a'とL_a'とは、C4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

25 で示される基である場合があげられる。

また具体的には、

s が式 (V a -1) で示される基であって a がベンゼン環であり、かつ、
f - g が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

- 5 b が、前記の式 (V' -1) で示される基であって、 $\text{W}_{a a}$ が $-\text{NT}_{a a}-$ 基（式中、 $\text{T}_{a a}$ は、前記と同一の意味を表す。）であって、かつ K_a' が水素原子であって L_a' が C1-C10 アルキル基である場合があげられる。

更に具体的には、

s が式 (V a -1) で示される基であって a がベンゼン環であり、かつ、

- 10 f - g が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

b が、前記の式 (V' -1) で示される基であって、 $\text{W}_{a a}$ が $-\text{NT}_{a a}-$ 基（式中、 $\text{T}_{a a}$ は、前記と同一の意味を表す。）であって、かつ K_a' と L_a' とが C4-C10 アルケニレン基をなす場合があげられる。

- 15 一層具体的には、

s が式 (V a -1) で示される基であって a がベンゼン環であり、かつ、

f - g が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

- 20 b が、前記の式 (V' -1) で示される基であって、 $\text{W}_{a a}$ が $-\text{NT}_{a a}-$ 基（式中、 $\text{T}_{a a}$ は、前記と同一の意味を表す。）であって、かつ $\text{T}_{a a}$ が水素原子又はメチル基であって、かつ K_a' が水素原子であって L_a' がメチル基である場合があげられる。

より一層具体的には、

s が式 (V a -1) で示される基であって a がベンゼン環であり、かつ、

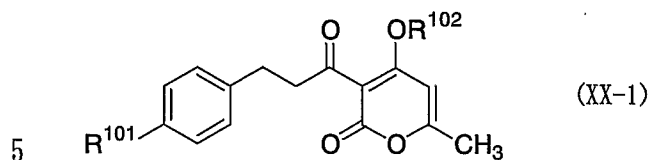
- 25 f - g が、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CO}-$ で示される基、又は、 $-\text{NH}-\text{CO}-\text{NH}-$ で示される基であり、かつ、

b が、前記の式 (V' -1) で示される基であって、 $\text{W}_{a a}$ が $-\text{NT}_{a a}-$ 基（式中、 $\text{T}_{a a}$ は、前記と同一の意味を表す。）であって、かつ K_a' と L_a' と

が 1, 3-ブタジエニレン基をなす場合があげられる。

本発明化合物の態様として、例えば、

式 (XX-1)

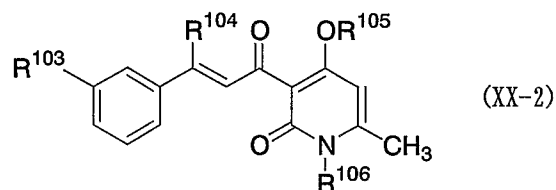


(式中、 R^{101} は、水素原子、C1-C6アルキル基又はC1-C6アルコキシ基を表し、 R^{102} は、水素原子又はC1-C6アルキル基を表す。)

で示される化合物をあげることができる。

また、例えば、

10 式 (XX-2)

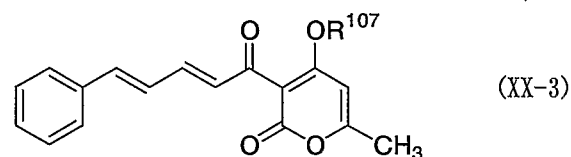


(式中、 R^{103} は、C1-C6アルコキシカルボニルC1-C6アルコキシ基又はカルボキシC1-C6アルコキシ基を表し、 R^{104} は、水素原子又はハロゲン原子を表し、 R^{105} は、水素原子又はC1-C6アルキル基を表し、 R^{106} は、水素原子又はC1-C6アルキル基を表す。)

で示される化合物をあげることができる。

また、例えば、

式 (XX-3)

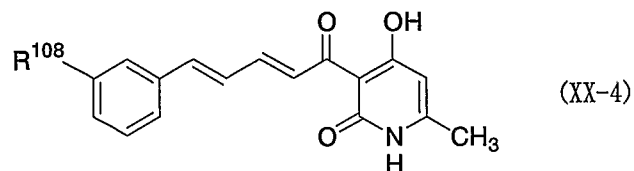


20 (式中、 R^{107} は、水素原子又はC1-C6アルキル基を表す。)

で示される化合物をあげることができる。

また、例えば、

式 (XX-4)

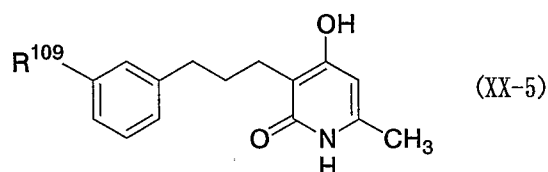


(式中、R¹⁰⁸は、C1-C6アルコキシカルボニルC1-C6アルコキシ基又はカルボキシC1-C6アルコキシ基を表す。)

5 で示される化合物をあげることができる。

また、例えば、

式 (XX-5)

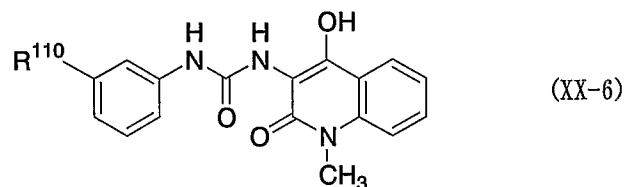


(式中、R¹⁰⁹は、C1-C6アルコキシカルボニルC1-C6アルコキシ基又はカルボキシC1-C6アルコキシ基を表す。)

10 で示される化合物をあげることができる。

また、例えば、

式 (XX-6)



15 (式中、R¹¹⁰は、ハロゲン原子又はC1-C6アルキル基を表す。)

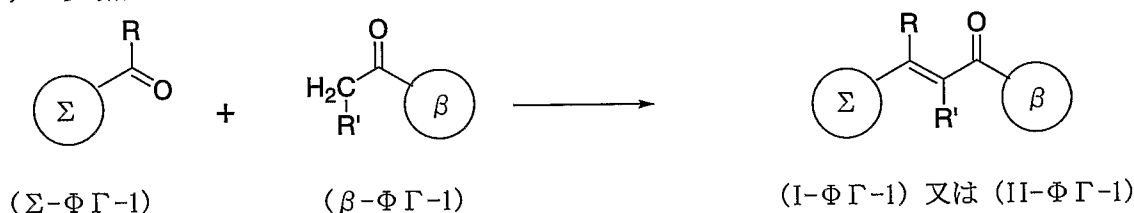
で示される化合物をあげることができる。

W003/070277号公報、W003/062204号公報、JP08041027号公報及びJP05221995号公報にある種の概念的な骨格を有する化合物が開示されているが、当該文献

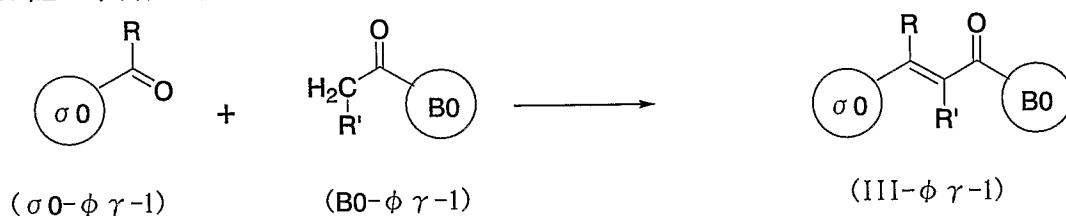
20 には組織内における細胞外マトリックス遺伝子の転写抑制の効果、ひいては細胞外マトリックス蓄積量抑制の効果についての記載は無い。

以下、化合物 (I) ~ (V) の製造方法を説明するが、幾何異性が可能な化合物の場合はその全ての幾何異性体を意味し、互変異性が可能な化合物の場合はその全ての互変異性体を意味する。

- 5 化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が式 ($\Phi\Gamma-1$) で示される基であって、 R が水素原子又は C1-C10 アルキル基である化合物 ($I-\Phi\Gamma-1$) 又は ($II-\Phi\Gamma-1$) (式中、 Σ 、 β 、 R 及び R' は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\Sigma-\Phi\Gamma-1$) (式中、 Σ 及び R は、前記と同一の意味を表す。) と、化合物 ($\beta-\Phi\Gamma-1$) (式中、 β 及び R' は、前記と同一の意味を表す。) とを、反応させることにより製造することができる (Indian J. Chem. (1974), 2, 46 参照)。

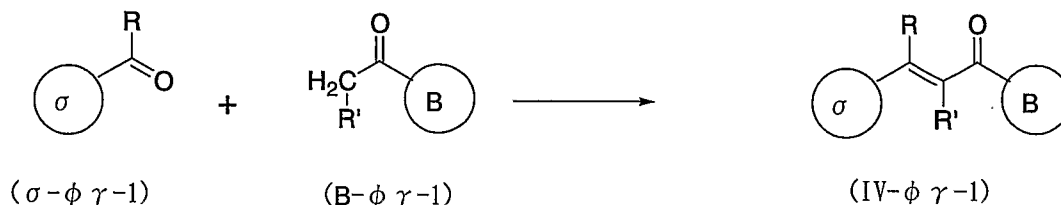


- 15 化合物 (III) で、 $\phi\sigma-\gamma\theta$ が式 ($\phi\gamma\theta-1$) で示される基であって、 R が水素原子又は C1-C10 アルキル基である化合物 ($III-\phi\gamma-1$) (式中、 $\sigma\theta$ 、 $B\theta$ 、 R 及び R' は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma\theta-\phi\gamma-1$) (式中、 $\sigma\theta$ 及び R は、前記と同一の意味を表す。) と、化合物 ($B\theta-\phi\gamma-1$) (式中、 $B\theta$ 及び R' は、前記と同一の意味を表す。) とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。

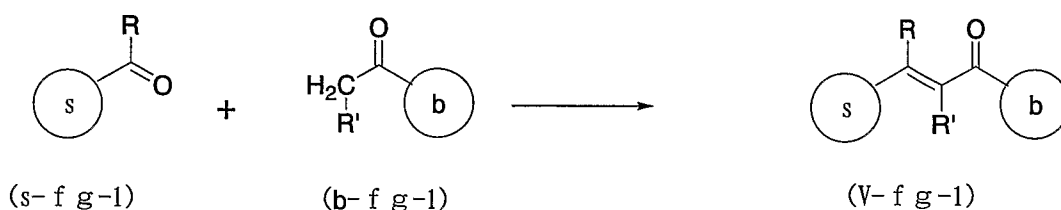


- 20 化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が、式 ($\phi\gamma-1$) で示される基であって、 R が水素原子又は C1-C10 アルキル基である化合物 ($IV-\phi\gamma-1$) (式中、 σ 、 B 、 R 及び R' は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma-\phi\gamma-1$) (式中、 σ 及び R は、前記と同一の意味を表す。) と、化合物 ($B-\phi\gamma-1$)

(式中、B 及び R' は、前記と同一の意味を表す。) とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。



化合物 (V) で、f - g が、式 (f g-1) で示される基であって、R が水素原子又は C1-C10 アルキル基である化合物 (V-f g-1) (式中、s、b、R 及び R' は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 (s-f g-1) (式中、s 及び R は、前記と同一の意味を表す。) と、化合物 (b-f g-1) (式中、b 及び R' は、前記と同一の意味を表す。) とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。



化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi - \Gamma$ が式 ($\Phi \Gamma$ -1) で示される基であって、R がハロゲン原子である化合物は、例えば、上記の化合物 (I- $\Phi \Gamma$ -1) 又は (II- $\Phi \Gamma$ -1) で R が水素原子である化合物に、臭素原子をを反応させることにより製造することができる (J. Serb. Chem. Soc., (1998), 63, 841 参照)。

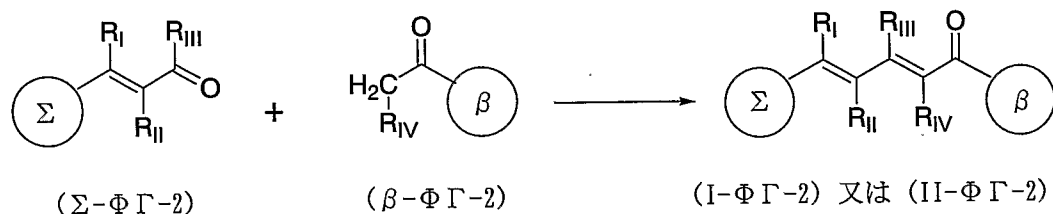
化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0$ -1) で示される基であって、R がハロゲン原子である化合物は、例えば、上記の化合物 (III- $\phi \gamma$ -1) で R が水素原子である化合物から、上記と同様にして、製造することができる。

化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が、式 ($\phi \gamma$ -1) で示される基であって、R がハロゲン原子である化合物は、例えば、上記の化合物 (IV- $\phi \gamma$ -1) で R が水素原子である化合物から、上記と同様にして、製造することができる。

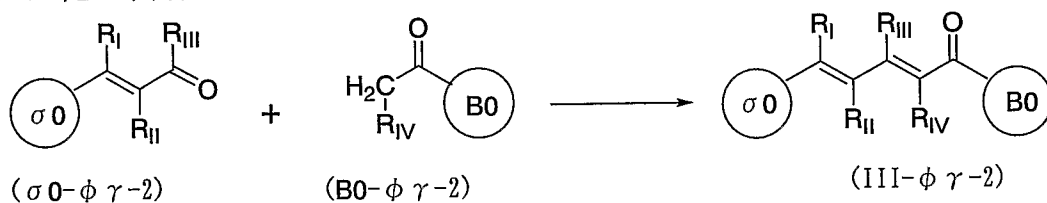
化合物 (V) で、f - g が、式 (f g-1) で示される基であって、R がハロゲン原子である化合物は、例えば、上記の化合物 (V-f g-1) で R が水素原子

である化合物から、上記と同様にして、製造することができる。

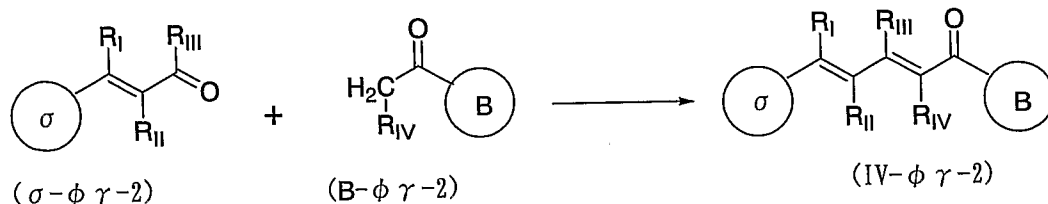
化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-2$) で示される基である化合物 (I- $\Phi\Gamma-2$) 又は (II- $\Phi\Gamma-2$) (式中、 Σ 、 β 、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 、 $R_{I\ I\ I}$ 及び $R_{I\ V}$ は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、式 ($\Sigma-\Phi\Gamma-2$) (式中、 Σ 、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物と、式 ($\beta-\Phi\Gamma-2$) (式中、 β 及び $R_{I\ V}$ は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを反応させることにより製造することができる (Chemical & Pharmaceutical Bulletin, (1980), 28, 3007参照)。



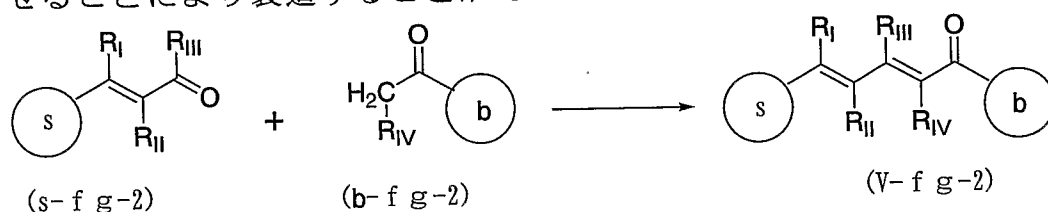
10 化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0 - 2$) で示される基である化合物
(III- $\phi \gamma - 2$) (式中、 $\sigma 0$ 、 $B 0$ 、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 、 $R_{I\ I\ I}$ 及び $R_{I\ v}$ は、
前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma 0 - \phi \gamma - 2$) (式中、 σ
0、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。) と、化合物 (
15 $B 0 - \phi \gamma - 2$) (式中、 $B 0$ 及び $R_{I\ v}$ は、前記と同一の意味を表す。) とを
、上記と同様に反応させることにより製造することができる。



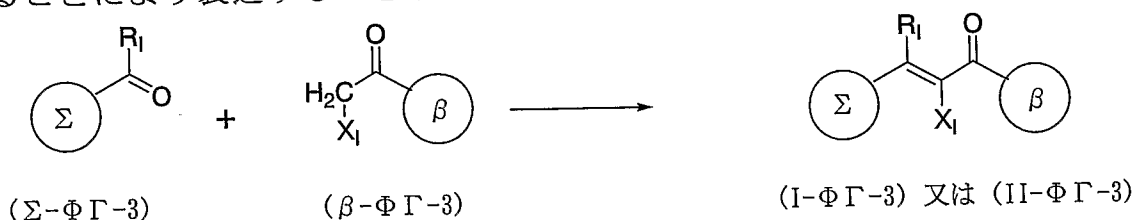
化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が、式 ($\phi-\gamma-2$) で示される基である化合物 ($I V-\phi-\gamma-2$) (式中、 σ 、 B 、 R_I 、 $R_{I I}$ 、 $R_{I I I}$ 及び $R_{I V}$ は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma-\phi-\gamma-2$) (式中、 σ 、 R_I 、 $R_{I I}$ 及び $R_{I I I}$ は、前記と同一の意味を表す。) と、化合物 ($B-\phi-\gamma-2$) (式中、 B 及び $R_{I V}$ は、前記と同一の意味を表す。) とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。



化合物 (V) で、f - g が、式 (f g-2) で示される基である化合物 (V- f g-2) (式中、s、b、R_I、R_{II}、R_{III} 及び R_{IV} は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 (s- f g-2) (式中、s、R_I、R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。) と、化合物 (b- f g-2) (式中、b 及び R_{IV} は、前記と同一の意味を表す。) とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。

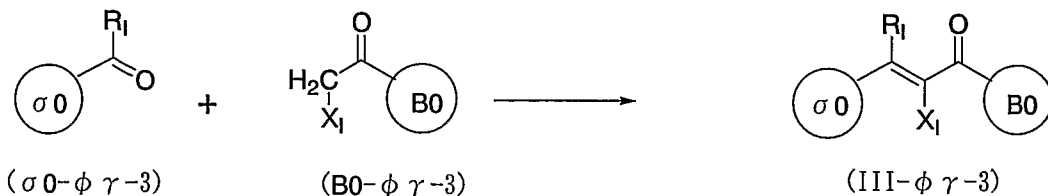


化合物 (I) 又は (II) で、Φ - Γ が、式 (Φ Γ-3) で示される基である化合物 (I-Φ Γ-3) 又は (II-Φ Γ-3) (式中、Σ、β、R_I 及び X_I は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、式 (Σ-Φ Γ-3) (式中、Σ 及び R_I は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物と、式 (β-Φ Γ-3) (式中、β 及び X_I は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを反応させることにより製造することができる (Chemical Papers, (1999), 53, 53 参照)。

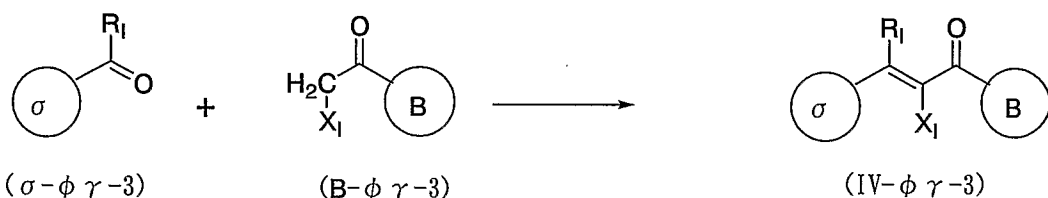


化合物 (III) で、φ 0 - γ 0 が式 (φ γ 0-3) で示される基である化合物 (III-φ γ-3) (式中、σ 0、B 0、R_I 及び X_I は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 (σ 0-φ γ-3) (式中、σ 0 及び R_I は、前記と同一の意味を表す。) と、化合物 (B 0-φ γ-3) (式中、B 0 及び X_I は、前記と同一の意味を表す。) とを、上記と同様に反応させることにより製造す

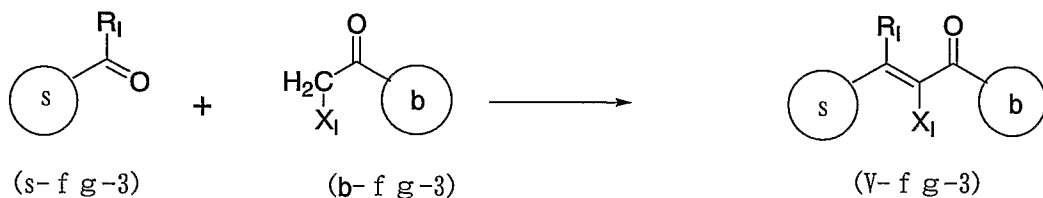
ることができる。



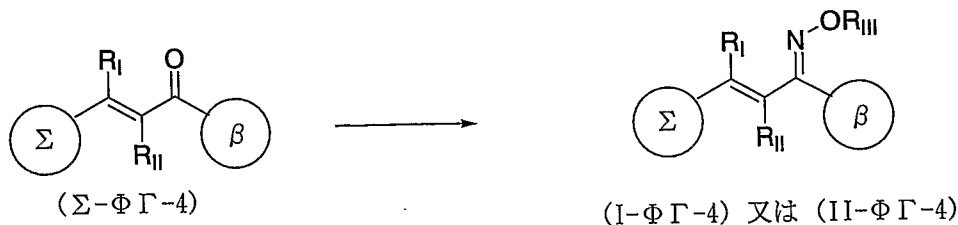
化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi \gamma-3$) で示される基である化合物 (IV- $\phi \gamma-3$) (式中、 σ 、 B 、 R_I 及び X_I は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma-\phi \gamma-3$) (式中、 σ 及び R_I は、前記と同一の意味を表す。)
 5 と、化合物 ($B-\phi \gamma-3$) (式中、 B 及び X_I は、前記と同一の意味を表す。) とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。



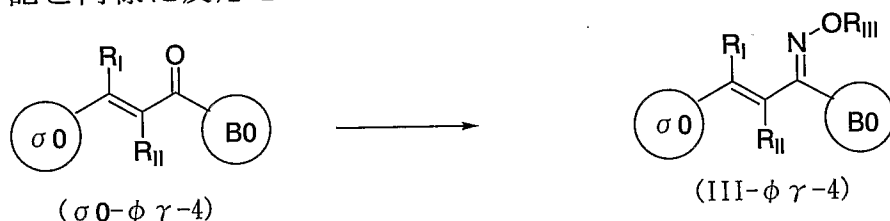
化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-3$) で示される基である化合物 (V- $f g-3$) (式中、 s 、 b 、 R_I 及び X_I は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($s-f g-3$) (式中、 s 及び R_I は、前記と同一の意味を表す。)
 10 と、化合物 ($b-f g-3$) (式中、 b 及び X_I は、前記と同一の意味を表す。) とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。



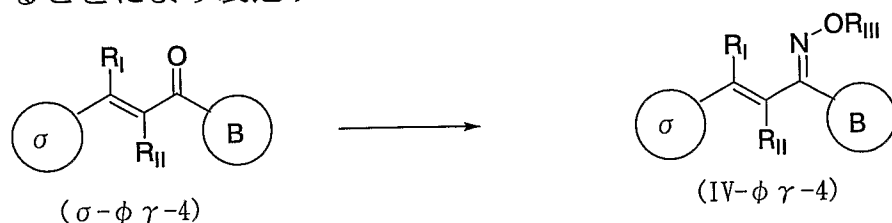
化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi \Gamma-4$) で示される基である化合物 (I- $\Phi \Gamma-4$) 又は (II- $\Phi \Gamma-4$) (式中、 Σ 、 β 、 R_I 、 $R_{I I}$ 及び $R_{I I I}$ は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、式 ($\Sigma-\Phi \Gamma-4$) (式中、 Σ 、 R_I 及び $R_{I I}$ は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物と、 $R_{I I I}-O-NH_2$ (式中、 $R_{I I I}$ は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを反応させることにより製造することができる (Indian J. heterocyclic Chem., (1999), 9, 13 参照)。



化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0 - 4$) で示される基である化合物 (III- $\phi \gamma - 4$) (式中、 $\sigma 0$ 、 $B 0$ 、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma 0 - \phi \gamma - 4$) (式中、 $\sigma 0$ 、 $B 0$ 、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) と、 $R_{III} - O - NH_2$ (式中、 R_{III} は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。

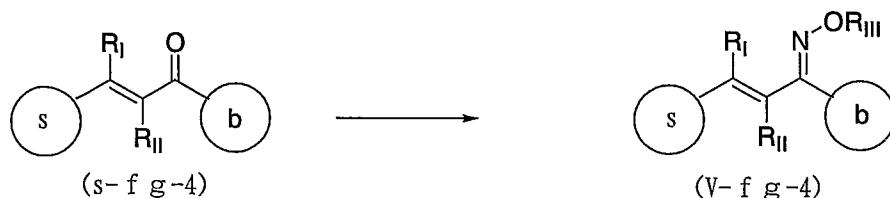


化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma - 4$) で示される基である化合物 (IV- $\phi \gamma - 4$) (式中、 σ 、 B 、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma - \phi \gamma - 4$) (式中、 σ 、 B 、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) と、 $R_{III} - O - NH_2$ (式中、 R_{III} は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを、上記と同様に反応させることにより製造することができる。



化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g - 4$) で示される基である化合物 (V- $f g - 4$) (式中、 s 、 b 、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($s - f g - 4$) (式中、 s 、 b 、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) と、 $R_{III} - O - NH_2$ (式中、 R_{III} は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを、上記と同様に反応させ

ることにより製造することができる。



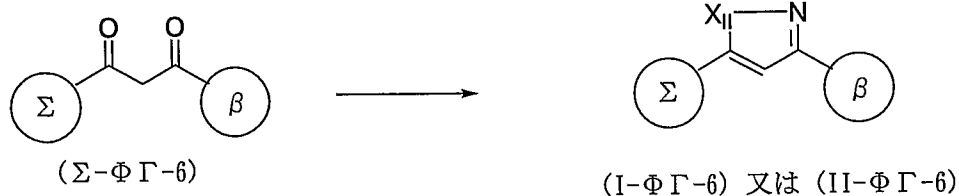
化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が式 ($\Phi\Gamma-5$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 ($\Sigma-\Phi\Gamma-4$) で R_I 及び R_{II} が水素原子である化合物と、 $H-X_{II}'-NH_2$ [式中、 X_{II}' は、オキシ基又は $-NR_I$ 一基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。)] を表す。] で示される化合物とを反応させることにより製造することができる (Chemical Papers, (1999), 3, 53, Indian J. Chem., (2003), 42B, 2091, J. Heterocyclic Chem., (2005), 2, 231 参照)。

10 化合物 (III) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-5$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 ($\sigma-\phi\gamma-4$) で R_I 及び R_{II} が水素原子である化合物から、上記と同様にして、製造することができる。

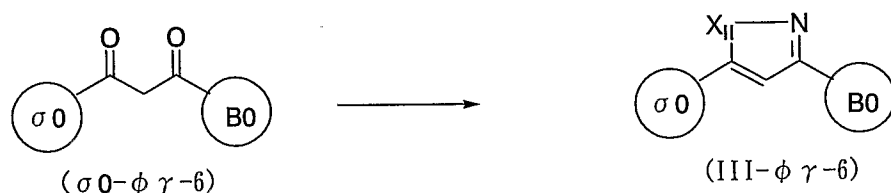
化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-5$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 ($\sigma-\phi\gamma-4$) で R_I 及び R_{II} が水素原子である化合物から、上記と同様にして、製造することができる。

15 化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-5$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 ($s-f g-4$) で R_I 及び R_{II} が水素原子である化合物から、上記と同様にして、製造することができる。

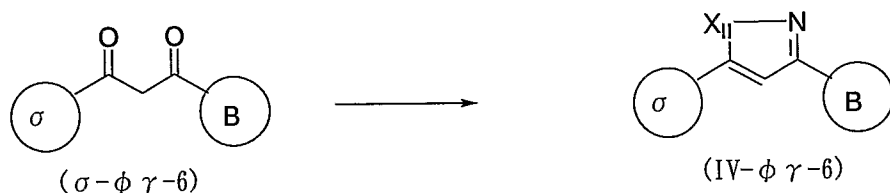
20 化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-6$) で示される基である化合物 (I- $\Phi\Gamma-6$) 又は (II- $\Phi\Gamma-6$) (式中、 Σ 、 β 及び X_{II} は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\Sigma-\Phi\Gamma-6$) と、 $H-X_{II}'-NH_2$ [式中、 X_{II}' は、オキシ基又は $-NR_I$ 一基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。)] を表す。] で示される化合物とを反応させることにより製造する
25 ことができる (Indian J. Heterocyclic Chem., (2001), 10, 241 参照)。



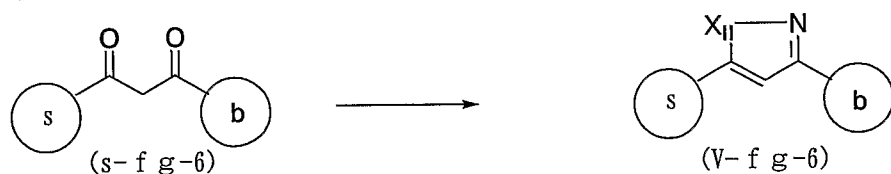
化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0-6$) で示される基である化合物 (III- $\phi \gamma-6$) (式中、 $\sigma 0$ 、 $B 0$ 及び X_{II} は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma 0 - \phi \gamma-6$) (式中、 $\sigma 0$ 及び $B 0$ は、前記と同一の意味を表す。) から、上記と同様にして製造することができる。



5 化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma-6$) で示される基である化合物 (IV- $\phi \gamma-6$) (式中、 σ 、 B 及び X_{II} は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($\sigma - \phi \gamma-6$) (式中、 σ 及び B は、前記と同一の意味を表す。) から、上記と同様にして製造することができる。



10 化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g-6$) で示される基である化合物 (V- $f g-6$) (式中、 s 、 b 及び X_{II} は、前記と同一の意味を表す。) は、例えば、化合物 ($s - f g-6$) (式中、 s 及び b は、前記と同一の意味を表す。) から、上記と同様にして製造することができる。



15 化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi - \Gamma$ が、式 ($\Phi \Gamma-7$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0-7$) で示される基である化合物

物、化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma - 7$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g - 7$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 ($\Sigma - \Phi \Gamma - 4$)、上記の化合物 ($\sigma 0 - \phi \gamma - 4$)、上記の化合物 ($\sigma - \phi \gamma - 4$)、又は、上記の化合物 ($s - f g - 4$) で、 R_I 及び $R_{I I}$ が水素原子である化合物と、 $H - X_{I I I} - CH_2 - CH_2 - NH_2$ [式中、 $X_{I I I}$ は、オキシ基、チオ基、又は $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。)] で示される化合物とを反応させることにより製造することができる (Chemical Papers, (1999), 53, 53 参照)。

10 化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi - \Gamma$ が、式 ($\Phi \Gamma - 8$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0 - 8$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma - 8$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g - 8$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 ($\Sigma - \Phi \Gamma - 6$)、上記の化合物 ($\sigma 0 - \phi \gamma - 6$)、上記の化合物 ($\sigma - \phi \gamma - 6$)、又は、上記の ($s - f g - 6$) で、 R_I 及び $R_{I I}$ が水素原子である化合物と、 $H - X_{I V} - CH_2 - CH_2 - NH_2$ [式中、 $X_{I V}$ は、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。)] で示される化合物とを反応させることにより製造することができる (J. Chemical Society [Section] C, (1969), 7, 1081 参照)。

20 化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi - \Gamma$ が、式 ($\Phi \Gamma - 9$) で示される基である化合物 (I- $\Phi \Gamma - 9$) 又は (II- $\Phi \Gamma - 9$)、化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0 - 9$) で示される基である化合物 (III- $\phi \gamma - 9$)、化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma - 9$) で示される基である化合物 (IV- $\phi \gamma - 9$)、及び、化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g - 9$) で示される基である化合物 ($s - f g - 9$) は、例えば、上記の化合物 ($\Sigma - \Phi \Gamma - 4$)、上記の化合物 ($\sigma 0 - \phi \gamma - 4$)、上記の化合物 ($\sigma - \phi \gamma - 4$)、又は、上記の化合物 ($s - f g - 4$) を、トリフルオロ酢酸中、過塩素酸リチウムの存在下、トリエチルシランと反応させることで製造

でき、また、文献Swiss343410号公報及びW099/16767号公報等を参照して製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-10$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0-\gamma 0$ が式 ($\phi\gamma 0-10$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-10$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-10$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 (I- $\Phi\Gamma-9$) 又は (II- $\Phi\Gamma-9$)、上記の化合物 (III- $\phi\gamma-9$)、上記の化合物 (IV- $\phi\gamma-9$)、又は、上記の化合物 (V- $f g-9$) と、 $R_{III}-O-NH_2$ (式中、 R_{III} は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを反応させることにより製造することができる (Indian J. Heterocyclic Chem., (1999), 9, 13 参照)。

化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-11$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0-\gamma 0$ が式 ($\phi\gamma 0-11$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-11$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-11$) で示される基である化合物は、例えば、文献 J. Organic Chem., (1988), 53, 5325 等を参照して製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-12$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0-\gamma 0$ が式 ($\phi\gamma 0-12$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-12$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-12$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 ($\Sigma-\Phi\Gamma-4$)、上記の化合物 ($\sigma 0-\phi\gamma-4$)、上記の化合物 ($\sigma-\phi\gamma-4$)、又は、上記の化合物 ($s-f g-4$) を、テトラヒドロフラン中、水素化ほう素ナトリウムと反応させることで製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-13$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0-\gamma 0$ が式 ($\phi\gamma 0-13$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-13$) で示される基である化合物、
5 及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-13$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 ($\Sigma-\Phi\Gamma-4$)、上記の化合物 ($\sigma 0-\phi\gamma-4$)、上記の化合物 ($\sigma-\phi\gamma-4$)、又は、上記の化合物 ($s-f g-4$) を、トリフルオロ酢酸中、過塩素酸リチウムの存在下、トリエチルシランと反応させることで製造できる。

10 また、化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-13$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0-\gamma 0$ が式 ($\phi\gamma 0-13$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-13$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-13$) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 (I- $\Phi\Gamma-9$) 又は (II- $\Phi\Gamma-9$)、上記の化合物 (III- $\phi\gamma-9$)、上記の化合物 (IV- $\phi\gamma-9$)、又は、上記の化合物 (V- $f g-9$) を、トリフルオロ酢酸中、過塩素酸リチウムの存在下、トリエチルシランと反応させることで製造できる。

20 化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-14$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0-\gamma 0$ が式 ($\phi\gamma 0-14$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-14$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-14$) で示される基である化合物は、例えば、文献W003/070277号公報及び特開平8-41027等を参照して製造することができる。

25

化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-15$) で示される基である化合物 (I- $\Phi\Gamma-15$) 又は (II- $\Phi\Gamma-15$)、化合物 (III) で、 $\phi 0-\gamma 0$ が式 ($\phi\gamma 0-15$) で示される基である化合物 (III- $\phi\gamma-15$)、化合物 (IV) で、 ϕ

— γ が式(φ γ -15)で示される基である化合物(IV-φ γ -15)、及び、化合物(V)で、f—gが、式(f g-15)で示される基である化合物(V-f g-15)は、例えば、文献Chemical Papers, (1999), 53, 53等を参照して製造することができる。

5

化合物(I)又は(II)で、Φ—Γが、式(Φ Γ-16)で示される基である化合物、化合物(III)で、φ 0— γ 0が式(φ γ 0-16)で示される基である化合物、化合物(IV)で、φ— γ が式(φ γ -16)で示される基である化合物、及び、化合物(V)で、f—gが、式(f g-16)で示される基である化合物は、
 10 上記の化合物(I-Φ Γ-15)又は(II-Φ Γ-15)、上記の化合物(III-φ γ -15)、上記の化合物(IV-φ γ -15)、又は、上記の化合物(V-f g-15)と、
 $R_{I \ I \ I} - O - NH_2$ (式中、 $R_{I \ I \ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

15 化合物(I)又は(II)で、Φ—Γが、式(Φ Γ-17)で示される基である化合物、化合物(III)で、φ 0— γ 0が式(φ γ 0-17)で示される基である化合物、化合物(IV)で、φ— γ が式(φ γ -17)で示される基である化合物、及び、化合物(V)で、f—gが、式(f g-17)で示される基である化合物は、
 20 上記の化合物(I-Φ Γ-15)又は(II-Φ Γ-15)、上記の化合物(III-φ γ -15)、上記の化合物(IV-φ γ -15)、又は、上記の化合物(V-f g-15)と、
 $H - X_{I \ I \ I}' - NH_2$ [式中、 $X_{I \ I \ I}'$ は、オキシ基又は—NR_I—基(R_I は、前記と同一の意味を表す。)を表す。]で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

25 化合物(I)又は(II)で、Φ—Γが、式(Φ Γ-18)で示される基である化合物、化合物(III)で、φ 0— γ 0が式(φ γ 0-18)で示される基である化合物、化合物(IV)で、φ— γ が式(φ γ -18)で示される基である化合物、及び、化合物(V)で、f—gが、式(f g-18)で示される基である化合物は

、例えば、上記の化合物 (Σ - Φ Γ -6)、上記の化合物 (σ 0- ϕ γ -6)、上記の化合物 (σ - ϕ γ -6)、又は、上記の (s - f g -6) で、 R_I 及び $R_{I\ I}$ が水素原子である化合物と、 $H-X_{I\ I\ I}'-NH_2$ [式中、 $X_{I\ I\ I}'$ は、オキシ基又は $-NR_I$ -基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。] で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 Φ - Γ が、式 (Φ Γ -19) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 ϕ 0- γ 0 が式 (ϕ γ 0-19) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 ϕ - γ が式 (ϕ γ -19) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 f - g が、式 (f g -19) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 (I- Φ Γ -15) 又は (II- Φ Γ -15)、上記の化合物 (III- ϕ γ -15)、上記の化合物 (IV- ϕ γ -15)、又は、上記の化合物 (V- f g -15) と $H-X_{I\ I\ I\ I}'-CH_2-CH_2-NH_2$ [式中、 $X_{I\ I\ I\ I}'$ は、オキシ基、チオ基、又は $-NR_I$ -基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。] で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 Φ - Γ が、式 (Φ Γ -20) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 ϕ 0- γ 0 が式 (ϕ γ 0-20) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 ϕ - γ が式 (ϕ γ -20) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 f - g が、式 (f g -20) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 (Σ - Φ Γ -6)、上記の化合物 (σ 0- ϕ γ -6)、上記の化合物 (σ - ϕ γ -6)、又は、上記の (s - f g -6) で、 R_I 及び $R_{I\ I}$ が水素原子である化合物と、 $H-X_{I\ V}'-CH_2-CH_2-NH_2$ [式中、 $X_{I\ V}'$ は、 $-NR_I$ -基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。] で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 Φ - Γ が、式 (Φ Γ -21) で示される基である化合物 (I- Φ Γ -21) 又は (II- Φ Γ -21)、化合物 (III) で、 ϕ 0- γ 0 が式 (

化合物 (III- ϕ γ -21)、化合物 (IV) で、 ϕ γ が式 (ϕ γ -21) で示される基である化合物 (IV- ϕ γ -21)、及び、化合物 (V) で、 f g が、式 (f g -21) で示される基である化合物 (V- f g -21) は、例えば、文献 J. Indian Chem. Soc., (1972), 49, 6, Chem. Ber., (1970), 03, 50, azzetta Chimica Italiana, (1989), 119, 367 及び J. Chemical Research (S), 1986) 374 等を参照して製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 Φ Γ が、式 (Φ Γ -22) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 ϕ 0 γ 0 が式 (ϕ γ 0 -22) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 ϕ γ が式 (ϕ γ -22) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 f g が、式 (f g -22) で示される基である化合物は、例えば、上記の化合物 (I- Φ Γ -21) 又は (II- Φ Γ -21)、上記の化合物 (III- ϕ γ -21)、上記の化合物 (IV- ϕ γ -21)、又は、上記の化合物 (V- f g -21) と、 $R_{111} - O - NH_2$ (式中、 R_{111} は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 Φ Γ が、式 (Φ Γ -23) で示される基である化合物 (I- Φ Γ -23) 又は (II- Φ Γ -23)、化合物 (III) で、 ϕ 0 γ 0 が式 (ϕ γ 0 -23) で示される基である化合物 (III- ϕ γ -23)、化合物 (IV) で、 ϕ γ が式 (ϕ γ -23) で示される基である化合物 (IV- ϕ γ -23)、及び、化合物 (V) で、 f g が、式 (f g -23) で示される基である化合物 (V- f g -23) は、例えば、文献 J. Heterocyclic Chem., (1991), 28, 167 等を参照して製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 Φ Γ が、式 (Φ Γ -24) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 ϕ 0 γ 0 が式 (ϕ γ 0 -24) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 ϕ γ が式 (ϕ γ -24) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 f g が、式 (f g -24) で示される基である化合物は

、上記の化合物 (I-Φ Γ-23) 又は (II-Φ Γ-23)、上記の化合物 (III-φ γ-23)、上記の化合物 (IV-φ γ-23)、又は、上記の化合物 (V-f g-23) と、
 $R_{I \ I \ I} - O - NH_2$ (式中、 $R_{I \ I \ I}$ は、前記と同一の意味を表す。) で示される化合物とを反応させることにより製造することができる。

5

化合物 (I) 又は (II) で、Φ-Γが、式 (Φ Γ-25) で示される基である化合物、化合物 (III) で、φ 0-γ 0が式 (φ γ 0-25) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、φ-γが式 (φ γ-25) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、f-gが、式 (f g-25) で示される基である化合物は
 10 、例えば、文献Egypt. J. Chem., (1984), 27, 11, Egypt. J. Chem., (1976), 19, 811 及びLiebig's Ann. Chem., (1990), 821等を参照して製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、Φ-Γが、式 (Φ Γ-26) で示される基である化合物、化合物 (III) で、φ 0-γ 0が式 (φ γ 0-26) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、φ-γが式 (φ γ-26) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、f-gが、式 (f g-26) で示される基である化合物は
 15 、例えば、文献J. Heterocyclic Chem., (1999), 36, 881, Egypt. J. Chem., (1984), 7, 11及びEgypt. J. Chem., (1976), 19, 811等を参照して製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、Φ-Γが、式 (Φ Γ-27) で示される基である化合物、化合物 (III) で、φ 0-γ 0が式 (φ γ 0-27) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、φ-γが式 (φ γ-27) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、f-gが、式 (f g-27) で示される基である化合物は
 20 、例えば、文献W003/070277号公報、W003/062204号公報及び特開平5-221995
 25 等を参照して製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、Φ-Γが、式 (Φ Γ-28) で示される基である化合物、化合物 (III) で、φ 0-γ 0が式 (φ γ 0-28) で示される基である化合物、

合物、化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma$ -28) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g$ -28) で示される基である化合物は、例えば、文献Org.Prep.Proced.Int., (2003), 35, 509等を参照して製造することができる。

5

化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi - \Gamma$ が、式 ($\Phi \Gamma$ -29) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0$ -29) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma$ -29) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g$ -29) で示される基である化合物は、
10 、例えば、文献Collect.Czech.Chem.Comm., (1988), 53, 3179等の記載の 3-ブ
ロモアセチル-4-ヒドロキシ-1-メチル-キノロン-2-オンと置換フ
ェノール類との反応により、製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi - \Gamma$ が、式 ($\Phi \Gamma$ -30) で示される基である化
15 合物、化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0$ -30) で示される基である化
合物、化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma$ -30) で示される基である化合物、
及び、化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g$ -30) で示される基である化合物は、
例えば、文献Chemical & Pharmaceutical Bulletin, (1979), 27, 242等を参照
して製造することができる。

20

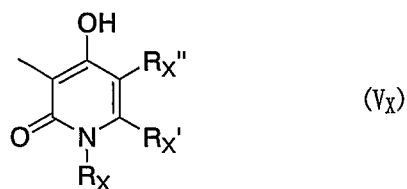
化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi - \Gamma$ が、式 ($\Phi \Gamma$ -31) で示される基である化
合物、化合物 (III) で、 $\phi 0 - \gamma 0$ が式 ($\phi \gamma 0$ -31) で示される基である化
合物、化合物 (IV) で、 $\phi - \gamma$ が式 ($\phi \gamma$ -31) で示される基である化合物、
及び、化合物 (V) で、 $f - g$ が、式 ($f g$ -31) で示される基である化合物は、
25 、例えば、文献薬学雑誌 (1968), 88, 106等の記載の 3-アセチル-
4-ヒドロキシ-6-メチル-1H-2-ピリドンと置換フェニルアセチル
クロリド類との反応により、製造することができる。

化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-32$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi O-\gamma O$ が式 ($\phi\gamma O-32$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-32$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-32$) で示される基である化合物は、例えば、文献薬学雑誌 (1968), 88, 106 等の記載の 3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-1H-2-ピリドンと置換フェニルクロホルメート類、置換フェニルイソシアネート類又は置換N-フェニルカルバモイルクロリド類との反応により、製造することができる。

10 化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-33$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi O-\gamma O$ が式 ($\phi\gamma O-33$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-33$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-33$) で示される基である化合物は、例えば、文献薬学雑誌 (1968), 88, 106 等の記載の 3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-1H-2-ピリドンと置換N-フェニルスルファモイルクロリド類との反応により、製造することができる。

20 化合物 (I) 又は (II) で、 $\Phi-\Gamma$ が、式 ($\Phi\Gamma-34$) で示される基である化合物、化合物 (III) で、 $\phi O-\gamma O$ が式 ($\phi\gamma O-34$) で示される基である化合物、化合物 (IV) で、 $\phi-\gamma$ が式 ($\phi\gamma-34$) で示される基である化合物、及び、化合物 (V) で、 $f-g$ が、式 ($f g-34$) で示される基である化合物は、例えば、文献 Indian J. Heterocyclic Chem., (1993), 3, 69 等を参照して製造することができる。

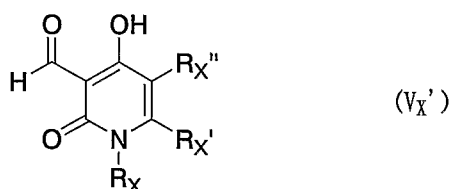
25 また、化合物 (I) 又は (II) における β 、化合物 (III) における $B O$ 、化合物 (IV) における B 、及び、化合物 (V) における b として、式 (V_x)



[式中、R_x は、C1-C10アルキル基を表し、R_x' 及びR_x' ' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、R_x' とR_x' ' とは、C3-C10アルキレン基をなすことがあり、また、R_x' とR_x' ' とは、M_a -基（式中、M_a は、前記と同一の意味を表す。）で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、R_x とR_x' は、C1-C10アルキレン基を介して環をなす。]

で示される基を挙げることができる。

化合物 (I) 又は (II) における β、化合物 (III) における B 0、化合物 (I V) における B、及び、化合物 (V) における b が、前記の式 (V_x) で示される基である化合物は、例えば、置換フェニルヒドラジン類と、式 (V_x')



(式中、R_x、R_x' 及びR_x' ' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される化合物とを、J.Heterocyclic Chem., (1999), 36, 881, Egypt. J.

Chem., (1984), 27, 11 及び Egypt. J. Chem., (1976), 19, 811 等に記載の方法で反応

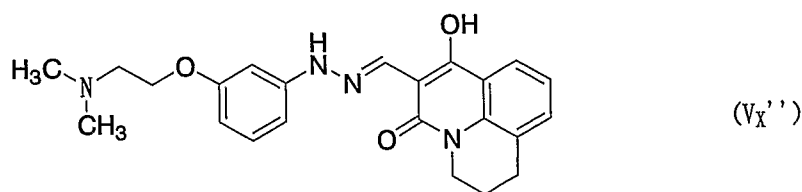
させることにより製造することができる。

化合物 (V_x') は、例えば、J.Heterocyclic Chem., (2000), 37, 1559 に記載された方法で得られる。

化合物 (I) 又は (II) における β、化合物 (III) における B 0、化合物 (I V) における B、及び、化合物 (V) における b が、前記の式 (V_x) で示

される基である化合物として、例えば、式 (V_x' ')

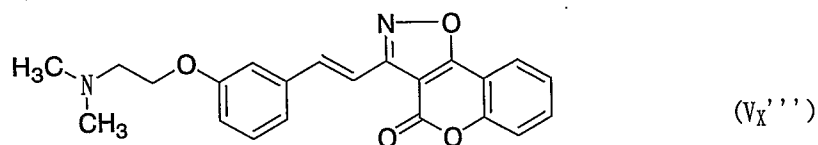
170



で示される化合物をあげられる。

また、上記の化合物 (I-ΦΓ-4) 又は (II-ΦΓ-4)、化合物 (III-φγ-4)、化合物 (IV-φγ-4)、及び、化合物 (V-fg-4) において、R₁₁₁ が
 5、水素原子である場合、Φ-Γ、φ0-γ0、φ-γ、及び、f-g のヒドロキシミノ基の酸素原子は、化合物 (I) 又は (II) における β、化合物 (III) における B0、化合物 (IV) における B、又は、化合物 (V) における b が 4 位に炭素原子を有するとき、当該 4 位炭素原子とエーテル結合してもよい。

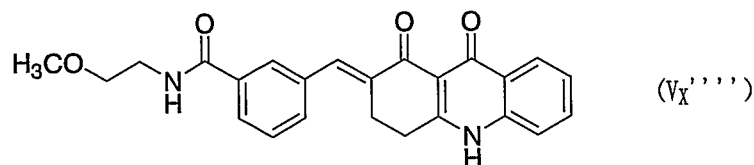
10 かかる化合物として、例えば、式 (V_{x'''})



で示される化合物をあげられ、文献 Indian J. Heterocyclic Chem., (1999), 9, 13 の記載に従って製造することができる。

また、化合物 (I) 又は (II) における β、化合物 (III) における B0、化合物 (IV) における B、及び、化合物 (V) における b が、各々、(I-9)、
 15、(II-9)、(III-9)、(IV-9)、又は、(V-9) で示される基であり、かつ、化合物 (I) 又は (II) における Φ-Γ、(III) における φ0-γ0、化合物 (IV) における φ-γ、及び、化合物 (V) における f-g が、各々、式 (ΦΓ-1)、式 (φγ0-1)、式 (φγ-1)、又は、式 (fg-1) で示される
 20 基である場合、R' と U とは、C1-C10アルキレン基を介して環をなしてもよい

かかる化合物として、例えば、式 (V_x''''')



で示される化合物をあげられ、置換ベンズアルデヒド類と、3,4-ジヒドロ-2H,10H-アクリジン-1,9-ジオンとを反応させる (Russian J.

5 General Chem., (2001), 71, 1257, Indian J. Chem., (1974), 12, 956 及び JP50046666号公報参照) ことにより製造することができる。

3,4-ジヒドロ-2H,10H-アクリジン-1,9-ジオンは、文献 Zeit Chem., (1985), 25, 432等に記載の方法に従って製造することができる。

10 本発明化合物 (V) のうち、化合物番号 (1a) ~ (116a) で表される本発明化合物 (Va) を、表 32 に例示する。

(表 32)

本発明化合物 (Va)

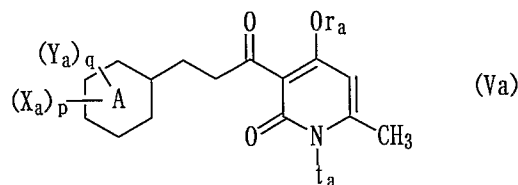


表 32 において、化合物番号 (1a) ~ (98a)、(100a) ~ (104a) 及び (106a) ~ (116a) においては、A はベンゼン環を表す。

表 3 2

化合物番号	X _a 及び Y _a	r _a	t _a
(1 a)	3-CH=CHCN	-H	-H
(2 a)	3-OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	-H
(3 a)	3-OCH ₂ CH=CH ₂	-H	-H
(4 a)	2-OCH ₂ C≡CH	-H	-H
(5 a)	3-OCH ₂ C≡CH	-H	-H
(6 a)	4-OCH ₂ C≡CH	-H	-H
(7 a)	3-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(8 a)	3-OCH ₃ , 4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(9 a)	3-OCH ₂ COOH	-H	-H
(10 a)	3-OCH ₂ CN	-H	-H
(11 a)	3-OCH ₂ CN	-H	-CH ₃
(12 a)	3-OCH ₂ CN	-CH ₃	-CH ₃
(13 a)	4-OCH ₂ CN	-H	-H
(14 a)	3-CH ₃ , 4-OCH ₂ CN	-H	-H
(15 a)	3-NO ₂ , 4-OCH ₂ CN	-H	-H
(16 a)	3-F, 4-OCH ₂ CN, 5-OCH ₃	-H	-H
(17 a)	3-NHCOCH=CH ₂	-H	-H
(18 a)	3-NHCOCH ₂ OCH ₃	-H	-H
(19 a)	3-NHCOCH ₂ OCH ₃	-H	-CH ₃
(20 a)	4-NHCOCH ₂ OCH ₃	-H	-H
(21 a)	3-NHCOOCH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	-H
(22 a)	3-NHCONHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	-H
(23 a)	3-NHSO ₂ CH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(24 a)	3-NHSO ₂ CH ₂ COOH	-H	-H
(25 a)	3-NHCOCH ₂ CN	-H	-H
(26 a)	3-CONHSO ₂ CH ₃	-H	-H
(27 a)	3-CONHCH ₂ CH ₂ OH	-H	-H
(28 a)	3-CONHCH ₂ COOCH ₃	-H	-H

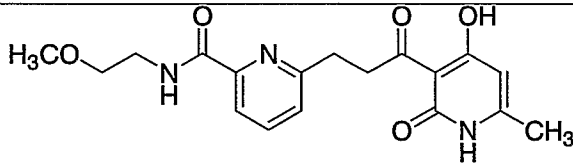
(表 3 2 続き)

(29 a)	$3-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(30 a)	$4-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	-H
(31 a)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	-H
(32 a)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(33 a)	$4-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	-H
(34 a)	$3-\text{CONHCH}_2\text{COOH}$	-H	-H
(35 a)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CN}$	-H	-H
(36 a)	$3-\text{OCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(37 a)	$3-\text{OCH}_2\text{COOH}$	-H	$-\text{CH}_3$
(38 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	-H	$-\text{CH}_3$
(39 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-H	-H
(40 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	-H	$-\text{CH}_3$
(41 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$
(42 a)	$3-\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(43 a)	$3-\text{CH}=\text{CF}_2$	-H	-H
(44 a)	$3-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	-H	-H
(45 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(46 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(47 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(48 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	-H	-H
(49 a)	$3-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	-H	$-\text{CH}_3$
(50 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	-H	$-\text{CH}_3$
(51 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(52 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$	-H	$-\text{CH}_3$
(53 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(54 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NHCOOC}(\text{CH}_3)_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(55 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-H	-H
(56 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-H	$-\text{CH}_3$
(57 a)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-H	$-\text{CH}_3$

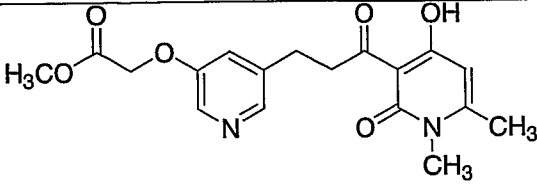
(表 3 2 続き)

(58 a)	3-OCH ₂ CH ₂ SO ₃ H	-H	-CH ₃
(59 a)	3-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₃ Na	-Na	-H
(60 a)	3-OCH ₂ COOCH ₃	-CH ₃	-CH ₃
(61 a)	3-OCH ₂ COO(CH ₂) ₉ -OH	-H	-CH ₃
(62 a)	4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(63 a)	3-OCH ₂ COOH · pyridine	-H	-H
(64 a)	3-OCH ₂ COOH	-CH ₃	-CH ₃
(65 a)	4-OCH ₂ COOH	-H	-H
(66 a)	3-OCH ₂ CONH ₂	-H	-H
(67 a)	3-OCH ₂ CONH ₂	-H	-CH ₃
(68 a)	3-OCH ₂ CONH ₂	-CH ₃	-CH ₃
(69 a)	3-OCH ₂ CON(CH ₃) ₂	-H	-H
(70 a)	3-OCH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₃
(71 a)	3-Br, 4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(72 a)	3-CH ₃ , 4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(73 a)	3-CH ₃ , 4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-CH ₃
(74 a)	3-NHCOCH ₃ , 4-OCH ₂ CN	-H	-H
(75 a)	3-OCH ₂ COCH ₃	-H	-CH ₃
(76 a)	3-CH ₂ SCH ₂ COOCH ₃	-H	-CH ₃
(77 a)	3-CH ₂ SOCH ₂ COOCH ₃	-H	-CH ₃
(78 a)	3-CH ₂ SO ₂ CH ₂ COOCH ₃	-H	-CH ₃
(79 a)	3-NHCOCH ₂ OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃
(80 a)	3-NHCOOCH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃
(81 a)	3-NHSO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	-H	-CH ₃
(82 a)	3-NHCH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-H	-H
(83 a)	3-CONHCH ₂ COOCH ₃	-CH ₃	-CH ₃
(84 a)	4-CONHCH ₂ COOCH ₃	-H	-CH ₃
(85 a)	4-CONHCH ₂ COOCH ₃	-CH ₃	-CH ₃
(86 a)	3-CONHCH ₂ COOH	-H	-CH ₃

(表 3 2 続き)

(87a)	3-CONHCH ₂ COOH	-CH ₃	-CH ₃
(88a)	4-CONHCH ₂ COOH	-H	-H
(89a)	4-CONHCH ₂ COOH	-H	-CH ₃
(90a)	4-CONHCH ₂ COOH	-CH ₃	-CH ₃
(91a)	3-CONHCH ₂ CONH ₂	-H	-H
(92a)	3-CONHCH ₂ CONH ₂	-H	-CH ₃
(93a)	3-CONHCH ₂ CONH ₂	-CH ₃	-CH ₃
(94a)	3-CONHCH(CO ₂ CH ₃) -CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H
(95a)	3-CONHCH(CO ₂ H) -CH ₂ CO ₂ H	-H	-H
(96a)	3-CONHCH ₂ CH ₂ OH	-H	-CH ₃
(97a)	3-CONHCH ₂ CH ₂ OH	-CH ₃	-CH ₃
(98a)	3-CONHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃
化合物番号	(Va)		
(99a)			
化合物番号	X _a 及び Y _a	r _a	t _a
(100a)	3-CONHSO ₂ CH ₃	-H	-CH ₃
(101a)	3-SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	-H
(102a)	3-SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	-CH ₃
(103a)	3-CONHOCH ₃	-H	-CH ₃
(104a)	3-CONHOCH ₂ CH=CH ₂	-H	-CH ₃

(表 3 2 続き)

化合物番号	(Va)		
(105a)			
化合物番号	X _a 及び Y _a	r _a	t _a
(106a)	3 - CH ₂ CH ₂ CN	-H	-CH ₃
(107a)	3-CH= 	-H	-CH ₃
(108a)	3 - CH=CHCN	-H	-CH ₃
(109a)	3 - C≡CC(CH ₃) ₂ OH	-H	-CH ₃
(110a)	3 - CH=CHCOOCH ₃	-H	-CH ₃
(111a)	3 - OCH ₂ CH=CH ₂	-H	-CH ₃
(112a)	3 - NHCOCOOCH ₃	-H	-CH ₃
(113a)	3 - CH=NOCH ₃	-H	-CH ₃
(114a)	3 - NHCSNHCH ₃	-H	-CH ₃
(115a)	3 - N=C(-SCH ₃)NHCH ₃	-H	-CH ₃
(116a)	3 - CH ₂ P(=O)(OCH ₃) ₂	-H	-CH ₃

本発明化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 b) ~ (8 b) で表される本発明化合物 (Vb) を、表 3 3 に例示する。

5 (表 3 3)

本発明化合物 (Vb)

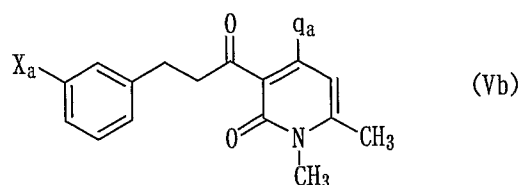


表 3 3

化合物番号	X _a	q _a
(1b)	-OCH ₂ COOCH ₃	-OCH ₂ CH=CH ₂
(2b)	-OCH ₂ COOCH ₃	-OCH ₂ C≡CH
(3b)	-OCH ₂ COOCH ₃	-OCH ₂ COOCH ₃
(4b)	-OCH ₂ COOH	-OCH ₂ COOH
(5b)	-OCH ₂ CONH ₂	-OCH ₂ CONH ₂
(6b)	-OCH ₂ COOCH ₃	-OCH ₂ CN
(7b)	-OCH ₂ COOH	-OCH ₂ CH ₂ OH
(8b)	-OCH ₂ COOCH ₃	-OCH ₂ Ph

本発明化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 c) ~ (4 c) で表される本発明化合物 (Vc) を、表 3 4 に例示する。

5 (表 3 4)

本発明化合物 (Vc)

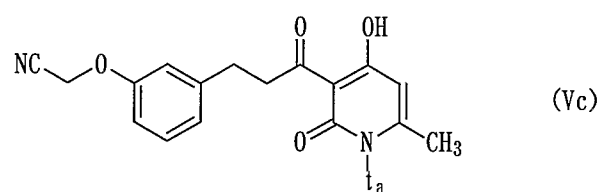


表 3 4

化合物番号	t _a
(1 c)	-CH ₂ CH=CH ₂
(2 c)	-CH ₂ C≡CH
(3 c)	-CH ₂ COOCH ₃
(4 c)	-CH ₂ COOH

本発明化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 d) ~ (9 3 d) で表される本
 10 発明化合物 (Vd) を、表 3 5 に例示する。

(表 3 5)

本発明化合物 (Vd)

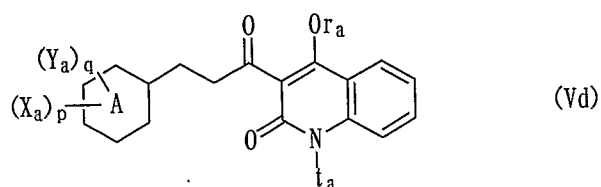


表 3 5 において、A はベンゼン環を表す。

表 3 5

化合物番号	X _a 及び Y _a	r _a	t _a
(1 d)	3-CH=CHCN	-H	-H
(2 d)	3-OCH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	-H
(3 d)	3-OCH ₂ CH=CH ₂	-H	-H
(4 d)	2-OCH ₂ C≡CH	-H	-H
(5 d)	3-OCH ₂ C≡CH	-H	-H
(6 d)	4-OCH ₂ C≡CH	-H	-H
(7 d)	3-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(8 d)	3-OCH ₃ , 4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(9 d)	3-OCH ₂ COOH	-H	-H
(10 d)	3-OCH ₂ CN	-H	-H
(11 d)	3-OCH ₂ CN	-H	-CH ₃
(12 d)	3-OCH ₂ CN	-CH ₃	-CH ₃
(13 d)	4-OCH ₂ CN	-H	-H
(14 d)	3-CH ₃ , 4-OCH ₂ CN	-H	-H
(15 d)	3-NO ₂ , 4-OCH ₂ CN	-H	-H
(16 d)	3-F, 4-OCH ₂ CN, 5-OCH ₃	-H	-H
(17 d)	3-NHCOCH=CH ₂	-H	-H
(18 d)	3-NHCOCH ₂ OCH ₃	-H	-H
(19 d)	3-NHCOCH ₂ OCH ₃	-H	-CH ₃
(20 d)	4-NHCOCH ₂ OCH ₃	-H	-H

(表 3 5 続き)

(21 d)	$3-\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	-H
(22 d)	$3-\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	-H
(23 d)	$3-\text{NHSO}_2\text{CH}_2\text{COOCH}_3$	-H	-H
(24 d)	$3-\text{NHSO}_2\text{CH}_2\text{COOH}$	-H	-H
(25 d)	$3-\text{NHCOCH}_2\text{CN}$	-H	-H
(26 d)	$3-\text{CONHSO}_2\text{CH}_3$	-H	-H
(27 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	-H	-H
(28 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	-H
(29 d)	$4-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	-H
(30 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	-H
(31 d)	$4-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	-H
(32 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{COOH}$	-H	-H
(33 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CN}$	-H	-H
(34 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	-CH ₃
(35 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	-CH ₃
(36 d)	$3-\text{OCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	-CH ₃
(37 d)	$3-\text{OCH}_2\text{COOH}$	-H	-CH ₃
(38 d)	$3-\text{OCH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	-H	-CH ₃
(39 d)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-H	-H
(40 d)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	-H	-CH ₃
(41 d)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	-CH ₃	-CH ₃
(42 d)	$3-\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	-H	-CH ₃
(43 d)	$3-\text{CH}=\text{CF}_2$	-H	-H
(44 d)	$3-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$	-H	-H
(45 d)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	-H	-CH ₃
(46 d)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}_3$	-H	-CH ₃
(47 d)	$3-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_3$	-H	-CH ₃

(表 3 5 続き)

(48 d)	3-OCH ₂ CH ₂ OH	-H	-H
(49 d)	3-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OH	-H	-CH ₃
(50 d)	3-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	-H	-CH ₃
(51 d)	3-OCH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	-CH ₃
(52 d)	3-OCH ₂ CH ₂ NH ₂	-H	-CH ₃
(53 d)	3-OCH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃	-H	-CH ₃
(54 d)	3-OCH ₂ CH ₂ NHCOOC(CH ₃) ₃	-H	-CH ₃
(55 d)	3-OCH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-H	-H
(56 d)	3-OCH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃
(57 d)	3-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃
(58 d)	3-OCH ₂ CH ₂ SO ₃ H	-H	-CH ₃
(59 d)	3-OCH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₃ Na	-Na	-H
(60 d)	3-OCH ₂ COOCH ₃	-CH ₃	-CH ₃
(61 a)	3-OCH ₂ COO(CH ₂) ₉ -OH	-H	-CH ₃
(62 d)	4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(63 a)	3-OCH ₂ COOH · pyridine	-H	-H
(64 d)	3-OCH ₂ COOH	-CH ₃	-CH ₃
(65 d)	4-OCH ₂ COOH	-H	-H
(66 d)	3-OCH ₂ CONH ₂	-H	-H
(67 d)	3-OCH ₂ CONH ₂	-H	-CH ₃
(68 d)	3-OCH ₂ CONH ₂	-CH ₃	-CH ₃
(69 d)	3-OCH ₂ CON(CH ₃) ₂	-H	-H
(70 d)	3-OCH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₃
(71 d)	3-Br, 4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(72 d)	3-CH ₃ , 4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-H
(73 d)	3-CH ₃ , 4-OCH ₂ COOCH ₃	-H	-CH ₃
(74 d)	3-NHCOCH ₃ , 4-OCH ₂ CN	-H	-H

(表 3 5 続き)

(7 5 d)	$3-\text{OCH}_2\text{COCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(7 6 d)	$3-\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(7 7 d)	$3-\text{CH}_2\text{SOCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(7 8 d)	$3-\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_2\text{COOCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(7 9 d)	$3-\text{NHCOCH}_2\text{OCH}_3$	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$
(8 0 d)	$3-\text{NHCOOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$
(8 1 d)	$3-\text{NHSO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	-H	$-\text{CH}_3$
(8 2 d)	$3-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	-H	-H
(8 3 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$
(8 4 d)	$4-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$	-H	$-\text{CH}_3$
(8 5 d)	$4-\text{CONHCH}_2\text{COOCH}_3$	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$
(8 6 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{COOH}$	-H	$-\text{CH}_3$
(8 7 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{COOH}$	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$
(8 8 d)	$4-\text{CONHCH}_2\text{COOH}$	-H	-H
(8 9 d)	$4-\text{CONHCH}_2\text{COOH}$	-H	$-\text{CH}_3$
(9 0 d)	$4-\text{CONHCH}_2\text{COOH}$	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$
(9 1 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CONH}_2$	-H	-H
(9 2 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CONH}_2$	-H	$-\text{CH}_3$
(9 3 d)	$3-\text{CONHCH}_2\text{CONH}_2$	$-\text{CH}_3$	$-\text{CH}_3$

化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 e) ~ (1 7 e) で表される化合物 (Ve) を表 3 6 に例示し、化合物番号 (1 8 e) ~ (2 1 e) で表される化合物

5 (Ve) を、表 3 7 ~ 4 0 に例示する。

(表 3 6 ~ 4 0)

化合物番号 (1 e) ~ (1 7 e) で表される化合物 (Ve)

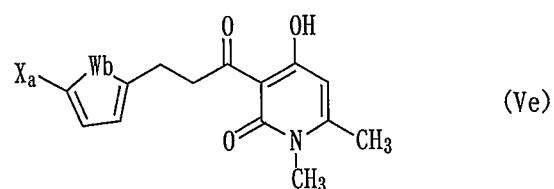


表 3 6

化合物 番号	X _a	W _b
(1 e)	-CONHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	S
(2 e)	-CONHCH ₂ CH ₂ OCH ₃	O
(3 e)	-CONHCH ₂ CH ₂ OH	S
(4 e)	-CONHCH ₂ CH ₂ OH	O
(5 e)	-CONHCH ₂ COOCH ₃	S
(6 e)	-CONHCH ₂ COOCH ₃	O
(7 e)	-CONHCH ₂ COOH	S
(8 e)	-CONHCH ₂ COOH	O
(9 e)	-CONHCH ₂ CONH ₂	S
(10 e)	-CONHCH ₂ CONH ₂	O
(11 e)	-CONHCH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	S
(12 e)	-CONHCH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	O
(13 e)	-CON(CH ₃)CH ₂ CH ₂ OCH ₃	S
(14 e)	-CON(CH ₃)CH ₂ CH ₂ OCH ₃	O
(15 e)	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OH	S
(16 e)	-CH ₂ SCH ₂ COOCH ₃	S
(17 e)	-N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	S

表 3 7

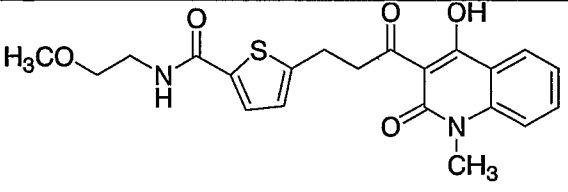
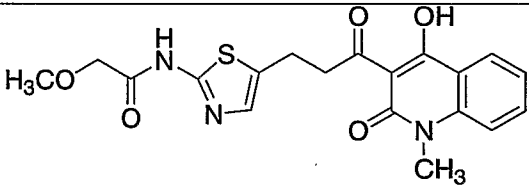
化合物 (Ve) 化合物番号 (18e)	
----------------------------	---

表 3 8

化合物 (Ve) 化合物番号 (19e)	
----------------------------	---

5 表 3 9

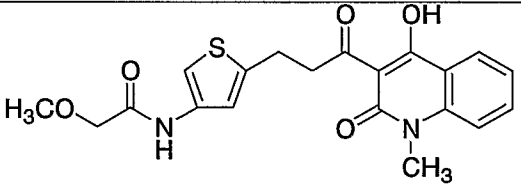
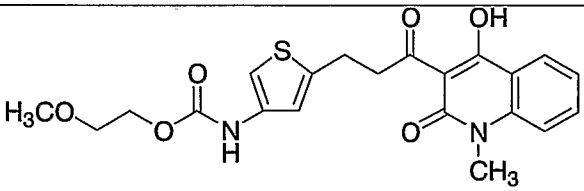
化合物 (Ve) 化合物番号 (20e)	
----------------------------	---

表 4 0

化合物 (Ve) 化合物番号 (21e)	
----------------------------	--

化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 f) ~ (24 f) で表される化合物 (

10 Vf) を、表 4 1 に例示する。

(表 4 1)

化合物 (Vf)

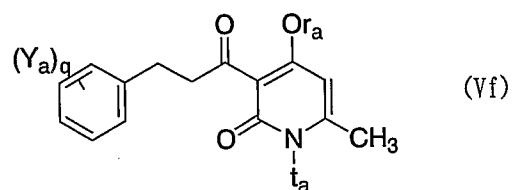


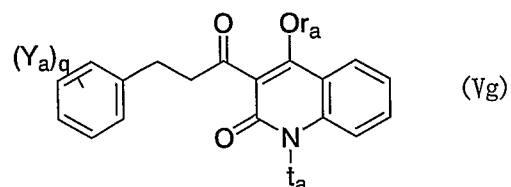
表 4 1

化合物番号	Y _a	r _a	t _a
(1 f)	H	H	H
(2 f)	H	H	CH ₃
(3 f)	H	CH ₃	CH ₃
(4 f)	3 - C 1	H	CH ₃
(5 f)	3 - CH ₃	H	CH ₃
(6 f)	4 - CF ₃	H	H
(7 f)	3 - CH ₂ OCH ₃	H	CH ₃
(8 f)	3 - CH=CHCH ₃	H	CH ₃
(9 f)	3 - C≡CH	H	CH ₃
(10 f)	3 - OC ₂ H ₅	H	CH ₃
(11 f)	4 - SCH ₃	H	CH ₃
(12 f)	4 - S (O) CH ₃	H	CH ₃
(13 f)	4 - S (O) ₂ CH ₃	H	CH ₃
(14 f)	4 - NO ₂	H	CH ₃
(15 f)	3 - CN	H	CH ₃
(16 f)	4 - COOH	H	CH ₃
(17 f)	4 - COOCH ₃	H	CH ₃
(18 f)	4 - N (CH ₃) ₂	H	CH ₃
(19 f)	3 - NHCOCH ₃	H	CH ₃
(20 f)	3 - NHCON (CH ₃) ₂	H	CH ₃
(21 f)	3 - CONH ₂	H	CH ₃
(22 f)	3 - CON (CH ₃) ₂	H	CH ₃
(23 f)	3 - OCHF ₂	H	CH ₃
(24 f)	4 - OCF ₃	H	CH ₃

化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 g) ~ (6 g) で表される化合物 (Vg) を、表 4 2 に例示する。

(表 4 2)

化合物 (Vg)



5 表 4 2

化合物番号	Y_a	r_a	t_a
化合物番号	$(Y_a)_q$	r_a	t_a
(1 g)		H	CH ₃
(2 g)		H	CH ₃
(3 g)		H	H
(4 g)		H	CH ₃
(5 g)		H	H
(6 g)		H	CH ₃

化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 h) ~ (40 h) で表される化合物 (Vh) を、表 4 3 ~ 表 4 5 に例示する。

(表 4 3 ~ 表 4 5)

化合物 (Vh)

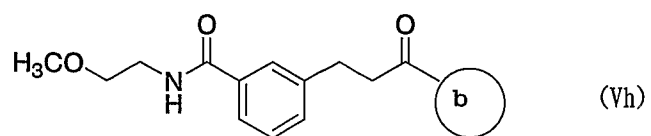


表 4 3

化合物番号		化合物番号	
(1 h)		(1 2 h)	
(2 h)		(1 3 h)	
(3 h)		(1 4 h)	
(4 h)		(1 5 h)	
(5 h)		(1 6 h)	

表 4 4

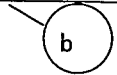
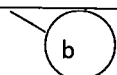
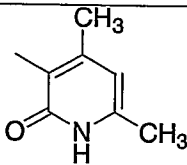
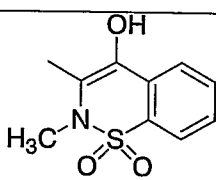
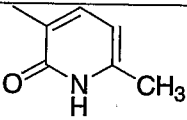
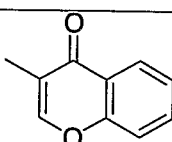
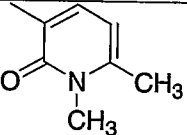
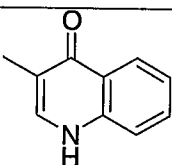
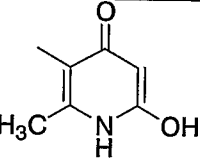
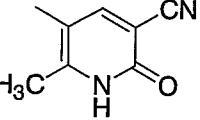
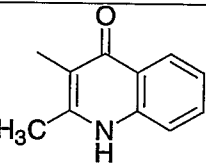
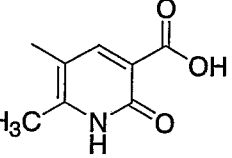
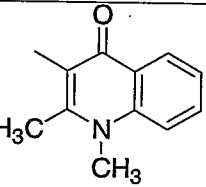
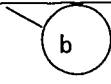
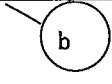
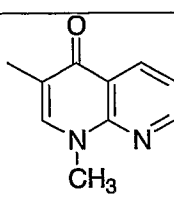
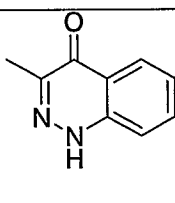
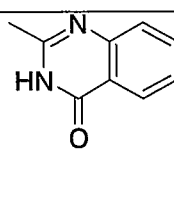
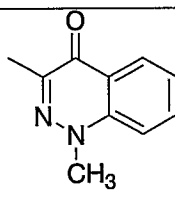
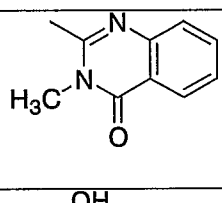
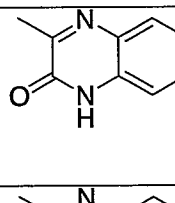
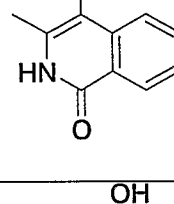
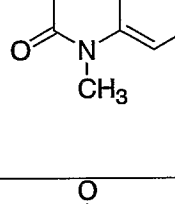
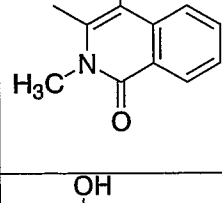
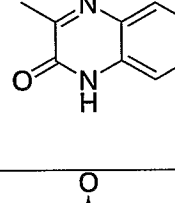
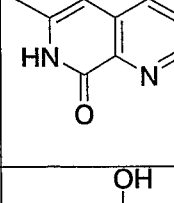
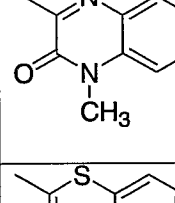
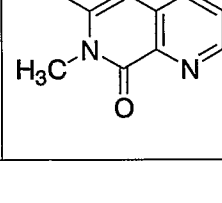
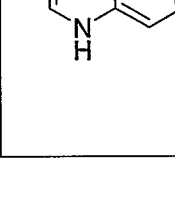
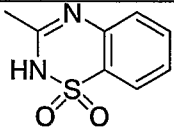
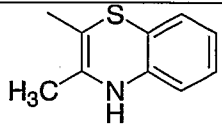
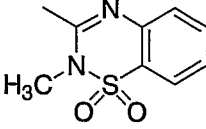
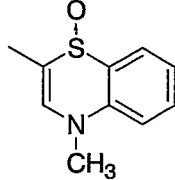
化合物番号		化合物番号	
(6 h)		(17 h)	
(7 h)		(18 h)	
(8 h)		(19 h)	
(9 h)		(20 h)	
(10 h)		(21 h)	
(11 h)		(22 h)	

表 4 5

化合物番号		化合物番号	
(2 3 h)		(3 2 h)	
(2 4 h)		(3 3 h)	
(2 5 h)		(3 4 h)	
(2 6 h)		(3 5 h)	
(2 7 h)		(3 6 h)	
(2 8 h)		(3 7 h)	
(2 9 h)		(3 8 h)	

(表 4 5 続き)

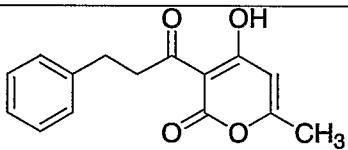
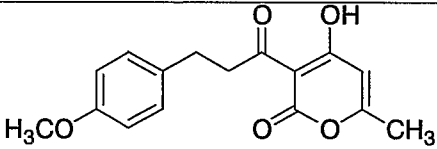
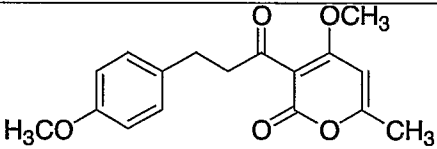
(3 0 h)		(3 9 h)	
(3 1 h)		(4 0 h)	

本発明化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 h') ~ (3 h') で表される本発明化合物 (Vh') を、表 4 6 に例示する。

5 (表 4 6)

本発明化合物 (Vh')

表 4 6

化合物 (Vh') 化合物番号 (1 h')	
化合物 (Vh') 化合物番号 (2 h')	
化合物 (Vh') 化合物番号 (3 h')	

10 本発明化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 i) ~ (6 i) で表される本発明化合物 (Vi) を、表 4 7 に例示する。

(表 4 7)

本発明化合物 (Vi)

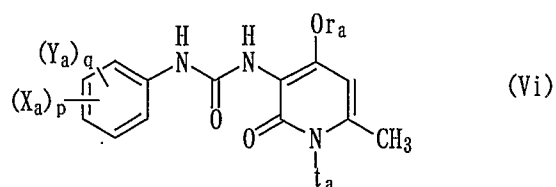


表 4 7

化合物番号	X _a 及び Y _a	r _a	t _a
(1 i)	3 - C l	- H	- C H ₃
(2 i)	3 - C H ₃	- C H ₃	- C H ₃
(3 i)	3 - O C H ₂ C H ₂ O C H ₃	- H	- C H ₃
(4 i)	3 - O C H ₂ C O O C H ₃	- H	- C H ₃
(5 i)	4 - O C H ₂ C ≡ C H	- H	- H
(6 i)	3 - O C H ₂ C H ₂ S C H ₃	- H	- C H ₃

本発明化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 j) ~ (4 j) で表される本発明化合物 (Vj) を、表 4 8 に例示する。

5 (表 4 8)

本発明化合物 (Vj)

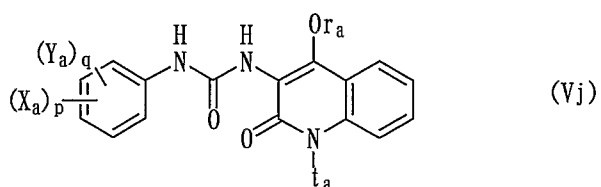


表 4 8

化合物番号	X _a 及び Y _a	r _a	t _a
(1 j)	3 - C l	- H	- C H ₃
(2 j)	3 - C H ₃	- C H ₃	- C H ₃
(3 j)	3 - O C H ₂ C H ₂ O C H ₃	- H	- C H ₃
(4 j)	3 - O C H ₂ C O O C H ₃	- H	- C H ₃

本発明化合物 (V) のうち、化合物番号 (1 k) ~ (4 5 k) で表される本
 10 発明化合物 (Vk) を、表 4 9 ~ 8 6 に例示する。

(表 4 9 ~)

表 4 9

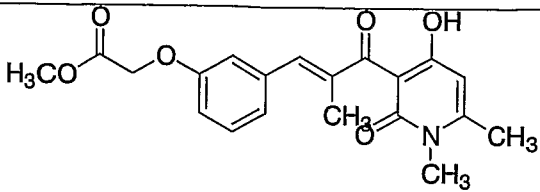
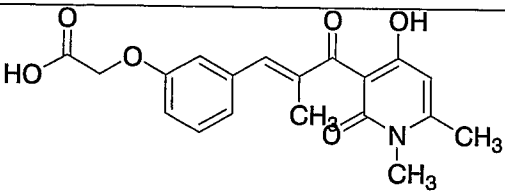
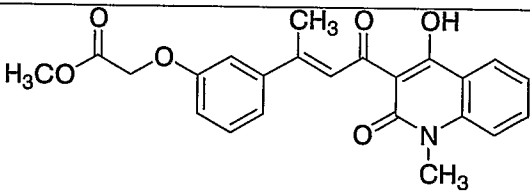
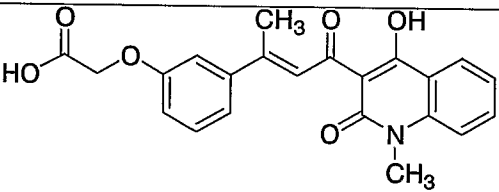
化合物 (Vk) 化合物番号 (1 k)	
化合物 (Vk) 化合物番号 (2 k)	

表 5 0

化合物 (Vk) 化合物番号 (3 k)	
化合物 (Vk) 化合物番号 (4 k)	

5

表 5 1

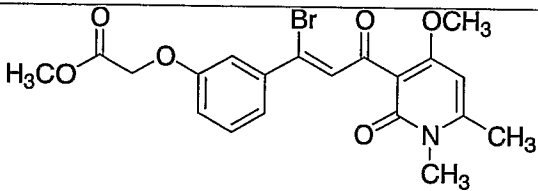
化合物 (Vk) 化合物番号 (5 k)	
----------------------------	---

表 5 2

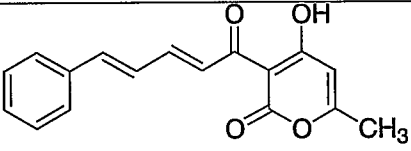
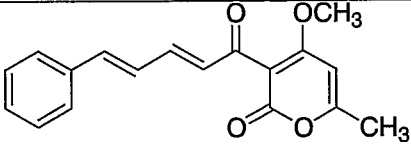
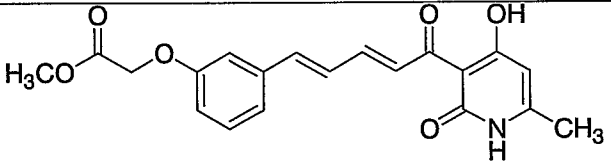
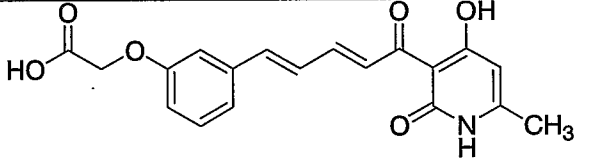
化合物 (Vk) 化合物番号 (6 k)	
化合物 (Vk) 化合物番号 (7 k)	

表 5 3

化合物 (Vk) 化合物番号 (8 k)	
化合物 (Vk) 化合物番号 (9 k)	

5 表 5 4

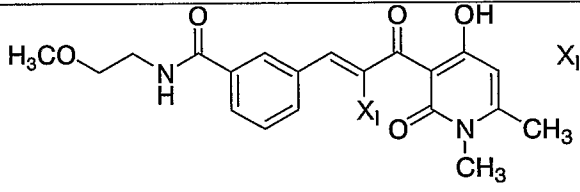
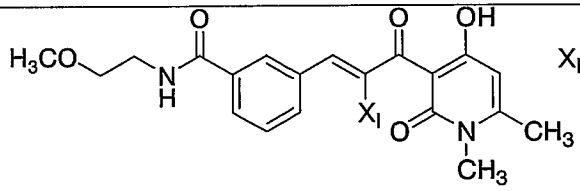
化合物 (Vk) 化合物番号 (10 k)	 $X_1 = -COCH_3$
化合物 (Vk) 化合物番号 (11 k)	 $X_1 = -COOCH_3$

表 5 5

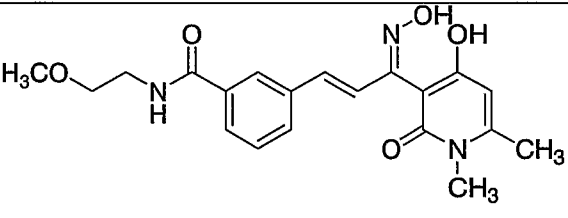
化合物 (Vk) 化合物番号 (1 2 k)	
------------------------------	--

表 5 6

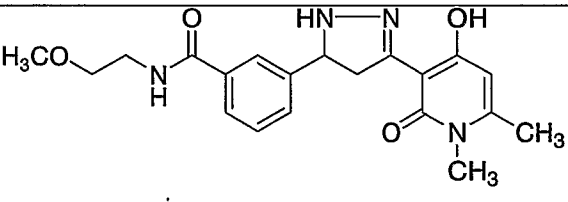
化合物 (Vk) 化合物番号 (1 3 k)	
------------------------------	--

表 5 7

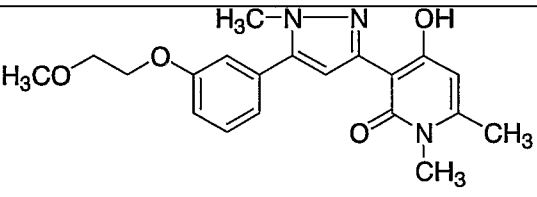
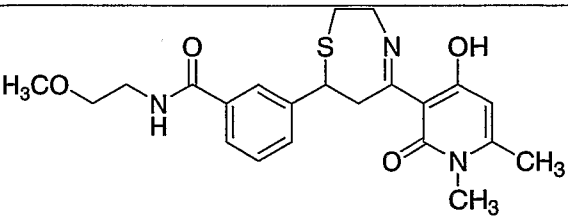
化合物 (Vk) 化合物番号 (1 4 k)	
------------------------------	--

表 5 8

化合物 (Vk) 化合物番号 (1 5 k)	
------------------------------	--

5 表 5 9

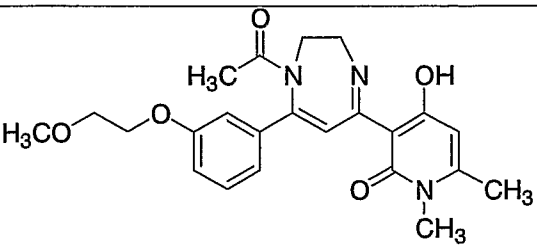
化合物 (Vk) 化合物番号 (1 6 k)	
------------------------------	--

表 6 0

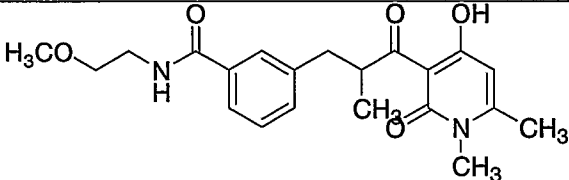
化合物 (Vk) 化合物番号 (17 k)	
-----------------------------	--

表 6 1

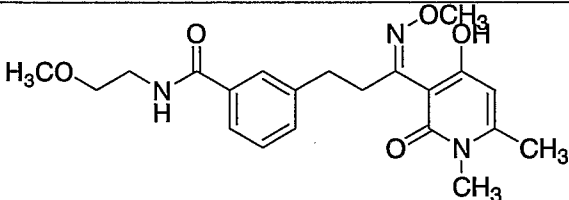
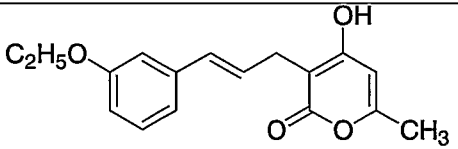
化合物 (Vk) 化合物番号 (18 k)	
-----------------------------	--

表 6 2

化合物 (Vk) 化合物番号 (19 k)	
-----------------------------	---

5 表 6 3

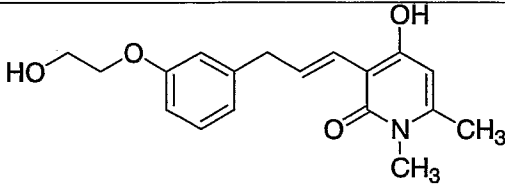
化合物 (Vk) 化合物番号 (20 k)	
-----------------------------	---

表 6 4

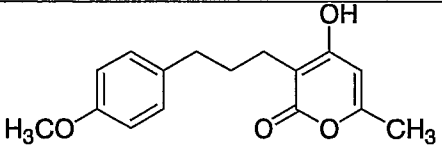
化合物 (Vk) 化合物番号 (2 1 k)	
------------------------------	---

表 6 5

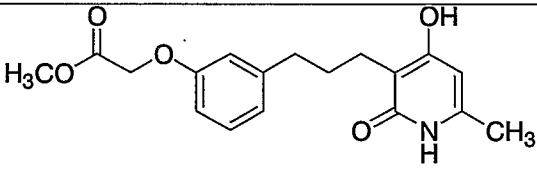
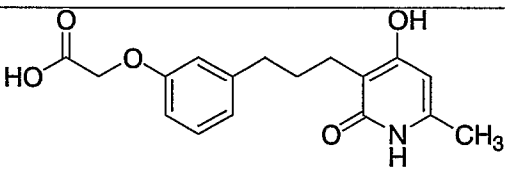
化合物 (Vk) 化合物番号 (2 2 k)	
化合物 (Vk) 化合物番号 (2 3 k)	

表 6 6

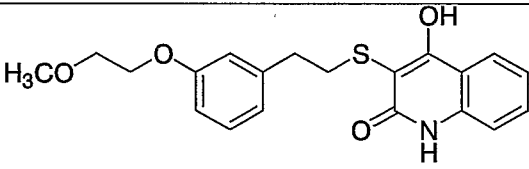
化合物 (Vk) 化合物番号 (2 4 k)	
------------------------------	---

表 6 7

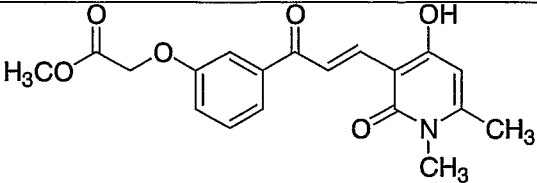
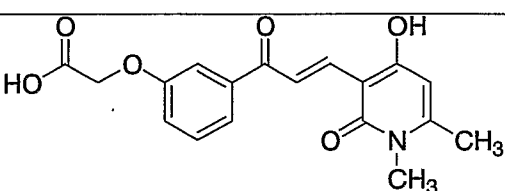
化合物 (Vk) 化合物番号 (2 5 k)	
化合物 (Vk) 化合物番号 (2 6 k)	

表 6 8

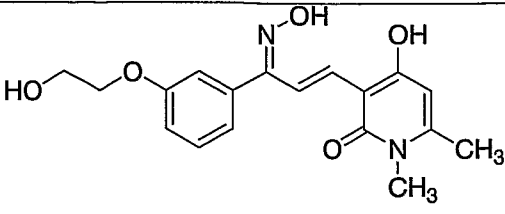
化合物 (Vk) 化合物番号 (27k)	
----------------------------	---

表 6 9

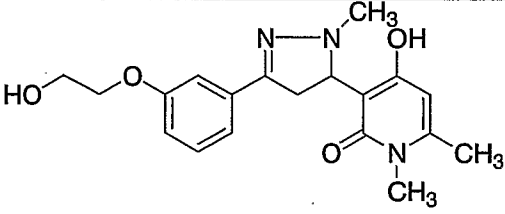
化合物 (Vk) 化合物番号 (28k)	
----------------------------	---

表 7 0

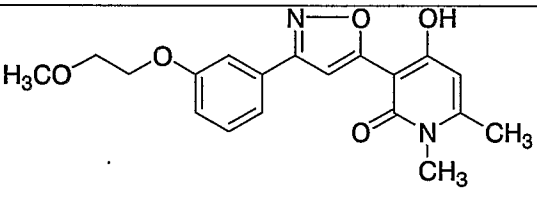
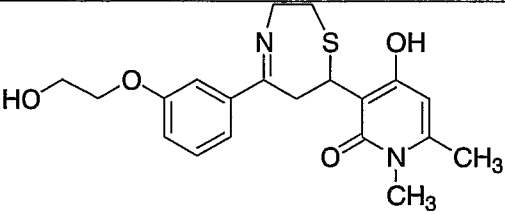
化合物 (Vk) 化合物番号 (29k)	
----------------------------	---

表 7 1

化合物 (Vk) 化合物番号 (30k)	
----------------------------	---

5 表 7 2

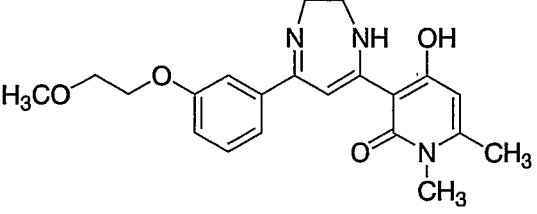
化合物 (Vk) 化合物番号 (31k)	
----------------------------	---

表 7 3

化合物 (Vk) 化合物番号 (3 2 k)	
------------------------------	--

表 7 4

化合物 (Vk) 化合物番号 (3 3 k)	
------------------------------	--

表 7 5

化合物 (Vk) 化合物番号 (3 4 k)	
------------------------------	--

表 7 6

化合物 (Vk) 化合物番号 (3 5 k)	
------------------------------	--

5 表 7 7

化合物 (Vk) 化合物番号 (3 6 k)	
------------------------------	--

表 7 8

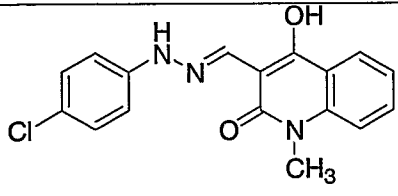
化合物 (Vk) 化合物番号 (37k)	
----------------------------	---

表 7 9

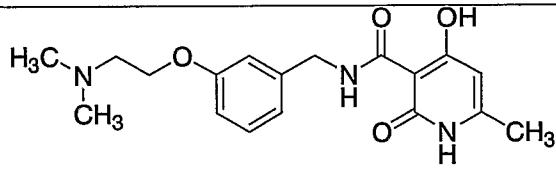
化合物 (Vk) 化合物番号 (38k)	
----------------------------	--

表 8 0

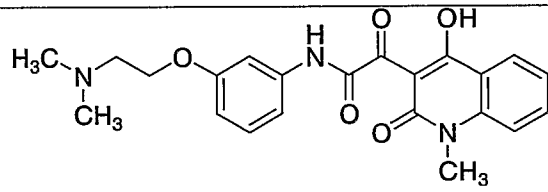
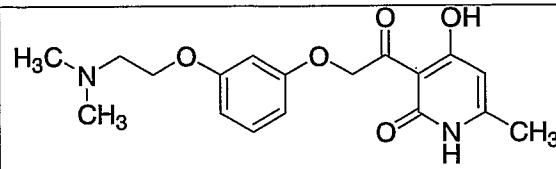
化合物 (Vk) 化合物番号 (39k)	
----------------------------	---

表 8 1

化合物 (Vk) 化合物番号 (40k)	
----------------------------	--

5 表 8 2

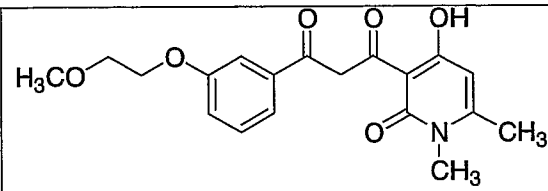
化合物 (Vk) 化合物番号 (41k)	
----------------------------	---

表 8 3

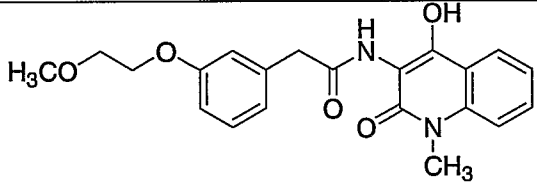
化合物 (Vk) 化合物番号 (4 2 k)	
------------------------------	---

表 8 4

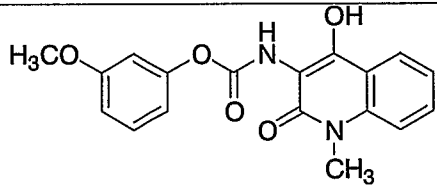
化合物 (Vk) 化合物番号 (4 3 k)	
------------------------------	---

表 8 5

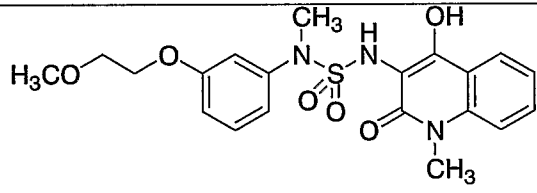
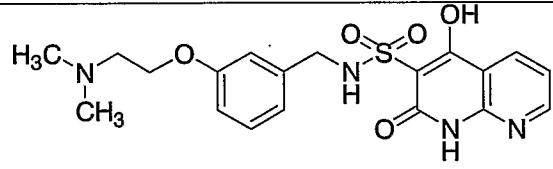
化合物 (Vk) 化合物番号 (4 4 k)	
------------------------------	---

表 8 6

化合物 (Vk) 化合物番号 (4 5 k)	
------------------------------	--

化合物 (I) ~ (V) は、I 型コラーゲン遺伝子、フィブロネクチン遺伝子等の細胞外マトリックス遺伝子の転写を抑制する能力を有する。当該能力は、I 型コラーゲン遺伝子、フィブロネクチン遺伝子等の細胞外マトリックス遺伝子の発現量を減少させて、コラーゲン、フィブロネクチン等の細胞外マトリックス

5 スの蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するために重要である。よって、化合物 (I) ~ (V) は、I 型コラーゲン遺伝子、フィブロネクチン遺伝子等の細胞外マトリックス遺伝子の発現量を減少させてコラーゲン、フィ
10 ブロネクチン等の細胞外マトリックスの蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための組成物 (医薬品、化粧品、食品添加物等) の有効成分として利用することができる。

本発明転写抑制組成物や本発明線維化改善組成物の適用可能な疾患としては、例えば、コラーゲン、フィブロネクチン等の細胞外マトリックスの過度の
15 集積により組織が線維化することにより硬化し、その結果、臓器等の組織の機能低下や瘢痕形成等を来す疾患 (即ち、線維症等) をあげることができる。具体的には例えば、肝硬変、慢性膵炎、スキルス胃癌、間質性肺疾患、喘息、慢性閉塞性肺疾患、糸球体腎炎、ループス腎炎、尿細管間質性腎炎、I g A 腎
20 症、腎硬化症、糖尿病性腎症、遺伝性腎疾患、心筋線維症、心不全、P T C A 後の再狭窄、動脈硬化、骨髓線維症、関節リウマチ、炎症後の過形成痕跡、術後の瘢痕や熱傷性瘢痕、アトピー性皮膚炎、肥厚性瘢痕、子宮筋腫、前立腺肥大症、強皮症、アルツハイマー病、硬化性腹膜炎、糖尿病性網膜症、I 型糖尿病等
25 をあげることができる。因みに、肝硬変においては、1 つの例として、C 型又は B 型肝炎ウイルスが慢性的な炎症を誘発し、T G F - β の量が上昇することにより、肝線維化 (特に、I 型・III 型コラーゲンの蓄積) を引き起こして当該疾患となることがすでに知られている (例えば、Clin. Liver Dis., 7, 195-210 (2003) 参照)。間質性肺疾患においては、1 つの例として、ダニ・ウイルス・結核菌等による肺炎を誘発して T G F - β の量が上昇し、肺線維化を引き起こして当該疾患となると考えられている。糖尿病性腎症や I g A 腎症等の慢性腎不全においては、前者では高血糖によって腎糸球体で T G F - β の量が上昇し、後者では I g A が腎糸球体に蓄積することにより、腎炎を誘発して T G F - β の量が上昇し、腎線維化 (特に、I 型・IV 型コラーゲンの蓄積) を引き起こして当該疾患となることがすでに示唆されている (例えば、

Am. J. Physiol. Renal Physiol., 278, F830-F838 (2000), Kidney Int., 64, 149-159

(2003)参照)。尚、糖尿病性腎症のモデル動物であるd b / d bマウスとは、摂食を抑制するレプチン受容体に変異をもつため、過食により高血糖となり自然発症的に糖尿病を併発するものである。d b / d bマウスは、正常マウスと比較して血中グルコース濃度が約4倍高く、腎糸球体線維化とT G F - β 量との増加が認められている（例えば、Am. J. Pathol., 158, 1653-1663(2001)参照）。

またI g A腎症のモデル動物である抗T h y - 1ラットとは、抗T h y - 1抗体を正常ラットに投与することにより、人工的に腎線維化を引き起こさせたものである。当該モデル動物に対して抗T G F - β 受容体抗体を投与することにより、腎線維化が抑制されることが示されている（例えば、Kidney Int., 60, 1745-1755(2001)参照）。強皮症においては、その原因は不明だが、そのモデル動物であるT s kマウスに対し、T G F - β 阻害剤を投与することにより皮膚線維化の改善が認められている（例えば、J. Invest. Dermatol., 118, 461-470(2001)参照）。以上のことから、T G F - β の作用を抑制する化合物は、T G F - β によるコラーゲン合成促進を阻害して組織の線維化を抑制し、線維症治療効果を得るための組成物（医薬品、化粧品、食品添加物等）の有効成分として利用することができるのである。一方、左室拡張不全等の心不全の病因は、高血圧状態の心臓線維化がその1つとされている。以上のことから、T G F - β によるフィブロネクチン合成促進を阻害して組織の線維化を抑制し、心不全治療効果を得るための組成物（医薬品等）の有効成分として利用することができるのである。

かかる本発明転写抑制組成物や本発明線維化改善組成物は、化合物（I）～（V）と不活性担体とを含有する。これらの組成物中に含有される化合物（I）～（V）は、通常、0.01重量%～99.99重量%であり、不活性担体は、通常、99.99重量%～0.01重量%である。該不活性担体は、薬学的に許容される担体や賦形剤であり、本発明転写抑制組成物や本発明線維化改善組成物はさらに、医薬品添加剤、化粧品添加剤、食品添加剤等を含有してもよい。

また、化合物 (I) ~ (V) は、後述する実施例 2 及び 3 にも示されるように、 $TGF-\beta$ が有する I 型コラーゲン遺伝子の転写促進能力を阻害する。即ち、化合物 (I) ~ (V) は $TGF-\beta$ の作用を抑制する能力を有する $TGF-\beta$ アンタゴニストである。よって、化合物 (I) ~ (V) は、 $TGF-\beta$ 作用抑制組成物の有効成分として利用することもできる。 $TGF-\beta$ は、毛髪の成長サイクルにおける成長期（以下、毛髪成長期と記すこともある。）から退行期（以下、毛髪退行期と記すこともある。）への移行を促進する能力を有することが知られている [J. Invest. Dermatol., 111, 948-954 (1998), FASEB J., 16, 1967-1969 (2002)]。さらに、抗 $TGF-\beta$ 抗体や、 $TGF-\beta$ 阻害剤である Fetuin 等は、 $TGF-\beta$ による毛の伸長抑制作用に対して拮抗的に働き、毛の伸長促進作用を示すことが報告されている [J. Invest. Dermatol., 118, 993-997 (2002)、公開特許公報 特開 2000-342296]。よって、本発明化合物（及びこれを有効成分として含有する $TGF-\beta$ 作用抑制組成物）は、 $TGF-\beta$ による毛髪退行期への移行促進を阻害して毛髪成長期の延長を導くことにより養毛効果を得るために利用してもよい。

かかる本発明 $TGF-\beta$ 抑制組成物や本発明養毛組成物は、化合物 (I) ~ (V) と不活性担体とを含有する。これらの組成物中に含有される化合物 (I) ~ (V) は、通常、0.01 重量% ~ 99.99 重量%であり、不活性担体は、通常、99.99 重量% ~ 0.01 重量%である。当該不活性担体は、薬学的に許容される担体や賦形剤であり、本発明 $TGF-\beta$ 抑制組成物や本発明養毛組成物はさらに、医薬品添加剤、化粧品添加剤、食品添加剤等を含有してもよい。

上記組成物に用いられる薬学的に許容される担体、賦形剤、医薬品添加剤、食品添加剤、化粧品添加剤等は、当該組成物の具体的用途に応じて適宜選択することができる。また、当該組成物の形態も、具体的用途に応じて、例えば、種々の固体、液体等の形態とすることができる。

例えば、化合物 (I) ~ (V) を医薬品の有効成分として用いる場合には、具

体的な形態として、例えば、散剤、細粒剤、顆粒剤、錠剤、シロップ剤、カプセル剤、懸濁化剤、エマルジョン剤、エキス剤及び丸剤等の経口剤、注射剤、外用液剤や軟膏剤等の経皮吸収剤、坐剤及び局所剤等の非経口剤等をあげることができる。

- 5 経口剤は、例えば、ゼラチン、アルギン酸ナトリウム、澱粉、コーンスターチ、白糖、乳糖、ぶどう糖、マンニット、カルボキシメチルセルロース、デキストリン、ポリビニルピロリドン、結晶セルロース、大豆レシチン、ショ糖、脂肪酸エステル、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ポリエチレングリコール、ケイ酸マグネシウム、無水ケイ酸等の担体や賦形剤、結合剤、崩壊剤、界面活性剤、滑沢剤、流動性促進剤、希釈剤、保存剤、着色剤、香料、安定化剤、保湿剤、防腐剤、酸化防止剤等の医薬品添加剤を用いて、通常の方法に従って製造することができる。
- 10

- 投与量は、投与される哺乳動物の年令、性別、体重、疾患の程度、本発明の組成物の種類、投与形態等によって異なるが、通常は経口の場合にはヒト成人
- 15 で1日あたり有効成分量として約1mg～約2g、好ましくは有効成分量として約5mg～約1gを投与すればよい。また、前記の1日の投与量を1回又は数回に分けて投与することができる。

- 非経口剤のうち、注射剤は、生理食塩水、滅菌水リンゲル液等の水溶性溶剤、植物油、脂肪酸エステル等の非水溶性溶剤、ブドウ糖、塩化ナトリウム等の
- 20 等張化剤、溶解補助剤、安定化剤、防腐剤、懸濁化剤、乳化剤等の医薬品添加剤を用いて、通常の方法に従って製造することができる。外用液剤、ゲル状軟膏等の経皮吸収剤、直腸内投与のための坐剤等も通常の方法に従って製造することができる。このような非経口剤を投与するには、注射（皮下、静脈内等）、経皮投与、直腸投与すればよい。局所剤は、例えば、化合物（I）～（V）を
- 25 エチレンビニル酢酸ポリマー等の徐放性ポリマーのペレットに取り込ませて製造することができる。このペレットを治療すべき組織中に外科的に移植すればよい。

投与量は、投与される哺乳動物の年令、性別、体重、疾患の程度、本発明の

組成物の種類、投与形態等によって異なるが、通常は注射の場合にはヒト成人で有効成分量として約0.1mg～約500mgを投与すればよい。また、前記の1日の投与量を1回又は数回に分けて投与することができる。

5 化合物(I)～(V)を化粧品に添加して用いる場合には、当該化合物が添加された化粧品の具体的な形態としては、例えば、液状、乳状、クリーム、ローション、軟膏、ゲル、エアゾール、ムース等をあげることができる。ローションは、例えば、懸濁剤、乳化剤、保存剤等の化粧品添加剤を用いて、通常の方法に従って製造することができる。

10 投与量は、投与される哺乳動物の年令、性別、体重、疾患の程度、本発明の組成物の種類、投与形態等によって異なるが、通常ヒト成人で有効成分量として約0.01mg～約50mgを投与すればよい。また、前記の1日の投与量を1回又は数回に分けて投与することができる。

15 化合物(I)～(V)を食品添加物として用いる場合には、当該添加物が添加された食品の具体的な形態としては、例えば、粉末、錠剤、飲料、摂取可能なゲル若しくはシロップとの混合液状物、例えば、調味料、和菓子、洋菓子、氷菓、飲料、スプレッド、ペースト、漬物、ビン缶詰、畜肉加工品、魚肉・水産加工品、乳・卵加工品、野菜加工品、果実加工品、穀類加工品等の一般的な飲食物や嗜好物等をあげることができる。また、家畜、家禽、蜜蜂、蚕、魚等の飼育動物のための飼料や餌料への添加も可能である。

20 投与量は、投与される哺乳動物の年令、性別、体重、疾患の程度、本発明の組成物の種類、投与形態等によって異なるが、通常ヒト成人で有効成分量として約0.1mg～約500mgを投与すればよい。また、前記の1日の投与量を1回又は数回に分けて投与することができる。

25 実施例

以下に実施例を挙げ、本発明を更に具体的に説明する。

実施例1 実施例1-1～1-21に、本発明化合物の合成を記す。

実施例1-1 式(V_x ' ' ' ')で示される化合物の合成

エタノール 5 m l 及びピペリジン 19 m g の混合物に、3,4-ジヒドロ-2H,10H-アクリジン-1,9-ジオン 120 m g 及び 3-[(2-メトキシエチル)アミノカルボニル]ベンズアルデヒド 117 m g を溶解し、還流下に 10 時間 50 分加熱した。室温に冷却後濃縮し、析出した結晶を濾取して乾燥して、3-(1,9-ジオキソ-3,4,9,10-テトラヒドロ-1H-アクリジン-2-イリデンメチル)-N-(2-メトキシエチル)ベンズアミド [化合物 (V_x ' ' ' ')] の淡黄色結晶 90 m g を得た。

¹H-NMR (270 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm) : 2.95 ~ 3.00 (2H), 3.05 ~ 3.10 (2H), 3.17 (s, 3H), 3.45 ~ 3.55 (4H), 7.39 (t, 1H, J = 7.8 Hz), 7.50 ~ 7.78 (5H), 7.84 (d, 1H, J = 7.8 Hz), 7.95 (s, 1H), 8.14 (d, 1H, J = 7.0 Hz), 8.60 (broad, 1H), 12.01 (broad s, 1H)

15 実施例 1-2 化合物 [化合物番号 (7a)] の合成

4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 100 m g のトリフルオロ酢酸 5 m l 溶液に、過塩素酸カリウム 3 m g 及びトリエチルシラン 185 μ l を加え、室温で 6 時間攪拌した。反応液にクロロホルムと水を加え、有機層を水洗し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。クロロホルム : テトラヒドロフランの 1 : 1 の展開液で、シリカゲル TLC 上、R_f 値が 0.4 の区分を取り、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソプロピル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (7a)] の無色結晶 19 m g を得た。

¹H-NMR (270 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm) : 2.21 (s, 3H), 2.84 (t, 2H, J = 7.8 Hz), 3.56 (t, 2H, J = 8.1 Hz), 3.75 (s, 3H), 4.76 (s, 2H), 5.84 (s, 1H), 6.70 ~ 6.76 (1H), 6.80 ~ 6.90 (2H), 7.

1 9 (t, 1H, J = 7.8 Hz), 11.57 (s, 1H), 15.83 (s, 1H)

実施例 1-3 本発明化合物〔化合物番号 (9a)〕の合成

5 4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソプロピル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 1.00g のメタノール 10ml 溶液に、1 規定水酸化ナトリウム水溶液 10ml を添加した。室温で 30 分攪拌し、反応液を濃縮し、10%塩酸で酸性とし、析出した結晶を濾取し、水、テトラヒドロフラン、t-ブチルメチルエーテルで洗い、乾燥することにより、
10 4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(カルボキシメトキシ)フェニル]-1-オキソプロピル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン〔化合物番号 (9a)〕の白色結晶 894mg を得た。

¹H-NMR (270MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): 2.18 (s, 3H), 2.80~2.90 (2H), 3.30~3.40 (2H), 4.63 (s, 2H),
15 5.84 (s, 1H), 6.72 (d, 1H, J = 7.3 Hz), 6.83 (s, 1H), 6.84 (d, 1H, J = 8.6 Hz), 7.19 (t, 1H, J = 7.6 Hz), 11.56 (s, 1H), 12.94 (s, 1H), 15.58 (s, 1H)

20 実施例 1-4 本発明化合物〔化合物番号 (1h')〕の合成

4-ヒドロキシ-6-メチル-2H-ピラン-2-オン 3.17g、トルエン 150ml、4-ジメチルアミノピリジン 0.37g、3-フェニルプロピオン酸及びN,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド 6.00g の混合物を、70~75℃で 7 時間 50 分加熱した。室温に冷却後、10%塩酸水を加え、酢酸エチルで抽出し、
25 飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、析出した結晶を濾取してヘキサンで洗い、乾燥して、4-ヒドロキシ-3-(3-フェニル-1-オキソプロピル)-6-メチル-2H-ピラン-2-オン〔化合物番号 (1h')〕の淡青色結晶 1.

2.3 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 2.27 (s, 3H), 3.00 (t, 2H, $J=4.0\text{ Hz}$), 3.41 (dt, 2H, $J=3.4\text{ Hz}$), 5.93 (s, 1H), 7.20~7.40 (5H)

5

実施例 1-5 本発明化合物 [化合物番号 (2h')] の合成

3-フェニルプロピオン酸の代わりに、3-(4-メトキシフェニル)プロピオン酸を用いた以外は実施例 1-4 と同様にして、4-ヒドロキシ-3-[3-(4-メトキシフェニル)-1-オキソプロピル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (2h')] の淡青色結晶 5.00 gを得た。

10

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 2.27 (s, 3H), 2.93 (t, 2H, $J=7.4\text{ Hz}$), 3.38 (d, 2H, $J=7.5\text{ Hz}$), 3.78 (s, 3H), 5.94 (s, 1H), 6.83 (dd, 2H, $J=1, 9, 6.6\text{ Hz}$), 7.18 (d, 2H, $J=8.5\text{ Hz}$)

15

実施例 1-6 本発明化合物 [化合物番号 (3h')] の合成

ヘキサメチルホスホラミド 20 ml 及び 4-ヒドロキシ-3-[3-(4-メトキシフェニル)-1-オキソプロピル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン 1.87 g の混合物に、水素化ナトリウム (60% 油性) 0.26 g を 16℃ で加え、30℃ に昇温して 30 分間攪拌した。次いで、ジメチル硫酸 0.98 g を加えて、室温で一夜攪拌した。その後、反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供することにより、4-メトキシ-3-[3-(4-メトキシフェニル)-1-オキソプロピル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (3h')] の黄色油状物 0.37 g を得た。

25

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 2.29 (s, 3H), 2.91 (t, 2H, $J=7.3\text{ Hz}$), 3.13 (dd, 2H, $J=6.4, 9.3\text{ Hz}$), 3.77 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 6.0

7 (s, 1H), 6.80 (dd, 2H, J=1, 9, 7.2 Hz), 7.13 (d, 2H, J=8.6 Hz)

実施例 1-7 本発明化合物 [化合物番号 (1j)] の合成

5 1-メチル-3-アミノ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン塩酸塩 300 mg、5 %水酸化ナトリウム水溶液及びエタノール 2 ml の混合物に、3-クロロフェニルイソシアネート 223 mg を加え、室温で 2 時間攪拌した。10 %塩酸水を加え、析出した固体を水及び酢酸エチルで洗浄し、1-(3-クロロフェニル)-3-(4-ヒドロキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-3-イル)ウレ
10 ア [化合物番号 (1j)] の黄色結晶 165 mg を得た。

¹H-NMR (270 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm) : 3.56 (s, 3H), 6.69 (s, 1H), 6.87~6.91 (m, 3H), 7.10 (t, 1H, J=8.1 Hz), 7.22~7.24 (m, 2H), 7.29 (d, 1H, J=8.1 Hz), 7.41 (dt, 1H, J=2.7, 8.1
15 Hz), 7.65 (s, 1H), 8.11 (dd, 1H, J=2.7, 8.1 Hz), 13.81 (broad s, 1H)

実施例 1-8 本発明化合物 [化合物番号 (5k)] の合成

4-メトキシ-3-[3-[3-(メトキシカルボニルメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン 0.86 g、クロロホルム 1
20 .23 g 及びトリエチルアミン 1.6 ml の混合物に、臭素 0.6 ml を添加することにより、4-メトキシ-3-[3-[3-(メトキシカルボニルメトキシ)フェニル]-1-オキソ--3-ブromo-2-プロペニル]-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (5k)] の黄色結晶 9.8 mg を得た。

25 ¹H-NMR (270 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm) : 2.45 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.39 (s, 1H), 7.05~7.15 (1H), 7.40 (t, 1H, J=7.8 Hz), 7.48~7.52 (1H)

, 7.94 (s, 1H)

実施例 1-9 本発明化合物 [化合物番号 (6k)] の合成

クロロホルム 300 ml に 3-アセチル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2H-ピラン
5 -2-オン 33.6 g、シンナムアルデヒド 26.4 g 及びピペリジン 5 ml を
溶解し、モレキュラーシーブスを充填したソックスレー抽出器で水分を除去し
つつ、還流下に 3 時間加熱した。室温に冷却後、反応液を 10% 塩酸、飽和食
塩水で順次洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮した。析出した
10 結晶を濾取し、これをシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供することによ
り、4-ヒドロキシ-3-(3-フェニル-1-オキソ-2,4-ペンタジエニル)-6-メチル
-2H-ピラン [化合物番号 (6k)] の赤色結晶 26.4 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.27 (s, 3H), 5.94 (s, 1H), 7.05~7.15 (2H), 7.35~7.45 (3H), 7.50~7.55 (2H), 7.70~7.85 (2H)

実施例 1-10 本発明化合物 [化合物番号 (7k)] の合成

4-ヒドロキシ-3-[3-(4-メトキシフェニル)-1-オキソプロピル]-6-メチル
-2H-ピラン-2-オンの代わりに 4-ヒドロキシ-3-(3-フェニル-1-オキソ-2,4-ペ
ンタジエニル)-6-メチル-2H-ピランを用いた以外は実施例 1-6 と同様にし
20 て、4-メトキシ-3-(3-フェニル-1-オキソ-2,4-ペンタジエニル)-6-メチル-2H-
ピラン [化合物番号 (7k)] の淡黄色結晶 3.42 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3) δ (ppm): 2.34 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 6.11 (s, 1H), 6.66 (d, 1H, J
= 15.2 Hz), 6.96~6.98 (2H), 7.30~7.50 (6H)
25)

実施例 1-11 本発明化合物 [化合物番号 (8k)] の合成

ピリジン 10 ml 及びピペリジン 0.12 g の混合物に、3-アセチル-4-ヒ

ドロキシ-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 0.49 g 及び 3-(メトキシカルボニルメトキシ)シンナムアルデヒド 0.96 g を溶解し、還流下に 55 分加熱した。室温に冷却後水を加え、析出した結晶を濾取して水洗し、テトラヒドロフラン 5 ml と加熱して不溶物を濾取して乾燥し、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソ-2,4-ペンタジエニル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (8k)] の黄色結晶 0.22 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.19 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.74 (s, 2H), 5.85 (s, 1H), 6.93 (d, 1H, $J=6.0$ Hz), 7.10~7.50 (5H), 7.65~7.75 (1H), 8.11 (d, 1H, $J=15.0$ Hz)

実施例 1-12 本発明化合物 [化合物番号 (9k)] の合成

4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソプロピル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノンの代わりに 4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソ-2,4-ペンタジエニル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 167 mg を用いた以外は実施例 1-3 と同様にして、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(カルボキシメトキシ)フェニル]-1-オキソ-2,4-ペンタジエニル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (9k)] の褐色結晶 137 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.19 (s, 3H), 4.74 (s, 2H), 5.82 (s, 1H), 6.91 (d, 1H, $J=3$ Hz), 7.15~7.50 (5H), 7.65~7.75 (1H), 8.11 (d, 1H, $J=15$ Hz), 11.57 (s, 1H)

25 実施例 1-13 本発明化合物 [化合物番号 (19k)] の合成

トルエン 300 ml、4-ヒドロキシ-6-メチル-2H-ピラン-2-オン 7.70 g、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデ-7-セン 9.30 g、パラジウム(II)アセチルアセトネート 1.00 g、トリフェニルホスフィン 3.20 g 及び 3-エト

キシシンナミルアセテート 13.5 g の混合物を、75℃で2時間加熱した。室温に冷却後、析出した結晶を濾取し、エタノールで再結晶し、4-ヒドロキシ-3-[3-(3-エトキシフェニル)-2-プロペニル]-6-メチル-2H-ピラン [化合物番号 (19k)] の淡黄色結晶 6.98 g を得た。

- 5 $^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl_3) δ (ppm) : 1.30 (t, 3H, $J=6.9\text{ Hz}$), 2.16 (s, 3H), 3.15 (d, 1H, $J=5.9\text{ Hz}$), 4.00 (q, 2H, $J=7.0\text{ Hz}$), 6.03 (s, 1H), 6.30~6.40 (2H), 6.70~6.80 (1H), 6.88~6.98 (2H), 7.17 (t, 1H, $J=7.8\text{ Hz}$)

10

参考例

3-エトキシシンナミルアセテートの代わりにシンナミルアセテートを用いた以外は実施例 1-13 と同様にして、4-ヒドロキシ-3-(3-フェニル-2-プロペニル)-6-メチル-2H-ピランの淡黄色結晶 60 mg を得た

- 15 $^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm) : 2.16 (s, 3H), 3.15 (d, 2H, $J=6.0\text{ Hz}$), 6.03 (s, 1H), 6.15~6.35 (1H), 6.35 (d, 1H, $J=16.0\text{ Hz}$), 7.15~7.25 (1H), 7.25~7.35 (2H), 7.45~7.85 (2H)

20

実施例 1-14 本発明化合物 [化合物番号 (20k)] の合成

- 4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン 0.71 g のテトラヒドロフラン 20 ml 溶液に、水素化ほう素ナトリウム 0.23 g を添加し、室温で
25 10日間攪拌した。反応液に2N塩酸を加え、反応混合物を氷水に注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(2-ヒドロキシエトキシ)フェニル]-1-プロペニル

] -1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (20k)] の白色結晶 0.23 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.26 (s, 3H), 3.23 (d, 2H, $J=4.6$ Hz), 3.35 (s, 3H), 3.68 (dd, 2H, $J=5.1, 10.0$ Hz), 3.96 (t, 2H, $J=5.1$ Hz), 4.82 (t, 2H, $J=5.4$ Hz), 5.85 (s, 1H), 6.20~6.30 (2H), 6.73 (d, 1H, $J=8.1$ Hz), 6.80~6.90 (2H), 7.16 (t, 1H, $J=7.8$ Hz), 10.07 (s, 1H)

10

実施例 1-15 本発明化合物 [化合物番号 (21k)] の合成

4-ヒドロキシ-3-[3-(4-メトキシフェニル)-1-オキソプロピル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オンのトリフルオロ酢酸 50 ml 溶液に、トリエチルシラン 3.00 g 及び過塩素酸リチウム 69.0 mg を、5℃で添加した。室温で3時間攪拌し、反応液を濃縮して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、4-ヒドロキシ-3-[3-(4-メトキシフェニル)プロピル]-6-メチル-2H-ピラン-2-オン [化合物番号 (21k)] の白色結晶 1.60 g を得た。

15

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, CDCl $_3$) δ (ppm) : 1.50~1.70 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.48 (t, 2H, $J=7.8$ Hz), 2.60 (t, 2H, $J=7.9$ Hz), 3.76 (s, 3H), 6.03 (s, 1H), 6.79 (dd, 2H, $J=1, 9, 6.5$ Hz), 7.09 (d, 2H, $J=8.5$ Hz), 8.53 (broad s, 1H)

20

実施例 1-16 本発明化合物 [化合物番号 (22k)] の合成

4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソ-2-プロペニル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 8.00 g のトリフルオロ酢酸 50 ml 溶液に、トリエチルシラン 14.9 ml 及び過塩素酸リチウム 248 mg を、氷冷下添加した。氷冷下2時間30分攪拌した。反応液に氷水に注加

25

し、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、濃縮して、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]プロピル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (22k)] の黄白色結晶 2.14 g を得た。

- 5 $^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 1.50~1.70 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.40 (t, 2H, $J=7.8$ Hz), 2.50~2.51 (2H), 3.69 (s, 3H), 4.76 (s, 2H), 5.87 (s, 1H), 6.60~6.80 (3H), 7.17 (t, 1H, $J=8.1$ Hz), 10.49 (broad, 1H), 11.51
10 (broad, 1H)

実施例 1-17 本発明化合物 [化合物番号 (23k)] の合成

4-ヒドロキシ-3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]-1-オキソプロピル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノンの代わりに4-ヒドロキシ

- 15 -3-[3-[3-[(メトキシカルボニル)メトキシ]フェニル]プロピル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 1.00 g を用いた以外は実施例 1-3 と同様にして、4-ヒドロキシ-3-[3-[3-(カルボキシメトキシ)フェニル]プロピル]-6-メチル-2(1H)-ピリジノン [化合物番号 (23k)] の白色結晶 556 mg を得た。

- $^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 1.50~1.75 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 2.35 (t, 2H, $J=7.3$ Hz), 2.48~2.52 (2H), 4.63 (s, 2H), 5.68 (s, 1H), 6.60~6.80 (3H), 7.16 (t, 1H, $J=7.8$ Hz), 9.96 (broad, 1H), 11.03 (broad, 1H)
20

- 25 実施例 1-18 本発明化合物 [化合物番号 (26k)] の合成

エタノール 10 ml 及び 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 10 ml の混合物に、3-ホルミル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2(1H)-ピリジノン 0.50 g 及び 3-シアノメトキシアセトフェノン 0.58 g を溶解し、還流下に 3 時間 20 分加熱し

た。室温に冷却後、1 N塩酸水を加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後濃縮して、残渣を酢酸エチル及びエタノールで洗い、乾燥して4-ヒドロキシ-3-[3-(3-カルボキシフェニル)-3-オキソ-1-プロペニル]-1,6-ジメチル-2(1H)-ピリジノン〔化合物番号(5 26 k)〕の黄褐色結晶0.17 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.36 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 4.76 (s, 2H), 6.00 (s, 1H), 7.17 (d, 1H, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.45 (d, 1H, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.52 (t, 1H, $J=7.6\text{ Hz}$), 8.00 (d, 1H, $J=15.4\text{ Hz}$), 8.28 (d, 1H, $J=15.1\text{ Hz}$)

実施例1-19 本発明化合物〔化合物番号(37 k)〕の合成

エタノール30 ml及び4-クロロフェニルヒドラジン塩酸塩1.00 gの混合物に、20%ナトリウムエトキシド294 mgを添加し、ここに1-メチル-3-ホルミル-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン439 mgを加え、室温で3時間攪拌した。析出した結晶を濾取し、エタノールと水で洗い、乾燥して3-[(4-クロロフェニル)ヒドラジノメチル]-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン〔化合物番号(37 k)〕の黄色結晶697 mgを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 3.61 (s, 3H), 6.91 (d, 1H, $J=10.8\text{ Hz}$), 7.30~7.35 (m, 3H), 7.53 (d, 1H, $J=8.1\text{ Hz}$), 7.68 (dt, 1H, $J=2.7, 8.1\text{ Hz}$), 8.03 (dd, 1H, $J=2.7, 8.1\text{ Hz}$), 8.45 (s, 1H), 10.77 (broad s, 1H), 13.24 (broad s, 1H)

実施例1-20 本発明化合物〔化合物番号(38 k)〕の合成

エタノール10 ml及び3-(2-ジメチルアミノエトキシ)ベンジルアミン661 mgの混合物に、3-エトキシカルボニル-4-ヒドロキシ-6-メチル-2(1H)-

ピリジノン 737 mg を加え、還流下に 6 時間加熱した。室温に冷却後濃縮し、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後濃縮して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、4-ヒドロキシ-6-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロピリジン-3-カルボン酸

5 3-(2-ジメチルアミノエトキシ)ベンジルアミド [化合物番号 (38k)] の白色結晶 402 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 2.19 (s, 9H), 2.55~2.60 (2H), 3.95~4.05 (2H), 4.02 (t, 1H, $J=5.9$ Hz), 4.99 (d, 1H, $J=5.9$ Hz),
10 5.91 (s, 1H), 6.80~6.90 (3H), 7.25 (t, 1H, $J=7.8$ Hz), 10.48 (t, 1H, $J=5.4$ Hz), 11.77 (broad, 1H), 15.58 (s, 1H)

実施例 1-21 本発明化合物 [化合物番号 (42k)] の合成

15 1-メチル-3-アミノ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン塩酸塩 1.08 g と 20% 水酸化ナトリウム水溶液 20 ml の混合物に、3-(2-メトキシエトキシ)フェニルアセチルクロリド 1.09 g を加え、室温で攪拌した。10% 塩酸水で酸性とし、析出した固体を濾取してシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、黄褐色油状の N-(4-ヒドロキシ-1-メチル-2-オキソ-1,2-ジヒドロキノ
20 リン-3-イル)-2-[3-(2-メトキシエトキシ)フェニル]アセトアミド [化合物番号 (42k)] 295 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz, DMSO- d_6) δ (ppm) : 3.45 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.74~3.79 (m, 2H), 3.80 (s, 2H), 4.12~4.16 (m, 2H), 6.84~6.98 (m, 3H), 7.21~7.37 (m, 3H), 7.56 (dt, 1H, $J=2.7, 8.1$ Hz), 8.13 (dd, 1H, $J=2.7, 8.1$ Hz), 8.80 (broad s, 1H), 12.71 (s, 1H)

実施例 2 (I 型コラーゲン遺伝子の転写調節領域と結合されたレポーター遺伝子を有するプラスミドの調製)

正常ヒト胎児皮膚線維芽細胞 (C l o n t e c h 社、カタログ番号 C C - 2 5 0 9) 1×10^8 細胞を 37°C 、5 % CO_2 雰囲気下で一晩培養した。培養
5 された細胞をリン酸ナトリウム緩衝液 (以下、P B S と記す。) で 2 回洗浄した後、P B S 3 m l を加えセルスクレイパー (N a l g e n、カタログ番号 1 7 9 6 9 3) を用いて細胞を器壁から剥がした。剥がされた細胞を遠心分離 (1, 5 0 0 r p m、 4°C 、1 5 分間) により集め、これを P B S 2 0 m l に懸濁して再度遠心分離した。得られた沈殿に、D N A E x t r a c t i o n
10 n K i t (S t r a t a g e n e 社、カタログ番号 2 0 0 6 0 0) の S o l u t i o n 2 を 1 1 m l、p r o n a s e を $4.8 \mu\text{l}$ それぞれ加えて 60°C にて 1 時間振とうした後、得られた混合液を氷中に 1 0 分間放置した。次に、当該混合液に上記キットの S o l u t i o n 3 を 4 m l 加えて混合した後、これを氷中に 5 分間放置した。遠心分離 (3, 0 0 0 r p m、 4°C 、1 5 分間
15) し、上清を回収した。回収された上清に、当該上清 1 m l 当たり $2 \mu\text{l}$ の R N a s e を加え、 37°C で 1 5 分間放置した。この混合液に、2 倍容量のエタノールを加えて混合し、出現した白い糸状の物質 (ゲノム D N A) を回収した。回収されたゲノム D N A を 7 0 % エタノールで洗浄した後、風乾した。風乾されたゲノム D N A を 1 0 m M T r i s - H C l, 1 m M E D T A (p H
20 8. 0) (以下、T E と記す。) $500 \mu\text{l}$ に溶解した。

得られたゲノム D N A 溶解液 (ゲノム D N A 1 μg 相当量) と、配列番号 1 (配列番号 1 : コラーゲンプロモーター D N A を増幅するために設計されたオリゴヌクレオチドプライマー : ccaagctagc gaaattatct tttctttcat ag 32) で示される塩基配列からなるオリゴヌクレオチド及び配列番号 2 (配列番号
25 2 : コラーゲンプロモーター D N A を増幅するために設計されたオリゴヌクレオチドプライマー : ccaaaagctt gcagtcgtgg ccagtacc 28) で示される塩基配列からなるオリゴヌクレオチド ($10 \text{ pmol} / \mu\text{l}$) 各 $1 \mu\text{l}$ 、蒸留水 $29 \mu\text{l}$ 、T a K a R a L A T a q (宝酒造社、カタログ番号 R R 0 0 2 A

に添付されたbuffer 5 μ l、Mg²⁺溶液 5 μ l、dNTP mixture 5 μ l及びTaKaRa LA Taq（宝酒造社、カタログ番号RR002A）0.5 μ lを混合した。得られた混合液を94℃、5分間保温した後、94℃、1分間次いで60℃、1分間さらに72℃、1分間の保温を1
5 サイクルとしてこれを30サイクル行った。当該混合液を2%アガロースゲル電気泳動に供することにより、約0.5 kbのDNAを回収した。回収されたDNAをフェノール・クロロホルム処理した後、エタノール沈殿することによりDNAを回収した。回収されたDNAを超純水に溶解し、この溶解液にNhe I 2.5 μ l及びHind III 2.5 μ lを加え、37℃で3時間保温し
10 た。次いで、当該溶解液を2%アガロースゲル電気泳動に供することにより、約3.5 kbのDNAを回収した。回収されたDNAをエタノール沈殿することにより再びDNA（以下、コラーゲンプロモーターDNAと記す。）を回収した。

一方、ホタルルシフェラーゼをコードする塩基配列を有するベクターpGL
15 3（Promega社、カタログ番号E1751）をNhe I及びHind IIIで消化した後、上記と同様にアガロースゲル電気泳動に供することにより、約5 kbのDNAを回収した。回収されたDNAをエタノール沈殿することにより再びDNAを回収した。回収されたDNAに蒸留水44 μ l、Alkaline Phosphatase（宝酒造、カタログ番号2120A）に添付さ
20 れたBuffer 5 μ l及びAlkaline Phosphatase（宝酒造社、カタログ番号2120A）1 μ lを加えて、この混合液を65℃で30分間保温した。次に、当該混合液を2回フェノール・クロロホルム処理した後、エタノール沈殿することによりDNA（以下、LucベクターDNAと記す。）を回収した。次いで、上記コラーゲンプロモーターDNA 約20 ng
25 とLucベクターDNA 約20 ngとを混合した後、DNA Ligation kit Ver 2酵素溶液を同量添加して16℃で一昼夜保温した。当該混合液に大腸菌5Hd α （TOYOBO社、カタログ番号DNA-903）を加えて水中に30分間放置し、次いで42℃、45秒間保温した後、得られた大

腸菌を $50 \mu\text{g}/\text{ml}$ アンピシリンナトリウム（ナカライ社、カタログ番号 027-39）を含む LB プレートに播種し、 37°C 、一昼夜放置した。出現したシングルコロニーを $50 \mu\text{g}/\text{ml}$ アンピシリンを含む LB 培地 2 ml で 37°C 、12 時間培養した。得られた培養液から AUTOMATIC DNA ISOLATION SYSTEM PI-50（KURABO 社）を用いてプラスミド DNA を調製した。調製されたプラスミド DNA の塩基配列を DNA シークエンサーで分析した。その結果、当該プラスミド（以下、COL-Luc と記す。）は、ヒト由来の I 型コラーゲン $\alpha 2$ 鎖遺伝子の転写調節領域の $-3500 \sim +57$ （転写開始点を $+1$ とする。）の塩基配列の下流に、レポーター遺伝子としてホタルルシフェラーゼのアミノ酸配列をコードする塩基配列が接続されてなる塩基配列を保有していることが確認された。

実施例 3（レポーター遺伝子の発現量を指標とした被験化合物が有する I 型コラーゲン遺伝子の転写調節能力の測定）

15 正常ヒト胎児皮膚線維芽細胞 1×10^6 細胞を 100 mm ディッシュに播種し、非働化牛胎児血清（以下、FBS と記す。Gibco 社、カタログ番号 21140-079）を $10 (\text{v}/\text{v}) \%$ 含む Dulbecco's-MEM（日水製薬社、カタログ番号 05919）培地（以下、当該培地を D-MEM（+）と記す。）中で 37°C 、 $5\% \text{ CO}_2$ 雰囲気下において一晩培養した。次いで培地を、FBS を含まない Dulbecco's-MEM 培地（以下、当該培地を D-MEM（-）と記す。）に置換した。

D-MEM（-） $300 \mu\text{l}$ に、COL-Luc $5 \mu\text{g}$ 及び pCMV- β -gal（Invitrogen 社、カタログ番号 10586-014） $5 \mu\text{g}$ を加え、得られた混合液を室温で 5 分間放置した（溶液 1）。また、D-MEM（-） $300 \mu\text{l}$ に Lipofectine（Gibco 社、カタログ番号 18292-011） $20 \mu\text{l}$ を加え、得られた混合液を室温で 45 分間放置した（溶液 2）。次に、溶液 1 と溶液 2 とを混合し、これを室温で 10 分間放置した後、当該混合液に D-MEM（-） 5.4 ml を加えて混合した。

当該混合液を前記正常ヒト胎児皮膚線維芽細胞に添加した後、当該細胞を 37℃、5% CO₂ 雰囲気下で培養した。6 時間後、ディッシュから培養上清を除き、細胞を PBS で 2 回洗浄した後、ディッシュに 0.25% トリプシンを含む PBS 1 ml を添加してディッシュから細胞を剥がした。剥がされた細胞
5 に D-MEM (+) を加えてよく混合した後、当該混合物を 12 ウエルプレートに 1 ml ずつ分注し、これを 37℃、5% CO₂ 雰囲気下で終夜培養した。翌日、各ウエルを D-MEM (-) で 2 回洗浄した後、0.1% FBS を含む Dulbecco's-MEM 培地 (以下、当該培地を D-MEM (0.1%) と記す。) 1 ml に置換した。

10 このようにして培養された細胞に、式 (V_x ' ' ' ') で示される化合物、化合物番号 (7a) 及び (1j) で示される本発明化合物が 1 mM になるよう 10% ジメチルスルホキシド (以下、DMSO と記す。) で溶解し、その溶液を 30 μl 添加した (本発明化合物最終濃度 30 μM、DMSO 最終濃度 0.1%)。尚、対照では 10% DMSO を 10 μl 添加した。

15 1 時間後、TGF-β (Pepro Tech 社) の 0.5 μg/ml 水溶液又は蒸留水を 10 μl 添加し、37℃、5% CO₂ 雰囲気下でさらに 40 時間培養した。培養された細胞を PBS で 2 回洗浄した後、これに細胞溶解剤 (東洋インキ社、カタログ番号 PD10) 200 μl を加え細胞を剥がした。剥がされた細胞を細胞懸濁液として回収した後、これを遠心分離 (15,000
20 rpm、4℃、5 分間) することにより、上清を回収した。回収された上清各 50 μl を 96 ウエルプレートに移した後、MICROLUMAT LB96 P (EG&G BERTHOLD 社製) を用いて、Luc アッセイ溶液 (20 mM Tricine (pH 7.8)、2.67 mM MgSO₄、0.1 mM EDTA、33.3 mM DTT、270 μM Coenzyme A、5
25 30 μM ATP、470 μM Luciferin) 50 μl を当該プレートに自動分注した後、各ウエル内の発光量を測定した (Delay: 1.6 秒、Meas. Interval: 20 秒)。

一方、回収された上清又は細胞溶解剤 50 μl を、予め 96 ウエルプレート

に分注された β -gal 基質溶液 (5.8 mM o-nitrophenyl-
-beta-D-galactopyranoside、1 mM $MgCl_2$ 、45 mM 2-メルカプトエタノール) 50 μ l に加えて 37℃、2 時間イン
キュベートした後、マイクロプレートリーダーを用いて各ウェル内の 420
5 nm の吸光度を測定した。得られた値を基にし、次式に従って転写活性を算出
した。

転写活性 = [発光量 (上清添加区) - 発光量 (細胞溶解剤添加区)] / [420 nm 吸光度 (上清添加区) - 420 nm 吸光度 (細胞溶解剤添加区)]

次に、算出された転写活性を基にし、次式に従って、TGF- β が有する I
10 型コラーゲン遺伝子の転写促進能力に対する被験化合物の阻害効果を阻害度
として算出した。

阻害度 = [転写活性 (DMSO 及び TGF- β 添加試験区) - 転写活性 (化合物
及び TGF- β 添加試験区)] / [転写活性 (DMSO 及び TGF- β 添加
試験区) - 転写活性 (DMSO 及び TGF- β 無添加試験区)] $\times 100$

15 式 (V_x ' ' ' ') で示される化合物、化合物番号 (7 a) 及び (1 j) で
示される本発明化合物が化合物最終濃度 30 μ M において、阻害度は、70 以
上であった。本発明化合物が、TGF- β が有する I 型コラーゲン遺伝子の転
写促進能力を阻害し、I 型コラーゲン遺伝子の転写を抑制する能力を有するこ
とが確認された。

20 実施例 4 (フィブロネクチンの発現量を指標とした被験化合物が有する TGF- β 抑制能力の測定)

正常ヒト皮膚線維芽細胞 (Clonetics 社、カタログ番号 CC-2509) 5 $\times 10^3$ 個/ウェルを、96 ウェルプレート (BECTON DICK
25 INSON 社、カタログ番号 35-3075) に播き、37℃、5% CO₂ 下
のインキュベーターで一晩培養した。翌日、0.1% 牛胎児血清を含む D-MEM 培地 (日水製薬 (株) 社、コード番号 05919) 0.1 ml に交換した。
その 1 時間後、化合物番号 (7 a) で示される本発明化合物を最終濃度 10

0 μ Mになるように添加し、1時間培養した後に、最終濃度 5 ng/ml の TGF- β (Peprotech社、カタログ番号 100-21R) を添加し、さらに 26 時間培養した。リン酸緩衝液で 2 回洗浄した後に、RNeasy Mini Kit (QIAGEN社、カタログ番号 74106) を用いて全 RNA を分離した。分離された全 RNA 5 μ l に、20 μ M オリゴ dT 1 μ l 及び RNase フリー蒸留水 4 μ l を加えて 65 $^{\circ}$ C、5 分間インキュベートし、直ぐに氷冷した。当該溶液 10 μ l に、5 $\times$ バッファー 4 μ l、MgCl₂ 2.4 μ l、10mM dNTP 1 μ l、RNasin 1 μ l、ImpromII 1 μ l、RNase フリー蒸留水 0.6 μ l (以上、全て Promega 社) を加えて 25 $^{\circ}$ C 5 分間、42 $^{\circ}$ C 1 時間、70 $^{\circ}$ C 15 分間の条件で逆転写反応した。

逆転写反応溶液 5 μ l に、配列番号 3 (配列番号 3 : フィブロネクチン遺伝子の DNA を検出するために、PCR 用プライマーとして設計されたオリゴヌクレオチド : tcgccatcag tagaaggtag ca 22)、配列番号 4 (配列番号 4 : フィ
15 フィブロネクチン遺伝子の DNA を検出するために、PCR 用プライマーとして設計されたオリゴヌクレオチド : tatactgaac accaggttgc aagtc 25) で示される各 20 pmol/ μ l のプライマー 1 μ l 及び配列番号 5 (配列番号 5 : フィ
20 フィブロネクチン遺伝子の DNA を検出するために、プローブとして設計されたオリゴヌクレオチド : ctcaaccttc ctgaaactgc aaactccgtc 30) で示される
25 フィブロネクチン遺伝子の DNA 検出用プローブ 1.25 μ l、又は Human GAPDH プライマー・プローブ (Applied Biosystems 社、カタログ番号 4310884E) 1.25 μ l を加え、TaqMan Universal PCR Master Mix (Applied Biosystems 社、カタログ番号 4304437) 12.5 μ l 及び滅菌水を加えて 50 μ l に調整し、Optical 96-Well Reaction Plate (Applied Biosystems 社、カタログ番号 N801-0560) のウェル中で混合した。スタンダードは、TGF- β のみを添加した細胞から全 RNA を調製し、その 250、125、62.5、

31. 25、15.625、7.8125 ngをそれぞれ逆転写反応したcDNA溶液を用いた。その後、Gene Amp 7900 (Applied Biosystems 社)を用いて50℃ 5分間 1サイクル、95℃ 15秒間及び60℃ 1分間の40サイクルの条件でPCRした。定量は各スタンダード直線を作成した後、フィブロネクチン量及びGAPDH量をそれぞれ算出し、次式に従って転写量を算出した。

フィブロネクチン転写量＝フィブロネクチン量／GAPDH量

阻害度＝〔転写量（DMSO及びTGF-β添加試験区）－転写量（化合物及びTGF-β添加試験区）〕／〔転写量（DMSO及びTGF-β添加試験区）－転写量（DMSO及びTGF-β無添加試験区）〕×100

化合物番号（7a）で示される本発明化合物の阻害度は、70%以上であった。

本発明化合物が、TGF-βによって促進される皮膚線維芽細胞のフィブロネクチン遺伝子の転写量を抑制することが確認された。

産業上の利用可能性

本発明により、組織における細胞外マトリックス遺伝子の発現量を減少させ、細胞外マトリックス蓄積量を低下させることにより、組織の線維化を改善させる組成物（即ち、細胞外マトリックス蓄積抑制剤や、線維症治療剤又は心不全治療剤）等の開発・提供が可能となる。

配列表フリーテキスト

配列番号1

コラーゲンプロモーターDNAを増幅するために設計されたオリゴヌクレオチドプライマー

配列番号2

コラーゲンプロモーターDNAを増幅するために設計されたオリゴヌクレオチドプライマー

配列番号 3

フィブロネクチンDNAを検出するために設計されたオリゴヌクレオチド
プライマー

配列番号 4

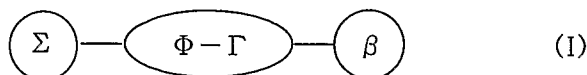
- 5 フィブロネクチンDNAを検出するために設計されたオリゴヌクレオチド
プライマー

配列番号 5

フィブロネクチンDNAを検出するために設計されたオリゴヌクレオチド
プローブ

請求の範囲

1. 式 (I)



5

[式中、

I. Σ は、式 (I α -1)

[式中、

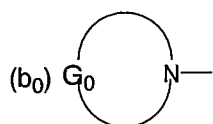
- 10 1. α は、芳香族 5 員環、又は、芳香族 6 員環を表し、 $(Y_{\alpha})_q$ において、 Y_{α} は、下記の X_0 群又は Y_0 群の基を表し、 q は、0、1、2 又は 3 を表し、 q が 2 以上のとき、 Y_{α} は同一又は相異なり、 q が 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_{α} は、 Z_0 群の基をなして α 環と縮環してもよく、 $(X_{\alpha})_p$ において、 X_{α} は、下記の X_0 群、 Y_0 群及び Z_0 群に属さない置換基を表し、 p は、0、1、2 又は 3 を表し、 p が 2 以上のとき、 X_{α} は同一又は相異なり、 p と q との和は 3 以下である。

- (1) X_0 群： M_a - 基 [M_a は、 R_b - 基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d - 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又は C1-C10 アルキレン基を表す。)、 HOR_d - 基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - R_d - 基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - O - R_d - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e O - CO - R_d - 基 (R_e 及

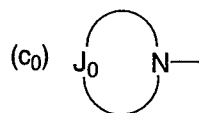
- び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH-$ 基、 R_e 、
 $R_e' N-R_d-$ 基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と
 同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一
 の意味を表す。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d-$ 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d
 5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_b O-CO-N(R_e)-R_d-$ 基 (R_b 、
 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-CO-$
 R_d- 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e'$
 $' N-CO-NR_e''-R_d-$ 基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は
 相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と
 10 同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-C$
 $(=NR_e'')-NR_e'''-R_d-$ 基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e'''
 R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の
 意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の
 意味を表す。)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d-$ 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、
 15 前記と同一の意味を表す。)、 $R_e R_e' N-SO_2-R_d-$ 基 (R_e 、 R_e'
 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 C2-C10アルケニル基又はC2-
 C10アルキニル基を表す。] である。

2. Y_0 群: $M_{b_0}-R_d-$ 基 [M_{b_0} は、 $M_{c_0}-$ 基 { M_{c_0} は、 $M_{d_0}-$
 $R_d'-$ 基 { M_{d_0} は、 M_a- 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置
 20 換されてもよい6-10員環のアリール基、又は、 M_a- 基 (M_a は、前記と
 同一の意味を表す。)} で置換されてもよい5-10員環のヘテロアリール基、
 又は、 M_a- 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい不
 飽和結合を含んでもよい3-10員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、
 又は、

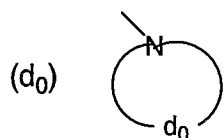
25



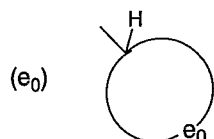
(b_0) - 基 ((b_0) において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5～14員の炭化水素環又は複素環をなす。)、



- 5 (c_0) - 基 ((c_0) において、 J_0 は、窒素原子を含んでもよく、芳香族5～7員環をなす。)、



- (d_0) - 基 { d_0 は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に
10 、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ - 基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。 } 、
15 スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5～12員の炭化水素環をなす。 } 又は



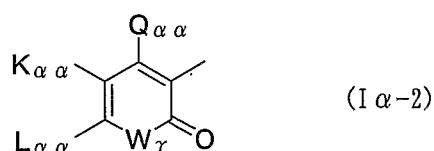
- (e_0) - 基 { e_0 は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基
20 、 $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) 、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5～12員の炭化水素環をなす。 } を表

し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。
 }、 $M_{c0} - B_a$ - 基 (M_{c0} 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、
 $M_{c0} - CO$ - 基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} - CO -$
 O - 基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} O - CO$ - 基 (M_{c0}
 5 O は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} R_e N$ - 基 (M_{c0} 及び R_e は、
 前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} - CO - NR_e$ - 基 (M_{c0} 及び R_e は、
 前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} O - CO - NR_e$ - 基 (M_{c0} 及び R_e
 e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} R_e N - CO$ - 基 (M_{c0} 及び R_e
 e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} R_e N - CO - NR_e'$ - 基 (M_{c0}
 10 c_0 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} R_e N - C (=NR_e')$
 $= NR_e'$ - 基 (M_{c0} 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記
 と同一の意味を表す。)、 $M_{c0} - SO_2 - NR_e$ - 基 (M_{c0} 及び R_e は、
 前記と同一の意味を表す。) 又は $M_{c0} R_e N - SO_2$ - 基 (M_{c0} 及び R_e
 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
 15] である。

3. Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、
 C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、
 チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環
 の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であ
 20 って、 α 環と縮環する基である。]

で示される基、

式 (I α -2)



[式中、

25 1. $K_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(I- $\alpha\alpha$) - 基
 [(I- $\alpha\alpha$) は、式 (I- $\alpha\alpha$)



[式中、 $\alpha \alpha$ は、芳香族5員環又は芳香族6員環を表し、 Y_{α} 及び q は、前記と同一の意味を表し、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_{α} は、 Z_0 群(Z_0 群は、前記と同一の意味を表す。)の基をなして $\alpha \alpha$ 環と縮環してもよい。]

5 で示される基を表す。]

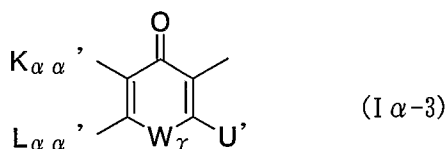
2. $L_{\alpha \alpha}$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、 $(I-\alpha \alpha)$ -基($(I-\alpha \alpha)$ は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC2-C10アルキル基、 $(I-\alpha \alpha)$ -基($(I-\alpha \alpha)$ は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC4-C10アルケニル基、又は、 $(I-\alpha \alpha)$ -基($(I-\alpha \alpha)$ は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC4-C10アルキニル基を表し、 $K_{\alpha \alpha}$ と $L_{\alpha \alpha}$ とは、置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。

3. $Q_{\alpha \alpha}$ は、水素原子、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表す。

4. W_r は、酸素原子又は $-N T_r$ -基(T_r は、窒素原子上の置換基を表す。)

で示される基、

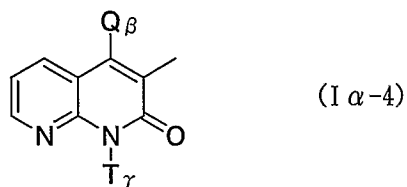
式 $(I \alpha -3)$



[式中、 $K_{\alpha \alpha}'$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、 $(I-\alpha \alpha)$ -基($(I-\alpha \alpha)$ は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 $L_{\alpha \alpha}'$ は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 $K_{\alpha \alpha}'$ と $L_{\alpha \alpha}'$ とは、置換基を有してもよいC3-C10アルキレン基又は置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 W_r は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、又は、

式 (I α -4)

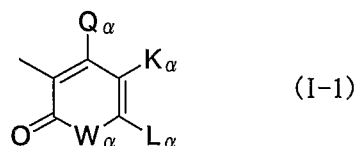


[式中、Q β は、置換されてもよい水酸基を表し、T γ は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基を表す。

I I. β は、

式 (I-1)



[式中、

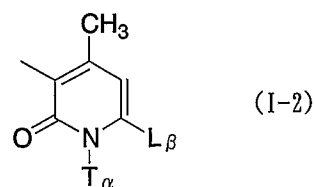
10 (1) Q α は、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表す。

(2) W α は、酸素原子又は-N T α -基 (T α は、水素原子、又は、窒素原子上の置換基を表す。) を表す。

(3) K α 及び L α は、同一又は相異なり、水素原子、又は、炭素原子上の置換基を表し、K α と L α とは、置換基を有してもよいC3-C10アルキレン基又は置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基、

式 (I-2)

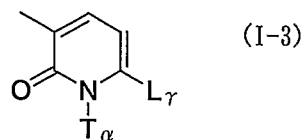


[式中、T α は、前記と同一の意味を表し、L β は水酸基又はメチル基を表す

20 。]

で示される基、

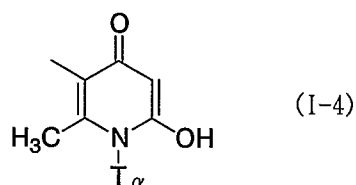
式 (I-3)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 L_γ は、C1-C10アルキル基を表す。]

5 で示される基、

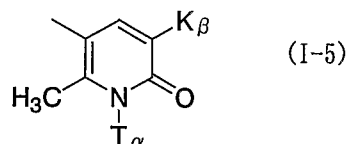
式 (I-4)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

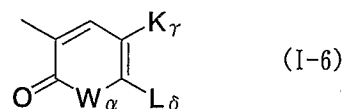
式 (I-5)



10 [式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 K_β は、シアノ基又は $UOCO-$ 基 (U は、水素原子又は C1-C10アルキル基を表す。)を表す。]

で示される基、

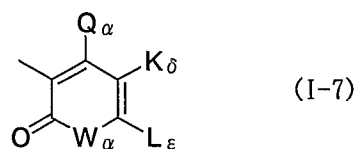
式 (I-6)



15 [式中、 W_α は、前記と同一の意味を表し、 K_γ と L_δ とは、置換基を有してもよい C3-C10アルキレン基又は置換基を有してもよい C4-C10アルケニレン基をなす。]

で示される基、

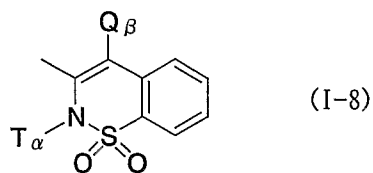
式 (I-7)



[式中、 Q_α 及び W_α は、前記と同一の意味を表し、 K_δ と L_ϵ とは、 $-V_\alpha = V_\alpha' - V_\alpha'' = V_\alpha''' -$ 基 (V_α 、 V_α' 、 V_α'' 及び V_α''' ' は、同一又は相異なり、置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、 V_α 、 V_α' 、 V_α'' 及び V_α''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。) をなす。]

で示される基、

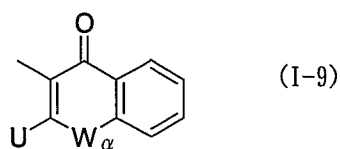
式 (I-8)



10 [式中、 T_α 及び Q_β は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

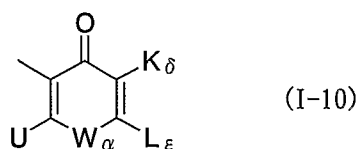
式 (I-9)



[式中、 U 及び W_α は、前記と同一の意味を表す。]

15 で示される基、

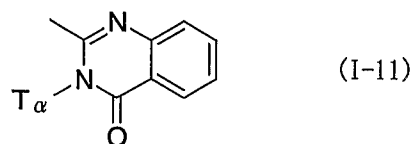
式 (I-10)



[式中、 U 、 W_α 、 K_δ 及び L_ϵ は、前記と同一の意味を表す。]

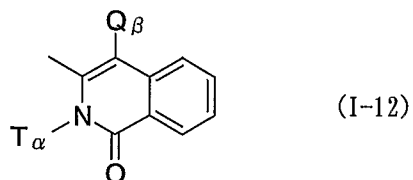
で示される基、

式 (I-11)

[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

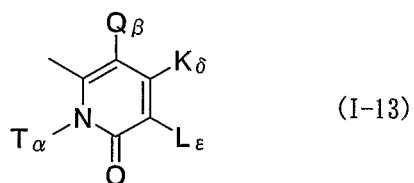
で示される基、

5 式 (I-12)

[式中、 T_α 及び Q_β は、前記と同一の意味を表す。]

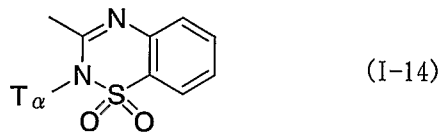
で示される基、

式 (I-13)

[式中、 T_α 、 Q_β 、 K_δ 及び L_ϵ は、前記と同一の意味を表す。]

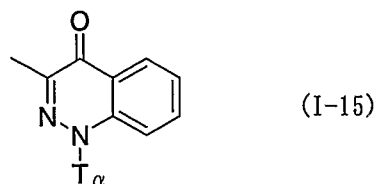
10 で示される基、

式 (I-14)

[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

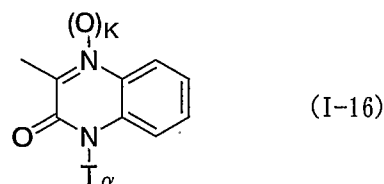
式 (I-15)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

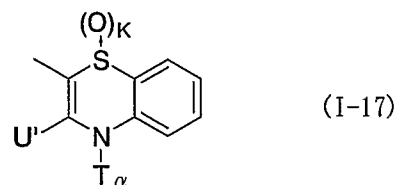
式 (I-16)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

5 で示される基、又は、

式 (I-17)



[式中、 T_α 、 U' 及び K は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基を表す。

I I I. $\Phi-\Gamma$ において、

10 Φ は Σ に結合する原子又は基を表し、 Γ は、 β に結合する原子又は基を表し、 $\Phi-\Gamma$ は、

式 ($\Phi\Gamma-1$)



(式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 R' は
15 、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

で示される基、

式 ($\Phi\Gamma-2$)



(式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び CR_V は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。)

で示される基、

5 式 ($\Phi \Gamma-3$)



[式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R'' - CO-$ 基 (R'' は、C1-C10アルキル基を表す。) 又は $R_{II} - O - C(=O) -$ 基 (R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

10 で示される基、

式 ($\Phi \Gamma-4$)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

15 式 ($\Phi \Gamma-5$)



[式中、 X_{II} は、オキシ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

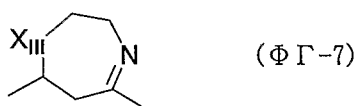
20 式 ($\Phi \Gamma-6$)



(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma-7$)



[式中、 X_{III} は、オキシ基、チオ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一

の意味を表す。)又は $-N(-COR'')$ -基(R'' は、前記と同一の意味を表す。)を表す。]

で示される基、

式(ΦΓ-8)



- 5 [式中、 X_{IV} は、 $-NR_I$ -基(R_I は、前記と同一の意味を表す。)又は $-N(-COR'')$ -基(R'' は、前記と同一の意味を表す。)を表す。]
前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

式(ΦΓ-9)

- 10 $-CHR_I-CHR_{II}-CO-$ (ΦΓ-9)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

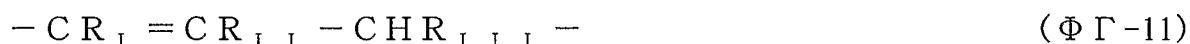
式(ΦΓ-10)



- 15 (式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

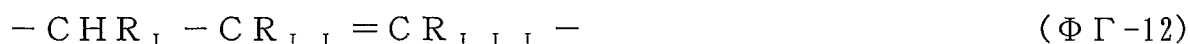
式(ΦΓ-11)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

- 20 で示される基、

式(ΦΓ-12)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

- 25 式(ΦΓ-13)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (ΦΓ-14)



- 5 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

式 (ΦΓ-15)



- 10 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (ΦΓ-16)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

- 15 で示される基、

式 (ΦΓ-17)



(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (ΦΓ-18)



- 20 (式中、 X_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

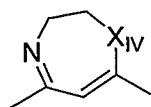
式 (ΦΓ-19)



(式中、 X_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-20)



(Φ Γ-20)

(式中、X_{IV} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

5 式 (Φ Γ-21)

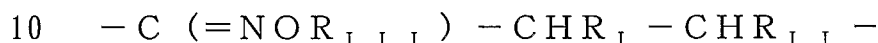


(Φ Γ-21)

(式中、R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-22)

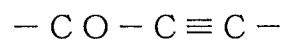


(Φ Γ-22)

(式中、R_I、R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-23)



(Φ Γ-23)

15 で示される基、

式 (Φ Γ-24)

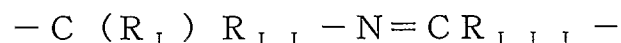


(Φ Γ-24)

(式中、R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

20 式 (Φ Γ-25)

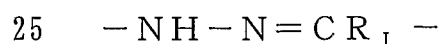


(Φ Γ-25)

(式中、R_I、R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-26)



(Φ Γ-26)

(式中、R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-27)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

5 で示される基、

式 (Φ Γ-28)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

10 式 (Φ Γ-29)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

で示される基、

15 式 (Φ Γ-30)



で示される基を表す。

式 (Φ Γ-31)



20 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-32)



[式中、 Y_{II} は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I$ 基 (式中、 R_I は、
25 前記と同一の意味を表す。)を表す。]

で示される基、

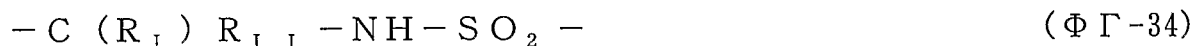
式 (Φ Γ-33)



(式中、R' ' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

式 (Φ Γ-34)



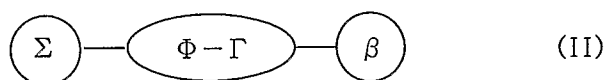
5 (式中、R_I 及び R_{I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基を表す。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一である
10 が、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっているてもよいことを意味するものである。]

で示される含複素環化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする細胞外マトリックス遺伝子転写抑制組成物。

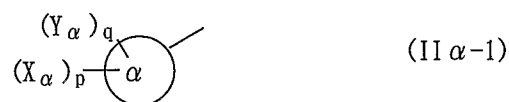
15 2. 式 (II)



[式中、

I. Σ は、

式 (II α-1)



[式中、

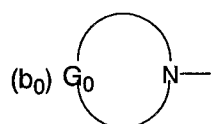
20 1. α は、芳香族 5 員環、又は、芳香族 6 員環を表し、(Y_α)_q において、Y_α は、下記の X₀ 群又は Y₀ 群の基を表し、q は、0、1、2 又は 3 を表して、q が 2 以上のとき、Y_α は同一又は相異なり、q が 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_α は、Z₀ 群の基をなして α 環と縮環しても

よく、 $(X_\alpha)_p$ において、 X_α は、下記の X_0 群、 Y_0 群及び Z_0 群に属さない置換基を表し、 p は、0、1、2又は3を表し、 p が2以上のとき、 X_α は同一又は相異なり、 p と q との和は3以下である。

- (1) X_0 群： M_a - 基 [M_a は、 R_b - 基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c - B_a - R_d - 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d - 基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - R_d - 基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - O - R_d - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - O - CO - R_d - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 HO - CO - $CH=CH$ - 基、 R_e - R_e' - N - R_d - 基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - CO - NR_e' - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_b - O - CO - $N(R_e)$ - R_d - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - R_e' - N - CO - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - R_e' - N - CO - NR_e'' - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - R_e' - N - $C(=NR_e'')$ - NR_e''' - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 、 R_e'' 及び R_e''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表し、 R_e''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_b - SO_2 - NR_e - R_d - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - R_e' - N - SO_2 - R_d - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-

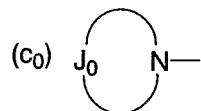
C10アルキニル基を表す。] である。

2. Y_0 群: $M_{b_0} - R_d$ - 基 [M_{b_0} は、 M_{c_0} - 基 { M_{c_0} は、 $M_{d_0} - R_{d'}$ - 基 { M_{d_0} は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい 6 - 10 員環のアリール基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい 5 - 10 員環のヘテロアリール基、又は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい不飽和結合を含んでもよい 3 - 10 員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、
- 5

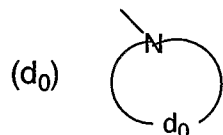


10

(b_0) - 基 ((b_0) において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、非芳香族の、5 ~ 14 員の炭化水素環又は複素環をなす。)、

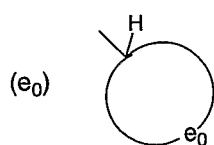


- 15 (c_0) - 基 ((c_0) において、 J_0 は、窒素原子を含んでもよく、芳香族 5 - 7 員環をなす。)、



- (d_0) - 基 { d_0 は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、 $-NR_1$ - 基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル
- 20

基、C3-C10アルケニル基又はC3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表す。}、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。} 又は



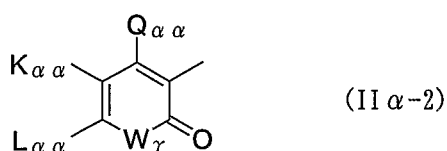
(e₀)-基 {e₀ は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 (R₁ は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい5-12員の炭化水素環をなす。} を表し、R_d' は、R_d と同一又は相異なり、R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、M_{c0}-B_a-基 (M_{c0} 及びB_a は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}-CO-基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}-CO-O-基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}O-CO-基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}R_eN-基 (M_{c0} 及びR_e は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}-CO-NR_e-基 (M_{c0} 及びR_e は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}O-CO-NR_e-基 (M_{c0} 及びR_e は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}R_eN-CO-基 (M_{c0} 及びR_e は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}R_eN-CO-NR_e'-基 (M_{c0}、R_e 及びR_e' は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}R_eN-C(=NR_e')-NR_e'-基 (M_{c0}、R_e、R_e' 及びR_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、M_{c0}-SO₂-NR_e-基 (M_{c0} 及びR_e は、前記と同一の意味を表す。) 又はM_{c0}R_eN-SO₂-基 (M_{c0} 及びR_e は、前記と同一の意味を表す。) を表し、R_d は、前記と同一の意味を表す。]

3. Z₀ 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基

、C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であって、 α 環と縮環する基である。]

5 で示される基、

式 (II α -2)



[式中、

1. $K_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(II - $\alpha\alpha$) - 基

10 [(II - $\alpha\alpha$) は、式 (II - $\alpha\alpha$)



[式中、 $\alpha\alpha$ は、芳香族5員環又は芳香族6員環を表し、 Y_{α} 及び q は、前記と同一の意味を表し、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_{α} は、 Z_0 群 (Z_0 群は、前記と同一の意味を表す。) の基をなして $\alpha\alpha$ 環と縮環してもよい。]

15 で示される基を表す。]

2. $L_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、(II - $\alpha\alpha$) - 基 ((II - $\alpha\alpha$) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC2-C10アルキル基、(II - $\alpha\alpha$) - 基 ((II - $\alpha\alpha$) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルケニル基、又は、(II - $\alpha\alpha$) - 基 ((II - $\alpha\alpha$) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルキニル基を表し、 $K_{\alpha\alpha}$ と $L_{\alpha\alpha}$ とは、置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。

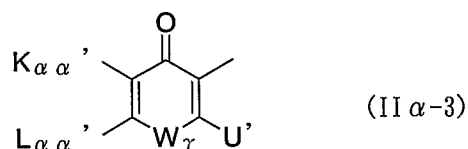
3. $Q_{\alpha\alpha}$ は、水素原子、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表す。

4. W_{γ} は、酸素原子又は -N T_{γ} - 基 (T_{γ} は、窒素原子上の置換基を表す

。)を表す。]

で示される基、

式 (II α-3)

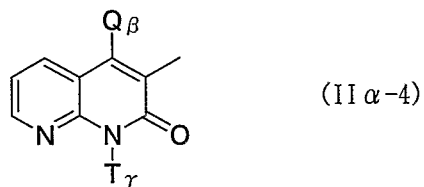


[式中、 $K_{\alpha\alpha}'$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、(II-αα) -基 (

5 (II-αα) は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 $L_{\alpha\alpha}'$ は、水素原子
又はC1-C10アルキル基を表し、 $K_{\alpha\alpha}'$ と $L_{\alpha\alpha}'$ とは、置換基を有してもよい
C3-C10アルキレン基又は置換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をな
すことがあり、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 W_{γ} は、前記と同一の
意味を表す。]

10 で示される基、又は、

式 (II α-4)

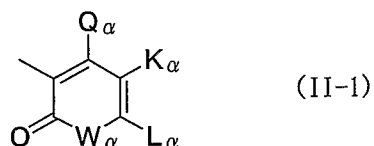


[式中、 Q_{β} は、置換されてもよい水酸基を表し、 T_{γ} は、前記と同一の意味
を表す。]

で示される基を表す。

15 I I. β は、

式 (II-1)



[式中、

(1) Q_{α} は、置換されてもよい水酸基、又は、置換されてもよいアミノ基を表
20 す。

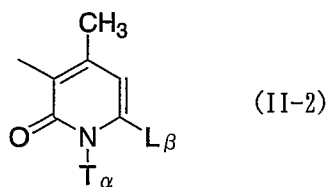
(2) W_{α} は、酸素原子又は $-N T_{\alpha}-$ 基 (T_{α} は、水素原子、又は、窒素原子上の置換基を表す。) を表す。

(3) K_{α} 及び L_{α} は、同一又は相異なり、水素原子、又は、炭素原子上の置換基を表し、 K_{α} と L_{α} とは、置換基を有してもよいC3-C10アルキレン基又は置

5 換基を有してもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基、

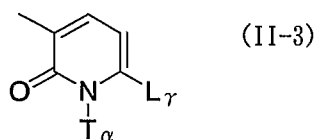
式 (II-2)



[式中、 T_{α} は、前記と同一の意味を表し、 L_{β} は水酸基又はメチル基を表す。]

10 で示される基、

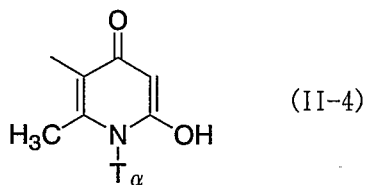
式 (II-3)



[式中、 T_{α} は、前記と同一の意味を表し、 L_{γ} は、C1-C10アルキル基を表す。]

で示される基、

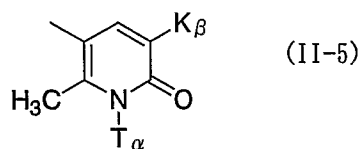
15 式 (II-4)



[式中、 T_{α} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

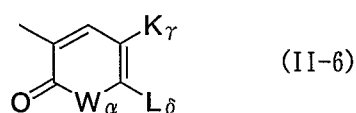
式 (II-5)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 K_β は、シアノ基又は $UOCO-$ 基 (U は、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表す。) を表す。]

で示される基、

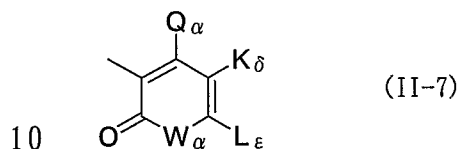
式 (II-6)



- 5 [式中、 W_α は、前記と同一の意味を表し、 K_γ と L_δ とは、置換基を有してもよい $C3-C10$ アルキレン基又は置換基を有してもよい $C4-C10$ アルケニレン基をなす。]

で示される基、

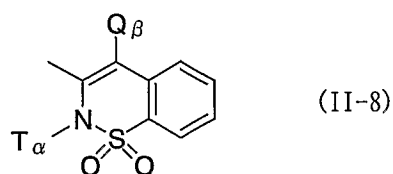
式 (II-7)



- 10 [式中、 Q_α 及び W_α は、前記と同一の意味を表し、 K_δ と L_ϵ とは、 $-V_\alpha = V_\alpha' - V_\alpha'' = V_\alpha'''$ - 基 (V_α 、 V_α' 、 V_α'' 及び V_α''' は、同一又は相異なり、置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、 V_α 、 V_α' 、 V_α'' 及び V_α''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。) をなす。]
- 15

で示される基、

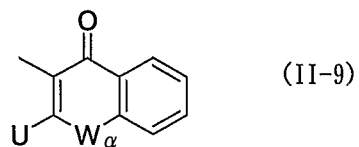
式 (II-8)



[式中、 T_α 及び Q_β は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

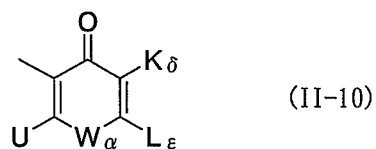
式 (II-9)



[式中、U及び W_α は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

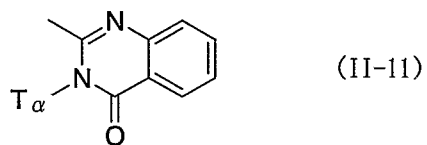
式 (II-10)



[式中、U、 W_α 、 K_δ 及び L_ϵ は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

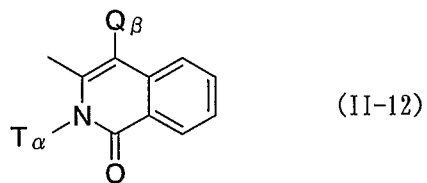
10 式 (II-11)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

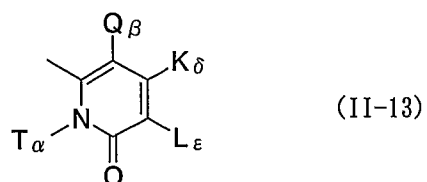
式 (II-12)



15 [式中、 T_α 及び Q_β は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

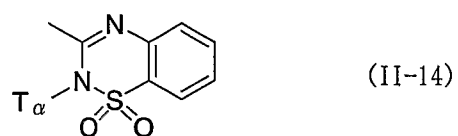
式 (II-13)



[式中、 T_α 、 Q_β 、 K_δ 及び L_ϵ は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

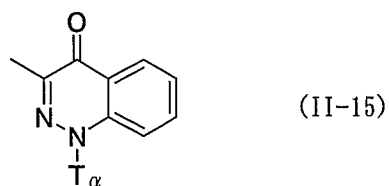
式 (II-14)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

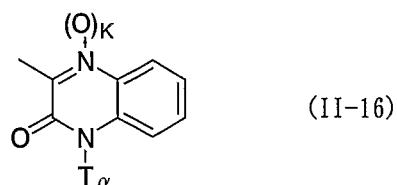
式 (II-15)



[式中、 T_α は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

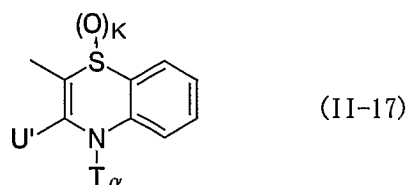
式 (II-16)



10 [式中、 T_α は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

で示される基、又は、

式 (II-17)



[式中、 T_α 、 U' 及び K は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基を表す。

III. $\Phi - \Gamma$ において、

Φ は Σ に結合する原子又は基を表し、 Γ は、 β に結合する原子又は基を表し、

5 $\Phi - \Gamma$ は、

式 ($\Phi \Gamma$ -1)



(式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 R' は、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原

10 子となることはない。)

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma$ -2)



(式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び CR_{IV} は、同一又は相異なり、水素原

15 子又は C1-C10 アルキル基を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma$ -3)



[式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R''-CO-$ 基 (R' は、C1-C10 アルキル基を表す。) 又は $R_{II}-O-C(=O)-$ 基 (R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

20 ' は、C1-C10 アルキル基を表す。) 又は $R_{II}-O-C(=O)-$ 基 (R_{II}

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma$ -4)



25 (式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\Phi \Gamma$ -5)



[式中、 X_{II} は、オキシ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

5 式 (ΦΓ-6)



(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (ΦΓ-7)



10 [式中、 X_{III} は、オキシ基、チオ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (ΦΓ-8)



15 [式中、 X_{IV} は、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]
前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

式 (ΦΓ-9)



20 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

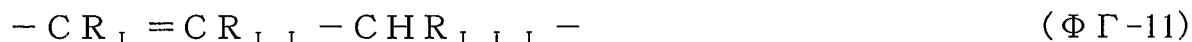
式 (Φ Γ-10)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

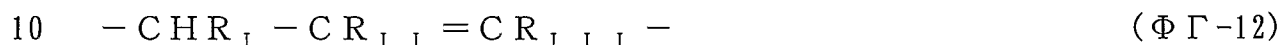
5 式 (Φ Γ-11)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-12)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-13)

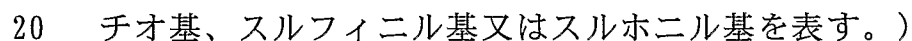


で示される基、

式 (Φ Γ-14)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、



で示される基、

式 (Φ Γ-15)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

25 で示される基、

式 (Φ Γ-16)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-17)



(式中、X_{I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

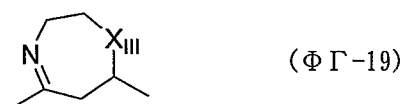
5 式 (Φ Γ-18)



(式中、X_{I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

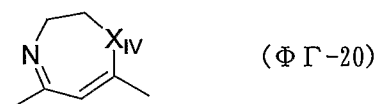
式 (Φ Γ-19)



(式中、X_{I I I} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (Φ Γ-20)



(式中、X_{I V} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-21)

15 $-\text{CO}-\text{CHR}_I-\text{CHR}_{I I}-$ (Φ Γ-21)

(式中、R_I 及び R_{I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-22)

$-\text{C}(=\text{NOR}_{I I I})-\text{CHR}_I-\text{CHR}_{I I}-$ (Φ Γ-22)

20 (式中、R_I、R_{I I} 及び R_{I I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-23)



で示される基、

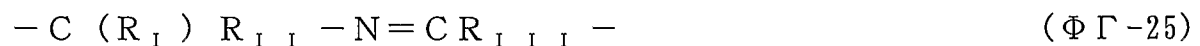
式 (Φ Γ-24)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-25)



で示される基、

式 (Φ Γ-26)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

15 　で示される基、

式 (Φ Γ-27)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

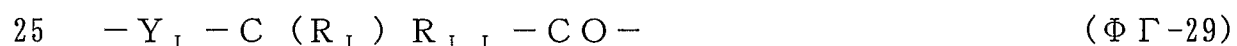
20 　式 (Φ Γ-28)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

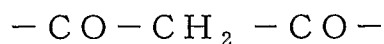
式 (Φ Γ-29)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

で示される基、

式 (Φ Γ-30)



(Φ Γ-30)

で示される基を表す。

式 (Φ Γ-31)

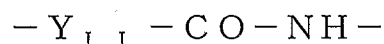


(Φ Γ-31)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (Φ Γ-32)

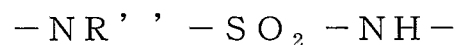


(Φ Γ-32)

10 [式中、 Y_{II} は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I-$ 基 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (Φ Γ-33)



(Φ Γ-33)

15 (式中、 R'' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

式 (Φ Γ-34)



(Φ Γ-34)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

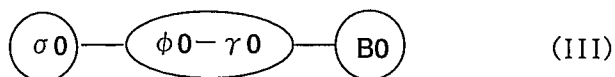
20 で示される基を表す。

但し、 p 及び q が同時に 0 になることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一である
25 が、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっているてもよいことを意味するものである。]

で示される含複素環化合物。

3. 式 (III)



[式中、

I. $\sigma 0$ は、

式 (IIIA 0-1)



5

[式中、

1. $A 0$ は、芳香族 5 員環、又は、芳香族 6 員環を表す。

2. $(X_{A0})_p$ において、 X_{A0} は、下記の A_0 群から N_0 群までのいずれかの群に含まれる基を表し、 p は、0、1、2 又は 3 を表し、 p が 2 以上のとき、 X_{A0} は、同一又は相異なる。

10

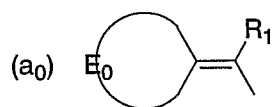
(1) A_0 群: $D_1 - R_4$ - 基 [D_1 は、 $(R_1 - (O)_k -) A_1 N - (O)_k$ - 基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又は C3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)} で置換された C2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表し、 k は、0 又は 1 を表し、 A_1 は、 $R_3 - (CH R_0)_m - (B_2 - B_3)_m$ - 基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい C1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニル基を表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又は C2-C10ハロアルキル基を表し、 m は、0 又は 1 を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ - 基 (R_1' は、 R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、 n は、0 又は 1 を表す。) を表し、 B_3

15

20

は、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。}を表し、 k' は、0又は1を表す。}を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表す。但し、 R_0' 、 R_0'' 、 $N-R_4$ -基 (R_0' 及び R_0'' は、 R_0 と同一又は相異なり、 R_0 と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)を除く。]、 D_2-R_4 -基 [D_2 は、シアノ基、 $R_1 R_1' NC (=N-(O)_n-A_1)$ -基 (R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 N=C(-OR_2)$ -基 (A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。)又は NH_2-CS -基を表し、 R_4 は前記と同一の意味を表す。]、 D_3-R_4 -基 [D_3 は、ニトロ基又は $R_1 OSO_2$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}又は $R_1 OSO_2$ -基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。))である。

(2) B_0 群:



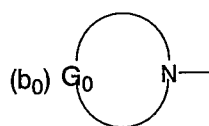
(a_0)-基

(a_0)において、 E_0 は、置換基を有してもよい、飽和又は不飽和の、芳香族又は非芳香族の、5～14員の炭化水素環又は複素環をなし、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)である。

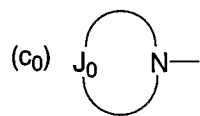
(3) C_0 群: ハロゲン原子、 R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 -基 [D_4 は、水酸基又は A_1-O -基 (A_1 は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は前記と同一の意味を表す。]、 D_5 -基 [D_5 は、 $O=C(R_3)$ -基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。))、 $A_1-(O)_n-N=C(R_3)$ -基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1-B_0-CO-R_4-(O)_n-N=C(R_3)-$

基 { R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ - 基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。}、 $D_2 - R_4 - (O)_n - N = C(R_3)$ - 基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 A_1 N - N = C$
 5 (R_3) - 基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。
]、 $R_1 A_1 N - O - R_4$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 (A_1 - (O)_n -) N$ - 基 (R_1 、 A_1 及び n は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルケニル
 10 基
 である。

(4) D_0 群:



(b_0) - R_4 - 基 ((b_0) において、 G_0 は、置換基を有してもよい、飽
 15 和又は不飽和の、非芳香族の、5 ~ 14 員の炭化水素環又は複素環をなす。)



(c_0) - R_4 - 基

20 ((c_0) において、 J_0 は、窒素原子を含んでもよく、芳香族 5 - 7 員環をなし、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、ハロゲン原子、 $R_2 - B_1 - R_4$ - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意

味を表す。)、 D_2 -基(D_2 は、前記と同一の意味を表す。)又は D_3 - R_4 -基(D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC2-C10アルキニル基

である。

5 (5) E_0 群: A_2 -CO- R_5 -基

である。但し、 A_2 が水酸基のとき、 R_5 がビニレン基ではない。

[A_2 は、

(i) A_3 - B_4 -基

{ A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、
10、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 R_{a0} -(R_4) $_m$ -基(R_{a0} は、置換されてもよい5-7員環のアリール基又はヘテロアリール基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b_0)- R_4 -基((b_0)及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c_0)- R_4 -
15基((c_0)及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 R_2 - B_1 - R_4 -基(R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 - R_4 -基(D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 -基(D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - R_4 -基(D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 -基(D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3 - R_4 -基(D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))若しくは A_4 -SO₂- R_4 -
20基{ A_4 は、(b_0)-基((b_0)は、前記と同一の意味を表す。)、(c_0)-基((c_0)は、前記と同一の意味を表す。)又は R_1 - R_1' -N-基(R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}で置換されたC1-C10アルキル基を表し、

25 B_4 は、オキシ基、チオ基又は-N((O) $_m$ R_1)-基(R_1 及び m は、前記と同一の意味を表す。)を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原子ではない。}、

(ii) R_1 - B_4 -CO- R_4 - B_4' -基(R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同

- 一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4 - B_4$ - 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、
- (iii) $R_2 - SO_2 - NR_1$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、
- 5 水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、
- (iv) (b_0) - 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、
- (v) (c_0) - 基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表す。) 又は
- (vi) $R_1 A_1 N - NR_1'$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_5 は、ハロゲン原子で置換されてもよい C2-C10 アルケニ
- 10 レン基、又は、C2-C10 アルキニレン基を表す。]
- (6) F_0 群: $A_5 - B_5 - R_6$ - 基 [A_5 は、 D_4 - 基 (D_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4 - SO_2$ - 基 (A_4 は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルキル基、又は、 R_2 - B_1 - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_2 - CO$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C1-C10 アルキル基を表し、 B_5 は、 B_1 - 基 (B_1 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-NA_1$ - 基 (A_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表し
- 15 、 R_6 は、単結合又は C1-C10 アルキレン基を表す。]
- である。
- (7) G_0 群: $A_6 - B_5 - R_6$ - 基
- [A_6 は、 $(a_0) - R_4$ - 基 ((a_0) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、C2-C10 アルケニル基、又は、C2-C10 アルキニル基、又は、ハロ
- 25 ゲン原子、 $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_2 - CO$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルケニル基、又は、ハロゲン原子、 $R_2 - B_1$

一基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 一基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 一基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)
 若しくは A_2 - CO - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) で置換された
 C2-C10アルキニル基、又は、(b_0) 一基 ((b_0) は、前記と同一の意味を
 5 表す。)、(c_0) 一基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 一
 基 (D_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 一基 (D_1 は、前記と同一の
 意味を表す。) 若しくは D_3 一基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。) で置
 換された C3-C10アルケニル基、又は、 D_4 一基 (D_4 は、前記と同一の意味を
 表す。)、 D_1 一基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは D_3 一基
 10 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C3-C10アルキニル基を表
 し、 B_5 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]
 である。

(8) H_0 群:

D_2 - N (- (O) $_n$ - A_1) - R_6 一基 (D_2 、 n 、 A_1 及び R_6 は、前記
 15 と同一の意味を表す。)、 D_2 一基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。但し
 、シアノ基を除く。)、 R_1 (R_1' (O) $_n$) N - C R_1'' = N - R_6 一
 基 (R_1 、 R_1' 、 n 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 R_1'' は、 R_1
 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表す。)、 R_1 - (O) $_n$ - N =
 C R_1' - N R_2 - R_6 一基 (R_1 、 n 、 R_1' 、 R_2 及び R_6 は、前記と同
 20 一の意味を表す。)、 R_2 - B_3 - N R_1 - CO - N R_1' - R_6 一基 (R_2
 、 B_3 、 R_1 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - CO
 - N R_1 - R_6 一基 (D_2 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。) 又
 は A_2 - COCO - N R_1 - R_6 一基 (A_2 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の
 意味を表す。)
 25 である。

(9) I_0 群:

A_7 - B_6 - N ((O) $_n$ R_1) - R_6 一基 [A_7 は、ハロゲン原子で置換さ
 れてもよい C2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル

- 基、 $R_2 - B_1 - R_4$ - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0) - R_4$ - 基 ((b_0) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0) - R_4$ - 基 ((c_0) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ - 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ - 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4 - SO_2 - R_4$ - 基 (A_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8 - CS - N((O)_n R_1) - R_6$ - 基 [A_8 は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10アルキル基を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、
- 15 $A_7' - B_2' - B_3 - N((O)_n R_1) - R_6$ - 基 [A_7' は、ハロゲン原子で置換されてもよい C3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよい C3-C10アルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4'$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 $D_4 - R_4'$ - 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4'$ - 基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0) - R_4'$ - 基 ((b_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c_0) - R_4'$ - 基 ((c_0) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ - 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4'$ - 基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)] 又は $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 B_2' は、オキシ基、チオ基又は $N((O)_n \cdot R_1')$ - 基 (n' は、 n と同一又は相異なり、 n と同一の意味を表し、 R_1' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 B_3 、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8' - B_2' - CS - N((O)_n$
- 20
- 25

R_1) - R_6 - 基 [A_8 ' は、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 B_2 ' は、前記と同一の意味を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 A_8 ' - S - B_3 ' - N ((O) n R_1) - R_6 - 基 [A_8 '、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_3 ' は、カルボニル
 5 基又はスルホニル基を表す。] 又は A_7 ' ' - SO₂ - N ((O) n R_1) - R_6 - 基 [A_7 ' ' は、C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 R_2 - B_1 - R_4 ' - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 ' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 - R_4 ' - 基 (D_4 及び R_4 ' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - R_4 - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - R_4 ' - 基 (D_1 及び R_4 ' は、前記と同一の意味を表す。)、(b_0) - R_4 ' - 基 ((b_0) 及び R_4 ' は、前記と同一の意味を表す。)、(c_0) - R_4 ' - 基 ((c_0) 及び R_4 ' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - R_4 - 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、NO₂ - R_4 - 基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。)
 10 又は A_2 - CO - R_4 - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(10) J_0 群: A_7 - CO - 基 (A_7 は、前記と同一の意味を表す。)、又は
 20 、 A_9 - CS - 基 (A_9 は、 A_7 又は A_8 を表す。)、又は、 A_9 ' (O) m N = C (A_9) - 基 (A_9 ' は、 A_7 ' 又は A_8 ' を表し、 m 及び A_9 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 D_2 - CO - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 A_2 - COCO - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 A_9 - CO - B_1 ' - R_6 - 基 (A_9 及び R_6 は、前記と同一の
 25 意味を表し、 B_1 ' は、オキシ基又はチオ基を表す。但し、 B_1 ' がオキシ基のとき、 A_9 は、 A_8 ではない。)、又は、 A_9 - CS - B_1 ' - R_6 - 基 (A_9 、 B_1 ' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 A_7 ' ' - SO₂ - B_1 ' - R_6 - 基 (A_7 ' '、 B_1 ' 及び R_6 は、前記と同一

の意味を表す。)、又は、 $A_8 - SO_2 - B_1' - R_6$ - 基 (A_8 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は、水素原子となることはない。)、又は、 $A_9' - B_2' - B_3 - B_1' - R_6$ - 基 (A_9' 、 B_2' 、 B_3 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。)、又は、(b_0) - 基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは (c_0) - 基 ((c_0) は、前記と同一の意味を表す。) で置換されたC2-C10アルケニル基である。

(11) K_0 群: $A_{10} - N((O)_n R_1) - CO - R_6$ - 基 [A_{10} は、水素原子 (但し、 n は0ではない。)、 $A_7'' - SO_2$ - 基 (A_7'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8 - SO_2$ - 基 (A_8 は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は、水素原子とはならない。)、 $A_9' O$ - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n は1ではない。)、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n が0のとき、 A_8' を除く。)、 $R_2 OCH_2$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - CO - CH(CH_2 CO - A_2)$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(12) L_0 群: $A_{10}' - N((O)_n R_1) - SO_2 - R_6$ - 基 [A_{10}' は、水素原子 (但し、 n は0ではない。)、 $A_9' O$ - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n は1ではない。)、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。但し、 n が0のとき、 A_8' を除く。)、 $R_2 - CO$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - CO - CH(CH_2 CO - A_2)$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_9'' R_1 N - SO_2 - N((O)_n R_1') - R_6$ - 基 [A_9'' は、水素原子又は A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_1 、 n 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意

味を表す。] 又は $(b_0) - SO_2 - N((O)_n R_1') - R_6$ - 基 $[(b_0), n, R_1'$ 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(13) M_0 群: $R_1 (R_2 S) C=N-R_6$ - 基 (R_1, R_2 及び R_6 は、
 5 前記と同一の意味を表す。)、 $R_2 B (R_2' B') C=N-R_6$ - 基 (R_2
 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 R_2' は、 R_2 と同一又は相異なり、
 R_2 と、同一の意味を表し、 B 及び B' は、同一又は相異なり、オキシ基又は
 チオ基を表す。)、 $R_1 R_1' N-(R_2 S) C=N-R_6$ - 基 (R_1, R_1'
 '、 R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 N=C(S R_2) -$
 10 $NR_2' - R_6$ - 基 (R_1, R_2, R_2' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表
 す。) 又は $R_1 (R_1' O) N-R_6$ - 基 (R_1, R_1' 及び R_6 は、前記と
 同一の意味を表す。)

である。

(14) N_0 群: $A_{11} - P(=O)(OR_1') - R_4$ - 基 [A_{11} は、 R_1
 15 $-$ 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 O - R_6$ - 基 (R_1 及び
 R_6 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 OCO - CHR_0$ - 基 (R_1 及
 び R_0 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_1' 及び R_4 は、前記と同
 一の意味を表す。]

である。

20 3. $(Y_{A0})_q$ において、 Y_{A0} は、下記の X_0 群及び Y_0 群の基を表し、
 q は、0、1、2 又は 3 を表し、 p (p は、前記と同一の意味を表す。) と q
 との和は 3 以下であり、 q が 2 以上のとき、 Y_{A0} は同一又は相異なり、 q が
 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_{A0} は、 Z_0 群の基を
 なして、 A_0 環と縮環してもよい。

25 (1) X_0 群:

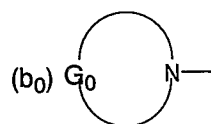
M_a - 基 [M_a は、 R_b - 基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C
 10 アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、水酸基、 R_c
 $-B_a - R_d$ - 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよい C1-C10 アルキル

基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 HOR_d -基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e-CO-R_d -基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、
 5 前記と同一の意味を表す。)、 $R_e-CO-O-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eO-CO-R_d$ -基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ -基、 $R_eR_e'N-R_d$ -基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
 10 。)、 $R_e-CO-NR_e'-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_bO-CO-N(R_e)-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-CO-NR_e''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-C(=NR_e''')-NR_e'''-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 、 R_e''' 及び R_e'''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e''' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'''' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
 15)、 $R_b-SO_2-NR_e-R_d$ -基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_eR_e'N-SO_2-R_d$ -基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。] である。

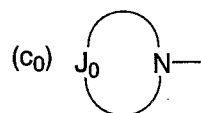
(2) Y_0 群:

25 $M_{b0}-R_d$ -基 [M_{b0} は、 M_{c0} -基 { M_{c0} は、 $M_{d0}-R_d'$ -基 { M_{d0} は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい6-10員環のアリール基、又は、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)} で置換されてもよい5-10員環のヘテロアリール基、又は、 M_a -

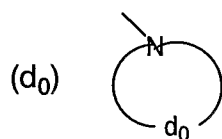
基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい不飽和結合を含んでもよい 3 - 10 員環の炭化水素環若しくは複素環をなす基、又は、



5 (b₀) - 基 ((b₀) は、前記と同一の意味を表す。)、



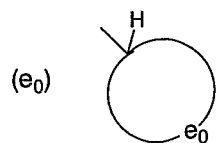
(c₀) - 基 ((c₀) は、前記と同一の意味を表す。)、



10

(d₀) - 基 { d₀ は、カルボニル基又はチオカルボニル基で置換され、更に、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 (R₁ は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5 - 12 員の炭化水素環をなす。} 又は

15



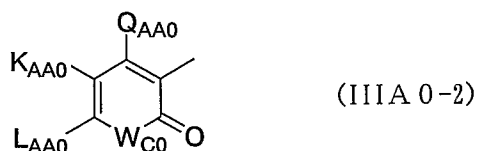
(e₀) - 基 { e₀ は、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、チオ基、-NR₁-基 (R₁ は、前記と同一の意味を表す。)、スルフィニル基若しくはスルホニル基で置換されてもよい 5 - 12 員の炭化水素環をなす。} を表

し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。
 }、 $M_{c_0} - B_a$ - 基 (M_{c_0} 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、
 $M_{c_0} - CO$ - 基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} - CO -$
 O - 基 (M_{c_0} は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} O - CO$ - 基 (M_{c_0}
 5 O は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} R_e N$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、
 前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} - CO - NR_e$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、
 前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} O - CO - NR_e$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e
 R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} R_e N - CO$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e
 R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} R_e N - CO - NR_e'$ - 基 (M_{c_0}
 10 c_0 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} R_e N - C (=NR_e')$
 $= NR_e''$ - 基 (M_{c_0} 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記
 と同一の意味を表す。)、 $M_{c_0} - SO_2 - NR_e$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e は、
 前記と同一の意味を表す。) 又は $M_{c_0} R_e N - SO_2$ - 基 (M_{c_0} 及び R_e
 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。
 15] である。

(3) Z_0 群: ハロゲン原子、C1-C10アルコキシ基、C3-C10アルケニルオキシ基、
 C3-C10アルキニルオキシ基、カルボニル基、チオカルボニル基、オキシ基、
 チオ基、スルフィニル基若しくはスルホニル基を有してもよい、5-12員環
 の炭化水素環又は複素環であって、芳香族又は非芳香族の、単環又は縮環であ
 20 って、A0環と縮環する基である。]

で示される基、

式 (IIIA 0-2)



[式中、

25 1. K_{AA0} は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(III-AA0)-基
 [(III-AA0)は、式(III-AA0)]



[式中、AA 0 は、芳香族 5 員環又は芳香族 6 員環を表し、 Y_{A0} 及び q は、前記と同一の意味を表し、 q が 2 以上のとき、隣接している 2 個の同一又は相異なる Y_{A0} は、 Z_0 群の基をなして AA 0 環と縮環してもよい。]

で示される基を表す。]を表す。

- 5 2. L_{AA0} は、水素原子、C1-C10アルキル基、(III-AA 0)-基 ((III-AA 0)は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10アルキル基、(III-AA 0)-基 ((III-AA 0)は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C4-C10アルケニル基、又は、(III-AA 0)-基 ((III-AA 0)は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C4-C10アルキニル基を表し、 K_{AA0} と L_{AA0} とは、単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C4-C10アルケニレン基をなすことがある。

3. Q_{AA0} は、

水素原子、又は、 Q_{A0} -基

- 15 [Q_{A0} は、
 水酸基、(b_0)-基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、
 $A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 及び B_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_c は、
 オキシ基又は $-N((O)_m R_1)$ -基 (m 及び R_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]、
 20 $A_7''-SO_2-B_c$ -基 (A_7'' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、
 $A_8-SO_2-B_c$ -基 (A_8 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、
 A_8 は水素原子とはならない。)、
 25 $R_1 R_1' N-SO_2-B_c$ -基 (R_1 、 R_1' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、

(b_0) - SO_2 - B_c - 基 (b_0) 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、

A_9' - B_c - 基 (A_9' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)、

D_5 - R_4 - B_c - 基 (D_5 、 R_4 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)

5、

M_{c0} - B_3 - B_c - 基 (M_{c0} 、 B_3 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。) 又は

M_{c0} - B_c - 基 (M_{c0} 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。)
を表す。]

10 である。

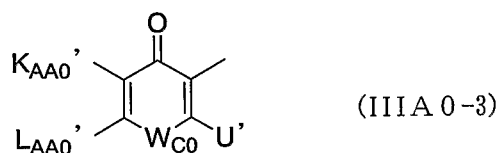
4. W_{c0} は、酸素原子又は

- NT_{c0} - 基 [T_{c0} は、 A_9' - 基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - R_4 - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_{c0} - 基 (M_{c0} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

15 である。]

で示される基、

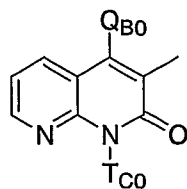
式(IIIA 0-3)



[式中、 K_{AA0}' は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、(III-AA0) - 基 ((III-AA0) は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 L_{AA0}' は、水
20 素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 K_{AA0}' と L_{AA0}' とは、C3-C10アル
キレン基又は単数又は同一又は相異なる複数の M_a - 基 (M_a は、前記と同一
の意味を表す。) で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあ
り、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 W_{c0} は、前記と同一の意味を表
す。]

25 で示される基、又は、

式(IIIA 0-4)



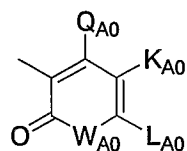
(IIIA 0-4)

[式中、 T_{C0} は、前記と同一の意味を表し、 Q_{B0} は、水酸基、 $A_9 - B_6$ -O-基 (A_9 及び B_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_{7''} - SO_2$ -O-基 ($A_{7''}$ は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8 - SO_2$ -O-基 (A_8 は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 $R_1 R_{1'} - N - SO_2 - O$ -基 (R_1 及び $R_{1'}$ は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b_0) - SO_2 - O$ -基 ((b_0) は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_{9'} - O$ -基 ($A_{9'}$ は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4 - O$ -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_{C0} - B_3 - O$ -基 (M_{C0} 及び B_3 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $M_{C0} - O$ -基 (M_{C0} は、前記と同一の意味を表す。)) を表す。]

で示される基を表す。

II. B0 は、

式(III-1)



(III-1)

[式中、

(1) Q_{A0} は、前記と同一の意味を表す。

(2) W_{A0} は、酸素原子又は

- NT_{A0} -基 [T_{A0} は、水素原子、 $A_{9'}$ -基 ($A_{9'}$ は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は M_{C0} -基 (M_{C0} は、前記と同一の意味を表す。)) を表す。]

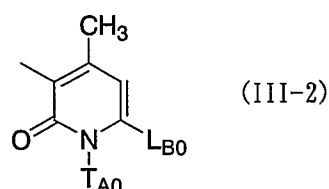
である。

(3) K_{A0} は、水素原子、ハロゲン原子又はC1-C10アルキル基を表し、 L_A

$_0$ は、水素原子、C1-C10アルキル基又は M_{b_0} -基 (M_{b_0} は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 K_{A_0} と L_{A_0} とは、C3-C10アルキレン基、又は、単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。]

5 で示される基、

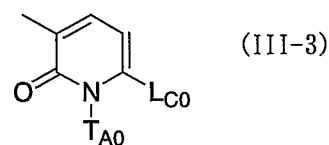
式 (III-2)



[式中、 T_{A_0} は、前記と同一の意味を表し、 L_{B_0} は水酸基又はメチル基を表す。]

で示される基、

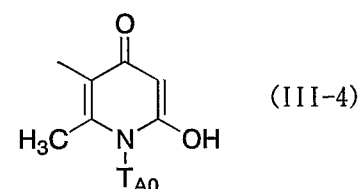
10 式 (III-3)



[式中、 T_{A_0} は、前記と同一の意味を表し、 L_{C_0} は、C1-C10アルキル基を表す。]

で示される基、

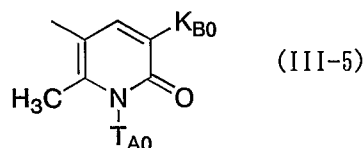
式 (III-4)



15 [式中、 T_{A_0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

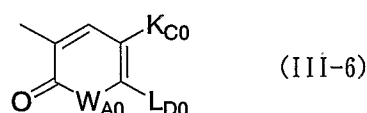
式 (III-5)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 K_{B0} は、シアノ基又は UOC オー基 (U は、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表す。) を表す。]

で示される基、

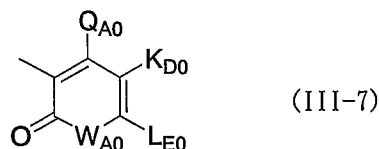
5 式 (III-6)



[式中、 W_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 K_{C0} と L_{D0} とは、 $C3-C10$ アルキレン基又は単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい $C4-C10$ アルケニレン基をなす。]

10 で示される基、

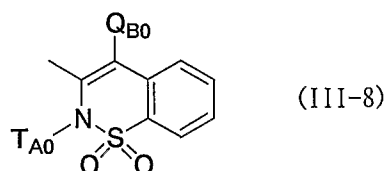
式 (III-7)



[式中、 Q_{A0} 及び W_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 K_{D0} と L_{E0} とは、
 $-V_{A0} = V_{A0}' - V_{A0}'' = V_{A0}'''$ -基 { V_{A0} 、 V_{A0}' 、 V_{A0}'' 及び V_{A0}''' } は、同一又は相異なり、 M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、
 V_{A0} 、 V_{A0}' 、 V_{A0}'' 及び V_{A0}''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。} をなす。]

で示される基、

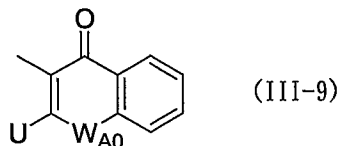
20 式 (III-8)



[式中、 T_{A0} 及び Q_{B0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

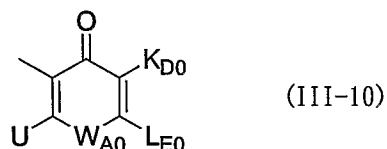
式 (III-9)



5 [式中、U 及び W_{A0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

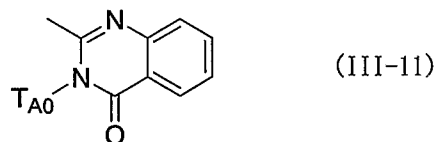
式 (III-10)



[式中、U、 W_{A0} 、 K_{D0} 及び L_{E0} は、前記と同一の意味を表す。]

10 で示される基、

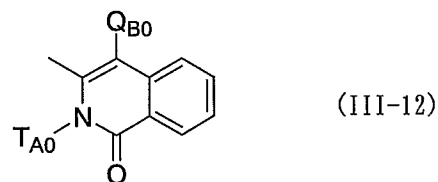
式 (III-11)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

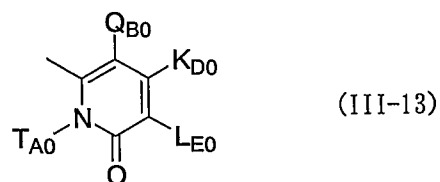
15 式 (III-12)



[式中、 T_{A0} 及び Q_{B0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

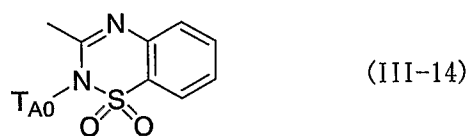
式 (III-13)



[式中、 T_{A0} 、 Q_{B0} 、 K_{D0} 及び L_{E0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

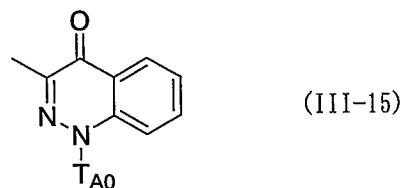
式 (III-14)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

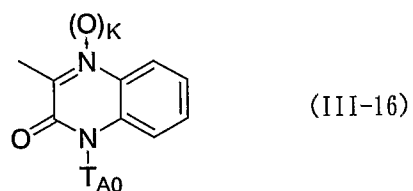
式 (III-15)



[式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

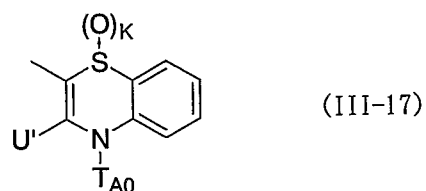
式 (III-16)



10 [式中、 T_{A0} は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

で示される基、又は、

式 (III-17)



[式中、 T_{A0} 、 U' 及び K は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基を表す。

III. $\phi 0 - \gamma 0$ において、

$\phi 0$ は $\sigma 0$ に結合する原子又は基を表し、 $\gamma 0$ は、 $B 0$ に結合する原子又は基

5 を表し、

$\phi 0 - \gamma 0$ は、

式 ($\phi \gamma 0-1$)

$-CR=CR'-CO-$

($\phi \gamma 0-1$)

(式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 R' は
10 、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma 0-2$)

$-CR_I=CR_{II}-CR_{III}=CR_{IV}-CO-$

($\phi \gamma 0-2$)

15 (式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び CR_{IV} は、同一又は相異なり、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma 0-3$)

$-CR_I=CX_I-CO-$

($\phi \gamma 0-3$)

20 [式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R''-CO-$ 基 (R'' は、C1-C10 アルキル基を表す。) 又は $R_{II}-O-C(=O)-$ 基 (R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 ($\phi \gamma 0-4$)

25 $-CR_I=CR_{II}-C(=NOR_{III})-$

($\phi \gamma 0-4$)

(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma 0-5$)



[式中、 X_{II} は、オキシ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

5 式 (φγ0-6)



(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φγ0-7)



10 [式中、 X_{III} は、オキシ基、チオ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (φγ0-8)



15 [式中、 X_{IV} は、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]
前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

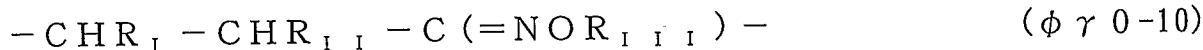
式 (φγ0-9)



20 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

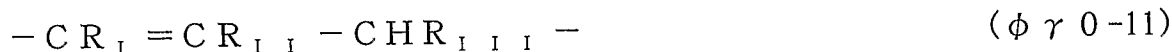
式 (φ γ 0-10)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

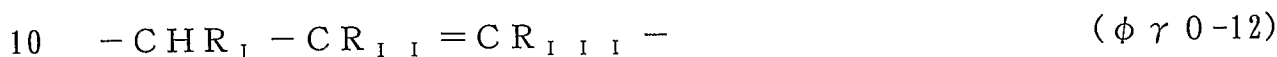
5 式 (φ γ 0-11)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-12)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-13)



15 (式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-14)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、

20 チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-15)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

25 で示される基、

式 (φ γ 0-16)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-17)



(式中、X_{I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

5 式 (φ γ 0-18)



(式中、X_{I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-19)



(式中、X_{I I I} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (φ γ 0-20)



(式中、X_{I V} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-21)

15 $-\text{CO}-\text{CHR}_I-\text{CHR}_{I I}-$ (φ γ 0-21)

(式中、R_I 及び R_{I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

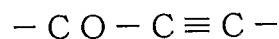
式 (φ γ 0-22)

$-\text{C}(=\text{NOR}_{I I I})-\text{CHR}_I-\text{CHR}_{I I}-$ (φ γ 0-22)

20 (式中、R_I、R_{I I} 及び R_{I I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

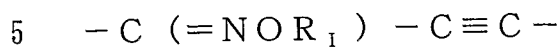
式 (φ γ 0-23)



(φ γ 0-23)

で示される基、

式 (φ γ 0-24)

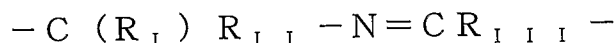


(φ γ 0-24)

(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-25)

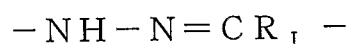


(φ γ 0-25)



で示される基、

式 (φ γ 0-26)



(φ γ 0-26)

(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

15 で示される基、

式 (φ γ 0-27)

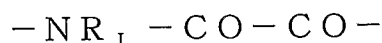


(φ γ 0-27)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

20 式 (φ γ 0-28)

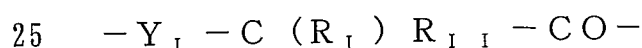


(φ γ 0-28)

(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-29)

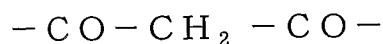


(φ γ 0-29)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

で示される基、

式 (φ γ 0-30)



(φ γ 0-30)

で示される基を表す。

式 (φ γ 0-31)

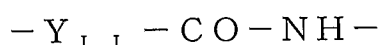


(φ γ 0-31)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ 0-32)



(φ γ 0-32)

- 10 [式中、 Y_{II} は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I$ 基 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (φ γ 0-33)

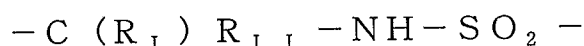


(φ γ 0-33)

- 15 (式中、 R'' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

式 (φ γ 0-34)



(φ γ 0-34)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

- 20 で示される基を表す。

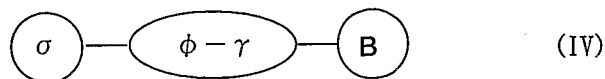
但し、 p 及び q が同時に 0 になることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一である

25 が、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっているてもよいことを意味するものである。]

で示される含複素環化合物。

4. 式 (IV)



[式中、

I. σ は、

式 (IVA-1)

5



[式中、

1. A は、芳香族 5 員環、又は、芳香族 6 員環を表す。

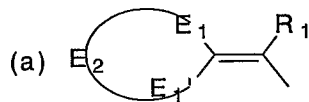
2. $(X_A)_p$ において、 X_A は、下記の A 群から N 群までのいずれかの群に含まれる基を表し、p は、0、1、2 又は 3 を表し、p が 2 以上のとき、 X_A

10 は、同一又は相異なる。

(1) A 群: $D_1 - R_4$ - 基 [D_1 は、 $(R_1 - (O)_k -) A_1 N - (O)_k$, - 基 { R_1 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 は、C1-C10アルキル基、C3-C10アルケニル基又は C3-C10アルキニル基を表し、 B_1 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又は15 スルホニル基を表す。) で置換された C2-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基を表し、k は、0 又は 1 を表し、 A_1 は、 $R_3 - (CHR_0)_m - (B_2 - B_3)_m$ - 基 { R_3 は、水素原子、又は、ハロゲン原子若しくは $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、20 又は、C2-C10アルキニル基を表し、 R_0 は、水素原子、C1-C10アルキル基又は C2-C10ハロアルキル基を表し、m は、0 又は 1 を表し、 B_2 は、単結合、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n R_1')$ - 基 (R_1' は、 R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表し、n は、0 又は 1 を表す。) を表し、 B_3 は

、カルボニル基、チオカルボニル基又はスルホニル基を表し、 m' は、0又は1を表し、 B_3 がスルホニル基のとき、 m は0となりかつ R_3 が水素原子となることはない。}を表し、 k' は、0又は1を表す。}を表し、 R_4 は、C1-C10アルキレン基を表す。但し、 R_0' 、 R_0'' 、 $N-R_4$ -基(R_0' 及び R_0'' は、 R_0 と同一又は相異なり、 R_0 と同一の意味を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。))を除く。]、 D_2-R_4 -基 [D_2 は、シアノ基、 R_1 、 R_1' 、 $NC(=N-(O)_n-A_1)$ -基(R_1 、 R_1' 、 n 、及び A_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1N=C(-OR_2)$ -基(A_1 及び R_2 は、前記と同一の意味を表す。))又は NH_2-CS -基を表し、 R_4 は前記と同一の意味を表す。]、 D_3-R_4 -基 (D_3 は、ニトロ基又は R_1OSO_2 -基(R_1 は、前記と同一の意味を表す。))を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。}又は R_1OSO_2 -基(R_1 は、前記と同一の意味を表す。))である。

(2) B群:



(a)-基

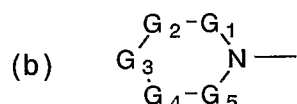
[(a) において、 E_1 及び E_1' は、C1-C10アルキル基若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されてもよいメチレン基、又は、カルボニル基を表す。但し、 E_1 及び E_1' は、同時にカルボニル基となることはない。 E_2 は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1'$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいC2-C10アルキレン基、又は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1'$ -基(R_1' は、前記と同一の意味を表す。))で置換されてもよいC3-C10アルケニレン基を表し、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

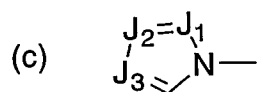
(3) C群: ハロゲン原子、 R_2-B_1 -基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の

意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ - 基 [D_4 は、水酸基又は $A_1 - O$ - 基 (A_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は前記と同一の意味を表す。]、 D_5 - 基 [D_5 は、 $O = C(R_3)$ - 基 (R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_1 - (O)_n - N = C(R_3)$ - 基 (A_1 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 - B_0 - CO - R_4 - (O)_n - N = C(R_3)$ - 基 { R_1 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表し、 B_0 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1')$ - 基 (R_1' 及び m は、前記と同一の意味を表す。) を表す。}、 $D_2 - R_4 - (O)_n - N = C(R_3)$ - 基 (D_2 、 R_4 、 n 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 A_1 N - N = C(R_3)$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_3 は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]、 $R_1 A_1 N - O - R_4$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 (A_1 - (O)_n -) N$ - 基 (R_1 、 A_1 及び n は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。) 又は D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルケニル基である。

(4) D 群:



(b) - R_4 - 基 [(b) において、 G_1 、 G_2 、 G_4 及び G_5 は、隣接原子と単結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチレン基、又は、隣接原子と二重結合で結ばれた、メチル基で置換されてもよいメチン基を表し、 G_3 は、単結合、又は、二重結合、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C1-C10 アルキレン基、又は、メチル基、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基若しくは $-NR_1$ - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C2-C10 アルケニレン基を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。]、



(c) $-R_4-$ 基

((c)において、 J_1 、 J_2 及び J_3 は、同一又は相異なり、メチル基で置換されてもよいメチン基、又は、窒素原子を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、ハロゲン原子、 $R_2-B_1-R_4$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は D_3-R_4 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC2-C10アルキニル基

である。

(5) E 群: A_2-CO-R_5 基

である。但し、 A_2 が水酸基のとき、 R_5 がビニレン基ではない。

[A_2 は、

(i) A_3-B_4 基

{ A_3 は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C2-C10ハロアルキル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、又は、 $R_a-(R_4)_m$ 基 (R_a は、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよい、フェニル基、ピリジル基、フリル基若しくはチエニル基を表し、 R_4 及び m は前記と同一の意味を表す。)、又は、(b) $-R_4$ 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、(c) $-R_4$ 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_2-B_1-R_4$ 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4-R_4 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1-R_4 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))、 D_2 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3-R_4 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。))

- ₃ 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4 - SO_2 - R_4$ - 基
 { A_4 は、(b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - 基
 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 R_1' N$ - 基 (R_1 及び R_1'
₁ ' は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_4 は、前記と同一の意味を表
 5 す。} で置換された C1-C10 アルキル基を表し、
 B_4 は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_m R_1)$ - 基 (R_1 及び m は、前
 記と同一の意味を表す。) を表す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 A_3 が水素原
 子ではない。}、
 (ii) $R_1 - B_4 - CO - R_4 - B_4'$ - 基 (R_1 、 B_4 及び R_4 は、前記と同
 10 一の意味を表し、 B_4' は、 B_4 と同一又は相異なり、 B_4 と同一の意味を表
 す。但し、 B_4 がチオ基のとき、 R_2 が水素原子ではない。) 又は $D_2 - R_4$
 $- B_4$ - 基 (D_2 、 R_4 及び B_4 は、前記と同一の意味を表す。)、
 (iii) $R_2 - SO_2 - NR_1$ - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。但し、
 水素原子を除く。 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、
 15 (iv) (b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、
 (v) (c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。) 又は
 (vi) $R_1 A_1 N - NR_1'$ - 基 (R_1 、 A_1 及び R_1' は、前記と同一の意味
 を表す。) を表し、 R_5 は、ハロゲン原子で置換されてもよい C2-C10 アルケニ
 レン基、又は、C2-C10 アルキニレン基を表す。]
 20 (6) F 群: $A_5 - B_5 - R_6$ - 基 [A_5 は、 D_4 - 基 (D_4 は、前記と同一
 の意味を表す。)、 D_1 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_3 -
 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは $A_4 - SO_2$ - 基 (A_4 は
 、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルキル基、又は、 $R_2 -$
 B_1 - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は
 25 、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す
 。) 若しくは $A_2 - CO$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) で置換さ
 れた C1-C10 アルキル基を表し、 B_5 は、 B_1 - 基 (B_1 は、前記と同一の意味
 を表す。) 又は $-NA_1$ - 基 (A_1 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、

R_6 は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。]

である。

(7) G群: $A_6 - B_5 - R_6$ - 基

[A_6 は、(a) - R_4 - 基 ((a) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。

- 5)、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニル基、又は、ハロゲン原子、 $R_2 - B_1$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは $A_2 - CO$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC2-C10アルケニル基、又は、ハロゲン原子、 $R_2 - B_1$ - 基
10 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - 基 (D_5 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは $A_2 - CO$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC2-C10アルキニル基、又は、(b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。)、 D_4 - 基 (D_4 は、
15 前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC3-C10アルケニル基、又は、 D_4 - 基 (D_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_1 - 基 (D_1 は、前記と同一の意味を表す。)) 若しくは D_3 - 基 (D_3 は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されたC3-C10アルキニル基を表し、 B_5
20 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(8) H群:

- $D_2 - N(-O)_n - A_1 - R_6$ - 基 (D_2 、 n 、 A_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 D_2 - 基 (D_2 は、前記と同一の意味を表す。但し
25 、シアノ基を除く。)、 $R_1(R_1'(O)_n)N - CR_1'' = N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_1' 、 n 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 R_1'' は、 R_1 と同一又は相異なり、 R_1 と同一の意味を表す。)、 $R_1 - (O)_n - N = CR_1' - NR_2 - R_6$ - 基 (R_1 、 n 、 R_1' 、 R_2 及び R_6 は、前記と同

一の意味を表す。) 、 $R_2 - B_3 - NR_1 - CO - NR_1' - R_6$ - 基 (R_2 、 B_3 、 R_1 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。) 、 $D_2 - CO - NR_1 - R_6$ - 基 (D_2 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - COCO - NR_1 - R_6$ - 基 (A_2 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)

である。

(9) I 群：

$A_7 - B_6 - N((O)_n R_1) - R_6$ - 基 [A_7 は、ハロゲン原子で置換されてもよいC2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、C3-C10ハロアルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4$ - 基 (R_2 、 B_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4$ - 基 (D_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4$ - 基 (D_1 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(b) - R_4$ - 基 ((b) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $(c) - R_4$ - 基 ((c) 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ - 基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4$ - 基 (D_3 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_4 - SO_2 - R_4$ - 基 (A_4 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)] 又は $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)] を表し、 B_6 は、カルボニル基又はチオカルボニル基を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8 - CS - N((O)_n R_1) - R_6$ - 基 [A_8 は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

$A_7' - B_2' - B_3 - N((O)_n R_1) - R_6$ - 基 [A_7' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4'$ - 基 (R_2 及び B_1 は、前記と同一の意味を表し、 R_4' は、C2-C10アルキレン基を表す。)、 $D_4 - R_4'$ - 基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4'$ - 基 (D

₁ 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 (b) $-R_4'$ -基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 (c) $-R_4'$ -基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_3 - R_4'$ -基 (D_3 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $A_2 - CO - R_4$ -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) を表し、 B_2' は、オキシ基、チオ基又は $-N((O)_n \cdot R_1')$ -基 (n' は、 n と同一又は相異なり、 n と同一の意味を表し、 R_1' は、前記と同一の意味を表す。)) を表し、 B_3 、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8' - B_2' - CS - N((O)_n R_1) - R_6$ -基 [A_8' は、C1-C10アルキル基又はC2-C10ハロアルキル基を表し、 B_2' は、前記と同一の意味を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]、 $A_8' - S - B_3' - N((O)_n R_1) - R_6$ -基 [A_8' 、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_3' は、カルボニル基又はスルホニル基を表す。] 又は $A_7'' - SO_2 - N((O)_n R_1) - R_6$ -基 [A_7'' は、C2-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されたC3-C10アルケニル基、ハロゲン原子で置換されてもよいC3-C10アルキニル基、 $R_2 - B_1 - R_4'$ -基 (R_2 、 B_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_4 - R_4'$ -基 (D_4 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4$ -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_1 - R_4'$ -基 (D_1 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 (b) $-R_4'$ -基 ((b) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 (c) $-R_4'$ -基 ((c) 及び R_4' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_2 - R_4$ -基 (D_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $NO_2 - R_4$ -基 (R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $A_2 - CO - R_4$ -基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(10) J群: $A_7 - CO$ -基 (A_7 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $A_9 - CS$ -基 (A_9 は、 A_7 又は A_8 を表す。)、又は、 $A_9' (O)_m N$

$=C(A_9)$ - 基 (A_9' は、 A_7' 又は A_8' を表し、 m 及び A_9 は、前記
 と同一の意味を表す。)、又は、 D_2-CO - 基 (D_2 は、前記と同一の意味
 を表す。)、又は、 A_2-COCO - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。
)、又は、 $A_9-CO-B_1'-R_6$ - 基 (A_9 及び R_6 は、前記と同一の意
 5 味を表し、 B_1' は、オキシ基又はチオ基を表す。但し、 B_1' がオキシ基の
 とき、 A_9 は、 A_8 ではない。)、又は、 $A_9-CS-B_1'-R_6$ - 基 (A_9 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $A_7''-SO_2-B_1'-R_6$ - 基 (A_7'' 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の
 意味を表す。)、又は、 $A_8-SO_2-B_1'-R_6$ - 基 (A_8 、 B_1' 及び
 10 R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は、水素原子となることは
 ない。)、又は、 $A_9'-B_2'-B_3-B_1'-R_6$ - 基 (A_9' 、 B_2' 、
 B_3 、 B_1' 及び R_6 は、は、前記と同一の意味を表す。)、又は、(b)
 - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。) 若しくは (c) - 基 ((c) は
 、前記と同一の意味を表す。) で置換された C2-C10 アルケニル基
 15 である。

(11) K 群: $A_{10}-N((O)_n R_1)-CO-R_6$ - 基 [A_{10} は、水
 素原子 (但し、 n は 0 ではない。)、 $A_7''-SO_2$ - 基 (A_7'' は、前
 記と同一の意味を表す。)、 A_8-SO_2 - 基 (A_8 は、前記と同一の意味を
 表す。但し、 A_8 は、水素原子とはならない。)、 $A_9'O$ - 基 (A_9' は、
 20 前記と同一の意味を表す。但し、 n は 1 ではない。)、 A_9' - 基 (A_9' は
 、前記と同一の意味を表す。但し、 n が 0 のとき、 A_8' を除く。)、 R_2O
 CH_2 - 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 A_2-CO-R_4 - 基 (A_2 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2-CO-CH(CH_2CO-A_2)$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及
 25 び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(12) L 群: $A_{10}'-N((O)_n R_1)-SO_2-R_6$ - 基 [A_{10}'
 は、水素原子 (但し、 n は 0 ではない。)、 $A_9'O$ - 基 (A_9' は、前記と

同一の意味を表す。但し、 n は1ではない。)、 A_9' - 基 (A_9' は、前記
 と同一の意味を表す。但し、 n が0のとき、 A_8' を除く。)、 $R_2 - CO -$
 基 (R_2 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_2 - CO - R_4$ - 基 (A_2 及び
 R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は $A_2 - CO - CH(CH_2 CO - A$
 5 $_2)$ - 基 (A_2 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 n 、 R_1 及び R_6 は
 、前記と同一の意味を表す。]、 $A_9'' R_1 N - SO_2 - N((O)_n R_1$
 $') - R_6$ - 基 [A_9'' は、水素原子又は A_9' - 基 (A_9' は、前記と同
 一の意味を表す。) を表し、 R_1 、 n 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味
 を表す。] 又は (b) - $SO_2 - N((O)_n R_1') - R_6$ - 基 [(b)、
 10 n 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。]

である。

(13) M群: $R_1(R_2 S)C = N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_2 及び R_6 は、前
 記と同一の意味を表す。)、 $R_2 B(R_2' B')C = N - R_6$ - 基 (R_2 及
 び R_6 は、前記と同一の意味を表し、 R_2' は、 R_2 と同一又は相異なり、 R
 15 $_2$ と、同一の意味を表し、 B 及び B' は、同一又は相異なり、オキシ基又はチ
 オ基を表す。)、 $R_1 R_1' N - (R_2 S)C = N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_1'
 、 R_2 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 N = C(SR_2) - N$
 $R_2' - R_6$ - 基 (R_1 、 R_2 、 R_2' 及び R_6 は、前記と同一の意味を表す
 。) 又は $R_1(R_1' O)N - R_6$ - 基 (R_1 、 R_1' 及び R_6 は、前記と同
 20 一の意味を表す。)

である。

(14) N群: $A_{11} - P(=O)(OR_1') - R_4$ - 基 [A_{11} は、 R_1
 - 基 (R_1 は、前記と同一の意味を表す。)、 $R_1 O - R_6$ - 基 (R_1 及び R
 $_6$ は、前記と同一の意味を表す。) 又は $R_1 OCO - CHR_0$ - 基 (R_1 及び
 25 R_0 は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_1' 及び R_4 は、前記と同一
 の意味を表す。]

である。

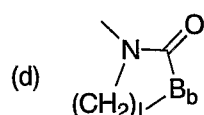
3. $(Y_A)_q$ において、 Y_A は、下記の X 群又は Y 群の基を表し、 q は、0

、1、2又は3を表し、 p (p は、前記と同一の意味を表す。)と q との和は3以下であり、 q が2以上のとき、 Y_A は、同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_A は、 Z 群の基をなして、 A 環と縮環してもよい。

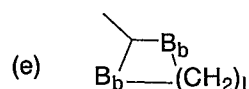
- 5 (1) X 群: M_a - 基 [M_a は、 R_b - 基 (R_b は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表す。)、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 R_c - B_a - R_d - 基 (R_c は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 B_a は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表し、 R_d は、単結合又はC1-C10アルキレン基を表す。)、 $HO-R_d$ - 基 (R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - $CO-R_d$ - 基 (R_e は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - $CO-O-R_d$ - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - $O-CO-R_d$ - 基 (R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 $HO-CO-CH=CH$ - 基、 R_e R_e' N - R_d - 基 (R_e 及び R_e' は、同一又は相異なり、 R_e は、前記と同一の意味を表し、 R_e' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e - $CO-NR_e' - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_b - $O-CO-N(R_e) - R_d$ - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e R_e' $N-CO-R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e R_e' $N-CO-NR_e'' - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、同一又は相異なり、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'' は、 R_e と同一の意味を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e R_e' $N-C(=NR_e''') - NR_e''' - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 、 R_e''' 及び R_e'''' は、同一又は相異なり、 R_e 、 R_e' 及び R_e''' は、前記と同一の意味を表し、 R_e'''' は、 R_e と同一の意味を表す。)、 R_b - $SO_2 - NR_e - R_d$ - 基 (R_b 、 R_e 及び R_d は、前記と同一の意味を表す。)、 R_e R_e' $N-SO_2 - R_d$ - 基 (R_e 、 R_e' 及び

R_d は、前記と同一の意味を表す。)、C2-C10アルケニル基又はC2-C10アルキニル基を表す。]である。

- (2) Y群: $M_b - R_d$ - 基 [M_b は、 M_c - 基 { M_c は、 $M_d - R_d'$ - 基 { M_d は、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいフェニル基、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいピリジル基、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)) で置換されてもよいナフチル基、(b) - 基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、(c) - 基 ((c) は、前記と同一の意味を表す。)、



- 10 (d) - 基 (l は、2、3又は4であり、 B_b は、オキシ基又はチオ基を表す。)) 又は



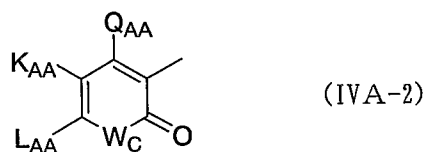
- (e) - 基 (l 及び B_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 R_d' は、 R_d と同一又は相異なり、 R_d と同一の意味を表す。} を表す。}、 $M_c - B_a$ - 基 (M_c 及び B_a は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - CO$ - 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - CO - O$ - 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - O - CO$ - 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - R_e - N$ - 基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - CO - NR_e$ - 基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - O - CO - NR_e$ - 基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - R_e - N - CO$ - 基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - R_e - N - CO - NR_e'$ - 基 (M_c 、 R_e 及び R_e' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - R_e - N - C(=NR_e') - NR_e''$ - 基 (M_c 、 R_e 、 R_e' 及び R_e'' は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - SO_2 - NR_e$ - 基 (M_c 及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)) 又は $M_c - R_e - N - SO_2$ - 基 (M_c

及び R_e は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 R_d は、前記と同一の意味を表す。]である。

- (3) Z群： $-Y_a'' = C(Y_a) - Y_a' -$ 基 (Y_a は、水素原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基を表し、 Y_a' は、オキシ基、又は、チオ基、又は、C1-C10アルキル基で置換されてもよいイミノ基を表し、 Y_a'' は、 $-N=$ 基又はメチン基を表す。)、C3-C10アルキレン基又は $-Y_b = Y_b' - Y_b'' = Y_b''' -$ 基 [Y_b 、 Y_b' 、 Y_b'' 及び Y_b''' は、同一又は相異なり、 $M_a -$ 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表す。]

で示される基、

式 (IVA-2)



[式中、

1. K_{AA} は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(IV-AA)-基 [(IV-AA)は、式(IV-AA)]



[式中、AAは、芳香族5員環又は芳香族6員環を表し、 Y_A 及びqは、前記と同一の意味を表し、qが2以上のとき、隣接している2個の同一又は相異なる Y_A は、 Z_0 群の基をなしてAA環と縮環してもよい。]

- で示される基を表す。]を表す。

2. L_{AA} は、水素原子、C1-C10アルキル基、(IV-AA)-基 ((IV-AA)は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC2-C10アルキル基、(IV-AA)-基 ((IV-AA)は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC4-C10アルケニル基、又は、(IV-AA)-基 ((IV-AA)は、前記と同一の意味を表す。)

で置換されてもよいC4-C10アルキニル基を表し、 K_{AA} と L_{AA} とは、単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基（ M_a は、前記と同一の意味を表す。）で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。

3. Q_{AA} は、

5 水素原子、又は、 Q_A -基

[Q_A は、

水酸基、(b)-基（(b)は、前記と同一の意味を表す。）

$A_9-B_6-B_c$ -基 [A_9 及び B_6 は、前記と同一の意味を表し、 B_c は、オキシ基又は $-N((O)_m R_1)$ -基（ m 及び R_1 は、前記と同一の意味を表す。）を表す。但し、 A_9 が水素原子のとき、 B_c は、スルホニル基ではない。]

$A_7''-SO_2-B_c$ -基（ A_7'' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。）

15 $A_8-SO_2-B_c$ -基（ A_8 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。）

$R_1 R_1' N-SO_2-B_c$ -基（ R_1 、 R_1' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。）

(b)- SO_2-B_c -基（(b)及び B_c は、前記と同一の意味を表す。）

20 $A_9'-B_c$ -基（ A_9' 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。）

$D_5-R_4-B_c$ -基（ D_5 、 R_4 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。）

$M_c-B_3-B_c$ -基（ M_c 、 B_3 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。）

又は

25 M_c-B_c -基（ M_c 及び B_c は、前記と同一の意味を表す。）

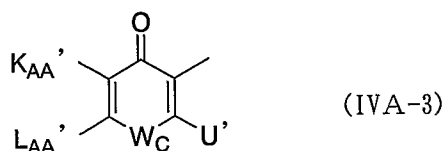
を表す。]

である。

4. W_c は、酸素原子又は

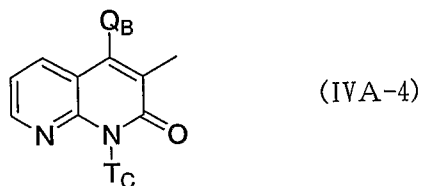
$-NT_c$ - 基 [T_c は、 A_9 ' - 基 (A_9 ' は、前記と同一の意味を表す。)
 $-D_5 - R_4$ - 基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c -
 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]
 である。]

5 示される基、
式(IVA-3)



10 [式中、 $K_{AA'}$ は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、(III-AA)-基（(III-AA)は、前記と同一の意味を表す。）を表し、 $L_{AA'}$ は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 $K_{AA'}$ と $L_{AA'}$ とは、C3-C10アルキレン基又は単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基（ M_a は、前記と同一の意味を表す。）で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 W_c は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、又は、
式(IVA-4)



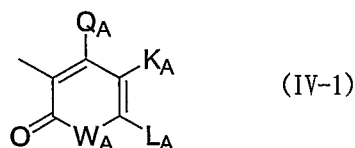
15 [式中、 T_c は、前記と同一の意味を表し、 Q_B は、水酸基、 $A_9 - B_6 - O$
 ー基 (A_9 及び B_6 は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_7' - SO_2 - O$
 ー基 (A_7' は、前記と同一の意味を表す。)、 $A_8 - SO_2 - O$ ー基 (A_8
 は、前記と同一の意味を表す。但し、 A_8 は水素原子とはならない。)、 R_1
 20 $R_1' - N - SO_2 - O$ ー基 (R_1 及び R_1' は、前記と同一の意味を表す。
)、 $(b) - SO_2 - O$ ー基 ((b) は、前記と同一の意味を表す。)、 A_9
 'ー基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 $D_5 - R_4 - O$ ー基 (D_5
 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)、 $M_c - B_3 - O$ ー基 (M_c 及

び B_3 は、前記と同一の意味を表す。) 又は M_c - O - 基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基を表す。

I I. B は、

5 式 (IV-1)



[式中、

(1) Q_A は、前記と同一の意味を表す。

(2) W_A は、酸素原子又は

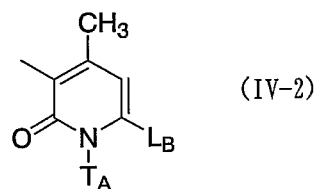
10 -N T_A -基 [T_A は、水素原子、 A_9' -基 (A_9' は、前記と同一の意味を表す。)、 D_5 - R_4 -基 (D_5 及び R_4 は、前記と同一の意味を表す。)
又は M_c -基 (M_c は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

である。

(3) K_A は、水素原子、ハロゲン原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 L_A は
15 、水素原子、C1-C10 アルキル基又は M_b -基 (M_b は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 K_A と L_A とは、C3-C10 アルキレン基、又は、単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよい C4-C10 アルケニレン基をなすことがある。]

で示される基、

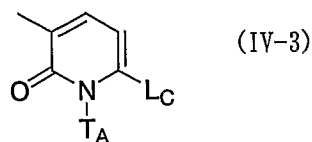
20 式 (IV-2)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表し、 L_B は水酸基又はメチル基を表す。]

で示される基、

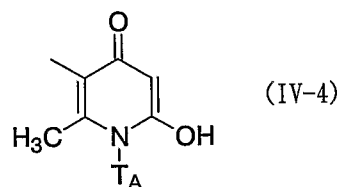
式 (IV-3)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表し、 L_C は、C1-C10アルキル基を表す。]

で示される基、

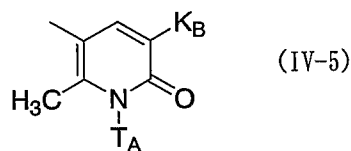
5 式 (IV-4)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

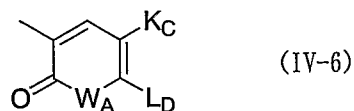
式 (IV-5)



10 [式中、 T_A は、前記と同一の意味を表し、 K_B は、シアノ基又は $UOCO-$ 基 (U は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。)を表す。]

で示される基、

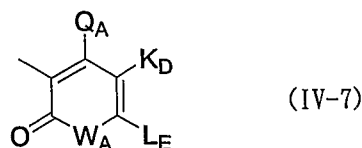
式 (IV-6)



15 [式中、 W_A は、前記と同一の意味を表し、 K_C と L_D とは、C3-C10アルキレン基又は単数又は同一又は相異なる複数の M_a -基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなす。]

で示される基、

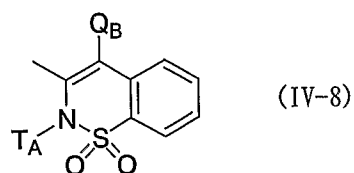
式 (IV-7)



[式中、 Q_A 及び W_A は、前記と同一の意味を表し、 K_D と L_E とは、 $-V_A = V_A'$ 、 $-V_A'' = V_A'''$ - 基 { V_A 、 V_A' 、 V_A'' 及び V_A''' } は、同一又は相異なり、 M_a - 基 (M_a は、前記と同一の意味を表す。) で置換されてもよいメチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、 V_A 、 V_A' 、 V_A'' 及び V_A''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。} をなす。]

で示される基、

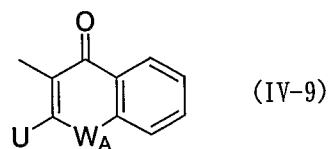
式 (IV-8)



[式中、 T_A 及び Q_B は、前記と同一の意味を表す。]

10 で示される基、

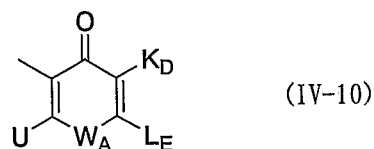
式 (IV-9)



[式中、 U 及び W_A は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

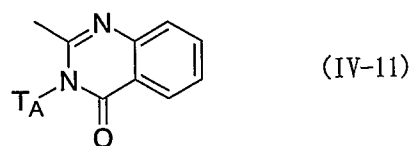
15 式 (IV-10)



[式中、 U 、 W_A 、 K_D 及び L_E は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

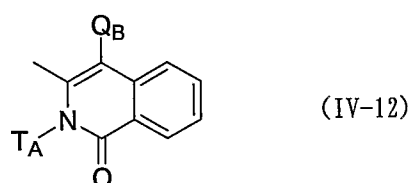
式 (IV-11)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

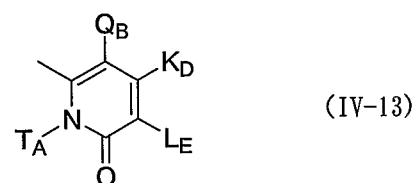
式 (IV-12)



5 [式中、 T_A 及び Q_B は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

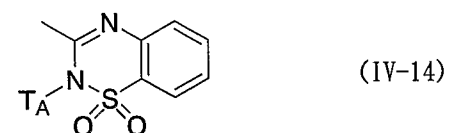
式 (IV-13)



[式中、 T_A 、 Q_B 、 K_D 及び L_E は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

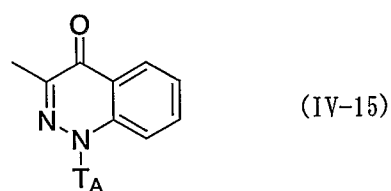
10 式 (IV-14)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

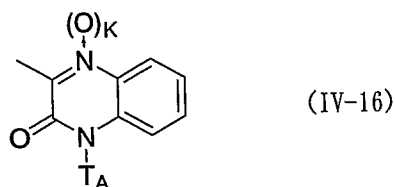
式 (IV-15)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

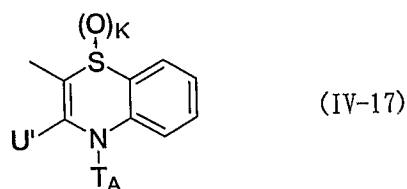
式(IV-16)



[式中、 T_A は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

5 5 で示される基、又は、

式(IV-17)



[式中、 T_A 、 U' 及び K は、前記と同一の意味を表す。]

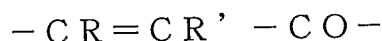
で示される基を表す。

I I I. $\phi - \gamma$ において、

10 ϕ は σ に結合する原子又は基を表し、 γ は、 B に結合する原子又は基を表し、

$\phi - \gamma$ は、

式 ($\phi \gamma - 1$)

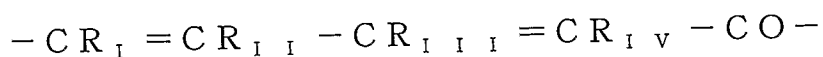


($\phi \gamma - 1$)

(式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表し、 R' は、
15 、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

で示される基、

式 ($\phi \gamma - 2$)



($\phi \gamma - 2$)

20 (式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び CR_{IV} は、同一又は相異なり、水素原子又は C1-C10 アルキル基を表す。)

で示される基、

式 (φ γ-3)



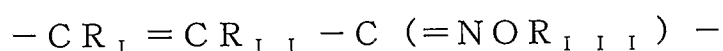
(φ γ-3)

[式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R'' - CO-$ 基 (R'' は、C1-C10アルキル基を表す。) 又は $R_{II} - O - C(=O) -$ 基 (R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

5

で示される基、

式 (φ γ-4)

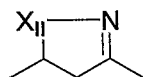


(φ γ-4)

(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (φ γ-5)

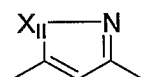


(φ γ-5)

[式中、 X_{II} は、オキシ基、 $-NR_I-$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

15 で示される基、

式 (φ γ-6)

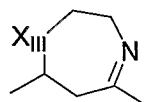


(φ γ-6)

(式中、 X_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ-7)

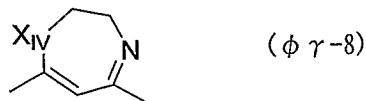


(φ γ-7)

20 [式中、 X_{III} は、オキシ基、チオ基、 $-NR_I-$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (φ γ-8)



[式中、 X_{Iv} は、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR''')$ 基 (R''' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。
] 前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

式 (φ γ-9)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

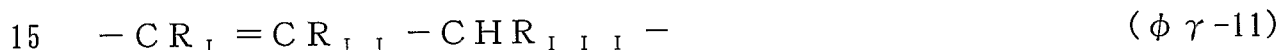
10 式 (φ γ-10)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

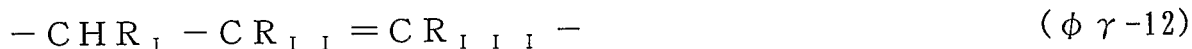
式 (φ γ-11)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

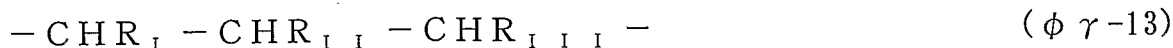
式 (φ γ-12)



20 (式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ-13)



(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

25 で示される基、

式 (φ γ-14)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

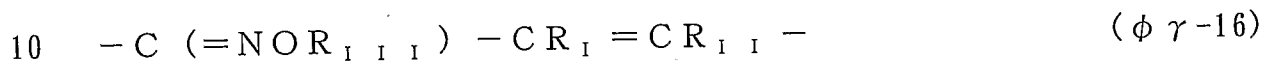
5 式 ($\phi\ \gamma-15$)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\ \gamma-16$)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\ \gamma-17$)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

15 で示される基、

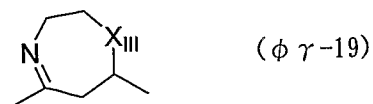
式 ($\phi\ \gamma-18$)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

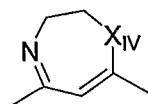
式 ($\phi\ \gamma-19$)



20 (式中、 $X_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\ \gamma-20$)



(φ γ-20)

(式中、X_{I V} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

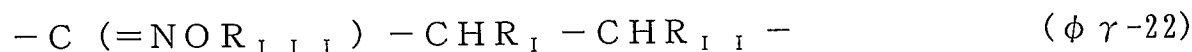
式 (φ γ-21)



5 (式中、R_I 及び R_{I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ-22)



(式中、R_I、R_{I I} 及び R_{I I I} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (φ γ-23)



で示される基、

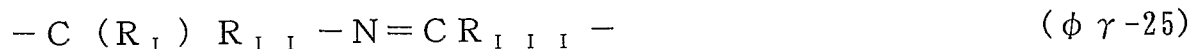
式 (φ γ-24)



(式中、R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ-25)



20 (式中、R_I、R_{I I} 及び R_{I I I} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (φ γ-26)



(式中、R_I は、前記と同一の意味を表す。)

25 で示される基、

式 (φ γ-27)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

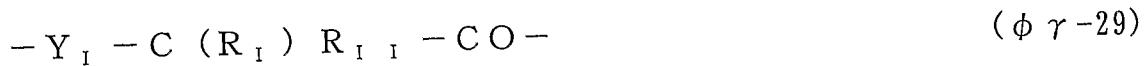
式 ($\phi\gamma-28$)



(式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 ($\phi\gamma-29$)



10 (式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

で示される基、

式 ($\phi\gamma-30$)



15 で示される基を表す。

式 ($\phi\gamma-31$)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

20 式 ($\phi\gamma-32$)



[式中、 Y_{II} は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I$ 基 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

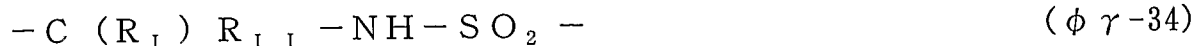
25 式 ($\phi\gamma-33$)



(式中、 R'' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

式 (φ γ-34)



(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基を表す。

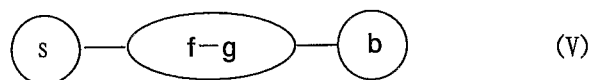
5 但し、 p 及び q が同時に 0 になることはない。

尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択肢の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっ

10 ていてもよいことを意味するものである。]

で示される含複素環化合物。

5. 式 (V)



15 [式中、

I. s は、

式 (Va-1)



[式中、 a は、ベンゼン環、ピリジン環、チオフェン環、フラン環、ピロール環、ピラゾール環、1, 2, 3-トリアゾール環、テトラゾール環、イソオキサゾール環、チアゾール環、ピリダジン環又はピリミジン環を表し、 X_a は、シアノ基で置換されたC1-C10アルキル基、又は、テトラヒドロピラン-4-イリデン基で置換されたC1-C10アルキル基、又は、ハロゲン原子若しくはシアノ基で置換されたC2-C10アルケニル基、又は、C1-C10アルコキシカルボニル基で

20

置換されたC2-C10アルケニル基、又は、ヒドロキシ基で置換されたC3-C10アルキニル基、又は、 $a_0 - r_1 - b - r_1'$ - 基 { a_0 は、C1-C10アルキルチオ基で置換されたメチル基、C1-C10アルキルスルフィニル基で置換されたメチル基、C1-C10アルキルスルホニル基で置換されたメチル基、C2-C10アルケニル基、C2-C10アルキニル基、 $r_2 O - CO$ - 基 (r_2 は、C1-C10アルキル基又は水

5 酸基で置換されたC2-C10アルキル基を表す。)、カルボキシ基、 $rr' N - CO$ - 基 (r 及び r' は、同一又は相異なり、水素原子又はC1-C10アルキル基を表す。)、 $a_1 - NH - CO$ - 基 (a_1 は、C1-C10アルコキシ基で置換されたC2-C10アルキル基を表す。)、 $a_1' - CO$ - 基 (a_1' は、モルホリノ基を表す。)、 $rr' N - CH_2$ - 基 (r 及び r' は、前記と同一の意味を表す。)

10)、 $r_0 - (O)_1 - CONH - CH_2$ - 基 (r_0 は、C1-C10アルキル基を表し、 1 は0又は1を表す。)、 $r - OCH_2$ - 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)、 $r_0 - CO$ - 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。)、シアノ基又はスルホメチル基を表し、 r_1 は、C1-C10アルキレン基を表し、 r_1' は、

15 単結合又はC1-C10アルキレン基を表し、 b は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基、スルホニル基又はメチル基で置換されてもよいイミノ基を表す。}、又は、 $a_2 - y - CO - NH$ - 基 (a_2 は、C1-C10アルコキシ基で置換されたC2-C10アルキル基を表し、 y は、オキシ基又はイミノ基を表す。)、又は、 $r O - COCO - NH$ - 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $a_3 - z - NH$ - 基 (a_3 は、C2-C10アルケニル基、又は、C1-C10アルコキシ基、C1-C10アルコキシカルボニル基、カルボキシ基若しくはシアノ基で置換されたC1-C10アルキル基を表し、 z は、カルボニル基又はスルホニル基を表す。)、

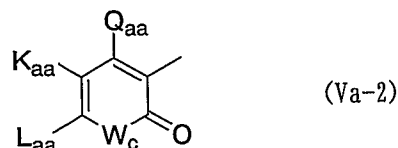
20 又は、 $a_4 - Nr' CO$ - 基 { a_4 は、C1-C10アルコキシ基、又は、C3-C10アルケニルオキシ基、又は、 $r_0 - SO_2$ - 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、水酸基若しくはC1-C10アルコキシ基で置換されたC2-C10アルキル基、又は、 $r_0 r_0' N$ - 基 (r_0 は、前記と同一の意味を表し、 r_0' は、 r_0 と同一又は相異なり、 r_0 と同一の意味を表す。)} で置換されたC2-C10アルキル基、又は、 $r O - CO$ - 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)

25

- 、シアノ基若しくはアミノカルボニル基で置換されたC1-C10アルキル基、又は、 $rO-CO-(rO-COCH_2)CH$ -基 (r は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 r' は、前記と同一の意味を表す。}、又は、 a_5-NHSO_2 -基 (a_5 は、C1-C10アルコキシ基で置換されたC2-C10アルキル基を表す。
- 5)、又は、 $r_0ON=CH$ -基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $r_0NHCSNH$ -基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $r_0NHC(-Sr_0')=N$ -基 (r_0 及び r_0' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $(rO)_2P(=O)CH_2$ -基 (r は、前記と同一の意味を表す。)を表し、 p は、0、1、2又は3を表し、 p が2以上のとき、 X_a は、
- 10 同一又は相異なり、
- Y_a は、ハロゲン原子、又は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C1-C10アルコキシ基で置換されてもよいC1-C10アルキル基、又は、C2-C10アルケニル基、又は、C2-C10アルキニル基、又は、2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル基、又は、[1,3]ジオキサラン-2-イル基、又は、
- 15 モルホリノ基で置換されたC1-C10アルコキシ基、又は、 $a_0'-b'$ -基 (a_0' は、ハロゲン原子で置換されてもよいC1-C10アルキル基を表し、 b' は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)、又は、ニトロ基、又は、シアノ基、又は、 $rO-CO$ -基 (r は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $r_0r_0'N$ -基 (r_0 及び r_0' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 r_0CO-NH -基 (r_0 は、前記と同一の意味を表す。)、
- 20 又は、 $r_0r_0'NCONH$ -基 (r_0 及び r_0' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、 $rr'NCO$ -基 (r 及び r' は、前記と同一の意味を表す。)、又は、水酸基を表し、 q は、0、1、2又は3を表し、 q が2以上のとき、 Y_a は、同一又は相異なり、 q が2以上のとき、隣接している Y_a は、 a 環と縮環して4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン環をなしてもよい。]
- 25

で示される基、

式(Va-2)



[式中、

1. K_{aa} は、水素原子、ハロゲン原子、又は、(V-aa)-基

[(V-aa)は、式(V-aa)



5 [式中、aaは、チオフェン環、フラン環、ピロール環、チアゾール環、ベンゼン環又はピリジン環を表し、 Y_a 及びqは、前記と同一の意味を表す。]で示される基を表す。]

2. L_{aa} は、水素原子、C1-C10アルキル基、(V-aa)-基 ((V-aa)は、前記と同一の意味を表す。)で置換されたC2-C10アルキル基、(V-aa)-基 ((V-aa)は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC4-C10アルケニル基、又は、(V-aa)-基 ((V-aa)は、前記と同一の意味を表す。)で置換されてもよいC4-C10アルキニル基を表し、 K_{aa} と L_{aa} とは、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがある。

15 3. Q_{aa} は、水素原子、 r_a-O- 基 { r_a は、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10アルキニル基、又は、 $r_o r_o' N-CH_2-$ 基 (r_o 及び r_o' は、前記と同一の意味を表す。)、 $r OCH_2-$ 基 (r は、前記と同一の意味を表す。)、 r_o-CO- 基 (r_o は、前記と同一の意味を表す。)、C1-C10アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、アミノカルボニル基若しくはシアノ基で置換されたC1-C10アルキル基、又は、 r_3-r_1- 基 (r_3 は、フェニル基又はピリジル基を表し、 r_1 は、C1-C10アルキレン基を表す。)を表す。}、又は、ピペリジノ基、又は、モルホリノ基、又は、 $r_4 r_4' N-$ 基 (r_4 及び r_4' は、同一又は相異なり、水素原子、又は、C1-C10アルキル基、又は、C3-C10アルケニル基、又は、C3-C10

20

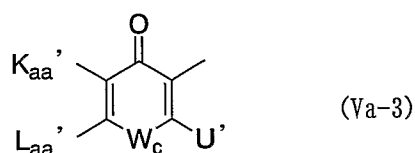
アルキニル基、又は、C1-C10アルコキシ基で置換されたC2-C10アルキル基を表す。但し、同時に水素原子となることはない。)である。

4. W_c は、酸素原子又は $-NT_c-$ 基 [T_c は、 r_b - 基 (r_b は、 r_a と同一又は相異なり、 r_a と同一の意味を表す。) 又は r_3' - 基 (r_3' は、

5 r_3 と同一又は相異なり、 r_3 と同一の意味を表す。) を表す。但し、水素原子となることはない。] である。]

で示される基、

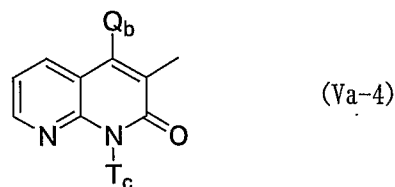
式 (Va-3)



10 [式中、 K_{aa}' は、水素原子、C1-C10アルキル基、又は、(V-a a)-基 (V-a a) は、前記と同一の意味を表す。) を表し、 L_{aa}' は、水素原子又はC1-C10アルキル基を表し、 K_{aa}' と L_{aa}' とは、ハロゲン原子、C1-C10アルキル基、C1-C10アルコキシ基若しくはニトロ基で置換されてもよいC4-C10アルケニレン基をなすことがあり、 U' は、水素原子又はメチル基を表し、 W_c は、前記と同一の意味を表す。]

15 で示される基、又は、

式 (Va-4)

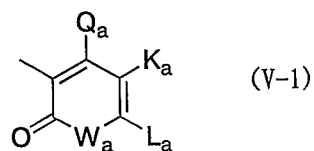


[式中、 T_c は、前記と同一の意味を表し、 Q_b は、 r_a - O - 基 (r_a は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基を表す。

20 I I. b は、

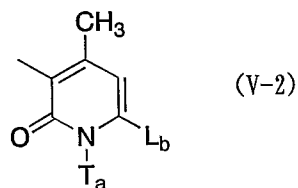
式 (V-1)



5 [式中、 Q_a は、 r_a -O-基（ r_a は、前記と同一の意味を表す。）、又は、ピペリジノ基、又は、モルホリノ基、又は、 r_4 r_4' N-基（ r_4 及び r_4' は、前記と同一の意味を表す。）を表し、 W_a は、酸素原子又は $-NT_a$ 一基 [T_a は、 r_b -基（ r_b は、 r_a と同一又は相異なり、 r_a と同一の意味を表す。）又は r_3' -基（ r_3' は、 r_3 と同一又は相異なり、 r_3 と同一の意味を表す。）を表す。] を表し、 K_a は、水素原子、ハロゲン原子又は C1-C10アルキル基を表し、 L_a は、水素原子又は C1-C10アルキル基を表し、 K_a と L_a とは、C3-C10アルキレン基又は 1, 3-ブタジエニレン基をなすことがある。]

10 で示される基、

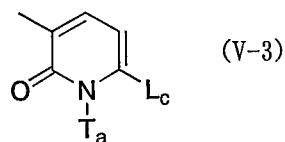
式 (V-2)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表し、 L_b は水酸基又はメチル基を表す。]

で示される基、

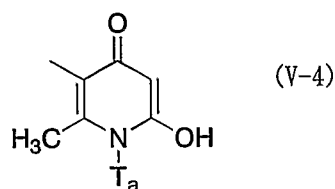
15 式 (V-3)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表し、 L_c は、C1-C10アルキル基を表す。]

で示される基、

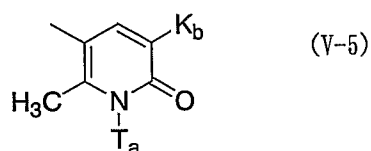
式 (V-4)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

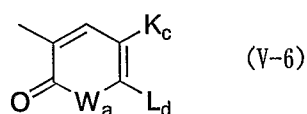
式 (V-5)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表し、 K_b は、シアノ基又は $UOCO-$ 基 (U は、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表す。) を表す。]

で示される基、

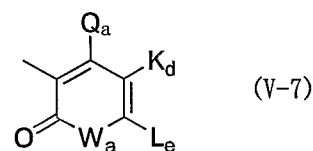
式 (V-6)



[式中、 W_a は、前記と同一の意味を表し、 K_c と L_d とは、 $C3-C10$ アルキレン基又は $C4-C10$ アルケニレン基をなす。]

で示される基、

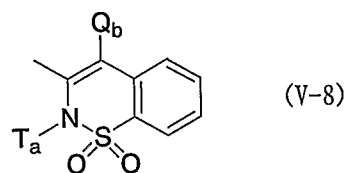
式 (V-7)



[式中、 Q_a 及び W_a は、前記と同一の意味を表し、 K_d と L_e とは、 $-V_a = V_a' - V_a'' = V_a''' -$ 基 (V_a 、 V_a' 、 V_a'' 及び V_a''' は、同一又は相異なり、メチン基、又は、 $-N=$ 基を表し、 V_a 、 V_a' 、 V_a'' 及び V_a''' のうち少なくとも一つは $-N=$ 基を表す。) をなす。]

で示される基、

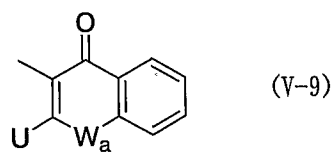
式 (V-8)



[式中、 T_a 及び Q_b は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、又は、

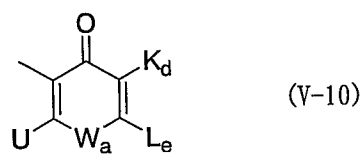
式 (V-9)



[式中、 U 及び W_a は、前記と同一の意味を表す。]

5 で示される基、

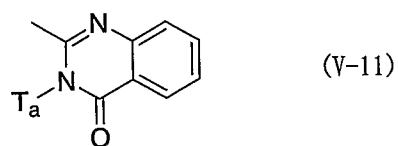
式 (V-10)



[式中、 U 、 W_a 、 K_d 及び L_e は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

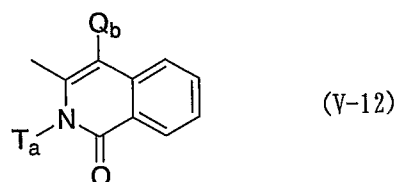
10 式 (V-11)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

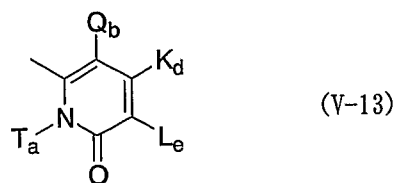
式 (V-12)



15 [式中、 T_a 及び Q_b は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

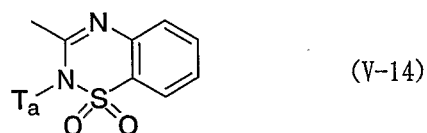
式 (V-13)



[式中、 T_a 、 Q_b 、 K_d 及び L_e は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

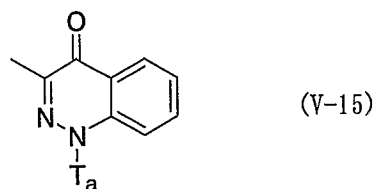
5 式 (V-14)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基、

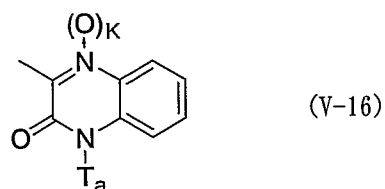
式 (V-15)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表す。]

10 で示される基、

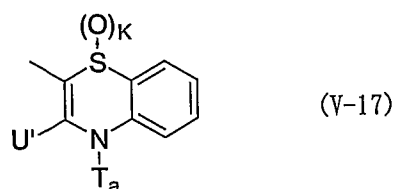
式 (V-16)



[式中、 T_a は、前記と同一の意味を表し、 K は、0 又は 1 を表す。]

で示される基、又は、

式 (V-17)



[式中、 T_a 及び K は、前記と同一の意味を表し、 U' は、前記と同一の意味を表す。]

で示される基を表す。

I I I. $f-g$ において、

- 5 f は s に結合する原子又は基を表し、 g は、 b に結合する原子又は基を表し、 $f-g$ は、

式 ($f-g-1$)



- 10 (式中、 R は、ハロゲン原子、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表し、 R' は、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表す。但し、 R 及び R' が、同時に水素原子となることはない。)

で示される基、

式 ($f-g-2$)



- 15 (式中、 R_I 、 R_{II} 、 R_{III} 及び CR_{IV} は、同一又は相異なり、水素原子又は $C1-C10$ アルキル基を表す。)

で示される基、

式 ($f-g-3$)



- 20 [式中、 R_I は、前記と同一の意味を表し、 X_I は、 $R''-CO-$ 基 (R'' は、 $C1-C10$ アルキル基を表す。) 又は $R_{II}-O-C(=O)-$ 基 (R_{II} は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 ($f-g-4$)

- 25 $-CR_I=CR_{II}-C(=NOR_{III})- \quad (f-g-4)$

(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (f g-5)



5 [式中、 $X_{I\ I}$ は、オキシ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

で示される基、

式 (f g-6)



(式中、 $X_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

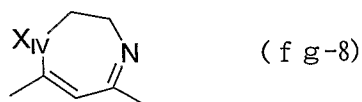
式 (f g-7)



[式中、 $X_{I\ I\ I}$ は、オキシ基、チオ基、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

15 で示される基、

式 (f g-8)



[式中、 $X_{I\ V}$ は、 $-NR_I$ 基 (R_I は、前記と同一の意味を表す。) 又は $-N(-COR'')$ 基 (R'' は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]
前記と同一の意味を表す。]

20 で示される基、

式 (f g-9)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

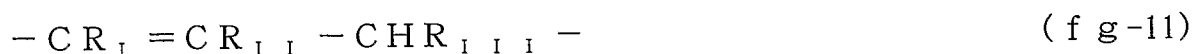
式 (f g-10)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

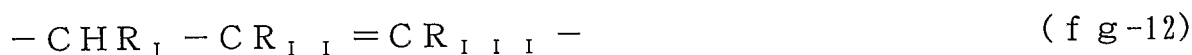
で示される基、

式 (f g-11)



で示される基、

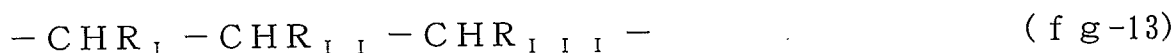
式 (f g-12)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

15 　で示される基、

式 (f g-13)



(式中、 R_I 、 $R_{I\ I}$ 及び $R_{I\ I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

20 　式 (f g-14)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表すし、 Y_I は、オキシ基、チオ基、スルフィニル基又はスルホニル基を表す。)

で示される基、

25 　式 (f g-15)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (f g-16)

(式中、 R_I 、 R_{II} 及び R_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

5 式 (f g-17)

(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (f g-18)

(式中、 X_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

10 で示される基、

式 (f g-19)

(式中、 X_{III} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (f g-20)

15 (式中、 X_{IV} は、前記と同一の意味を表す。)

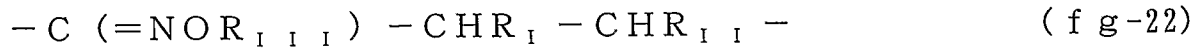
で示される基、

式 (f g-21)

(式中、 R_I 及び R_{II} は、前記と同一の意味を表す。)

20 で示される基、

式 (f g-22)



(式中、 R_1 、 R_{11} 及び R_{111} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (fg-23)



で示される基、

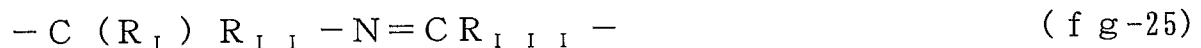
式 (fg-24)



(式中、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)

10 　で示される基、

式 (fg-25)



(式中、 R_1 、 R_{11} 及び R_{111} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

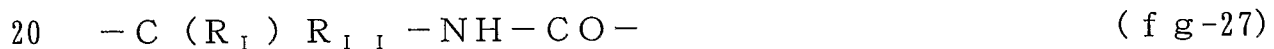
15 　式 (fg-26)



(式中、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (fg-27)



(式中、 R_1 及び R_{11} は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

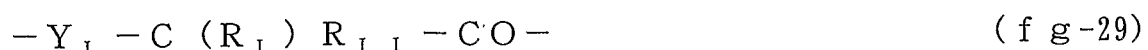
式 (fg-28)



25 　(式中、 R_1 は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、

式 (fg-29)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表し、 Y_I は、前記と同一の意味を表す)

で示される基、

式 (f g-30)



で示される基を表す。

式 (f g-31)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

10 　で示される基、

式 (f g-32)



[式中、 $Y_{I\ I}$ は、オキシ基、チオ基、又は、 $-NR_I-$ 基 (式中、 R_I は、前記と同一の意味を表す。) を表す。]

15 　で示される基、

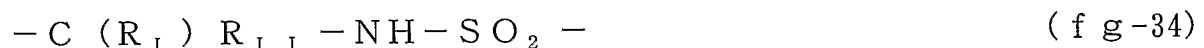
式 (f g-33)



(式中、 R'' は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基、又は、

20 　式 (f g-34)



(式中、 R_I 及び $R_{I\ I}$ は、前記と同一の意味を表す。)

で示される基を表す。

但し、 p 及び q が同時に 0 になることはない。

25 　尚、複数の置換基の間での同一記号における「前記と同一の意味を表す」とは、当該複数の置換基が互いに独立しながら前記と同一の意味を表すことを示し、当該複数の置換基の間では、選ばれる置換基の選択枝の範囲が同一であるが、その範囲内で選ばれる限り当該選ばれる置換基は同じであっても、異なっ

ていてもよいことを意味するものである。]

で示される含複素環化合物。

- 5 6. 請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする細胞外マトリックス遺伝子転写抑制組成物。

7. 請求項 5 記載の含複素環化合物と不活性担体とを含有することを特徴とする細胞外マトリックス遺伝子転写抑制組成物。

- 10 8. 細胞外マトリックス遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物の使用。

9. 細胞外マトリックス遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物の使用。

- 15 10. 細胞外マトリックス遺伝子の転写を抑制するための有効成分としての、請求項 5 記載の含複素環化合物の使用。

- 20 11. 細胞外マトリックス遺伝子の発現量を減少させて細胞外マトリックス蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための有効成分としての、請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物の使用。

- 25 12. 細胞外マトリックス遺伝子の発現量を減少させて細胞外マトリックス蓄積量の低下を導くことにより組織の線維化を改善するための有効成分としての、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物の使用。

13. 有効量の、請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環

化合物を、組織の線維化を改善させる処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする組織線維化改善方法。

1 4. 有効量の請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物を、組織の線維化を改善さ
5 せる処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする組織線維化改善方法。

1 5. 請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物、又は、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物と、不活性担体とを含有することを特
10 徴とする慢性腎不全治療剤。

1 6. 慢性腎不全を治療するための有効成分としての、請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物、又は、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物の使用。

15 1 7. 有効量の、請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物、又は、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物を、慢性腎不全治療処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする慢性腎不全治療方法。

20 1 8. 請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物、又は、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物と、不活性担体とを含有することを特徴とする心不全治療剤。

1 9. 心不全を治療するための有効成分としての、請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物、又は、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環
25 化合物の使用。

2 0. 有効量の、請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環

化合物、又は、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物を、心不全治療処置を必要とする哺乳動物患者に投与することを特徴とする心不全治療方法。

2 1. 請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物と不
5 活性担体とを含有することを特徴とする TGF- β 作用抑制組成物。

2 2. 請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物と不活性担体とを含有することを特
徴とする TGF- β 作用抑制組成物。

10 2 3. TGF- β の作用を抑制するための有効成分としての、請求項 1 記載の
組成物に有効成分として含有される含複素環化合物の使用。

2 4. TGF- β の作用を抑制するための有効成分としての、請求項 2 ～ 5 記
載の含複素環化合物の使用。

15 2 5. 請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環化合物、又
は、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物と、不活性担体とを含有することを特
徴とする養毛組成物。

20 2 6. TGF- β による毛髪退行期への移行促進を阻害して毛髪成長期の延長
を導くことにより養毛効果を得るための有効成分としての、請求項 1 記載の組
成物に有効成分として含有される含複素環化合物、又は、請求項 2 ～ 5 記載の
含複素環化合物の使用。

25 2 7. 有効量の、請求項 1 記載の組成物に有効成分として含有される含複素環
化合物、又は、請求項 2 ～ 5 記載の含複素環化合物を、養毛処置を必要とする
哺乳動物患者に投与することを特徴とする養毛方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/060746

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D213/69(2006.01)i, A61K8/49(2006.01)i, A61K31/366(2006.01)i,
A61K31/4412(2006.01)i, A61K31/4704(2006.01)i, A61K31/473(2006.01)i,
A61P9/04(2006.01)i, A61P13/12(2006.01)i, A61P17/14(2006.01)i,
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)

C07D213/69, C07D213/82, C07D215/22, C07D215/38, C07D219/06, C07D309/36,
A61K8/49, A61K31/366, A61K31/4412, A61K31/4704, A61K31/473

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)

REGISTRY/Caplus/MEDLINE (STN), WPI

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2005/028441 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 31 March, 2005 (31.03.05), Full text & EP 1671950 A1 & JP 2006-104061 A	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27
X	WO 2005/028463 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 31 March, 2005 (31.03.05), Full text & EP 1671961 A1 & JP 2006-104063 A	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27

☒ 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
15 August, 2007 (15.08.07)

Date of mailing of the international search report
28 August, 2007 (28.08.07)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/060746

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2005/028439 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 31 March, 2005 (31.03.05), Full text & EP 1671948 A1 & JP 2006-211680 A & US 2006/0211680 A1	1-7,15,18, 21,22,25,27
X	WO 03/080592 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 02 October, 2003 (02.10.03), Full text & JP 2004-175780 A	1-7,15,18, 21,22,25,27
P,X	WO 2006/093336 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 08 September, 2006 (08.09.06), Full text & JP 2006-241045 A	1-7,15,18, 21,22,25,27
P,X	WO 2006/093339 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 08 September, 2006 (08.09.06), Full text & JP 2006-273848 A	1-7,15,18, 21,22,25,27
P,X	WO 2006/100922 A1 (Sumitomo Chemical Co., Ltd.), 28 September, 2006 (28.09.06), Full text & JP 2006-273847 A	1-7,15,18, 21,22,25,27

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/060746

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

A61P43/00(2006.01)i, A61Q7/00(2006.01)i, C07D213/82(2006.01)i,
C07D215/22(2006.01)i, C07D215/38(2006.01)i, C07D219/06(2006.01)i,
C07D309/36(2006.01)i

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national
classification and IPC)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/060746

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. ☒ Claims Nos.: (See extra sheet.)
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Claims 8 to 14, 16, 17, 19, 20, 23, 24 and 26 are relevant to methods for treatment of the human body or animal body by therapy under the provisions of the PCT Rule 39.1(iv).
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.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2007/060746

Continuation of Box No.II-1 of continuation of first sheet (2)

Claims 8 to 14, 16, 17, 19, 20, 23, 24, 26

<Subject of search>

In claims 1 and 2, there is an expression "a substituent not belonging to the following groups X_0 , Y_0 and Z_0 " as the variable symbol X_α . However, the expression is unclear as to what types of structures the variable symbol X_α includes, even when the statements in the description are investigated. Therefore, the expression makes the scopes of the medical use inventions and the compound inventions of the present application unclear.

Such being the case, in this international search report, a prior art search was made for chemical substances specifically disclosed in the description.

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（I P C））

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（I P C））

Int.Cl. C07D213/69, C07D213/82, C07D215/22, C07D215/38, C07D219/06, C07D309/36, A61K8/49, A61K31/366, A61K31/4412, A61K31/4704, A61K31/473

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）

REGISTRY/Caplus/MEDLINE (STN), WPI

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 2005/028441 A1（住友化学株式会社）2005.03.31, 文献全体 & EP 1671950 A1 & JP 2006-104061 A	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27
X	WO 2005/028463 A1（住友化学株式会社）2005.03.31, 文献全体 & EP 1671961 A1 & JP 2006-104063 A	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27
X	WO 2005/028439 A1（住友化学株式会社）2005.03.31, 文献全体 & EP 1671948 A1 & JP 2006-211680 A & US 2006/0211680 A1	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27

☒ 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

15.08.2007

国際調査報告の発送日

28.08.2007

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁（I S A/J P）
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）

大宅 郁治

4C

8829

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) . 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 03/080592 A1 (住友化学株式会社) 2003. 10. 02, 文献全体 & JP 2004-175780 A	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27
P, X	WO 2006/093336 A1 (住友化学株式会社) 2006. 09. 08, 文献全体 & JP 2006-241045 A	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27
P, X	WO 2006/093339 A1 (住友化学株式会社) 2006. 09. 08, 文献全体 & JP 2006-273848 A	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27
P, X	WO 2006/100922 A1 (住友化学株式会社) 2006. 09. 28, 文献全体 & JP 2006-273847 A	1-7, 15, 18, 21, 22, 25, 27

発明の属する分野の分類

C07D213/69(2006.01)i, A61K8/49(2006.01)i, A61K31/366(2006.01)i,
A61K31/4412(2006.01)i, A61K31/4704(2006.01)i, A61K31/473(2006.01)i,
A61P9/04(2006.01)i, A61P13/12(2006.01)i, A61P17/14(2006.01)i, A61P43/00(2006.01)i,
A61Q7/00(2006.01)i, C07D213/82(2006.01)i, C07D215/22(2006.01)i,
C07D215/38(2006.01)i, C07D219/06(2006.01)i, C07D309/36(2006.01)i

(第 II 欄 1. の続き)

8-14, 16, 17, 19, 20, 23, 24, 26

<調査の対象について>

請求の範囲 1 及び 2 は、 X_a として「下記の X_0 群、 Y_0 群及び Z_0 群に属さない置換基」と記載されているが、明細書の記載を検討しても、当該 X_a が如何なる構造のものまでを包含するものなのか明確であるということができないので、本願医薬用途発明及び化合物発明の範囲を不明確とするものである。

よって、この国際調査報告では、明細書に具体的に記載された化学物質に基づいて先行技術調査を行った。

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（P C T 17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（特別ページ参照）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8-14, 16, 17, 19, 20, 23, 24及び26は、P C T 規則39.1(iv)に規定の治療による人体又は動物の体の処置方法に該当する。
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P C T 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ろ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。