

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第4785677号
(P4785677)

(45) 発行日 平成23年10月5日 (2011. 10. 5)

(24) 登録日 平成23年7月22日 (2011. 7. 22)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 333/72 (2006. 01)

C O 7 D 333/72 C S P

C O 7 D 409/12 (2006. 01)

C O 7 D 409/12

C O 7 D 417/12 (2006. 01)

C O 7 D 417/12

C O 7 D 413/12 (2006. 01)

C O 7 D 413/12

C O 7 D 409/14 (2006. 01)

C O 7 D 409/14

請求項の数 16 (全 452 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2006-235401 (P2006-235401)

(22) 出願日 平成18年8月31日 (2006. 8. 31)

(65) 公開番号 特開2007-91733 (P2007-91733A)

(43) 公開日 平成19年4月12日 (2007. 4. 12)

審査請求日 平成20年1月31日 (2008. 1. 31)

(31) 優先権主張番号 特願2005-251055 (P2005-251055)

(32) 優先日 平成17年8月31日 (2005. 8. 31)

(33) 優先権主張国 日本国 (JP)

(73) 特許権者 000206956

大塚製薬株式会社

東京都千代田区神田司町2丁目9番地

(74) 代理人 100065215

弁理士 三枝 英二

(74) 代理人 100076510

弁理士 掛樋 悠路

(74) 代理人 100086427

弁理士 小原 健志

(72) 発明者 山下 博司

徳島県徳島市川内町加賀須野463-10

大塚製薬株式会社内

(72) 発明者 松原 淳

徳島県徳島市川内町平石夷野224-18

大塚製薬株式会社内

最終頁に続く

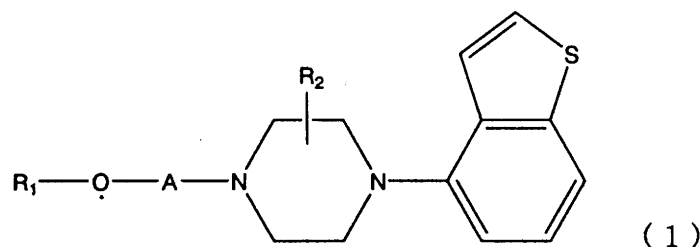
(54) 【発明の名称】 複素環化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1)：

【化1】

〔式中、R₂は、水素又は低級アルキル基を示す。〕

Aは低級アルキレン基又は低級アルケニレン基を示す。

R₁は以下の基(I)～(IV)からなる群から選ばれたシクロC3-C8アルキル基、芳香環基又は複素環基を示す：

(I) シクロC3-C8アルキル基、

(II) フェニル基、ナフチル基、ジヒドロインデニル基及びテトラヒドロナフチル基からなる群から選ばれた芳香環基、

(III) 窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有する飽和

又は不飽和複素単環基、

(IV) [1] テトラヒドロキノキサリニル基、[2] テトラヒドロキナゾリニル基、[3] ジヒドロキナゾリニル基、[4] インドリニル基、[5] インドリル基、[6] イソインドリニル基、[7] ベンゾイミダゾリニル基、[8] ジヒドロベンゾイミダゾリル基、[9] テトラヒドロベンゾアゼピニル基、[10] テトラヒドロベンゾジアゼピニル基、[11] ヘキサヒドロベンゾアゾシニル基、[12] ジヒドロベンゾオキサジニル基、[13] ジヒドロベンゾオキサゾリル基、[14] ベンゾイソキサゾリル基、[15] ベンゾオキサジアゾリル基、[16] テトラヒドロベンゾオキサゼピニル基、[17] ジヒドロベンゾチアジニル基、[18] ベンゾチアゾリル基、[19] ベンゾオキサチオリル基、[20] クロメニル基、[21] ジヒドロベンゾフリル基、[22] カルバゾリル基、[23] ジベンゾフリル基及び[24] キノキサリニル基からなる群より選ばれた窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有するベンゼン縮合複素環基、

10

ここで、上記 R_1 で示されるシクロC3-C8アルキル基、芳香環及び複素環上には、下記(1)～(66)からなる群から選ばれた少なくとも1つの基が置換していてもよい：

- (1) 低級アルキル基、
- (2) 低級アルケニル基、
- (3) ハロゲン置換低級アルキル基、
- (4) 低級アルコキシ基、
- (5) アリールオキシ基、
- (6) 低級アルキルチオ基、
- (7) ハロゲン置換低級アルコキシ基、
- (8) ヒドロキシ基、
- (9) 保護されたヒドロキシ基、
- (10) ヒドロキシ低級アルキル基、
- (11) 保護されたヒドロキシ低級アルキル基、
- (12) ハロゲン、
- (13) シアノ基、
- (14) アリール基、
- (15) ニトロ基、
- (16) アミノ基、

20

(17) 置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を有するアミノ基、

30

- (18) 低級アルカノイル基、
- (19) アリール基上に低級アルキル基を有していてもよいアリールスルホニル基、
- (20) カルボキシ基、
- (21) 低級アルコキシカルボニル基、
- (22) カルボキシ低級アルキル基、
- (23) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- (24) 低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基、
- (25) カルボキシ低級アルケニル基、
- (26) 低級アルコキシカルボニル低級アルケニル基、
- (27) 置換基として低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル低級アルケニル基、
- (28) 以下の基(i)-(lxxviii)からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいカルバモイル基：

40

- (i) 低級アルキル基、
- (ii) 低級アルコキシ基、

50

- (iii) ヒドロキシ低級アルキル基、
(iv) 低級アルコキシ低級アルキル基、
(v) アリールオキシ低級アルキル基、
(vi) ハロゲン置換低級アルキル基、
(vii) 低級アルキル基、低級アルカノイル基、アロイル基及びカルバモイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ低級アルキル基、
(viii) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシカルボニル基及びフェニル低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいシクロC3-C8アルキル基、
(ix) シクロC3-C8アルキル置換低級アルキル基、
(x) 低級アルケニル基、
(xi) 置換基として低級アルキル基、低級アルキル基を有していてもよいフェニル基及び低級アルコキシ基を有していてもよいフェニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、
(xii) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
(xiii) フリル低級アルキル基（フリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、
(xiv) テトラヒドロフリル低級アルキル基、
(xv) 1,3-ジオキサニル低級アルキル基、
(xvi) テトラヒドロピラニル低級アルキル基、
(xvii) ピロリル低級アルキル基（ピロリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、
(xviii) オキソ基を有していてもよいジヒドロピラゾリル基で置換された低級アルキル基、
(xix) ピラゾリル低級アルキル基（ピラゾリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、
(xx) イミダゾリル低級アルキル基、
(xxi) ピリジル低級アルキル基、
(xxii) ピラジニル低級アルキル基（ピラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、
(xxiii) ピロリジニル低級アルキル基（ピロリジニル基上には、オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、
(xxiv) ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、ベンゾイル基及び低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、
(xxv) ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、
(xxvi) モルホリニル低級アルキル基、
(xxvii) チエニル低級アルキル基（チエニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、
(xxviii) チアゾリル低級アルキル基、
(xxix) ジヒドロベンゾフリル低級アルキル基、
(xxx) ベンゾピラニル低級アルキル基（ベンゾピラニル基上にはオキソ基が置換していてもよい）、
(xxxi) ベンズイミダゾリル低級アルキル基、
(xxxii) 低級アルキル基上に、低級アルコキシカルボニル基を有していてもよいインドリル低級アルキル基、
(xxxiii) 低級アルキル基上に、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた置換基を有するイミダゾリル低級アルキル基、
(xxxiv) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピリジル基、

10

20

30

40

50

(xxxv)置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピロリジニル基、

(xxxvi)置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及び低級アルキル基及びハロゲンからなる群から選ばれた基を有していてもよいアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペリジル基、

(xxxvii)オキソ基を有していてもよいテトラヒドロフリル基、

(xxxviii)オキソ基を有していてもよいヘキサヒドロアゼピニル基、

(xxxix)置換基として低級アルキル基、アリール基及びフリル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピラゾリル基、

(xl)チアゾリル基、

(xli)低級アルキル基を有していてもよいチアジアゾリル基、

(xlii)低級アルキル基を有していてもよいイソキサゾリル基、

(xliii)インダゾリル基、

(xliv)インドリル基、

(xlv)テトラヒドロベンゾチアゾリル基、

(xlvi)置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン及びオキソ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいテトラヒドロキノリル基、

(xlvii)低級アルキル基を有していてもよいキノリル基、

(xlviii)ベンゾジオキソリル低級アルキル基、

(xlix)置換基としてハロゲン；低級アルキル基；低級アルコキシ基；ハロゲン置換低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルコキシ基；低級アルケニル基；低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ基；スルファモイル基；低級アルキルチオ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル基；ピロリル基；低級アルキニル基；シアノ基；ニトロ基；アリールオキシ基；アリール低級アルコキシ基；ヒドロキシ基；ヒドロキシ低級アルキル基；低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基；ピラゾリル基；オキソ基を有していてもよいピロリジニル基；オキサゾリル基；低級アルキル基を有していてもよいイミダゾリル基；オキソ基を有していてもよいジヒドロフリル基；オキソ基を有していてもよいチアゾリジニル低級アルキル基；イミダゾリル低級アルカノイル基及びピペリジニルカルボニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアリール基、

(l)シアノ低級アルキル基、

(li)低級アルキル基及びオキソ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいジヒドロキノリル基、

(lii)ハロゲン置換低級アルキルアミノ基、

(liii)低級アルキルチオ低級アルキル基、

(liv)低級アルキル基を有していてもよいアミジノ基、

(lv)アミジノ低級アルキル基、

(lvi)低級アルケニルオキシ低級アルキル基、

(lvii)アリール基上に低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン置換低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいアリールアミノ基、

(lviii)アリール低級アルケニル基、

(lix)低級アルキル基を有していてもよいピリジルアミノ基、

(lx)アリール低級アルキル基（アリール基上及び／又は低級アルキル基上には、ハロゲン、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、

(lxi)低級アルキニル基、

(lxii)アリールオキシ低級アルキル基（アリール基上には、低級アルコキシ基；低級

10

20

30

40

50

アルコキシ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基；及びオキシ基を有していてもよいピロリジニル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、

(lxi) オキシ基を有していてもよいイソキサゾリジニル基、

(lxii) ジヒドロインデニル基、

(lxiii) アリール低級アルコキシ低級アルキル基、

(lxiv) テトラヒドロピラニル基、

(lxv) 低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアゼチジニル基、

(lxvi) 低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアゼチジニル低級アルキル基、 10

(lxvii) テトラゾリル基、

(lxviii) オキシ基を有していてもよいインドリニル基、

(lxix) 低級アルキル基及び低級アルキルチオ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいトリアゾリル基、

(lxx) カルバモイル基を有していてもよいイミダゾリル基、

(lxxi) 低級アルキル基を有していてもよいオキサゾリル基、

(lxxii) 低級アルキル基を有していてもよいイソチアゾリル基、

(lxxiii) ベンゾイミダゾリル基、

(lxxiv) オキシ基を有していてもよいジヒドロベンゾチアゾリル基、 20

(lxxv) 低級アルコキシカルボニル基を有していてもよいチエニル基ならびに

(lxxvi) 低級アルキル基を有していてもよいオキサゾリル低級アルキル基、

(29) アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、アリール基、アリール低級アルキル基、アロイル基及びアミノ置換アルキル基（アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ低級アルキル基、

(30) 低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基が置換した低級アルキル基、

(31) 低級アルキル基を有していてもよいチオカルバモイル基、 30

(32) スルファモイル基、

(33) オキシ基を有していてもよいオキサゾリジニル基、

(34) オキシ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいイミダゾリジニル基、

(35) オキシ基を有していてもよいピロリジニル基、

(36) イミダゾリル基、

(37) トリアゾリル基、

(38) イソキサゾリル基、

(39) 低級アルキル基；低級アルカノイル基；アリールスルホニル基；オキシ基；ヒドロキシ基；及び低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいピペリジル基、 40

(40) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルカノイル基、カルボキシ低級アルキル基、低級アルキルカルバモイル低級アルキル基、カルバモイル基、低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ基（アミノ基上に低級アルキル基、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよい）、ピペリジル基

（ピペリジル基上には、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、ピペラジニル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デシ 50

ル基、モルホリニル基、ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基（ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、ピリジル基、ピリジリオキシ基、ピリジル低級アルコキシ基、テトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキシ基を有していてもよい）、ベンゾジオキシリル基、アリール低級アルコキシ基（アリール基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリール基（アリール基上にはハロゲン、低級アルコキシ基及びヒドロキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリールオキシ基（アリール基上にはシアノ基、ハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリール低級アルキル基（アリール基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）及びアロイル基（アリール基上にはハロゲン及び低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいピペリジルカルボニル基、

10

（４１）置換基としてヒドロキシ低級アルキル基、カルバモイル基、ヒドロキシ基、アミノ基、アミノ基（アミノ基上には、低級アルキル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基、ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、アリールオキシ基（アリール基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を有していてもよい）、アリールオキシ低級アルキル基（アリール基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を有していてもよい）及びテトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキシ基を有していてもよい）からなる群から選ばれた基を有していてもよいピロリジニルカルボニル基、

20

（４２）置換基として低級アルキル基、シクロC3-C8アルキル基、低級アルカノイル基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、1,3-ジオキサニル低級アルキル基、テトラヒドロフリル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基（低級アルキル基上には、フェニル基が置換していてもよい）、イミダゾリル低級アルキル基、フリル低級アルキル基、ピロリジニルカルボニル低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有していてもよいピペリジル基、ピリジル基（ピリジル基上には、低級アルキル基、シアノ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）及びチエノ[2,3-b]ピリジル基、アリール基（アリール基上にハロゲン及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アロイル基、フリルカルボニル基、アリール低級アルコキシカルボニル基及びオキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペラジニルカルボニル基、

30

（４３）ヘキサヒドロアゼピニルカルボニル基、

（４４）置換基として低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニルカルボニル基、

40

（４５）低級アルキル基を有していてもよいジヒドロピロリルカルボニル基、

（４６）チオモルホリニルカルボニル基、

（４７）低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいモルホリニルカルボニル基、

（４８）低級アルコキシ基及びシアノ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアリール基を有していてもよいチアゾリジニルカルボニル基、

（４９）アザビシクロ[3.2.2]ニルカルボニル基、

（５０）ハロゲン置換又は無置換のアリールオキシ基を有していてもよい8-アザビシクロ[3.2.1]オクチルカルボニル基、

50

- (51) インドリニルカルボニル基、
 (52) テトラヒドロキノリルカルボニル基、
 (53) テトラヒドロピリド[3.4-b]インドリルカルボニル基、
 (54) モルホリニル低級アルキル基、
 (55) ピペラジニル基上に低級アルキル基を有していてもよいピペラジニル低級アルキル基、
 (56) モルホリニルカルボニル低級アルキル基、
 (57) ピペラジニル基上に低級アルキル基を有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基、
 (58) オキシ基、
 (59) アミノ低級アルコキシ基（アミノ基上に低級アルキル基を有していてもよい）、
 (60) 低級アルコキシ低級アルコキシ基、
 (61) オキシ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペラジニル基、
 (62) モルホリニル基、
 (63) オキシ基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよい1, 3, 8-トリアザスピロ[4.5]デカニルカルボニル基、
 (64) ピリジル基を有していてもよいテトラヒドロピリジルカルボニル基、
 (65) チオキシ基を有していてもよいイミダゾリジニルカルボニル基、ならびに
 (66) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカニル基]
- で表される複素環化合物又はその塩。

【請求項2】

R₁が以下の基(I A)、(II)、(III A)及び(IV)からなる群から選ばれたシクロC5-C6アルキル基、芳香環基又は複素環基を示す、請求項1に記載の複素環化合物又はその塩：

- (I A)シクロC5-C6アルキル基、
 (II)フェニル基、ナフチル基、ジヒドロインデニル基及びテトラヒドロナフチル基からなる群から選ばれた芳香環基、
 (III A)ピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピラニル、チエニルから選ばれた窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から2個有する飽和又は不飽和複素単環基、
 (IV) [1] テトラヒドロキノキサリニル基、[2] テトラヒドロキナゾリニル基、[3] ジヒドロキナゾリニル基、[4] インドリニル基、[5] インドリル基、[6] イソインドリニル基、[7] ベンゾイミダゾリニル基、[8] ジヒドロベンゾイミダゾリル基、[9] テトラヒドロベンゾアゼピニル基、[10] テトラヒドロベンゾジアゼピニル基、[11] ヘキサヒドロベンゾアゾシニル基、[12] ジヒドロベンゾオキサジニル基、[13] ジヒドロベンゾオキサゾリル基、[14] ベンゾイソキサゾリル基、[15] ベンゾオキサジアゾリル基、[16] テトラヒドロベンゾオキサゼピニル基、[17] ジヒドロベンゾチアジニル基、[18] ベンゾチアゾリル基、[19] ベンゾオキサチオリル基、
 [20] クロメニル基、[21] ジヒドロベンゾフリル基、[22] カルバゾリル基、[23] ジベンゾフリル基及び[24] キノキサリニル基からなる群より選ばれた窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有するベンゼン縮合複素環基、

ここで、上記R₁で示されるシクロC5-C6アルキル基、芳香環及び複素環上には、下記(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、

(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1~5個置換していてもよい:

- (1) 低級アルキル基、
- (2) 低級アルケニル基、
- (3) ハロゲン置換低級アルキル基、
- (4) 低級アルコキシ基、
- (5A) フェノキシ基、
- (6) 低級アルキルチオ基、
- (7) ハロゲン置換低級アルコキシ基、
- (8) ヒドロキシ基、
- (9A) フェニル低級アルコキシ基、
- (10) ヒドロキシ低級アルキル基、
- (11A) 低級アルコキシ低級アルキル基、
- (12) ハロゲン、
- (13) シアノ基、
- (14A) フェニル基、
- (15) ニトロ基、
- (16) アミノ基、

(17A) 置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有するアミノ基

- (18) 低級アルカノイル基、
- (19A) フェニル基上に低級アルキル基を有していてもよいフェニルスルホニル基、
- (20) カルボキシ基、
- (21) 低級アルコキシカルボニル基、
- (22) カルボキシ低級アルキル基、
- (23) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- (24) 低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基、
- (25) カルボキシ低級アルケニル基、
- (26) 低級アルコキシカルボニル低級アルケニル基、

(27A) 置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子が1~3個置換した低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいカルバモイル低級アルケニル基

(28A) 以下の基(i)-(vi)、(vii A)、(viii A)、(ix)、(x)、(xi A)、(xii A)、(xiii A)、(xiv)-(xvi)、(xvii A)、(xviii)、(xix A)、(xx)、(xxi)、(xxii A)、(xxiii A)、(xxiv A)、(xxv A)、(xxvi)、(xxvii A)、(xxviii)、(xxix)、(xxx A)、(xxxi)、(xxxii A)、(xxxiii A)、(xxxiv A)、(xxxv A)、(xxxvi A)、(xxxvii A)、(xxxviii A)、(xxxix A)、(xl)、(xli A)、(xlii A)、(xliii)-(xlv)、(xlvi A)、(xlvii A)、(xlviii)、(xlix A)、(l)、(li A)、(lii)-(lvi)、(lvii A)、(lviii A)、(lix A)、(lx A)、(lxi)、(lxii A)、(lxiii A)、(lxiv)、(lxv A)、(lxvi A)、(lxvii A)、(lxviii A)、(lxix)、(lxx A)、(lxxi A)、(lxxii A)、(lxxiii A)、(lxxiv A)、(lxxv)、(lxxvi A)、(lxxvii A)及び(lxxviii A)からなる群から選ばれた置換基を1~2個有していてもよいカルバモイル基:

- (i) 低級アルキル基、
- (ii) 低級アルコキシ基、
- (iii) ヒドロキシ低級アルキル基、
- (iv) 低級アルコキシ低級アルキル基、
- (v) アリールオキシ低級アルキル基、
- (vi) ハロゲン置換低級アルキル基、

(vii A) 低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基及びカルバモイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ低級アルキル基、

(viii A) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシカルボニル基及びフェニル低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいシクロC3-C8アルキル基、

(ix) シクロC3-C8アルキル置換低級アルキル基、

(x) 低級アルケニル基、

(xi A) 置換基として低級アルキル基、低級アルキル基を有していてもよいフェニル基及び低級アルコキシ基を有していてもよいフェニル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいカルバモイルを1～2個有する低級アルキル基、

(xii A) 1～2個の低級アルコキシカルボニルを有する低級アルキル基、

(xiii A) フリル基低級アルキル基（フリル基上には、1～2個の低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xiv) テトラヒドロフリル低級アルキル基、

(xv) 1,3-ジオキサニル低級アルキル基、

(xvi) テトラヒドロピラニル低級アルキル基、

(xvii A) ピロリル低級アルキル基（ピロリル基上には、1～2個の低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xviii) オキソ基を有していてもよいジヒドロピラゾリル基で置換された低級アルキル基、

(xix A) ピラゾリル低級アルキル基（ピラゾリル基上には、1～3個の低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xx) イミダゾリル低級アルキル基、

(xxi) ピリジル低級アルキル基、

(xxii A) ピラジニル低級アルキル基（ピラジニル基上には、1～3個の低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xxiii A) ピロリジニル低級アルキル基（ピロリジニル基上には、オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基が1～2個置換していてもよい）、

(xxiv A) ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、ベンゾイル基及び低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい）、

(xxv A) ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が1～3個置換していてもよい）、

(xxvi) モルホリニル低級アルキル基、

(xxvii A) チエニル低級アルキル基（チエニル基上には、低級アルキル基が1～3個置換していてもよい）、

(xxviii) チアゾリル低級アルキル基、

(xxix) ジヒドロベンゾフリル低級アルキル基、

(xxx A) ベンゾピラニル低級アルキル基（ベンゾピラニル基上には1個のオキソ基が置換していてもよい）、

(xxxi) ベンズイミダゾリル低級アルキル基、

(xxxii A) 低級アルキル基上に、低級アルコキシカルボニル基を1～3個有していてもよいインドリル低級アルキル基、

(xxxiii A) 低級アルキル基上に、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた置換基を1～3個有するイミダゾリル低級アルキル基、

(xxxiv A) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピリジル基、

(xxxv A) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピロリジニル基、

(xxxvi A) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカ

10

20

30

40

50

ノイル基及びベンゾイル基（フェニル基上に低級アルキル基及びハロゲンからなる群から選ばれた基を有していてもよい）からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいペリジル基、

(xxxvii A)1個のオキシ基を有していてもよいテトラヒドロフリル基、

(xxxviii A)1個のオキシ基を有していてもよいヘキサヒドロアゼピニル基、

(xxxix A)置換基として低級アルキル基、フェニル基及びフリル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピラゾリル基、

(xl)チアゾリル基、

(xli A)低級アルキル基を1～3個有していてもよいチアジアゾリル基、

(xlii A)低級アルキル基を1～3個有していてもよいイソキサゾリル基、

(xliii)インダゾリル基、

(xliv)インドリル基、

(xlv)テトラヒドロベンゾチアゾリル基、

(xlvi A)置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン及びオキシ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいテトラヒドロキノリル基、

(xlvii A)低級アルキル基を1～3個有していてもよいキノリル基、

(xlviii)ベンゾジオキサリル低級アルキル基、

(xlix A)フェニル基又はナフチル基、（それぞれ置換基としてハロゲン；低級アルキル基；低級アルコキシ基；ハロゲン置換低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルコキシ基；低級アルケニル基；低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ基；スルファモイル基；低級アルキルチオ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル基；ピロリル基；低級アルキニル基；シアノ基；ニトロ基；フェニルオキシ基；フェニル低級アルコキシ基；ヒドロキシ基；ヒドロキシ低級アルキル基；低級アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいカルバモイル基；ピラゾリル基；オキシ基を1個有していてもよいピロリジニル基；オキサゾリル基；低級アルキル基を1～3個有していてもよいイミダゾリル基；オキシ基を1個有していてもよいジヒドロフリル基；オキシ基を2個有していてもよいチアゾリジニル低級アルキル基；イミダゾリル低級アルカノイル基及びピペリジニルカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよい）、

(l)シアノ低級アルキル基、

(li A)低級アルキル基及びオキシ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいジヒドロキノリル基、

(lii)ハロゲン置換低級アルキルアミノ基、

(liii)低級アルキルチオ低級アルキル基、

(liv)低級アルキル基を有していてもよいアミジノ基、

(lv)アミジノ低級アルキル基、

(lvi)低級アルケニルオキシ低級アルキル基、

(lvii A)フェニル基上に低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン置換低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた置換基を1～3個有していてもよいフェニルアミノ基、

(lviii A)フェニル低級アルケニル基、

(lix A)低級アルキル基を1～3個有していてもよいピリジルアミノ基、

(lx A)フェニル低級アルキル基（フェニル基上及び／又は低級アルキル基上には、ハロゲン、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい）、

(lxi)低級アルキニル基、

(lxii A)フェニルオキシ低級アルキル基（フェニル基上には、低級アルコキシ基、N－低級アルコキシ－N－低級アルキルカルバモイル基及びオキソピロリジニル基からな

10

20

30

40

50

る群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい)、

(lxiii A) オキソ基を1個有していてもよいイソキサゾリジニル基、

(lxiv) ジヒドロインデニル基、

(lxv A) フェニル低級アルコキシ低級アルキル基、

(lxvi) テトラヒドロピラニル基、

(lxvii A) 低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいアゼチジニル基、

(lxviii A) 低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいアゼチジニル低級アルキル基、

(lxix) テトラゾリル基、

(lxx A) オキソ基を1個有していてもよいインドリニル基、

(lxxi A) 低級アルキル基及び低級アルキルチオ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいトリアゾリル基、

(lxxii A) カルバモイル基を1～3個有していてもよいイミダゾリル基、

(lxxiii A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいオキサゾリル基、

(lxxiv A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいイソチアゾリル基、

(lxxv) ベンゾイミダゾリル基、

(lxxvi A) オキソ基を1個有していてもよいジヒドロベンゾチアゾリル基、

(lxxvii A) 低級アルコキシカルボニル基を1～3個有していてもよいチエニル基ならびに

(lxxviii A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいオキサゾリル低級アルキル基 (29A) アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、フェニル基、フェニル低級アルキル基、ベンゾイル基及びアミノ置換アルキル基 (アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が1～2個置換していてもよい) からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ低級アルキル基、

(30A) 低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいカルバモイル基が1個置換した低級アルキル基、

(31A) 低級アルキル基を1～2個有していてもよいチオカルバモイル基、

(32) スルファモイル基、

(33A) オキソ基を1個有していてもよいオキサゾリジニル基、

(34A) オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を1～2個有していてもよいイミダゾリジニル基、

(35A) オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基、

(36) イミダゾリル基、

(37) トリアゾリル基、

(38) イソキサゾリル基、

(39A) 低級アルキル基；低級アルカノイル基；低級アルキルフェニルスルホニル基；オキソ基；ヒドロキシ基；ならびに低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた置換基を1～3個有していてもよいピペリジル基、

(40A) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルカノイル基、カルボキシ低級アルキル基、低級アルキルカルバモイル低級アルキル基、カルバモイル基、低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ基 (アミノ基上に低級アルキル基、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよい)、ピペリジル基 (ピペリジル基上には、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよい)、ピペラジニル基 (ピペラジニル基上には、低級アルキル基が1～3個置換していてもよい)、1,4-ジオキサー8-ア

10

20

30

40

50

ザスピロ[4.5]デシル基、モルホリニル基、ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基（ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基上には、1個の低級アルキル基が置換していてもよい）、ピリジル基、ピリジルオキシ基、ピリジル低級アルコキシ基、テトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキシ基を1個有していてもよい）、ベンゾジオキシリル基、フェニル低級アルコキシ基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）、フェニル基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルコキシ基及びヒドロキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）、フェニルオキシ基（フェニル基上にはシアノ基、ハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）、フェニル低級アルキル基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）及びベンゾイル基（フェニル基上にはハロゲン及び低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいピペリジルカルボニル基、

10

（4 1 A）置換基としてヒドロキシ低級アルキル基、カルバモイル基、ヒドロキシ基、アミノ基、アミノ基（アミノ基上には、低級アルキル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基、ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、1個の低級アルキル基が置換していてもよい）、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、1個の低級アルキル基が置換していてもよい）、フェニルオキシ基（フェニル基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を1~3個有していてもよい）、フェニルオキシ低級アルキル基（フェニル基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を1~3個有していてもよい）及びテトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキシ基を有していてもよい）からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよいピロリジニルカルボニル基、

20

（4 2 A）置換基として低級アルキル基、シクロC3-C8アルキル基、低級アルカノイル基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、低級アルキル基が1~2個置換していてもよい）、ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、低級アルキル基が1~2個置換していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、1,3-ジオキサニル低級アルキル基、テトラヒドロフリル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基（低級アルキル基上には、フェニル基が1~2個置換していてもよい）、イミダゾリル低級アルキル基、フリル低級アルキル基、ピロリジニルカルボニル低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を1~2個有していてもよいピペリジル基、ピリジル基（ピリジル基上には、低級アルキル基、シアノ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい）及びチエノ[2,3-b]ピリジル基、フェニル基（フェニル基上にハロゲン及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）、ベンゾイル基、フリルカルボニル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基及びオキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよいピペラジニルカルボニル基、

30

40

（4 3）ヘキサヒドロアゼピニルカルボニル基、

（4 4 A）置換基として低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた置換基を1~3個有していてもよいヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニルカルボニル基、

（4 5 A）低級アルキル基を1~3個有していてもよいジヒドロピロリルカルボニル基、

（4 6）チオモルホリニルカルボニル基、

（4 7 A）低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよいモルホリニルカルボニル基、

（4 8 A）低級アルコキシ基及びシアノ基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよいフェニル基を1~3個有していてもよいチアゾリジニルカルボニル基、

50

- (49) アザビシクロ [3. 2. 2] ノニルカルボニル基、
 (50A) ハロゲン置換又は無置換のフェニルオキシ基を1～3個有していてもよい8-アザビシクロ [3.2.1] オクチルカルボニル基、
 (51) インドリニルカルボニル基、
 (52) テトラヒドロキノリルカルボニル基、
 (53) テトラヒドロピリド [3.4-b] インドリルカルボニル基、
 (54) モルホリニル低級アルキル基、
 (55A) ピペラジニル基上に低級アルキル基を1～3個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基、
 (56) モルホリニルカルボニル低級アルキル基、
 (57A) ピペラジニル基上に低級アルキル基を1～3個有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基、
 (58) オキソ基、
 (59A) アミノ低級アルコキシ基 (アミノ基上に低級アルキル基を1～2個有していてもよい)、
 (60) 低級アルコキシ低級アルコキシ基、
 (61A) オキソ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピペラジニル基、
 (62) モルホリニル基、
 (63A) オキソ基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよい
 1, 3, 8-トリアザスピロ [4.5] デカニルカルボニル基、
 (64A) ピリジル基を1～3個有していてもよいテトラヒドロピリジルカルボニル基、
 (65A) チオキソ基を1個有していてもよいイミダゾリジニルカルボニル基、ならびに
 (66) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4.5] デカニル基。

【請求項3】

Aが低級アルキレン基である請求項1又は2に記載の複素環化合物又はその塩。

【請求項4】

R₁が以下の基(I A)、(II A)、(III A')からなる群から選ばれたシクロC5-C6アルキル基、芳香環基又は複素環基を示す請求項3に記載の複素環化合物又はその塩：

- (I A) シクロC5-C6アルキル基、
 (II A) フェニル基、
 (III A') ピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1～2個有する飽和又は不飽和複素単環基。
 ここで、上記R₁で示されるシクロC5-C6アルキル基、芳香環及び複素環上には、請求項2で定義された(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい。

【請求項5】

R₁がシクロC5-C6アルキル基を示す請求項4に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記R₁で示されるシクロC5-C6アルキル基上には、請求項2で定義された(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、

10

20

30

40

50

(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい。

【請求項6】

R₁がフェニル基を示す請求項4に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記R₁で示されるフェニル基上には、請求項2で定義された(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい。

10

【請求項7】

R₁がピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1～2個有する飽和又は不飽和複素単環基を示す請求項4に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記R₁で示される複素環上には、請求項2で定義された(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい。

20

【請求項8】

R₁が以下の基(I A)、(II A)、(III A')からなる群から選ばれたシクロC5-C6アルキル基、芳香環基又は複素環基を示す請求項4に記載の複素環化合物又はその塩：

30

(I A)シクロC5-C6アルキル基、

(II A)フェニル基、

(III A')ピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1～2個有する飽和又は不飽和複素単環基。

ここで、上記R₁で示されるシクロC5-C6アルキル基、芳香環及び複素環上には、下記(1)、(4)、(10)、(17A)、(18)、(21)、(28A')、(29A)、(30A)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)、(39A)、(61A)及び(62)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい。

(1)低級アルキル基、

(4)低級アルコキシ基、

40

(10)ヒドロキシ低級アルキル基、

(17A)置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有するアミノ基

(18)低級アルカノイル基、

(21)低級アルコキシカルボニル基、

(28A')以下の基(i)(ii)(iv)(xii A)(xxi)からなる群から選ばれた置換基を1～2個有していてもよいカルバモイル基：

(i)低級アルキル基、

50

- (ii) 低級アルコキシ基、
- (iv) 低級アルコキシ低級アルキル基、
- (xii A) 1～2個の低級アルコシカルボニルを有する低級アルキル基、
- (xxi) ピリジル低級アルキル基、

(29A) アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコシカルボニル基、低級アルカノイル基、フェニル基、フェニル低級アルキル基、ベンゾイル基及びアミノ置換アルキル基（アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が1～2個置換していてもよい）からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ低級アルキル基、

(30A) 低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいカルバモイル基が1個置換した低級アルキル基、 10

(33A) オキソを1個有していてもよいオキサゾリジニル基、

(34A) オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を1～2個有していてもよいイミダゾリジニル基、

(35A) オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基、

(36) イミダゾリル基、

(39A) 低級アルキル基；低級アルカノイル基；低級アルキルフェニルスルホニル基；オキソ基；ヒドロキシ基；ならびに低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコシカルボニル基及び低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた置換基を1～3個有していてもよいピペリジル基、 20

(61A) オキソ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピペラジニル基及び

(62) モルホリニル基。

【請求項9】

R₁が、フェニル基を示す請求項8に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記R₁で示される芳香環上には、請求項8で定義された(1)、(4)、(10)、(17A)、(18)、(21)、(28A')、(29A)、(30A)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)、(39A)、(61A)及び(62)からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。 30

【請求項10】

R₁が、フェニル基を示す請求項9に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記R₁で示される芳香環上には、下記(1)、(4)、(10)、(17A)、(18)、(28A'')、(33A)、(35A)、(39A')及び(61A')からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

(1) 低級アルキル基、

(4) 低級アルコキシ基、

(10) ヒドロキシ低級アルキル基、

(17A) 置換基として低級アルキル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有するアミノ基 40

(18) 低級アルカノイル基、

(28A'') 1個の低級アルコキシ低級アルキル基を有するカルバモイル基、

(33A) オキソを1個有していてもよいオキサゾリジニル基、

(35A) オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基、

(39A') ピペリジル基及び

(61A') オキソ基、低級アルカノイル基及び低級アルコシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいピペラジニル基。

【請求項11】

R₁が、フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のアミ 50

ノ基（該アミノ基上に1又は2個の低級アルキル基を有する）を有するフェニル基、フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のカルバモイル基（該カルバモイル基上に、低級アルキル基（該低級アルキル基上に2個の低級アルコキシ基を有する）を1個有する）を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピロリジニル基を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピペリジル基を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルカノイル基を有する）を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルカノイル基及び1個のオキシ基を有する）を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルコキシカルボニル基及び1個のオキシ基を有する）を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のN－[（N－低級アルコキシカルボニルアミノ）低級アルカノイル]アミノ基を有するフェニル基、フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のN－（アミノ低級アルカノイル）アミノ基を有するフェニル基、フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のN－[（N－低級アルカノイルアミノ）低級アルカノイル]アミノ基を1個有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルコキシ基、1個の低級アルカノイル基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルコキシカルボニル基を有する）を有するフェニル基、又は
 フェニル基上に、1個の低級アルコキシ基、1個のヒドロキシ低級アルキル基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルコキシカルボニル基を有する）を有するフェニル基である請求項10に記載の複素環化合物又はその塩。

【請求項12】

一般式（1）で表される複素環化合物が、4－[3－{4－（ベンゾ[b]チオフェン－4－イル）ピペラジン－1－イル}プロポキシ]－N－（2，2－ジメトキシエチル）－3－メトキシ－5－メチルベンズアミドである、請求項11に記載の複素環化合物またはその塩。

【請求項13】

一般式（1）で表される複素環化合物が、1－アセチル－4－{4－[3－{4－（ベンゾ[b]チオフェン－4－イル）ピペラジン－1－イル}プロポキシ]－3－メトキシ－5－メチルフェニル}ピペラジンである、請求項11に記載の複素環化合物またはその塩。

【請求項14】

一般式（1）で表される複素環化合物が、4－{4－[3－{4－（ベンゾ[b]チオフェン－4－イル）ピペラジン－1－イル}プロポキシ]－3－メトキシ－5－メチルフェニル}－3－オキソ－1－メトキシカルボニルピペラジンである、請求項11に記載の複素環化合物またはその塩。

【請求項15】

一般式（1）で表される複素環化合物が、2－アミノ－N－{4－[3－{4－（ベンゾ[b]チオフェン－4－イル）ピペラジン－1－イル}プロポキシ]－3－メトキシ－5－メチルフェニル}アセトアミドである、請求項11に記載の複素環化合物またはその塩。

【請求項16】

一般式（1）で表される複素環化合物が、4－{4－[3－（4－（ベンゾ[b]チオフ

エン-4-イル} ピペラジン-1-イル} プロボキシ-3-ヒドロキシメチル-5-メトキシフェニル}-1-メトキシカルボニルピペラジンである、請求項11に記載の複素環化合物またはその塩。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な複素環化合物に関する。

【背景技術】

【0002】

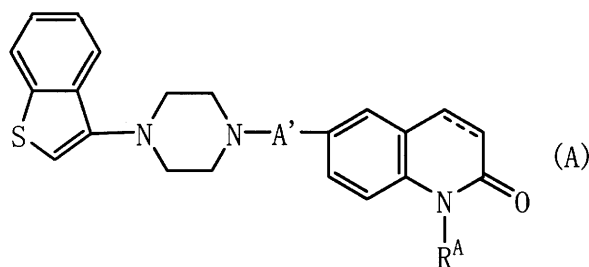
統合失調症を始め双極性障害、気分障害及び感情障害の病因がヘテロジナス (heterogeneous: 異種) であることより、薬剤に広い治療スペクトラムを発現させるためには、複数の薬理作用を併有していることが望まれる。

【0003】

特許文献1には、一般式

【0004】

【化1】



【0005】

[式中、A' は $-(CH_2)_mCH_2-$ 、 $-(CH_2)_mO-$ 等を示す。m は 1~4 の整数を示す。R^A は水素原子、1~3 個の弗素原子で置換されていてもよい C₁₋₄ アルキル基等を示す。]

で表されるカルボスチリル誘導体が、D₂ 受容体アンタゴニスト作用及びセロトニン 2_A (5-HT_{2A}) 受容体アンタゴニスト作用を有し、統合失調症及び他の中枢神経疾患の治療に有効であることが開示されている。

【0006】

しかしながら、該特許文献1には、該文献に記載のカルボスチリル誘導体が、D₂ 受容体パーシャルアゴニスト作用、5-HT_{2A} 受容体アンタゴニスト作用、α₁ 受容体アンタゴニスト作用及びセロトニン取り込み阻害作用を併有し、広い治療スペクトラムを有する点については全く開示されていない。

【0007】

また特許文献2には、ある種の [1, 8] ナフチリジン-2-オン誘導体が開示されている。

【0008】

しかしながら、該特許文献2にも、該文献に記載の [1, 8] ナフチリジン-2-オン誘導体が、D₂ 受容体パーシャルアゴニスト作用、5-HT_{2A} 受容体アンタゴニスト作用、α₁ 受容体アンタゴニスト作用及びセロトニン取り込み阻害作用を併有し、広い治療スペクトラムを有する点については全く開示されていない。

【特許文献1】 WO 2004/026864 A1

【特許文献2】 WO 2005/043309 A1

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0009】

本発明は、公知の定型抗精神病薬及び非定型抗精神病薬に比べて、より広い治療スペク

トラムを有し、副作用が少なく、忍容性及び安全性に優れた抗精神病薬を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0010】

本発明者らは、上記課題を解決するために鋭意研究を重ねた結果、ドパミン D_2 受容体パーシャルアゴニスト作用 (D_2 受容体パーシャルアゴニスト作用)、セロトニン $5-H T_{2A}$ 受容体アンタゴニスト作用 ($5-H T_{2A}$ 受容体アンタゴニスト作用) 及びアドレナリン α_1 受容体アンタゴニスト作用 (α_1 受容体アンタゴニスト作用) を有し、更にそれらの作用に加えてセロトニン取り込み阻害作用 (あるいはセロトニン再取り込み阻害作用) を併有する新規化合物を合成することに成功した。本発明は、斯かる知見に基づき完成されたものである。

10

【0011】

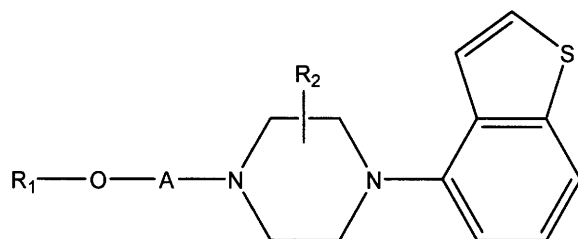
本発明は、以下の項に示す複素環化合物又はその塩及びその製造方法を提供する。

【0012】

項1. 一般式 (1) :

【0013】

【化2】



20

【0014】

[式中、 R_2 は、水素又は低級アルキル基を示す。

Aは低級アルキレン基又は低級アルケニレン基を示す。

R_1 は以下の基(I)~(IV)からなる群から選ばれたシクロC3-C8アルキル基、芳香環基又は複素環基を示す：

30

(I) シクロC3-C8アルキル基、

(II) フェニル基、ナフチル基、ジヒドロインデニル基及びテトラヒドロナフチル基からなる群から選ばれた芳香環基、

(III) 窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有する飽和又は不飽和複素単環基、

(IV) [1] テトラヒドロキノキサリニル基、[2] テトラヒドロキナゾリニル基、

[3] ジヒドロキナゾリニル基、[4] インドリニル基、[5] インドリル基、[6] イソインドリニル基、[7] ベンゾイミダゾリニル基、[8] ジヒドロベンゾイミダゾリル基、[9] テトラヒドロベンゾアゼピニル基、[10] テトラヒドロベンゾジアゼピニル基、[11] ヘキサヒドロベンゾアゾシニル基、[12] ジヒドロベンゾオキサジニル基、[13] ジヒドロベンゾオキサゾリル基、[14] ベンゾイソキサゾリル基、[15] ベンゾオキサジアゾリル基、[16] テトラヒドロベンゾオキサゼピニル基、[17] ジヒドロベンゾチアジニル基、[18] ベンゾチアゾリル基、[19] ベンゾオキサチオリル基、[20] クロメニル基、[21] ジヒドロベンゾフリル基、[22] カルバゾリル基、[23] ジベンゾフリル基及び[24] キノキサリニル基からなる群より選ばれた窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有するベンゼン縮合複素環基、

40

ここで、上記 R_1 で示されるシクロC3-C8アルキル基、芳香環及び複素環上には、下記(1)~(66)からなる群から選ばれた少なくとも1つの基が置換していてもよい：

50

- (1) 低級アルキル基、
- (2) 低級アルケニル基、
- (3) ハロゲン置換低級アルキル基、
- (4) 低級アルコキシ基、
- (5) アリールオキシ基、
- (6) 低級アルキルチオ基、
- (7) ハロゲン置換低級アルコキシ基、
- (8) ヒドロキシ基、
- (9) 保護されたヒドロキシ基、
- (10) ヒドロキシ低級アルキル基、 10
- (11) 保護されたヒドロキシ低級アルキル基、
- (12) ハロゲン、
- (13) シアノ基、
- (14) アリール基、
- (15) ニトロ基、
- (16) アミノ基、
- (17) 置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を有するアミノ基、 20
- (18) 低級アルカノイル基、
- (19) アリール基上に低級アルキル基を有していてもよいアリールスルホニル基、
- (20) カルボキシ基、
- (21) 低級アルコキシカルボニル基、
- (22) カルボキシ低級アルキル基、
- (23) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- (24) 低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基、
- (25) カルボキシ低級アルケニル基、
- (26) 低級アルコキシカルボニル低級アルケニル基、
- (27) 置換基として低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル低級アルケニル基、 30
- (28) 以下の基(i)–(lxxviii)からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいカルバモイル基：
 - (i) 低級アルキル基、
 - (ii) 低級アルコキシ基、
 - (iii) ヒドロキシ低級アルキル基、
 - (iv) 低級アルコキシ低級アルキル基、
 - (v) アリールオキシ低級アルキル基、
 - (vi) ハロゲン置換低級アルキル基、
 - (vii) 低級アルキル基、低級アルカノイル基、アロイル基及びカルバモイル基からなる群からえられた基を有していてもよいアミノ低級アルキル基、 40
 - (viii) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシカルボニル基及びフェニル低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいシクロC3-C8アルキル基、
 - (ix) シクロC3-C8アルキル置換低級アルキル基、
 - (x) 低級アルケニル基、
 - (xi) 置換基として低級アルキル基、低級アルキル基を有していてもよいフェニル基及び低級アルコキシ基を有していてもよいフェニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、
 - (xii) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、 50

(xiii)フリル低級アルキル基（フリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）

(xiv)テトラヒドロフリル低級アルキル基、

(xv)1,3-ジオキソラニル低級アルキル基、

(xvi)テトラヒドロピラニル低級アルキル基、

(xvii)ピロリル低級アルキル基（ピロリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xviii)オキソ基を有していてもよいジヒドロピラゾリル基で置換された低級アルキル基、

(xix)ピラゾリル低級アルキル基（ピラゾリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、 10

(xx)イミダゾリル低級アルキル基、

(xxi)ピリジル低級アルキル基、

(xxii)ピラジニル低級アルキル基（ピラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xxiii)ピロリジニル低級アルキル基（ピロリジニル基上には、オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、

(xxiv)ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、ベンゾイル基及び低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、

(xxv)ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、 20

(xxvi)モルホリニル低級アルキル基、

(xxvii)チエニル低級アルキル基（チエニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xxviii)チアゾリル低級アルキル基、

(xxix)ジヒドロベンゾフリル低級アルキル基、

(xxx)ベンゾピラニル低級アルキル基（ベンゾピラニル基上にはオキソ基が置換していてもよい）、

(xxxi)ベンズイミダゾリル低級アルキル基、

(xxxii)低級アルキル基上に、低級アルコキシカルボニル基を有していてもよいインドリル低級アルキル基、 30

(xxxiii)低級アルキル基上に、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた置換基を有するイミダゾリル低級アルキル基、

(xxxiv)置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピリジル基、

(xxxv)置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピロリジニル基、

(xxxvi)置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及び低級アルキル基及びハロゲンからなる群から選ばれた基を有していてもよいアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペリジル基、 40

(xxxvii)オキソ基を有していてもよいテトラヒドロフリル基、

(xxxviii)オキソ基を有していてもよいヘキサヒドロアゼピニル基、

(xxxix)置換基として低級アルキル基、アリール基及びフリル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピラゾリル基、

(xl)チアゾリル基、

(xli)低級アルキル基を有していてもよいチアジアゾリル基、

(xlii)低級アルキル基を有していてもよいイソキサゾリル基、

(xlili)インダゾリル基、

(xliv)インドリル基、

(xlv)テトラヒドロベンゾチアゾリル基、 50

(xlvi)置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン及びオキソ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいテトラヒドロキノリル基、

(xlvii) 低級アルキル基を有していてもよいキノリル基、

(xlviii)ベンゾジオキソリル低級アルキル基、

(xlix)置換基としてハロゲン；低級アルキル基；低級アルコキシ基；ハロゲン置換低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルコキシ基；低級アルケニル基；低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ基；スルファモイル基；低級アルキルチオ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル基；ピロリル基；低級アルキニル基；シアノ基；ニトロ基；アリールオキシ基；アリール低級アルコキシ基；ヒドロキシ基；ヒドロキシ低級アルキル基；低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基；ピラゾリル基；オキソ基を有していてもよいピロリジニル基；オキサゾリル基；低級アルキル基を有していてもよいイミダゾリル基；オキソ基を有していてもよいジヒドロフリル基；オキソ基を有していてもよいチアゾリジニル低級アルキル基；イミダゾリル低級アルカノイル基及びピペリジニルカルボニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアリール基、

10

(l)シアノ低級アルキル基、

(li) 低級アルキル基及びオキソ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいジヒドロキノリル基

(lii)ハロゲン置換低級アルキルアミノ基、

20

(liii)低級アルキルチオ低級アルキル基、

(liv)低級アルキル基を有していてもよいアミジノ基、

(lv)アミジノ低級アルキル基、

(lvi)低級アルケニルオキシ低級アルキル基、

(lvii)アリール基上に低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン置換低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいアリールアミノ基、

(lviii)アリール低級アルケニル基、

(lix)低級アルキル基を有していてもよいピリジルアミノ基、

(lx)アリール低級アルキル基（アリール基上及び／又は低級アルキル基上には、ハロゲン、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、

30

(lxi)低級アルキニル基、

(lxii) アリールオキシ低級アルキル基（アリール基上には、低級アルコキシ基；低級アルコキシ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基；及びオキソ基を有していてもよいピロリジニル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、

(lxiii)オキソ基を有していてもよいイソキサゾリジニル基、

(lxiv)ジヒドロインデニル基、

40

(lxv)アリール低級アルコキシ低級アルキル基、

(lxvi)テトラヒドロピラニル基、

(lxvii)低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアゼチジニル基、

(lxviii) 低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアゼチジニル低級アルキル基、

(lxix)テトラゾリル基、

(lxx) オキソ基を有していてもよいインドリニル基、

(lxxi) 低級アルキル基及び低級アルキルチオ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいトリアゾリル基、

50

- (lxxii)カルバモイル基を有していてもよいイミダゾリル基、
(lxxiii)低級アルキル基を有していてもよいオキサゾリル基、
(lxxiv) 低級アルキル基を有していてもよいイソチアゾリル基、
(lxxv)ベンゾイミダゾリル基、
(lxxvi) オキシ基を有していてもよいジヒドロベンゾチアゾリル基、
(lxxvii) 低級アルコキシカルボニル基を有していてもよいチエニル基ならびに
(lxxviii)低級アルキル基を有していてもよいオキサゾリル低級アルキル基、
(29) アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、アリール基、アリール低級アルキル基、アロイル基及びアミノ置換アルキル基（アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ低級アルキル基、
(30) 低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基が置換した低級アルキル基、
(31) 低級アルキル基を有していてもよいチオカルバモイル基、
(32) スルファモイル基、
(33) オキシ基を有していてもよいオキサゾリジニル基、
(34) オキシ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいイミダゾリジニル基、
(35) オキシ基を有していてもよいピロリジニル基、
(36) イミダゾリル基、
(37) トリアゾリル基、
(38) イソキサゾリル基、
(39) 低級アルキル基；低級アルカノイル基；アリールスルホニル基；オキシ基；ヒドロキシ基；及び低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいピペリジル基、
(40) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルカノイル基、カルボキシ低級アルキル基、低級アルキルカルバモイル低級アルキル基、カルバモイル基、低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ基（アミノ基上に低級アルキル基、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよい）、ピペリジル基（ピペリジル基上には、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、ピペラジニル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デシル基、モルホリニル基、ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基（ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、ピリジル基、ピリジルオキシ基、ピリジル低級アルコキシ基、テトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキシ基を有していてもよい）、ベンゾジオキサリル基、アリール低級アルコキシ基（アリール基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリール基（アリール基上にはハロゲン、低級アルコキシ基及びヒドロキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリールオキシ基（アリール基上にはシアノ基、ハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリール低級アルキル基（アリール基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）及びアロイル基（アリール基上にはハロゲン及び低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいピペリジルカルボニル基、
(41) 置換基としてヒドロキシ低級アルキル基、カルバモイル基、ヒドロキシ基、アミ

10

20

30

40

50

ノ基、アミノ基（アミノ基上には、低級アルキル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基、ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、アリールオキシ基（アリール基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を有していてもよい）、アリールオキシ低級アルキル基（アリール基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を有していてもよい）及びテトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキソ基を有していてもよい）からなる群から選ばれた基を有していてもよいピロリジニルカルボニル基、

（４２）置換基として低級アルキル基、シクロC3-C8アルキル基、低級アルカノイル基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、1,3-ジオキサニル低級アルキル基、テトラヒドロフリル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基（低級アルキル基上には、フェニル基が置換していてもよい）、イミダゾリル低級アルキル基、フリル低級アルキル基、ピロリジニルカルボニル低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有していてもよいピペリジル基、ピリジル基（ピリジル基上には、低級アルキル基、シアノ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）及びチエノ[2,3-b]ピリジル基、アリール基（アリール基上にハロゲン及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アロイル基、フリルカルボニル基、アリール低級アルコキシカルボニル基及びオキソ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペラジニルカルボニル基、

（４３）ヘキサヒドロアゼピニルカルボニル基、

（４４）置換基として低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニルカルボニル基、

（４５）低級アルキル基を有していてもよいジヒドロピロリルカルボニル基、

（４６）チオモルホリニルカルボニル基、

（４７）低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいモルホリニルカルボニル基、

（４８）低級アルコキシ基及びシアノ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアリール基を有していてもよいチアゾリジニルカルボニル基、

（４９）アザビシクロ[3.2.2]ノニルカルボニル基、

（５０）ハロゲン置換又は無置換のアリールオキシ基を有していてもよい8-アザビシクロ[3.2.1]オクチルカルボニル基、

（５１）インドリニルカルボニル基、

（５２）テトラヒドロキノリルカルボニル基、

（５３）テトラヒドロピリド[3.4-b]インドリルカルボニル基、

（５４）モルホリニル低級アルキル基、

（５５）ピペラジニル基上に低級アルキル基を有していてもよいピペラジニル低級アルキル基、

（５６）モルホリニルカルボニル低級アルキル基、

（５７）ピペラジニル基上に低級アルキル基を有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基、

（５８）オキソ基、

（５９）アミノ低級アルコキシ基（アミノ基上に低級アルキル基を有していてもよい）、

（６０）低級アルコキシ低級アルコキシ基、

（６１）オキソ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペラジニル基、

（６２）モルホリニル基、

(63) オキシ基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよい1, 3, 8-トリアザスピロ [4.5] デカニルカルボニル基、

(64) ピリジル基を有していてもよいテトラヒドロピリジルカルボニル基、

(65) チオキシ基を有していてもよいイミダゾリジニルカルボニル基、ならびに

(66) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4.5] デカニル基]

で表される複素環化合物又はその塩。

【0015】

項2. R_1 が以下の基(I A)、(II)、(III A)及び(IV)からなる群から選ばれたシクロC5-C6アルキル基、芳香環基又は複素環基を示す、項1に記載の複素環化合物又はその塩：

(I A)シクロC5-C6アルキル基、

(II)フェニル基、ナフチル基、ジヒドロインデニル基及びテトラヒドロナフチル基からなる群から選ばれた芳香環基、

(III A)ピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピラニル、チエニルから選ばれた窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から2個有する飽和又は不飽和複素単環基、

(IV) [1] テトラヒドロキノキサリニル基、[2] テトラヒドロキナゾリニル基、[3] ジヒドロキナゾリニル基、[4] インドリニル基、[5] インドリル基、[6] イソインドリニル基、[7] ベンゾイミダゾリニル基、[8] ジヒドロベンゾイミダゾリル基、[9] テトラヒドロベンゾアゼピニル基、[10] テトラヒドロベンゾジアゼピニル基、[11] ヘキサヒドロベンゾアゾシニル基、[12] ジヒドロベンゾオキサジニル基、[13] ジヒドロベンゾオキサゾリル基、[14] ベンゾイソキサゾリル基、[15] ベンゾオキサジアゾリル基、[16] テトラヒドロベンゾオキサゼピニル基、[17] ジヒドロベンゾチアジニル基、[18] ベンゾチアゾリル基、[19] ベンゾオキサチオリル基、[20] クロメニル基、[21] ジヒドロベンゾフリル基、[22] カルバゾリル基、[23] ジベンゾフリル基及び[24] キノキサリニル基からなる群より選ばれた窒素原子、酸素原子及び硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有するベンゼン縮合複素環基、

ここで、上記 R_1 で示されるシクロC5-C6アルキル基、芳香環及び複素環上には、下記(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい：

(1) 低級アルキル基、

(2) 低級アルケニル基、

(3) ハロゲン置換低級アルキル基、

(4) 低級アルコキシ基、

(5A) フェノキシ基、

(6) 低級アルキルチオ基、

(7) ハロゲン置換低級アルコキシ基、

(8) ヒドロキシ基、

(9A) フェニル低級アルコキシ基、

(10) ヒドロキシ低級アルキル基、

(11A) 低級アルコキシ低級アルキル基、

(12) ハロゲン、

(13) シアノ基、

10

20

30

40

50

- (14A) フェニル基、
(15) ニトロ基、
(16) アミノ基、
(17A) 置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有するアミノ基
(18) 低級アルカノイル基、
(19A) フェニル基上に低級アルキル基を有していてもよいフェニルスルホニル基、
(20) カルボキシ基、
(21) 低級アルコキシカルボニル基、
(22) カルボキシ低級アルキル基、
(23) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
(24) 低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基、
(25) カルボキシ低級アルケニル基、
(26) 低級アルコキシカルボニル低級アルケニル基、
(27A) 置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子が1~3個置換した低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいカルバモイル低級アルケニル基、
(28A) 以下の基(i)-(vi)、(vii A)、(viii A)、(ix)、(x)、(xi A)、(xii A)、
(xiii A)、(xiv)-(xvi)、(xvii A)、(xviii)、(xix A)、(xx)、(xxi)、(xxii A)、(xxiii A)、(xxiv A)、(xxv A)、(xxvi)、(xxvii A)、(xxviii)、(xxix)、(xxx A)、(xxxi)、(xxxii A)、(xxxiii A)、(xxxiv A)、(xxxv A)、(xxxvi A)、(xxxvii A)、(xxxviii A)、(xxxix A)、(xl)、(xli A)、(xlii A)、(xliii)-(xlv)、(xlvi A)、(xlvii A)、(xlviii)、(xlix A)、(l)、(li A)、(lii)-(lvi)、(lvii A)、(lviii A)、(lix A)、(lx A)、(lxi)、(lxii A)、(lxiii A)、(lxiv)、(lxv A)、(lxvi)、(lxvii A)、(lxviii A)、(lxix)、(lxx A)、(lxxi A)、(lxxii A)、(lxxiii A)、(lxxiv A)、(lxxv)、(lxxvi A)、(lxxvii A)及び(lxxviii A)からなる群から選ばれた置換基を1~2個有していてもよいカルバモイル基：
(i) 低級アルキル基、
(ii) 低級アルコキシ基、
(iii) ヒドロキシ低級アルキル基、
(iv) 低級アルコキシ低級アルキル基、
(v) アリールオキシ低級アルキル基、
(vi) ハロゲン置換低級アルキル基、
(vii A) 低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基及びカルバモイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいアミノ低級アルキル基、
(viii A) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシカルボニル基及びフェニル低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよいシクロC3-C8アルキル基、
(ix) シクロC3-C8アルキル置換低級アルキル基、
(x) 低級アルケニル基、
(xi A) 置換基として低級アルキル基、低級アルキル基を有していてもよいフェニル基及び低級アルコキシ基を有していてもよいフェニル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいカルバモイルを1~2個有する低級アルキル基、
(xii A) 1~2個の低級アルコキシカルボニルを有する低級アルキル基、
(xiii A) フリル基低級アルキル基（フリル基上には、1~2個の低級アルキル基が置換していてもよい）、
(xiv) テトラヒドロフリル低級アルキル基、
(xv) 1,3-ジオキソラニル低級アルキル基、

10

20

30

40

50

- (xvi) テトラヒドロピラニル低級アルキル基、
- (xvii A) ピロリル低級アルキル基（ピロリル基上には、1～2個の低級アルキル基が置換していてもよい）、
- (xviii) オキソ基を有していてもよいジヒドロピラゾリル基で置換された低級アルキル基、
- (xix A) ピラゾリル低級アルキル基（ピラゾリル基上には、1～3個の低級アルキル基が置換していてもよい）、
- (xx) イミダゾリル低級アルキル基、
- (xxi) ピリジル低級アルキル基、
- (xxii A) ピラジニル低級アルキル基（ピラジニル基上には、1～3個の低級アルキル基が置換していてもよい）、
- (xxiii A) ピロリジニル低級アルキル基（ピロリジニル基上には、オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基が1～2個置換していてもよい）、
- (xxiv A) ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、ベンゾイル基及び低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい）、
- (xxv A) ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が1～3個置換していてもよい）、
- (xxvi) モルホリニル低級アルキル基、
- (xxvii A) チエニル低級アルキル基（チエニル基上には、低級アルキル基が1～3個置換していてもよい）、
- (xxviii) チアゾリル低級アルキル基、
- (xxix) ジヒドロベンゾフリル低級アルキル基、
- (xxx A) ベンゾピラニル低級アルキル基（ベンゾピラニル基上には1個のオキソ基が置換していてもよい）、
- (xxxi) ベンズイミダゾリル低級アルキル基、
- (xxxii A) 低級アルキル基上に、低級アルコキシカルボニル基を1～3個有していてもよいインドリル低級アルキル基、
- (xxxiii A) 低級アルキル基上に、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた置換基を1～3個有するイミダゾリル低級アルキル基、
- (xxxiv A) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピリジル基、
- (xxxv A) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピロリジニル基、
- (xxxvi A) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及びベンゾイル基（フェニル基上に低級アルキル基及びハロゲンからなる群から選ばれた基を有していてもよい）からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピペリジル基、
- (xxxvii A) 1個のオキソ基を有していてもよいテトラヒドロフリル基、
- (xxxviii A) 1個のオキソ基を有していてもよいヘキサヒドロアゼピニル基、
- (xxxix A) 置換基として低級アルキル基、フェニル基及びフリル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピラゾリル基、
- (xl) チアゾリル基、
- (xli A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいチアジアゾリル基、
- (xlii A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいイソキサゾリル基、
- (xl iii) インダゾリル基、
- (xl iv) インドリル基、
- (xl v) テトラヒドロベンゾチアゾリル基、
- (xl vi A) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン及びオキソ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいテトラヒドロキノリル基、

(xlvi A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいキノリル基、

(xlvii) ベンゾジオキソリル低級アルキル基、

(xlviii A) フェニル基又はナフチル基、（それぞれ置換基としてハロゲン；低級アルキル基；低級アルコキシ基；ハロゲン置換低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルコキシ基；低級アルケニル基；低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ基；スルファモイル基；低級アルキルチオ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル基；ピロリル基；低級アルキニル基；シアノ基；ニトロ基；フェニルオキシ基；フェニル低級アルコキシ基；ヒドロキシ基；ヒドロキシ低級アルキル基；低級アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいカルバモイル基；ピラゾリル基；オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基；オキサゾリル基；低級アルキル基を1～3個有していてもよいイミダゾリル基；オキソ基を1個有していてもよいジヒドロフリル基；オキソ基を2個有していてもよいチアゾリジニル低級アルキル基；イミダゾリル低級アルカノイル基及びピペリジニルカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよい）、

10

(1) シアノ低級アルキル基、

(li A) 低級アルキル基及びオキソ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいジヒドロキノリル基、

(lii) ハロゲン置換低級アルキルアミノ基、

(liii) 低級アルキルチオ低級アルキル基、

20

(liv) 低級アルキル基を有していてもよいアミジノ基、

(lv) アミジノ低級アルキル基、

(lvi) 低級アルケニルオキシ低級アルキル基、

(lvii A) フェニル基上に低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン置換低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた置換基を1～3個有していてもよいフェニルアミノ基、

(lviii A) フェニル低級アルケニル基、

(lix A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいピリジルアミノ基、

(lx A) フェニル低級アルキル基（フェニル基上及び／又は低級アルキル基上には、ハロゲン、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい）、

30

(lxi) 低級アルキニル基、

(lxii A) フェニルオキシ低級アルキル基（フェニル基上には、低級アルコキシ基、N-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基及びオキソピロリジニル基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい）、

(lxiii A) オキソ基を1個有していてもよいイソキサゾリジニル基、

(lxiv) ジヒドロインデニル基、

(lxv A) フェニル低級アルコキシ低級アルキル基、

(lxvi) テトラヒドロピラニル基、

40

(lxvii A) 低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいアゼチジニル基、

(lxviii A) 低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいアゼチジニル低級アルキル基、

(lxix) テトラゾリル基、

(lxx A) オキソ基を1個有していてもよいインドリニル基、

(lxxi A) 低級アルキル基及び低級アルキルチオ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいトリアゾリル基、

(lxxii A) カルバモイル基を1～3個有していてもよいイミダゾリル基、

(lxxiii A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいオキサゾリル基、

50

(lxxiv A) 低級アルキル基を1~3個有していてもよいイソチアゾリル基、
(lxxv) ベンゾイミダゾリル基、
(lxxvi A) オキソ基を1個有していてもよいジヒドロベンゾチアゾリル基、
(lxxvii A) 低級アルコキシカルボニル基を1~3個有していてもよいチエニル基なら
びに

(lxxviii A) 低級アルキル基を1~3個有していてもよいオキサゾリル低級アルキル基
(29A) アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキ
シカルボニル基、低級アルカノイル基、フェニル基、フェニル低級アルキル基、ベンゾイ
ル基及びアミノ置換アルキル基（アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル
基が1~2個置換していてもよい）からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいア
ミノ低級アルキル基、

10

(30A) 低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1
~2個有していてもよいカルバモイル基が1個置換した低級アルキル基、

(31A) 低級アルキル基を1~2個有していてもよいチオカルバモイル基、

(32) スルファモイル基、

(33A) オキソ基を1個有していてもよいオキサゾリジニル基、

(34A) オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を1~2個有してい
てもよいイミダゾリジニル基、

(35A) オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基、

(36) イミダゾリル基、

20

(37) トリアゾリル基、

(38) イソキサゾリル基、

(39A) 低級アルキル基；低級アルカノイル基；低級アルキルフェニルスルホニル基；
オキソ基；ヒドロキシ基；ならびに低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキ
シカルボニル基及び低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた
基を1~2個有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた置換基を1~3個有していて
もよいピペリジル基、

(40A) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基、低
級アルカノイル基、カルボキシ低級アルキル基、低級アルキルカルバモイル低級アルキル
基、カルバモイル基、低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、
アミノ基（アミノ基上に低級アルキル基、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル
基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよい）、ピペリジ
ル基（ピペリジル基上には、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基及びベンゾ
イル基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）、ピペラジニル基（ピペラ
ジニル基上には、低級アルキル基が1~3個置換していてもよい）、1,4-ジオキサ-8-ア
ザスピロ[4.5]デシル基、モルホリニル基、ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基（ヘキサ
ヒドロ-1,4-ジアゼピニル基上には、1個の低級アルキル基が置換していてもよい）、
ピリジル基、ピリジルオキシ基、ピリジル低級アルコキシ基、テトラヒドロキノリル基（
テトラヒドロキノリル基上にはオキソ基を1個有していてもよい）、ベンゾジオキサリル
基、フェニル低級アルコキシ基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アル
コキシ基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個有してい
てもよい）、フェニル基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルコキシ基及びヒドロキシ
基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）、フェニルオキシ基（フェニル
基上にはシアノ基、ハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級
アルキル基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）、フェニル低級アルキ
ル基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換
低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい）及びベンゾイル基
（フェニル基上にはハロゲン及び低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個有
していてもよい）からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいピペリジルカルボニ
ル基、

30

40

50

(4 1 A) 置換基としてヒドロキシ低級アルキル基、カルバモイル基、ヒドロキシ基、アミノ基、アミノ基（アミノ基上には、低級アルキル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基、ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、1個の低級アルキル基が置換していてもよい）、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、1個の低級アルキル基が置換していてもよい）、フェニルオキシ基（フェニル基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を1～3個有していてもよい）、フェニルオキシ低級アルキル基（フェニル基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を1～3個有していてもよい）及びテトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキシ基を有していてもよい）からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピロリジニルカルボニル基、

10

(4 2 A) 置換基として低級アルキル基、シクロC3-C8アルキル基、低級アルカノイル基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、低級アルキル基が1～2個置換していてもよい）、ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、低級アルキル基が1～2個置換していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、1,3-ジオキサニル低級アルキル基、テトラヒドロフリル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基（低級アルキル基上には、フェニル基が1～2個置換していてもよい）、イミダゾリル低級アルキル基、フリル低級アルキル基、ピロリジニルカルボニル低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を1～2個有していてもよいピペリジル基、ピリジル基（ピリジル基上には、低級アルキル基、シアノ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい）及びチエノ[2,3-b]ピリジル基、フェニル基（フェニル基上にハロゲン及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよい）、ベンゾイル基、フリルカルボニル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基及びオキシ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピペラジニルカルボニル基、

20

(4 3) ヘキサヒドロアゼピニルカルボニル基、

(4 4 A) 置換基として低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた置換基を1～3個有していてもよいヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニルカルボニル基、

(4 5 A) 低級アルキル基を1～3個有していてもよいジヒドロピロリルカルボニル基、

30

(4 6) チオモルホリニルカルボニル基、

(4 7 A) 低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいモルホリニルカルボニル基、

(4 8 A) 低級アルコキシ基及びシアノ基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいフェニル基を1～3個有していてもよいチアゾリジニルカルボニル基、

(4 9) アザビシクロ[3.2.2]ニルカルボニル基、

(5 0 A) ハロゲン置換又は無置換のフェニルオキシ基を1～3個有していてもよい8-アザビシクロ[3.2.1]オクチルカルボニル基、

(5 1) インドリニルカルボニル基、

(5 2) テトラヒドロキノリルカルボニル基、

40

(5 3) テトラヒドロピリド[3.4-b]インドリルカルボニル基、

(5 4) モルホリニル低級アルキル基、

(5 5 A) ピペラジニル基上に低級アルキル基を1～3個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基、

(5 6) モルホリニルカルボニル低級アルキル基、

(5 7 A) ピペラジニル基上に低級アルキル基を1～3個有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基、

(5 8) オキシ基、

(5 9 A) アミノ低級アルコキシ基（アミノ基上に低級アルキル基を1～2個有していてもよい）、

50

(60) 低級アルコキシ低級アルコキシ基、
 (61A) オキソ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいピペラジニル基
 (62) モルホリニル基、
 (63A) オキソ基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよい1, 3, 8-トリアザスピロ [4.5] デカニルカルボニル基、
 (64A) ピリジル基を1～3個有していてもよいテトラヒドロピリジルカルボニル基、
 (65A) チオキソ基を1個有していてもよいイミダゾリジニルカルボニル基、ならびに
 (66) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4.5] デカニル基。

【0016】

10

項3. Aが低級アルキレン基である項1又は2に記載の複素環化合物又はその塩。

【0017】

項4. R_1 が以下の基(I A)、(II A)、(III A')からなる群から選ばれたシクロC5-C6アルキル基、芳香環基又は複素環基を示す項3に記載の複素環化合物又はその塩：

(I A) シクロC5-C6アルキル基、

(II A) フェニル基、

(III A') ピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1～2個有する飽和又は不飽和複素単環基。

ここで、上記 R_1 で示されるシクロC5-C6アルキル基、芳香環及び複素環上には、項2で定義された(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい。

20

【0018】

項5. R_1 がシクロC5-C6アルキル基を示す項4に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記 R_1 で示されるシクロC5-C6アルキル基上には、項2で定義された(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい。

30

【0019】

項6. R_1 がフェニル基を示す項4に記載の複素環化合物又はその塩：

40

ここで、上記 R_1 で示されるフェニル基上には、項2で定義された(1)～(4)、(5A)、(6)～(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)～(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)～(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)～(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1～5個置換していてもよい。

【0020】

50

項7. R_1 がピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1~2個有する飽和又は不飽和複素単環基を示す項4に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記 R_1 で示される複素環上には、項2で定義された(1)~(4)、(5A)、(6)~(8)、(9A)、(10)、(11A)、(12)、(13)、(14A)、(15)、(16)、(17A)、(18)、(19A)、(20)~(26)、(27A)、(28A)、(29A)、(30A)、(31A)、(32)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)~(38)、(39A)、(40A)、(41A)、(42A)、(43)、(44A)、(45A)、(46)、(47A)、(48A)、(49)、(50A)、(51)~(54)、(55A)、(56)、(57A)、(58)、(59A)、(60)、(61A)、(62)、(63A)、(64A)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた基が1~5個置換していてもよい。

10

【0021】

項8. R_1 が以下の基(I A)、(II A)、(III A')からなる群から選ばれたシクロC5-C6アルキル基、芳香環基又は複素環基を示す項4に記載の複素環化合物又はその塩：

(I A) シクロC5-C6アルキル基、

(II A) フェニル基、

(III A')ピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1~2個有する飽和又は不飽和複素単環基。

ここで、上記 R_1 で示されるシクロC5-C6アルキル基、芳香環及び複素環上には、下記(1)、(4)、(10)、(17A)、(18)、(21)、(28A')、(29A)、(30A)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)、(39A)、(61A)及び(62)からなる群から選ばれた基が1~5個置換していてもよい。

20

(1) 低級アルキル基、

(4) 低級アルコキシ基、

(10) ヒドロキシ低級アルキル基、

(17A) 置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有するアミノ基

30

(18) 低級アルカノイル基、

(21) 低級アルコキシカルボニル基、

(28A')以下の基(i) (ii) (iv) (xii A) (xxi)からなる群から選ばれた置換基を1~2個有していてもよいカルバモイル基：

(i) 低級アルキル基、

(ii) 低級アルコキシ基、

(iv) 低級アルコキシ低級アルキル基、

(xii A) 1~2個の低級アルコキシカルボニルを有する低級アルキル基、

(xxi) ピリジル低級アルキル基、

(29A) アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、フェニル基、フェニル低級アルキル基、ベンゾイル基及びアミノ置換アルキル基(アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が1~2個置換していてもよい)からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいアミノ低級アルキル基、

40

(30A) 低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいカルバモイル基が1個置換した低級アルキル基、

(33A) オキソを1個有していてもよいオキサゾリジニル基、

(34A) オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を1~2個有していてもよいイミダゾリジニル基、

(35A) オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基、

50

(36) イミダゾリル基、

(39A) 低級アルキル基；低級アルカノイル基；低級アルキルフェニルスルホニル基；オキソ基；ヒドロキシ基；ならびに低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた置換基を1~3個有していてもよいピペリジル基、

(61A) オキソ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよいピペラジニル基及び

(62) モルホリニル基。

【0022】

10

項9. R_1 がシクロヘキシル基を示す項8に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記 R_1 で示されるシクロヘキシル基上には、項8で定義された(1)、(4)、(10)、(17A)、(18)、(21)、(28A')、(29A)、(30A)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)、(39A)、(61A)及び(62)からなる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

【0023】

項10. R_1 が、フェニル基を示す項8に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記 R_1 で示される芳香環上には、項8で定義された(1)、(4)、(10)、(17A)、(18)、(21)、(28A')、(29A)、(30A)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)、(39A)、(61A)及び(62)からなる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

20

【0024】

項11. R_1 が、フェニル基を示す項10に記載の複素環化合物又はその塩：

ここで、上記 R_1 で示される芳香環上には、下記(1)、(4)、(10)、(17A)、(18)、(28A'')、(33A)、(35A)、(39A')及び(61A')からなる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

(1) 低級アルキル基、

(4) 低級アルコキシ基、

(10) ヒドロキシ低級アルキル基、

(17A) 置換基として低級アルキル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有するアミノ基

30

(18) 低級アルカノイル基、

(28A'') 1個の低級アルコキシ低級アルキル基を有するカルバモイル基、

(33A) オキソを1個有していてもよいオキサゾリジニル基、

(35A) オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基、

(39A') ピペリジル基及び

(61A') オキソ基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいピペラジニル基。

【0025】

40

項12. R_1 が、

フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のアミノ基（該アミノ基上に1又は2個の低級アルキル基を有する）を有するフェニル基、

フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のカルバモイル基（該カルバモイル基上に、低級アルキル基（該低級アルキル基上に2個の低級アルコキシ基を有する）を1個有する）を有するフェニル基、

フェニル基上に、1個のヒドロキシ低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のオキサゾリジニル基（該オキサゾリジニル基上にオキソ基を1個有する）を有するフェニル基、

フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピロリジニ

50

ル基を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピペリジル基を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルカノイル基を有する）を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルカノイル基及び1個のオキシ基を有する）を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルコキシカルボニル基及び1個のオキシ基を有する）を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のN-[(N-低級アルコキシカルボニルアミノ)低級アルカノイル]アミノ基を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のN-(アミノ低級アルカノイル)アミノ基を有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルキル基、1個の低級アルコキシ基、及び1個のN-[(N-低級アルカノイルアミノ)低級アルカノイル]アミノ基を1個有するフェニル基、
 フェニル基上に、1個の低級アルコキシ基、1個の低級アルカノイル基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルコキシカルボニル基を有する）を有するフェニル基、又は
 フェニル基上に、1個の低級アルコキシ基、1個のヒドロキシ低級アルキル基、及び1個のピペラジル基（該ピペラジル基上に1個の低級アルコキシカルボニル基を有する）を有するフェニル基である項11に記載の複素環化合物又はその塩。

【0026】

項13. R_1 が、ピペリジル、ピラゾリル、及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1～2個有する飽和又は不飽和複素単環基を示す項8に記載の複素環化合物又はその塩：
 ここで、上記 R_1 で示される複素環上には、上記複素環基上には、項8で定義された(1)、(4)、(10)、(17A)、(18)、(21)、(28A')、(29A)、(30A)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)、(39A)、(61A)及び(62)からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

【0027】

項14. R_1 が、ピペリジル、ピラゾリル、及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1～2個有する飽和又は不飽和複素単環基を示す項13に記載の複素環化合物又はその塩：
 ここで、上記 R_1 で示される複素環上には、下記(1)、(17A')、及び(28A'')からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

(1) 低級アルキル基、

(17A') 置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有するアミノ基及び

(28A'') 低級アルキル基を1～2個有していてもよいカルバモイル基。

【0028】

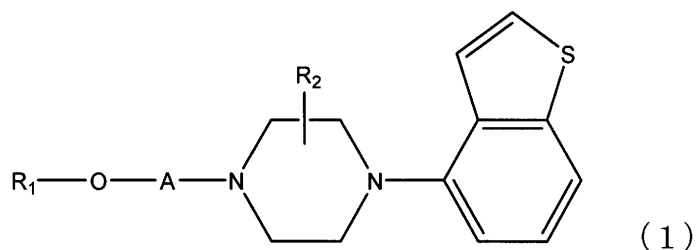
項15. R_1 が、
 1個の低級アルキル基及び1個の低級アルカノイルアミノ基を有するピラゾリル基、
 1個の低級アルキル基及び1個のN, N-ジ低級アルキルアミノ基を有するピラゾリル基、
 1個のN, N-ジ低級アルキルカルバモイル基を有するピペリジル基、又は
 1個のN, N-ジ低級アルキルカルバモイル基を有するチアゾリル基である項14に記載の複素環化合物又はその塩。

【0029】

一般式(1)で表される本発明の複素環化合物又はその塩において、式中、 R_1 、 R_2 及びAが以下の置換基を示すものが好ましい：

【0030】

【化 3】



【0031】

〔式中、 R^2 は、水素又は低級アルキル基を示す。〕

Aは低級アルキレン基又は低級アルケニレン基（好ましくは低級アルキレン基）を示す。
 R^1 は以下の基（I B）、（II A）、（III B）及び（IV）からなる群から選ばれた芳香環基又は複素環基を示す：

（I B）シクロC5-C6アルキル基（より好ましくはシクロヘキシル基）、

（II A）フェニル基、ナフチル基、ジヒドロインデニル基、テトラヒドロナフチル基からなる群から選ばれた芳香環基（より好ましくはフェニル基）、

（III B）ピロリジニル、イミダゾリジニル、ピペリジル、ヘキサヒドロピリミジニル、ピペラジニル、アゼパニル、アゾカニル、ピロリル、ジヒドロピロリル、イミダゾリル、ジヒドロイミダゾリル、トリアゾリル、ジヒドロトリアゾリル、ピラゾリル、ピリジル、ジヒドロピリジル、ピリミジニル、ジヒドロピリミジニル、ピラジニル、ジヒドロピラジニル、ピリダジニル、テトラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、オキサゾリジニル、イソオキサゾリジニル、モルホリニル、チアゾリル、ジヒドロチアゾリル、イソチアゾリル、チアジアゾリル、ジヒドロチアジニル、チアゾリジニル、テトラヒドロフリル、テトラヒドロピラニル、ピラニル、テトラヒドロチオフリル、テトラヒドロチオピラニル、チエニル及びチオピラニルからなる群から選ばれた窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有する飽和又は不飽和複素単環基（より好ましくは、ピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピラニル、チエニルから選ばれた窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から2個有する飽和又は不飽和複素単環基、さらに好ましくはピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1~2個有する飽和又は不飽和複素単環基）

、
 （IV）（1）テトラヒドロキノキサリニル基、（2）テトラヒドロキナゾリニル基、（3）ジヒドロキナゾリニル基、（4）インドリニル基、（5）インドリル基、（6）イソインドリニル基、（7）ベンゾイミダゾリニル基、（8）ジヒドロベンゾイミダゾリル基、（9）テトラヒドロベンゾアゼピニル基、（10）テトラヒドロベンゾジアゼピニル基、（11）ヘキサヒドロベンゾアゾシニル基、（12）ジヒドロベンゾオキサジニル基、（13）ジヒドロベンゾオキサゾリル基、（14）ベンゾイソキサゾリル基、（15）ベンゾオキサジアゾリル基、（16）テトラヒドロベンゾオキサゼピニル基、（17）ジヒドロベンゾチアジニル基、（18）ベンゾチアゾリル基、（19）ベンゾオキサチオリル基、（20）クロメニル基、（21）ジヒドロベンゾフリル基、（22）カルバゾリル基、（23）ジベンゾフリル基及び（24）キノキサリニル基からなる群より選ばれた窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有するベンゼン縮合複素環基、

ここで、上記 R^1 で示される芳香環及び複素環上には、下記（1）～（4）、（5A）、（6）～（8）、（9A）、（10）、（11A）、（12）～（16）、（17A）、（18）、（19B）、（20）～（26）、（27B）、（28A）、（29B）、（30A）、（31B）、（32）、（33B）、（34A）、（35B）、（36）～（38）、（39B）、（40B）、（41B）、（42B）、（43）、（44B）、（45B）、（46

10

20

30

40

50

)、(47B)、(48B)、(49)、(50B)、(51)～(54)、(55B)、(56)、(57B)、(58)、(59B)、(60)、(61B)、(62)、(63B)、(64B)、(65A)及び(66)からなる群から選ばれた少なくとも1つの基が置換していてもよい:

- (1) 低級アルキル基、
- (2) 低級アルケニル基、
- (3) ハロゲン置換低級アルキル基、
- (4) 低級アルコキシ基、
- (5A) フェノキシ基、
- (6) 低級アルキルチオ基、
- (7) ハロゲン置換低級アルコキシ基、
- (8) ヒドロキシ基、
- (9A) フェニル低級アルコキシ基、
- (10) ヒドロキシ低級アルキル基、
- (11A) 低級アルコキシ低級アルキル基、
- (12) ハロゲン、
- (13) シアノ基、
- (14) フェニル基、
- (15) ニトロ基、
- (16) アミノ基、

10

(17A) 置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有するアミノ基(より好ましくは、N-低級アルキルアミノ基、N, N-ジ低級アルキルアミノ基、N-低級アルカノイルアミノ基、N-低級アルコキシカルボニルアミノ基、N-低級アルキルスルホニルアミノ基、N-低級アルキル-N-低級アルカノイルアミノ基、N-低級アルキル-N-低級アルコキシカルボニルアミノ基、N-[カルバモイル]アミノ基、N-[N-低級アルキルカルバモイル]アミノ基、N-[N, N-ジ低級アルキルカルバモイル]アミノ基、N-[アミノ低級アルカノイル]アミノ基、N-[N-低級アルカノイルアミノ]低級アルカノイルアミノ基、N-[N-低級アルコキシカルボニルアミノ]低級アルカノイルアミノ基)、

20

- (18) 低級アルカノイル基、
- (19B) フェニル基上に低級アルキル基を有していてもよいフェニルスルホニル基(より好ましくは低級アルキルフェニルスルホニル基)、
- (20) カルボキシ基、
- (21) 低級アルコキシカルボニル基、
- (22) カルボキシ低級アルキル基、
- (23) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- (24) 低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基、
- (25) カルボキシ低級アルケニル基、
- (26) 低級アルコキシカルボニル低級アルケニル基、

30

(27B) 置換基として低級アルキル基及びハロゲン原子が1～3個置換した低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいカルバモイル低級アルケニル基(より好ましくはカルバモイル低級アルケニル基、N-低級アルキルカルバモイル低級アルケニル基、N, N-ジ低級アルキルカルバモイル低級アルケニル基又はN-ハロゲン原子が1～3個置換した低級アルキルカルバモイル低級アルケニル基)、

40

- (28B) 以下の基(i)-(vi)、(vii B)、(viii B)、(ix)、(x)、(xi B)、(xii A)、(xiii A)、(xiv)-(xvi)、(xvii A)、(xviii A)、(xix A)、(xx)、(xx)、(xxii B)、(xxiii A)、(xxiv B)、(xxv B)、(xxvi)、(xxvii B)、(xxviii)、(xxix)、(xx

50

x A)、(xxxi)、(xxxii B)、(xxxiii B)、(xxxiv B)、(xxxv A)、(xxxvi B)、(xxxvii A)、(xxxviii A)、(xxxix B)、(xl)、(xli B)、(xlii B)、(xliii)–(xlv)、(xlvi B)、(xlvii B)、(xlviii)、(xlix B)、(l)、(li B)、(lii)–(lvi)、(lvii B)、(lviii A)、(lix B)、(lx B)、(lxi)、(lxii B)、(lxiii A)、(lxiv)、(lxv A)、(lxvi)、(lxvii B)、(lxviii B)、(lxix)、(lxx B)、(lxxi B)、(lxxii B)、(lxxiii B)、(lxxiv B)、(lxxv)、(lxxvi A)、(lxxvii B)及び(lxxviii B)からなる群から選ばれた置換基を1~2個有していてもよいカルバモイル基：

(i)低級アルキル基、

(ii)低級アルコキシ基、

(iii)ヒドロキシ低級アルキル基、

(iv)低級アルコキシ低級アルキル基、

(v)アリールオキシ低級アルキル基、

(vi)ハロゲン置換低級アルキル基、

(vii B)低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基及びカルバモイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいアミノ低級アルキル基（より好ましくはN、N–ジ低級アルキルアミノ低級アルキル基、N–低級アルカノイルアミノ低級アルキル基、N–低級アルキル–N–低級アルカノイルアミノ低級アルキル基、N–低級アルキル–N–ベンゾイルアミノ低級アルキル基又はN–カルバモイルアミノ低級アルキル基）、

(viii B)置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコシカルボニル基及びフェニル低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個（好ましくは1~2個、さらに好ましくは1個）有していてもよいシクロC3-C8アルキル基、

(ix)シクロC3-C8アルキル置換低級アルキル基、

(x)低級アルケニル基、

(xi B)置換基として低級アルキル基、低級アルキル基を有していてもよいフェニル基及び低級アルコキシ基を有していてもよいフェニル基からなる群から選ばれた基を1~2個（好ましくは1個）有していてもよいカルバモイルを1~2個有する低級アルキル基（より好ましくはカルバモイル低級アルキル基、ジカルバモイル低級アルキル基、N–低級アルキルカルバモイル低級アルキル基、N、N–ジ低級アルキルカルバモイル低級アルキル基、N–[低級アルキルフェニル]カルバモイル低級アルキル基又はN–[低級アルコキシフェニル]カルバモイル低級アルキル基）、

(xii A)1~2個の低級アルコシカルボニルを有する低級アルキル基、

(xiii A)フリル基低級アルキル基（フリル基上には、1~2個の低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xiv)テトラヒドロフリル低級アルキル基、

(xv)1,3–ジオキサニル低級アルキル基、

(xvi)テトラヒドロピラニル低級アルキル基、

(xvii A)ピロリル低級アルキル基（ピロリル基上には、1~2個の低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xviii A)オキソ基を有していてもよいジヒドロピラゾリル基低級アルキル基、

(xix)ピラゾリル低級アルキル基（ピラゾリル基上には、1~3個の低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xx)イミダゾリル低級アルキル基、

(xxi)ピリジル低級アルキル基、

(xxii B)ピラジニル低級アルキル基（ピラジニル基上には、1~3個（好ましくは1個）の低級アルキル基が置換していてもよい）、

(xxiii A)ピロリジニル低級アルキル基（ピロリジニル基上には、オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基が1~2個置換していてもよい）、

(xxiv B)ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、ベンゾイル基及び低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基が1~3個（好ましくは1個）置換していてもよ

10

20

30

40

50

い)、

(xxv B) ピペラジニル低級アルキル基 (ピペラジニル基上には、低級アルキル基が1～3個 (好ましくは1個) 置換していてもよい)、

(xxvi) モルホリニル低級アルキル基、

(xxvii B) チエニル低級アルキル基 (チエニル基上には、低級アルキル基が1～3個 (好ましくは1個) 置換していてもよい)、

(xxviii) チアゾリル低級アルキル基、

(xxix) ジヒドロベンゾフリル低級アルキル基、

(xxx B) ベンゾピラニル低級アルキル基 (ベンゾピラニル基上には1個のオキシ基が置換していてもよい)、

(xxxi) ベンズイミダゾリル低級アルキル基、

(xxxii B) 低級アルキル基上に、低級アルコキシカルボニル基を1～3個 (好ましくは1個) 有していてもよいインドリル低級アルキル基、

(xxxiii B) 低級アルキル基上に、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた置換基を1～3個 (好ましくは1個) 有するイミダゾリル低級アルキル基、

(xxxiv B) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～3個 (好ましくは1個) 有していてもよいピリジル基、

(xxxv A) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個 (好ましくは1個) 有していてもよいピロリジニル基、

(xxxvi B) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及びベンゾイル基 (フェニル基上に低級アルキル基及びハロゲンからなる群から選ばれた基を1～3個 (好ましくは1個) 有していてもよい) からなる群から選ばれた基を1～3個 (好ましくは1個) 有していてもよいピペリジル基、

(xxxvii A) 1個のオキシ基を有していてもよいテトラヒドロフリル基、

(xxxviii A) 1個のオキシ基を有していてもよいヘキサヒドロアゼピニル基、

(xxxix B) 置換基として低級アルキル基、フェニル基及びフリル基からなる群から選ばれた基を1～3個 (好ましくは1個) 有していてもよいピラゾリル基、

(xl) チアゾリル基、

(xli B) 低級アルキル基を1～3個 (好ましくは1個) 有していてもよいチアジアゾリル基、

(xlii B) 低級アルキル基を1～3個 (好ましくは1～2個) 有していてもよいイソキサゾリル基、

(xliii) インダゾリル基、

(xliv) インドリル基、

(xlv) テトラヒドロベンゾチアゾリル基、

(xlvi B) 置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン及びオキシ基からなる群から選ばれた基を1～3個 (好ましくは1～2個) 有していてもよいテトラヒドロキノリル基、

(xlvii B) 低級アルキル基を1～3個 (好ましくは1個) 有していてもよいキノリル基、

(xlviii) ベンゾジオキサリル低級アルキル基、

(xlix B) フェニル基又はナフチル基、(それぞれ置換基としてハロゲン; 低級アルキル基; 低級アルコキシ基; ハロゲン置換低級アルキル基; ハロゲン置換低級アルコキシ基; 低級アルケニル基; 低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ基; スルファモイル基; 低級アルキルチオ基; 低級アルカノイル基; 低級アルコキシカルボニル基; ピロリル基; 低級アルキニル基; シアノ基; ニトロ基; フェニルオキシ基; フェニル低級

10

20

30

40

50

アルコキシ基；ヒドロキシ基；ヒドロキシ低級アルキル基；低級アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいカルバモイル基；ピラゾリル基；オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基；オキサゾリル基；低級アルキル基を1～3個（好ましくは1～2個）有していてもよいイミダゾリル基；オキソ基を1個有していてもよいジヒドロフリル基；オキソ基を2個有していてもよいチアゾリジニル低級アルキル基；イミダゾリル低級アルカノイル基及びピペリジニルカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～3個有していてもよい）、

(l) シアノ低級アルキル基、

(li B) 低級アルキル基及びオキソ基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよいジヒドロキノリル基

10

(lii) ハロゲン置換低級アルキルアミノ基、

(liii) 低級アルキルチオ低級アルキル基、

(liv) 低級アルキル基を有していてもよいアミジノ基、

(lv) アミジノ低級アルキル基、

(lvi) 低級アルケニルオキシ低級アルキル基、

(lvii B) フェニル基上に低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン置換低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた置換基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいフェニルアミノ基、

(lviii A) フェニル低級アルケニル基、

(lix B) 低級アルキル基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよいピリジルアミノ基（より好ましくは、N-低級アルキル-N-[低級アルキルフェニル]アミノ基）、

20

(lx B) フェニル低級アルキル基（フェニル基上及び／又は低級アルキル基上には、ハロゲン、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基が1～3個（より好ましくは1～2個）置換していてもよい）、

(lxi) 低級アルキニル基、

(lxii B) フェニルオキシ低級アルキル基（フェニル基上には、低級アルコキシ基、N-低級アルコキシ-N-低級アルキルカルバモイル基及びオキソピロリジニル基からなる群から選ばれた基が1～3個（より好ましくは1個）置換していてもよい）、

30

(lxiii A) オキソ基を1個有していてもよいイソキサゾリジニル基、

(lxiv) ジヒドロインデニル基、

(lxv A) フェニル低級アルコキシ低級アルキル基、

(lxvi) テトラヒドロピラニル基、

(lxvii B) 低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいアゼチジニル基、

(lxviii B) 低級アルカノイル基及びベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいアゼチジニル低級アルキル基、

(lxix) テトラゾリル基、

(lxx A) オキソ基を1個有していてもよいインドリニル基、

40

(lxxi B) 低級アルキル基及び低級アルキルチオ基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよいトリアゾリル基、

(lxxii B) カルバモイル基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいイミダゾリル基、

(lxxiii B) 低級アルキル基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいオキサゾリル基、

(lxxiv B) 低級アルキル基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいイソチアゾリル基、

(lxxv) ベンゾイミダゾリル基、

(lxxvi A) オキソ基を1個有していてもよいジヒドロベンゾチアゾリル基、

50

(lxxvii B) 低級アルコキシカルボニル基を1~3個（より好ましくは1個）有していてもよいチエニル基ならびに

(lxxviii B) 低級アルキル基を1~3個（より好ましくは1~2個）有していてもよいオキサゾリル低級アルキル基

(29B) アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、フェニル基、フェニル低級アルキル基、ベンゾイル基及びアミノ置換アルキル基（アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が1~2個（より好ましくは2個）置換していてもよい）からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいアミノ低級アルキル基、

(30A) 低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいカルバモイル基が1個置換した低級アルキル基、

(31B) 低級アルキル基を1~2個（より好ましくは1個）有していてもよいチオカルバモイル基、

(32) スルファモイル基、

(33B) オキソ基を1個有していてもよいオキサゾリジニル基（より好ましくは1個のオキソ基が置換したオキサゾリジニル基）、

(34A) オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を1~2個有していてもよいイミダゾリジニル基、

(35B) オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基（より好ましくは1個のオキソ基が置換したピロリジニル基）、

(36) イミダゾリル基、

(37) トリアゾリル基、

(38) イソキサゾリル基、

(39B) 低級アルキル基；低級アルカノイル基；低級アルキルフェニルスルホニル基；オキソ基；ヒドロキシ基；及び低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた置換基を1~3個（より好ましくは1~2個；さらに好ましくは1個）有していてもよいピペリジル基（さらに好ましくは、低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルキルフェニルスルホニル基、オキソ基、ヒドロキシ基、アミノ基、N-低級アルキル基アミノ基、N, N-ジ低級アルキルアミノ基、N-低級アルカノイルアミノ基、N-低級アルキル-N-低級アルコキシカルボニルアミノ基、N-低級アルキル-N-低級アルカノイルアミノ基、N-低級アルカノイルアミノ低級アルカノイルアミノ基からなる群から選ばれた置換基を1~3個（より好ましくは1~2個；さらに好ましくは1個）有していてもよいピペリジル基）、

(40B) 置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルカノイル基、カルボキシ低級アルキル基、低級アルキルカルバモイル低級アルキル基、カルバモイル基、低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ基（アミノ基上に低級アルキル基、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基およびベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよい）、ピペリジル基（ピペリジル基上には、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基およびベンゾイル基からなる群から選ばれた基を1~3個（より好ましくは1個）有していてもよい）、ピペラジニル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が1~3個（より好ましくは1~2個）置換していてもよい）、1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デシル基、モルホリニル基、ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基（ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基上には、1~3個（好ましくは1個）の低級アルキル基が置換していてもよい）、ピリジル基、ピリジルオキシ基、ピリジル低級アルコキシ基、テトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキソ基を1個有していてもよい）、ベンゾジオキソリル基、フェニル低級アルコキシ基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個（より好ましくは1~2個）有していてもよい）、フェニル基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルコ

10

20

30

40

50

キシ基及びヒドロキシ基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよい）、フェニルオキシ基（フェニル基上にはシアノ基、ハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよい）、フェニル低級アルキル基（フェニル基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよい）及びベンゾイル基（フェニル基上にはハロゲン及び低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよい）からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいピペリジルカルボニル基、

（41B）置換基としてヒドロキシ低級アルキル基、カルバモイル基、ヒドロキシ基、アミノ基、アミノ基（アミノ基上には、低級アルキル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基、ピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、1～3個（好ましくは1個）の低級アルキル基が置換していてもよい）、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、1～2個の低級アルキル基が置換していてもよい）、フェニルオキシ基（フェニル基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよい）、フェニルオキシ低級アルキル基（フェニル基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよい）及びテトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキソ基を有していてもよい）からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいピロリジニルカルボニル基、

（42B）置換基として低級アルキル基、シクロC3-C8アルキル基、低級アルカノイル基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、低級アルキル基が1～2個置換していてもよい）、ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、低級アルキル基が1～2個（より好ましくは1個）置換していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、1,3-ジオキソラニル低級アルキル基、テトラヒドロフリル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基（低級アルキル基上には、フェニル基が1～2個（より好ましくは1個）置換していてもよい）、イミダゾリル低級アルキル基、フリル低級アルキル基、ピロリジニルカルボニル低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を1～2個（より好ましくは1個）有していてもよいピペリジル基、ピリジル基（ピリジル基上には、低級アルキル基、シアノ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基が1～3個（より好ましくは1個）置換していてもよい）及びチエノ[2,3-b]ピリジル基、フェニル基（フェニル基上にハロゲン及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよい）、ベンゾイル基、フリルカルボニル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基及びオキソ基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよいピペラジニルカルボニル基、

（43）ヘキサヒドロアゼピニルカルボニル基、

（44B）置換基として低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた置換基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニルカルボニル基、

（45B）低級アルキル基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよいジヒドロピロリルカルボニル基、

（46）チオモルホリニルカルボニル基、

（47B）低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいモルホリニルカルボニル基、

（48B）低級アルコキシ基及びシアノ基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1個）有してもよいフェニル基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいチアゾリジニルカルボニル基、

（49）アザビシクロ[3.2.2]ニルカルボニル基、

10

20

30

40

50

(50B) ハロゲン置換又は無置換のフェニルオキシ基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよい8-アザビシクロ[3.2.1]オクチルカルボニル基、

(51) インドリニルカルボニル基、

(52) テトラヒドロキノリルカルボニル基、

(53) テトラヒドロピリド[3.4-b]インドリルカルボニル基、

(54) モルホリニル低級アルキル基、

(55B) ピペラジニル基上に低級アルキル基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいピペラジニル低級アルキル基、

(56) モルホリニルカルボニル低級アルキル基、

(57B) ピペラジニル基上に低級アルキル基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基、

(58) オキソ基、

(59B) アミノ低級アルコキシ基（アミノ基上に低級アルキル基を1～2個（より好ましくは2個）有していてもよい）、

(60) 低級アルコキシ低級アルコキシ基、

(61B) オキソ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよいピペラジニル基（より好ましくは、1個のオキソ基が置換したピペラジニル基、1個の低級アルキル基が置換したピペラジニル基、1個の低級アルカノイル基が置換したピペラジニル基、1個のオキソ基と1個の低級アルカノイル基が置換したピペラジニル基、1個のオキソ基と1個の低級アルコキシカルボニル基が置換したピペラジニル基）

(62) モルホリニル基、

(63B) オキソ基及びフェニル基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよい1, 3, 8-トリアザスピロ[4.5]デカニルカルボニル基、

(64B) プリジル基を1～3個（より好ましくは1個）有していてもよいテトラヒドロプリジルカルボニル基、

(65B) チオキソ基を1個有していてもよいイミダゾリジニルカルボニル基、

(66) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デカニル基]

で表される複素環化合物又はその塩。

【0032】

上記一般式(1)において、 R_1 は、シクロヘキシル基、フェニル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピラゾリル基、プリジル基、プリミジニル基、又はチアゾリル基が好ましい。

ここでシクロヘキシル基、フェニル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピラゾリル基、プリジル基、プリミジニル基及びチアゾリル基上には、好ましくは、下記(1)、(4)、(10)、(17)、(21)、(28C)、(29A)、(30A)、(33A)、(34A)、(35A)、(36)、(39C)、(61C)及び(62)からなる群から選ばれた基が1～3個、好ましくは1～2個置換している：

(1) 低級アルキル基、

(4) 低級アルコキシ基、

(10) ヒドロキシ低級アルキル基、

(17) 置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有するアミノ基、

(21) 低級アルコキシカルボニル基、

(28C) 以下の基(i)、(ii)、(iv)、(xii A) 及び(xxi)からなる群から選ばれた置換基を1～2個有していてもよいカルバモイル基：

(i) 低級アルキル基、

(ii) 低級アルコキシ基、

(iv) 低級アルコキシ低級アルキル基、

(xii A) 1~2個の低級アルコキシカルボニルを有する低級アルキル基、及び

(xxi) ピリジル低級アルキル基、

(29A) アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、フェニル基、フェニル低級アルキル基、ベンゾイル基及びアミノ置換アルキル基（アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が1~2個置換していてもよい）からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいアミノ低級アルキル基、

(30A) 低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいカルバモイル基が1個置換した低級アルキル基、

(33A) オキソを1個有していてもよいオキサゾリジニル基、

(34A) オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を1~2個有していてもよいイミダゾリジニル基、

(35A) オキソ基を1個有していてもよいピロリジニル基、

(36) イミダゾリル基、

(39C) 低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルキルフェニルスルホニル基、オキソ基、ヒドロキシ基、アミノ基、N-低級アルキル基アミノ基、N, N-ジ低級アルキルアミノ基、N-低級アルカノイルアミノ基、N-低級アルキル-N-低級アルコキシカルボニルアミノ基、N-低級アルキル-N-低級アルカノイルアミノ基、N-低級アルカノイルアミノ低級アルカノイルアミノ基からなる群から選ばれた置換基を1~3個有していてもよいピペリジル基

(61C) オキソ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいピペラジニル基及び

(62) モルホリニル基。

【0033】

前記一般式(1)において示される各基は、具体的には次の通りである。

【0034】

低級アルキル基としては、炭素数1~6の直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基を挙げることができる。より具体的には、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、sec-ブチル、n-ペンチル、1-エチルプロピル、イソペンチル、ネオペンチル、n-ヘキシル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、3, 3-ジメチルブチル、2-エチルブチル、イソヘキシル、3-メチルペンチル基等が含まれる。

【0035】

低級アルキレン基としては、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を挙げることができる。より具体的には、メチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2, 2-ジメチルエチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等が含まれる。

【0036】

低級アルケニレン基としては、二重結合を1~3個有する炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニレン基を挙げることができる。より具体的には、ビニレン、1-プロペニレン、1-メチルー1-プロペニレン、2-メチルー1-プロペニレン、2-プロペニレン、2-ブテニレン、1-ブテニレン、3-ブテニレン、2-ペンテニレン、1-ペンテニレン、3-ペンテニレン、4-ペンテニレン、1, 3-ブタジエニレン、1, 3-ペンタジエニレン、2-ペンテン-4-イニレン、2-ヘキセニレン、1-ヘキセニレン、5-ヘキセニレン、3-ヘキセニレン、4-ヘキセニレン、3, 3-ジメチルー1-プロペニレン、2-エチルー1-プロペニレン、1, 3, 5-ヘキサトリエニレン、1, 3-ヘキサジエニレン、1, 4-ヘキサジエニレン基等が含まれる。

【0037】

低級アルケニル基としては、二重結合を1～3個有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を挙げることができ、トランス体及びシス体の両者を包含する。より具体的には、ビニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、2-プロペニル、2-ブテニル、1-ブテニル、3-ブテニル、2-ペンテニル、1-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1, 3-ブタジエニル、1, 3-ペンタジエニル、2-ペンテン-4-イル、2-ヘキセニル、1-ヘキセニル、5-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、3, 3-ジメチル-1-プロペニル、2-エチル-1-プロペニル、1, 3, 5-ヘキサトリエニル、1, 3-ヘキサジエニル、1, 4-ヘキサジエニル基等が含まれる。

【0038】

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挙げられる。

【0039】

ハロゲン置換低級アルキル基としては、ハロゲン原子が1～7個、より好ましくは1～3個置換した前記例示の低級アルキル基を挙げることができる。より具体的には、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ブロモメチル、ジブロモメチル、ジクロロフルオロメチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、3, 3, 3-トリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、2, 2, 3, 3, 3-ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロイソプロピル、3-クロロプロピル、2-クロロプロピル、3-ブロモプロピル、4, 4, 4-トリフルオロブチル、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチル、4-クロロブチル、4-ブロモブチル、2-クロロブチル、5, 5, 5-トリフルオロペンチル、5-クロロペンチル、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル、6-クロロヘキシル、ペルフルオロヘキシル基等が含まれる。

【0040】

低級アルコキシ基としては、炭素数1～6の直鎖又は分岐鎖状のアルコキシ基を挙げることができる。より具体的には、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、tert-ブトキシ、sec-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、ネオペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、イソヘキシルオキシ、3-メチルペンチルオキシ基等が含まれる。

【0041】

アリール基としては、例えば、フェニル、置換フェニル、ビフェニル、置換ビフェニル、ナフチル、置換ナフチル基等を挙げることができる。アリール基の置換基としては、例えば、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）、前記例示のハロゲン、アミノ基等が挙げられ、これらの少なくとも1個が、アリール基上に1～7個、好ましくは1～5個、より好ましくは1～2個置換していてもよい。このようなアリールの具体例としては、フェニル、(2-, 3-, 又は4-)ビフェニル、(1-, 又は2-)ナフチル、(2-, 3-, 又は4-)メチルフェニル、(2-, 3-, 又は4-)エチルフェニル、(2-, 3-, 又は4-)n-プロピルフェニル、(2-, 3-, 又は4-)n-ブチルフェニル、(2-, 3-, 又は4-)n-ペンチルフェニル、(2-, 3-, 又は4-)n-ヘキシルフェニル、(2-, 3-, 又は4-)イソブチルフェニル、(2-, 3-, 又は4-)tert-ブチルフェニル、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 又は6'-)メチル-2-ビフェニル、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 又は6'-)メチル-3-ビフェニル、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 又は6'-)メチル-4-ビフェニル、(3-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 又は6'-)エチル-2-ビフェニル、(2-, 4-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 又は6'-)エチル-3-ビフェニル、(2-, 3-, 5-, 6-, 2'-, 3'-, 4'-, 5'-, 又は6'-)エチル-4-ビフェニル、(3-, 4-

ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) n-プロピル-2-ビ
 フェニル、(2ー、4ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー)
 n-プロピル-3-ビフェニル、(2ー、3ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、
 5'ー、又は6'ー) n-プロピル-4-ビフェニル、(3ー、4ー、5ー、6ー、2'
 ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) n-ブチル-2-ビフェニル、(2ー、4ー
 、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) n-ブチル-3-ビフェ
 ニル、(2ー、3ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) n-
 ブチル-4-ビフェニル、(3ー、4ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー
 、又は6'ー) n-ペンチル-2-ビフェニル、(2ー、4ー、5ー、6ー、2'ー、3
 'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) n-ペンチル-3-ビフェニル、(2ー、3ー、5
 ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) n-ペンチル-4-ビフェニ
 ル、(3ー、4ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) n-ヘ
 キシル-2-ビフェニル、(2ー、4ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー
 、又は6'ー) n-ヘキシル-3-ビフェニル、(2ー、3ー、5ー、6ー、2'ー、3
 'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) n-ヘキシル-4-ビフェニル、(3ー、4ー、5
 ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) イソブチル-2-ビフェニル
 、(2ー、4ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) イソブチ
 ル-3-ビフェニル、(2ー、3ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又
 は6'ー) イソブチル-4-ビフェニル、(3ー、4ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、
 4'ー、5'ー、又は6'ー) tert-ブチル-2-ビフェニル、(2ー、4ー、5ー
 、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) tert-ブチル-3-ビフェ
 ニル、(2ー、3ー、5ー、6ー、2'ー、3'ー、4'ー、5'ー、又は6'ー) tert
 -ブチル-4-ビフェニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) メ
 チル-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) メチル-2-
 ナフチル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) エチル-1-ナフチル、
 (1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) エチル-2-ナフチル、(2ー、3
 ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-プロピル-1-ナフチル、(1ー、3ー、
 4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-プロピル-2-ナフチル、(2ー、3ー、4ー
 、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-ブチル-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー
 、6ー、7ー、又は8ー) n-ブチル-2-ナフチル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー
 、7ー、又は8ー) n-ペンチル-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7
 ー、又は8ー) n-ペンチル-2-ナフチル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、
 又は8ー) n-ヘキシル-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は
 8ー) n-ヘキシル-2-ナフチル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー)
 イソブチル-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) イソ
 ブチル-2-ナフチル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) tert-
 ブチル-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) tert-
 ブチル-2-ナフチル、(2ー、3ー、又は4ー) クロロフェニル、(2ー、3ー、又は
 4ー) フルオロフェニル、(2ー、3ー、又は4ー) ブロモフェニル、(2ー、3ー、4
 ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) クロロ-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、
 6ー、7ー、又は8ー) クロロ-2-ナフチル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー
 、又は8ー) フルオロ-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8
 ー) フルオロ-2-ナフチル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) ブロ
 モ-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) ブロモ-2-ナ
 フチル、(2ー、3ー、又は4ー) アミノフェニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、
 7ー、又は8ー) アミノ-1-ナフチル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は
 8ー) アミノ-2-ナフチル、2, 3-ジメチルフェニル、3, 4-ジメチルフェニル、
 2, 4-ジメチルフェニル、2, 5-ジメチルフェニル、2, 6-ジメチルフェニル、2
 , 4, 6-トリメチルフェニル、3, 4, 5-トリメチルフェニル、2, 3, 4, 5-テ
 トラエチルフェニル、ペンタメチルフェニル、2, 4-ジメチル-1-ナフチル、2, 3

10

20

30

40

50

ージメチル-1-ナフチル、3, 4-ジメチル-1-ナフチル、3, 5, 7-トリエチルナフチル、3, 4, 5, 7-テトラメチル-1-ナフチル、2, 3, 4, 5, 7-ペンタメチル-1-ナフチル、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサエチル-1-ナフチル、ヘプタメチル-1-ナフチル、2, 3-ジアミノフェニル、2, 4, 6-トリアミノフェニル、2-メチル-5-クロロ-1-ナフチル基等が挙げられる。

【0042】

アリールオキシ基としては、例えば、フェニルオキシ、置換フェニルオキシ、ビフェニルオキシ、置換ビフェニルオキシ、ナフチルオキシ、置換ナフチルオキシ基等を挙げることができる。アリールオキシ基の置換基としては、例えば、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）、前記例示のハロゲン、アミノ基等が挙げられ、これらの少なくとも1個が、アリール基上に1～7個、好ましくは1～5個、より好ましくは1～2個置換していてもよい。このようなアリールオキシの具体例としては、フェニルオキシ、（2-、3-、又は4-）ビフェニルオキシ、（1-、又は2-）ナフチルオキシ、（2-、3-、又は4-）メチルフェニルオキシ、（2-、3-、又は4-）エチルフェニルオキシ、（2-、3-、又は4-）n-プロピルフェニルオキシ、（2-、3-、又は4-）n-ブチルフェニルオキシ、（2-、3-、又は4-）n-ペンチルフェニルオキシ、（2-、3-、又は4-）n-ヘキシルフェニルオキシ、（2-、3-、又は4-）イソブチルフェニルオキシ、（2-、3-、又は4-）tert-ブチルフェニルオキシ、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）メチル-2-ビフェニルオキシ、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）メチル-3-ビフェニルオキシ、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）メチル-4-ビフェニルオキシ、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）エチル-2-ビフェニルオキシ、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）エチル-3-ビフェニルオキシ、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）エチル-4-ビフェニルオキシ、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-プロピル-2-ビフェニルオキシ、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-プロピル-3-ビフェニルオキシ、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-プロピル-4-ビフェニルオキシ、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ブチル-2-ビフェニルオキシ、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ブチル-3-ビフェニルオキシ、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ブチル-4-ビフェニルオキシ、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ペンチル-2-ビフェニルオキシ、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ペンチル-3-ビフェニルオキシ、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ペンチル-4-ビフェニルオキシ、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ヘキシル-2-ビフェニルオキシ、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ヘキシル-3-ビフェニルオキシ、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）n-ヘキシル-4-ビフェニルオキシ、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）イソブチル-2-ビフェニルオキシ、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）イソブチル-3-ビフェニルオキシ、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）イソブチル-4-ビフェニルオキシ、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）tert-ブチル-2-ビフェニルオキシ、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）tert-ブチル-3-ビフェニルオキシ、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）tert-ブチル-4-ビフェニルオキシ、（2-、3-、4-、5-、

10

20

30

40

50

6-、7-、又は8-)メチル-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)メチル-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)エチル-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)エチル-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)n-プロピル-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)n-プロピル-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)n-ブチル-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)n-ブチル-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)n-ペンチル-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)n-ペンチル-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)n-ヘキシル-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)n-ヘキシル-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)イソブチル-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)イソブチル-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)tert-ブチル-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)tert-ブチル-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、又は4-)クロロフェニルオキシ、(2-、3-、又は4-)フルオロフェニルオキシ、(2-、3-、又は4-)ブロモフェニルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)クロロ-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)クロロ-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)フルオロ-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)フルオロ-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)ブロモ-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)ブロモ-2-ナフチルオキシ、(2-、3-、又は4-)アミノフェニルオキシ、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)アミノ-1-ナフチルオキシ、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)アミノ-2-ナフチルオキシ、2,3-ジメチルフェニルオキシ、3,4-ジメチルフェニルオキシ、2,4-ジメチルフェニルオキシ、2,5-ジメチルフェニルオキシ、2,6-ジメチルフェニルオキシ、2,4,6-トリメチルフェニルオキシ、3,4,5-トリメチルフェニルオキシ、2,3,4,5-テトラエチルフェニルオキシ、ペンタメチルフェニルオキシ、2,4-ジメチル-1-ナフチルオキシ、2,3-ジメチル-1-ナフチルオキシ、3,4-ジメチル-1-ナフチルオキシ、3,5,7-トリエチル-1-ナフチルオキシ、3,4,5,7-テトラメチル-1-ナフチルオキシ、2,3,4,5,7-ペンタメチル-1-ナフチルオキシ、2,3,4,5,6,7-ヘキサエチル-1-ナフチルオキシ、ヘプタメチル-1-ナフチルオキシ、2,3-ジアミノフェニルオキシ、2,4,6-トリアミノフェニルオキシ、2-メチル-5-クロロ-1-ナフチルオキシ等が挙げられる。

【0043】

低級アルキルチオ基としては、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基を挙げることができる。より具体的には、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、tert-ブチルチオ、n-ペンチルチオ、n-ヘキシルチオ基等が含まれる。

【0044】

ハロゲン置換低級アルコキシ基としては、ハロゲン原子が1~7個、好ましくは1~3個置換した前記例示の低級アルコキシ基を挙げることができる。より具体的には、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ブロモメトキシ、ジブロモメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロイソプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-ブロモプロポキシ、4,4,4-トリフルオロブトキシ、4,4,4,3,3-ペンタフルオロブトキシ

、4-クロロブトキシ、4-ブロモブトキシ、2-クロロブトキシ、5, 5, 5-トリフルオロペンチキシ、5-クロロペンチキシ、6, 6, 6-トリフルオロヘキシルオキシ、6-クロロヘキシルオキシ基等が含まれる。

【0045】

ヒドロキシ基の保護基としては、例えば、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）、低級アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニル低級アルキル基を挙げることができる。

【0046】

保護されたヒドロキシ基としては、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、tert-ブトキシ、sec-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、ネオペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、イソヘキシルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、低級アルカノイルオキシ基、フェニル低級アルコキシ基等を挙げることができる。より具体的には、ホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、ペンタノイルオキシ、tert-ブチルカルボニルオキシ、ヘキサノイルオキシ、ベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、1-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ、2-メチル-3-フェニルプロポキシ基等が挙げられる。

【0047】

ヒドロキシ低級アルキル基としては、ヒドロキシ基を1～5個、好ましくは1～3個有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、2, 3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、3, 4-ジヒドロキシブチル、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、3, 3-ジメチル-3-ヒドロキシプロピル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル、2, 3, 4-トリヒドロキシブチル、ペルヒドロキシヘキシル基等が含まれる。

【0048】

ヒドロキシ低級アルキル基の保護基としては、例えば、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）、低級アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニル低級アルキル基を挙げることができる。

【0049】

保護されたヒドロキシ低級アルキル基としては、前記例示の保護されたヒドロキシ基（好ましくは低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基又はフェニル低級アルコキシ基）を1～5個、好ましくは1～3個有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的にはメトキシメチル、2-メトキシエチル、2-エトキシエチル、2-n-プロポキシエチル、2-イソプロポキシエチル、2-n-ブトキシエチル、2-イソブトキシエチル、2-tert-ブトキシエチル、2-sec-ブトキシエチル、2-n-ペンチルオキシエチル、2-イソペンチルオキシエチル、2-ネオペンチルオキシエチル、2-n-ヘキシルオキシエチル、2-イソヘキシルオキシエチル、2-(3-メチルペンチルオキシ)エチル、2-ホルミルオキシエチル、2-アセチルオキシエチル、2-プロピオニルオキシエチル、2-ブチリルオキシエチル、2-イソブチリルオキシエチル、2-ペンタノイルオキシエチル、2-tert-ブチルカルボニルオキシエチル、2-ヘキサノイルオキシエチル、2-ベンジルオキシエチル、2-(2-フェニルエトキシ)エチル、2-(1-フェニルエトキシ)エチル、2-(3-フェニルプロポキシ)エチル、2-(4-フェニルブトキシ)エチル、2-(5-フェニルペンチルオキシ)エチル、2-(6-フェニルヘキシルオキシ)エチル、2-(1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ)エチル、2-(2-

10

20

30

40

50

メチル-3-フェニルプロポキシ)エチル、3-エトキシプロピル、2,3-ジエトキシプロピル、4-エトキシブチル、3,4-ジエトキシブチル、1,1-ジメチル-2-エトキシエチル、5-エトキシペンチル、6-エトキシヘキシル、3,3-ジメチル-3-エトキシプロピル、2-メチル-3-エトキシプロピル、2,3,4-トリエトキシブチル基等が含まれる。

【0050】

低級アルカノイル基としては、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を挙げることができる。より具体的には、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、tert-ブチルカルボニル、ヘキサノイル基等が含まれる。

【0051】

低級アルコキシカルボニル基としては、低級アルコキシ部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1~6の直鎖状又は分岐鎖状のアルコキシカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、n-ペンチルオキシカルボニル、ネオペンチルオキシカルボニル、n-ヘキシルオキシカルボニル、イソヘキシルオキシカルボニル、3-メチルペンチルオキシカルボニル基等が含まれる。

【0052】

低級アルキルスルホニル基としては、低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を挙げることができる。より具体的には、メチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、tert-ブチルスルホニル、sec-ブチルスルホニル、n-ペンチルスルホニル、イソペンチルスルホニル、ネオペンチルスルホニル、n-ヘキシルスルホニル、イソヘキシルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル基等が含まれる。

【0053】

低級アルキルカルバモイル基としては、置換基として前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1~2個有するカルバモイル基を挙げることができる。より具体的には、N-メチルカルバモイル、N,N-ジメチルカルバモイル、N-エチルカルバモイル、N,N-ジエチルカルバモイル、N-n-プロピルカルバモイル、N-n-ブチルカルバモイル、N-n-ペンチルカルバモイル、N-n-ヘキシルカルバモイル、N-イソブチルカルバモイル、N-tert-ブチルカルバモイル、N,N-ジ-n-プロピルカルバモイル基等が含まれる。

【0054】

アミノ低級アルカノイル基としては、アミノ基を1~3個（好ましくは1個）有する前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）を挙げることができる。より具体的にはアミノアセチル、3-アミノプロピオニル、4-アミノブチリル、3,4-ジアミノブチリル、3,3-ジメチル-3-アミノプロピオニル、4-アミノブチリル、5-アミノバレリル基等が含まれる。

【0055】

低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基としては、低級アルカノイル部分が前記例示の低級アルカノイルアミノ基を1~3個（好ましくは1個）有する前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）を挙げることができる。より具体的にはN-ホルミルアミノアセチル、N-アセチルアミノアセチル、N-プロピオニルアミノアセチル、3-(N-アセチルアミノ)プロピオニル、4-(N-アセチルアミノ)ブチリル、3,4-ジ(N-アセチルアミノ)ブチリル、3,3-ジメチル-3-(N-プロピニルアミノ)プロピオニル、4-(N-ホルミルアミノ)ブチリル、5-(N-アセチルアミノ)バレリル基等が含まれる。

【0056】

低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基としては、低級アルコキシカルボ

10

20

30

40

50

ニル部分が前記例示の低級アルコキシカルボニルアミノ基を1～3個（好ましくは1個）有する前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）を挙げることができる。より具体的にはN-メトキシカルボニルアミノアセチル、N-エトキシカルボニルアミノアセチル、N-tert-ブトキシカルボニルアミノアセチル、3-（N-メトキシカルボニルアミノ）プロピオニル、4-（N-メトキシカルボニルアミノ）ブチリル、3, 4-ジ（N-メトキシカルボニルアミノ）ブチリル、3, 3-ジメチル-3-（N-tert-ブトキシカルボニルアミノ）プロピオニル、4-（N-tert-ブトキシカルボニルアミノ）ブチリル、5-（N-tert-ブトキシカルボニルアミノ）バレリル基等が含まれる。

【0057】

置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、カルバモイル基、低級アルキルカルバモイル基、アミノ低級アルカノイル基、低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を有するアミノ基としては、置換基として、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）；前記例示の低級アルコキシカルボニル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基）；前記例示の低級アルキルスルホニル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基）；カルバモイル基；前記例示の低級アルキルカルバモイル基（好ましくは置換基として前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1～2個有するカルバモイル基）；前記例示のアミノ低級アルカノイル基；前記例示の低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基；及び前記例示の低級アルコキシカルボニルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有することのあるアミノ基を挙げることができる。より具体的には、例えば、アミノ、N-メチルアミノ、N, N-ジメチルアミノ、N-エチルアミノ、N-n-プロピルアミノ、N-イソプロピルアミノ、N-ホルミルアミノ、N-アセチルアミノ、N-tert-ブトキシカルボニルアミノ、N-メトキシカルボニルアミノ、N-メチルスルホニルアミノ、N-エチルスルホニルアミノ、N-メチル-N-アセチルアミノ、N-メチル-N-メトキシカルボニルアミノ、N-〔N, N-ジメチルカルバモイル〕アミノ、N-カルバモイルアミノ、N-〔N-メチルカルバモイル〕アミノ、N-〔N, N-ジエチルカルバモイル〕アミノ、N-〔アミノアセチル〕アミノ、N-〔〔N-ホルミルアミノ〕アセチル〕アミノ、N-〔〔N-アセチルアミノ〕アセチル〕アミノ、N-〔〔N-メトキシカルボニルアミノ〕アセチル〕アミノ、N-〔〔N-tert-ブトキシカルボニルアミノ〕アセチル〕アミノ基を挙げることができる。

【0058】

アリール基上に低級アルキル基を有していてもよいアリールスルホニル基としては、アリール部分が、フェニル、ビフェニル、ナフチル等であり、当該アリール部分上に、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～7個、好ましくは1～5個、より好ましくは1～2個有することのあるアリールスルホニル基を挙げることができる。このようなアリール基上に低級アルキル基を有していてもよいアリールスルホニル基の具体例としては、フェニルスルホニル、（2-、3-、又は4-）ビフェニルスルホニル、（1-、又は2-）ナフチルスルホニル、（2-、3-、又は4-）メチルフェニルスルホニル、（2-、3-、又は4-）エチルフェニルスルホニル、（2-、3-、又は4-）n-プロピルフェニルスルホニル、（2-、3-、又は4-）n-ブチルフェニルスルホニル、（2-、3-、又は4-）n-ペンチルフェニルスルホニル、（2-、3-、又は4-）n-ヘキシルフェニルスルホニル、（2-、3-、又は4-）イソブチルフェニルスルホニル、（3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）メチル-2-ビフェニルスルホニル、（2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-）メチル-3-ビフェニルスルホニル、（2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、

10

20

30

40

50

5'-、又は6'-)メチル-4-ビフェニルスルホニル、(3'-、4'-、5'-、6'-、
 2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)エチル-2-ビフェニルスルホニル、(
 2'-、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)エチル-3-
 ビフェニルスルホニル、(2'-、3'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、
 又は6'-)エチル-4-ビフェニルスルホニル、(3'-、4'-、5'-、6'-、2'-、
 3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-プロピル-2-ビフェニルスルホニル、(2'-
 1、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-プロピル-
 3-ビフェニルスルホニル、(2'-、3'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-
 1、又は6'-)n-プロピル-4-ビフェニルスルホニル、(3'-、4'-、5'-、6'-
 、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ブチル-2-ビフェニルスルホニ
 ル、(2'-、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ブ
 チル-3-ビフェニルスルホニル、(2'-、3'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-
 、5'-、又は6'-)n-ブチル-4-ビフェニルスルホニル、(3'-、4'-、5'-、
 6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ペンチル-2-ビフェニルス
 ルホニル、(2'-、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)
 n-ペンチル-3-ビフェニルスルホニル、(2'-、3'-、5'-、6'-、2'-、3'-
 、4'-、5'-、又は6'-)n-ペンチル-4-ビフェニルスルホニル、(3'-、4'-
 1、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ヘキシル-2-ビ
 フェニルスルホニル、(2'-、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又
 は6'-)n-ヘキシル-3-ビフェニルスルホニル、(2'-、3'-、5'-、6'-、2'-
 1、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ヘキシル-4-ビフェニルスルホニル、
 (3'-、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)イソブチル
 -2-ビフェニルスルホニル、(2'-、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-
 1、又は6'-)イソブチル-3-ビフェニルスルホニル、(2'-、3'-、5'-、6'-
 、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)イソブチル-4-ビフェニルスルホニ
 ル、(3'-、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)ter
 t-ブチル-2-ビフェニルスルホニル、(2'-、4'-、5'-、6'-、2'-、3'-、
 4'-、5'-、又は6'-)tert-ブチル-3-ビフェニルスルホニル、(2'-、
 3'-、5'-、6'-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)tert-ブチル-
 4-ビフェニルスルホニル、(2'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)メチル
 -1-ナフチルスルホニル、(1'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)メチル
 -2-ナフチルスルホニル、(2'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)エチル
 -1-ナフチルスルホニル、(1'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)エチル
 -2-ナフチルスルホニル、(2'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)n-プ
 ロピル-1-ナフチルスルホニル、(1'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)
 n-プロピル-2-ナフチルスルホニル、(2'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は
 8'-)n-ブチル-1-ナフチルスルホニル、(1'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、
 又は8'-)n-ブチル-2-ナフチルスルホニル、(2'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-
 1、又は8'-)n-ペンチル-1-ナフチルスルホニル、(1'-、3'-、4'-、5'-、6'-
 1、7'-、又は8'-)n-ペンチル-2-ナフチルスルホニル、(2'-、3'-、4'-、5'-
 1、6'-、7'-、又は8'-)n-ヘキシル-1-ナフチルスルホニル、(1'-、3'-、4'-
 1、5'-、6'-、7'-、又は8'-)n-ヘキシル-2-ナフチルスルホニル、(2'-、3'-
 1、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)イソブチル-1-ナフチルスルホニル、(1'-
 、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)イソブチル-2-ナフチルスルホニル、(
 2'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)tert-ブチル-1-ナフチルスル
 ホニル、(1'-、3'-、4'-、5'-、6'-、7'-、又は8'-)tert-ブチル-2-ナ
 フチルスルホニル、2,3-ジメチルフェニルスルホニル、3,4-ジメチルフェニルス
 ルホニル、2,4-ジメチルフェニルスルホニル、2,5-ジメチルフェニルスルホニル
 、2,6-ジメチルフェニルスルホニル、2,4,6-トリメチルフェニルスルホニル、
 3,4,5-トリメチルフェニルスルホニル、2,3,4,5-テトラエチルフェニルス

10

20

30

40

50

ルホニル、ペンタメチルフェニルスルホニル、2, 4-ジメチル-1-ナフチルスルホニル、2, 3-ジメチル-1-ナフチルスルホニル、3, 4-ジメチル-1-ナフチルスルホニル、3, 5, 7-トリエチル-1-ナフチルスルホニル、3, 4, 5, 7-テトラメチル-1-ナフチルスルホニル、2, 3, 4, 5, 7-ペンタメチル-1-ナフチルスルホニル、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサエチル-1-ナフチルスルホニル、ヘプタメチル-1-ナフチルスルホニル基等が挙げられる。

【0059】

カルボキシ低級アルキル基としては、カルボキシ基を1~3個（好ましくは1個）有する前記例示の低級アルキル（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、カルボキシメチル、2-カルボキシエチル、1-カルボキシエチル、1-カルボキシ-1-メチルエチル、3-カルボキシプロピル、2, 3-ジカルボキシプロピル、4-カルボキシブチル、3, 4-ジカルボキシブチル、1, 1-ジメチル-2-カルボキシエチル、5-カルボキシペンチル、6-カルボキシヘキシル、3, 3-ジメチル-3-カルボキシプロピル、2-メチル-3-カルボキシプロピル、2, 3, 4-トリカルボキシブチル基等が含まれる。

【0060】

低級アルコキシカルボニル低級アルキル基としては、前記例示の低級アルコキシカルボニル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基）を、1~3個（好ましくは1~2個）有する、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、1-メトキシカルボニルエチル、2-メトキシカルボニルエチル、2-エトキシカルボニルエチル、1-エトキシカルボニルエチル、3-メトキシカルボニルプロピル、3-エトキシカルボニルプロピル、4-エトキシカルボニルブチル、5-イソプロポキシカルボニルペンチル、6-n-プロポキシカルボニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-n-ブトキシカルボニルエチル、1-メチル-1-メトキシカルボニルエチル、2-メチル-1-メトキシカルボニルプロピル、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロピル、3-メチル-1-メトキシカルボニルブチル、ジエトキシカルボニルメチル、1, 2-ジエトキシカルボニルエチル、2-n-ペンチルオキシカルボニルエチル、n-ヘキシルオキシカルボニルメチル基等が含まれる。

【0061】

置換基として低級アルキル基、低級アルキル基を有していてもよいフェニル基及び低級アルコキシ基を有していてもよいフェニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル低級アルキル基としては、カルバモイル基を、1~3個、より好ましくは1~2個有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。カルバモイル部分には、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1~3個（好ましくは1個）有していてもよいフェニル基及び前記例示の低級アルコキシ基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）を1~3個（好ましくは1個）有していてもよいフェニル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよい。より具体的には、カルバモイルメチル、ジカルバモイルメチル、2-カルバモイルエチル、1-カルバモイルエチル、1-カルバモイル-2-メチルプロピル、3-カルバモイルプロピル、4-カルバモイルブチル、5-カルバモイルペンチル、6-カルバモイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエチル、2-メチル-3-カルバモイルプロピル、N-メチルカルバモイルメチル、N, N-ジメチルカルバモイルメチル、N-メチル-N-エチルカルバモイルメチル、N-メチルカルバモイルメチル、2-(N-メチルカルバモイル)エチル、2-(N-エチルカルバモイル)エチル、N-フェニルカルバモイルメチル、N-(2-メトキシフェニル)カルバモイルメチル、N-(4-メチルフェニル)カルバモイルメチル基等を挙げることができる。

【0062】

カルボキシ低級アルケニル基としては、カルボキシ基を1～3個、好ましくは1個有するトランス体及びシス体の両者を包含する前記例示の低級アルケニル基（好ましくは二重結合を1～3個有する炭素数2から6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基）を挙げることができる。より具体的には、2-カルボキシエテニル、3-カルボキシ-2-プロペニル、4-カルボキシ-2-ブテニル、4-カルボキシ-3-ブテニル、4-カルボキシ-1, 3-ブタジエニル、5-カルボキシ-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5-カルボキシ-2, 4-ヘキサジエニル、5-カルボキシ-3-ペンテニル、3-カルボキシ-1-プロペニル基等が含まれる。

【0063】

低級アルコキシカルボニル低級アルケニル基としては、前記例示の低級アルコキシカルボニル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基）を1～3個有するトランス体及びシス体の両者を包含する前記例示の低級アルケニル（好ましくは、二重結合を1～3個有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基）を例示できる。このような低級アルコキシカルボニル低級アルケニル基の具体例としては、例えば、2-メトキシカルボニルエテニル、2-エトキシカルボニルエテニル、1-エトキシカルボニルエテニル、3-メトキシカルボニル-2-プロペニル、3-エトキシカルボニル-2-プロペニル、4-エトキシカルボニル-2-ブテニル、4-エトキシカルボニル-1, 3-ブタジエニル、5-イソプロポキシカルボニル-3-ペンテニル、6-n-プロポキシカルボニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、1, 1-ジメチル-2-n-ブトキシカルボニルエテニル、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニル-2-プロペニル、2-n-ペンチルオキシカルボニルエテニル基等を挙げることができる。

【0064】

カルバモイル低級アルケニル基としては、カルバモイル基を1～3個、好ましくは1個有する前記例示の低級アルケニル基（好ましくは炭素数2から6の直鎖又は分枝鎖状で二重結合を1～3個有するアルケニル基）を挙げることができる。より具体的には、2-カルバモイルエテニル、3-カルバモイル-2-プロペニル、4-カルバモイル-2-ブテニル、4-カルバモイル-3-ブテニル、4-カルバモイル-1, 3-ブタジエニル、5-カルバモイル-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5-カルバモイル-2, 4-ヘキサジエニル、5-カルバモイル-3-ペンテニル、3-カルバモイル-1-プロペニル基等が含まれる。

【0065】

置換基として低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル低級アルケニル基としては、カルバモイル基上に、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）及び前記例示のハロゲン置換低級アルキル基（好ましくはハロゲン原子が1～7個、好ましくは1～3個置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）からなる群から選ばれた基が1～2個置換していてもよい、カルバモイル基を1～3個、好ましくは1個有する、前記例示の低級アルケニル基（好ましくは二重結合を1～3個有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基）を挙げることができる。その具体例としては、例えば、2-カルバモイルエテニル、2-(N-メチルカルバモイル)エテニル、2-(N-エチルカルバモイル)エテニル、2-(N, N-ジメチルカルバモイル)エテニル、2-[N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)カルバモイル]エテニル基等を挙げることができる。

【0066】

低級アルコキシ低級アルキル基としては、前記例示の低級アルコキシ基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）を1～3個、好ましくは1個有する、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を例示できる。より具体的には、メトキシメチル、2-メトキシエチル、1-エトキシエチル、2-エトキシエチル、2-イソブトキシエチル、2, 2-ジメトキシエチル、2-メトキシ-1-メチルエチル、2-メトキシ-1-エチルエチル、3-メトキシプロピル、3-

10

20

30

40

50

エトキシプロピル、2-イソプロポキシエチル、3-イソプロポキシプロピル、3-n-ブトキシプロピル、4-n-プロポキシブチル、1-メチル-3-イソブトキシプロピル、1, 1-ジメチル-2-n-ペンチルオキシエチル、5-n-ヘキシルオキシペンチル、6-メトキシヘキシル、1-エトキシイソプロピル、2-メチル-3-メトキシプロピル基等が含まれる。

【0067】

アリールオキシ低級アルキルとしては、アリール部分が、フェニル、ビフェニル、ナフチル等であるアリールオキシ基を1~3個、好ましくは1個有する、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。アリール基の置換基としては、例えば、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）、前記例示のハロゲン、アミノ基等が挙げられ、これらの少なくとも1個が、アリール環上に1~7個置換していてもよい。このようなアリールオキシ低級アルキルの具体例としては、フェノキシメチル、2-フェノキシエチル、2-〔（1-、又は2-）ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）メチルフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）エチルフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）n-プロピルフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）n-ブチルフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）n-ペンチルフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）n-ヘキシルフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）イソブチルフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）tert-ブチルフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）メチル-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）メチル-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）エチル-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）エチル-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）n-プロピル-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）n-プロピル-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）n-ブチル-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）n-ブチル-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）n-ペンチル-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）n-ペンチル-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）n-ヘキシル-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）n-ヘキシル-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）イソブチル-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）イソブチル-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）tert-ブチル-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）tert-ブチル-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）クロロフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）フルオロフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）ブロモフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）クロロ-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）クロロ-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）フルオロ-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）フルオロ-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）ブロモ-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）ブロモ-2-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、又は4-）アミノフェノキシ〕エチル、2-〔（2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）アミノ-1-ナフチルオキシ〕エチル、2-〔（1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-）

10

20

30

40

50

アミノ-2-ナフチルオキシ] エチル、2-(2, 3-ジメチルフェノキシ) エチル、2-(3, 4-ジメチルフェノキシ) エチル、2-(2, 4-ジメチルフェノキシ) エチル、2-(2, 5-ジメチルフェノキシ) エチル、2-(2, 6-ジメチルフェノキシ) エチル、2-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ) エチル、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) エチル、2-(2, 3, 4, 5-テトラエチルフェノキシ) エチル、2-(ペンタメチルフェノキシ) エチル、2-(2, 4-ジメチル-1-ナフチルオキシ) エチル、2-(2, 3-ジメチル-1-ナフチルオキシ) エチル、2-(3, 4-ジメチル-1-ナフチルオキシ) エチル、2-(3, 5, 7-トリエチル-1-ナフチルオキシ) エチル、2-(3, 4, 5, 7-テトラメチル-1-ナフチルオキシ) エチル、2-(2, 3, 4, 5, 7-ペンタメチル-1-ナフチルオキシ) エチル、2-(2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサエチル-1-ナフチルオキシ) エチル、2-(ヘプタメチル-1-ナフチルオキシ) エチル、2-(2, 3-ジアミノフェノキシ) エチル、2-(2, 4, 6-トリアミノフェノキシ) エチル、2-(2-メチル-5-クロロ-1-ナフチル) エチル、3-フェノキシプロピル、2, 3-ジフェノキシプロピル、4-フェノキシブチル、3, 4-ジフェノキシブチル、1, 1-ジメチル-2-フェノキシエチル、5-フェノキシペンチル、6-フェノキシヘキシル、3, 3-ジメチル-3-フェノキシプロピル、2-メチル-3-フェノキシプロピル、2, 3, 4-トリフェノキシブチル、3-[(1-又は2-)ナフチルオキシ] プロピル、2, 3-ジ[(1-又は2-)ナフチルオキシ] プロピル、4-[(1-又は2-)ナフチルオキシ] ブチル、3, 4-ジ[(1-又は2-)ナフチルオキシ] ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(1-又は2-)ナフチルオキシ] エチル、5-[(1-又は2-)ナフチルオキシ] ペンチル、6-[(1-又は2-)ナフチルオキシ] ヘキシル、3, 3-ジメチル-3-[(1-又は2-)ナフチルオキシ] プロピル、2-メチル-3-[(1-又は2-)ナフチルオキシ] プロピル、2, 3, 4-トリ[(1-又は2-)ナフチルオキシ] ブチル基等が挙げられる。

【0068】

低級アルキル基、低級アルカノイル基、アロイル基及びカルバモイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ低級アルキル基としては、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）、前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）、前記例示のアロイル基（好ましくはベンゾイル基）及びカルバモイル基を1～2個有していてもよいアミノ基を1～5個、好ましくは1個有する、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体例には、アミノメチル、2-アミノエチル、1-アミノエチル、3-アミノプロピル、4-アミノブチル、5-アミノペンチル、6-アミノヘキシル、1, 1-ジメチル-2-アミノエチル、2-メチル-3-アミノプロピル、N, N-ジメチルアミノメチル、N-メチル-N-エチルアミノメチル、N-メチルアミノメチル、2-(N-メチルアミノ) エチル、1-メチル-2-(N, N-ジメチルアミノ) エチル、1-メチル-2-(N, N-ジエチルアミノ) エチル、2-(N, N-ジメチルアミノ) エチル、2-(N, N-ジエチルアミノ) エチル、2-(N, N-ジイソプロピルアミノ) エチル、3-(N, N-ジメチルアミノ) プロピル、3-(N, N-ジエチルアミノ) プロピル、2-(N-アセチルアミノ) エチル、2-(N-メチル-N-アセチルアミノ) エチル、2-(N-メチル-N-n-ブチルアミノ) エチル、2-(N-メチル-N-ベンゾイルアミノ) エチル、2-(N-カルバモイルアミノ) エチル基等が含まれる。

【0069】

シクロC3-C8アルキル基としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル基等を挙げることができる。

【0070】

置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、低級アルコキシカルボニル基及びフェニル低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいシクロC3-C8アルキル基としては、置換基として、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖

10

20

30

40

50

又は分枝鎖状アルキル基) ; ヒドロキシ基 ; 前記例示の低級アルコキシ基カルボニル基 (好ましくは炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基) 及びフェニル基を 1 ~ 3 個、好ましくは 1 個有する、前記例示の低級アルコキシ基 (好ましくは炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基) からなる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個、好ましくは 1 個有していてもよいシクロ C3-C8 アルキル基を挙げることができる。より具体的には、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、1-メチルシクロプロピル、1-メチルシクロペンチル、1-メチルシクロヘキシル、2-メチルシクロヘキシル、4-ヒドロキシシクロヘキシル、4-メトキシカルボニルシクロヘキシル、2-ベンジルオキシシクロペンチル、2-ベンジルオキシシクロヘキシル基等が含まれる。

10

【0071】

シクロ C3-C8 アルキル置換低級アルキル基としては、前記例示のシクロ C3-C8 アルキル基を 1 ~ 3 個、好ましくは 1 個有する、前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基) を挙げることができる。より具体的には、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルメチル、2-シクロプロピルエチル、1-シクロブチルエチル、シクロペンチルメチル、3-シクロペンチルプロピル、4-シクロヘキシルブチル、5-シクロヘプチルペンチル、6-シクロオクチルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-シクロヘキシルエチル、2-メチル-3-シクロプロピルプロピル基等が含まれる。

【0072】

フリル低級アルキル基 (フリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい) としては、フリル基上に置換基として前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基) を 1 ~ 3 個 (好ましくは 1 ~ 2 個) 有していてもよいフリル基を 1 ~ 2 個 (好ましくは 1 個) 有する前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基) を挙げることができる。より具体的には、[(2-又は 3-) フリル] メチル、2- [(2-又は 3-) フリル] エチル、1- [(2-又は 3-) フリル] エチル、3- [(2-又は 3-) フリル] プロピル、4- [(2-又は 3-) フリル] ブチル、5- [(2-又は 3-) フリル] ペンチル、6- [(2-又は 3-) フリル] ヘキシル、1, 1-ジメチル-2- [(2-又は 3-) フリル] エチル、2-メチル-3- [(2-又は 3-) フリル] プロピル、[5-エチル- (2-, 3-, 又は 4-) フリル] メチル、[5-メチル- (2-, 3-, 又は 4-) フリル] メチル、[2-n-プロピル- (3-, 4-, 又は 5-) フリル] メチル、[3-tert-ブチル- (2-, 4-, 又は 5-) フリル] メチル、[4-n-ペンチル- (2-, 3-, 又は 5-) フリル] メチル、[2-n-ヘキシル- (3-, 4-, 又は 5-) フリル] メチル、[2, 5-ジメチル- (3-又は 4-) フリル] メチル、[2, 5-ジエチル- (3-又は 4-) フリル] メチル、[2, 4, 5-トリエチル-3-フリル] メチル基等が含まれる。

20

30

【0073】

テトラヒドロフリル低級アルキル基としては、テトラヒドロフリル基を 1 ~ 2 個 (好ましくは 1 個) 有する前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基) を挙げることができる。より具体的には、(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル) メチル、2- [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] エチル、1- [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] エチル、3- [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] プロピル、2, 3-ジ [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] プロピルプロピル、4- [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] ブチル、3, 4-ジ [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] ブチル、1, 1-ジメチル-2- [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] エチル、5- [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] ペンチル、6- [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] ヘキシル、3, 3-ジメチル-3- [(2-又は 3-) (2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)] プロピル

40

50

、2-メチル-3-[(2-又は3-)(2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)]プロピル、2, 3, 4-トリ[(2-又は3-)(2, 3, 4, 5-テトラヒドロフリル)]ブチル基等が含まれる。

【0074】

1, 3-ジオキソラニル低級アルキル基としては、1, 3-ジオキソラニル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を例示できる。より具体的には、[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]メチル、2-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]エチル、1-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]エチル、3-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]プロピル、4-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]エチル、5-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]ペンチル、6-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]ヘキシル、1-[(2-又は4-)1, 3-ジオキソラニル]イソプロピル、2-メチル-3-[(1-, 2-, 又は4-)イミダゾリル]プロピル基等が含まれる。

10

【0075】

テトラヒドロピラニル低級アルキル基としては、テトラヒドロピラニル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]メチル、2-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]エチル、1-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]エチル、3-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]プロピル、4-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]エチル、5-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]ペンチル、6-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]ヘキシル、1-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]イソプロピル、2-メチル-3-[(2-, 3-, 又は4-)テトラヒドロピラニル]プロピル基等が含まれる。

20

【0076】

ピロリル低級アルキル基(ピロリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい)としては、ピロリル基上に置換基として前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を1~3個(好ましくは1~2個)有していてもよいピロリル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]メチル、2-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]エチル、1-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]エチル、3-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]プロピル、4-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]エチル、5-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]ペンチル、6-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]ヘキシル、1-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]イソプロピル、2-メチル-3-[(1-, 2-, 又は3-)ピロリル]プロピル、[1-メチル-(2-又は3-)ピロリル]メチル、[1-エチル-(2-又は3-)ピロリル]メチル、[1-n-プロピル-(2-又は3-)ピロリル]メチル、[1-n-ブチル-(2-又は3-)ピロリル]メチル、[1-n-ペンチル-(2-又は3-)ピロリル]メチル、[1-n-ヘキシル-(2-又は3-)ピロリル]メチル、2-[5-メチル-(1-, 2-, 3-, 又は4-)ピロリル]エチル、1-[1-エチル-(2-又は3-)ピロリル]エチル、3-[1-エチル-(2-又は3-)ピロリル]プロピル、4-[1-n-プロピル-(2-又は3-)ピロリル]ブチル、5-[1-n-ブチル-(2-又は3-)ピロリル]ペンチル、6-[1-n-ペンチル-(2-又は3-)ピロリル]ヘキシル、[1, 5-ジメチル-(2-, 3-, 又は4-)ピロリル]メチル、[1, 3, 5-トリメチル-2-ピロリル]メチル、[1, 2, 4-トリメチル-3-ピロリル]メチル基等が含まれる。

30

40

50

【0077】

オキシ基を有していてもよいジヒドロピラゾリル基で置換された低級アルキル基としては、ジヒドロピラゾリル基が2，3-ジヒドロピラゾリル基又は4，5-ジヒドロピラゾリル基であり、そのジヒドロピラゾリル基上にオキシ基を有していてもよい前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、例えば、3-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリルメチル、2-〔4-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリル〕エチル、1-〔5-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリル〕エチル、3-〔3-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリル〕プロピル、4-〔4-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリル〕ブチル、5-〔1-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリル〕ペンチル、6-〔5-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリル〕ヘキシル、2-メチル-3-〔1-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリル〕プロピル、1，1-ジメチル-2-〔3-（2，3-又は4，5-）ジヒドロピラゾリル〕エチル、5-オキシ-4-（4，5-ジヒドロピラゾリル）メチル、2-〔5-オキシ-4-（4，5-ジヒドロピラゾリル）〕エチル、3-〔5-オキシ-4-（4，5-ジヒドロピラゾリル）〕プロピル基等が含まれる。

【0078】

ピラゾリル低級アルキル基（ピラゾリル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）としては、ピラゾリル基上に置換基として前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1～3個（好ましくは1～2個）有していてもよいピラゾリル基を1～2個（好ましくは1個）有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、3-ピラゾリルメチル、2-（4-ピラゾリル）エチル、2-（1-ピラゾリル）エチル、1-（5-ピラゾリル）エチル、3-（3-ピラゾリル）プロピル、4-（4-ピラゾリル）ブチル、5-（1-ピラゾリル）ペンチル、6-（5-ピラゾリル）ヘキシル、2-メチル-3-（1-ピラゾリル）プロピル、1，1-ジメチル-2-（3-ピラゾリル）エチル、1-メチル-3-ピラゾリルメチル、1-エチル-3-ピラゾリルメチル、1-n-プロピル-3-ピラゾリルメチル、1-n-ブチル-3-ピラゾリルメチル、1-n-ペンチル-3-ピラゾリルメチル、1-メチル-4-ピラゾリルメチル、5-メチル-3-ピラゾリルメチル、1-エチル-4-ピラゾリルメチル、1-n-プロピル-4-ピラゾリルメチル、1-n-ブチル-4-ピラゾリルメチル、1-n-ヘキシル-4-ピラゾリルメチル、3-メチル-1-ピラゾリルメチル、3-エチル-1-ピラゾリルメチル、3-n-プロピル-1-ピラゾリルメチル、3-n-ブチル-1-ピラゾリルメチル、1，5-ジメチル-3-ピラゾリルメチル、3，5-ジメチル-4-ピラゾリルメチル、3，4-ジメチル-1-ピラゾリルメチル、1，3-ジメチル-5-ピラゾリルメチル、3，4-ジエチル-1-ピラゾリルメチル、3，4-ジ-n-プロピル-1-ピラゾリルメチル、3，4-ジ-n-ブチル-1-ピラゾリルメチル、1，3，5-トリメチル-4-ピラゾリルメチル、3，4，5-トリメチル-1-ピラゾリルメチル、3，4，5-トリエチル-1-ピラゾリルメチル、3，4，5-トリ-n-プロピル-1-ピラゾリルメチル、3，4，5-トリ-n-ブチル-1-ピラゾリルメチル、1-メチル-5-ピラゾリルメチル、1-エチル-5-ピラゾリルメチル、1-n-プロピル-5-ピラゾリルメチル、1-n-ブチル-5-ピラゾリルメチル、2-（3-ピラゾリル）エチル、3-（3-ピラゾリル）プロピル、4-（3-ピラゾリル）ブチル、5-（3-ピラゾリル）ペンチル、6-（3-ピラゾリル）ヘキシル、2-〔1-（4-クロロフェニル）-3-ピラゾリル〕エチル、3-（1-メチル-3-ピラゾリル）プロピル、3-（3-メチル-4-ピラゾリル）プロピル、3-（5-メチル-4-ピラゾリル）プロピル、3-（1，5-ジメチル-3-ピラゾリル）プロピル、3-（1-エチル-3-ピラゾリル）プロピル、3-（1-n-プロピル-3-ピラゾリル）プロピル、3-（1-n-ブチル-3-ピラゾリル）プロピル、4-（1-メチル-3-ピラゾリル）ブチル、4-（1-エチル-3-ピラゾリル）ブチル、4-（1-n-プロピル-3-ピラゾリル）ブ

10

20

30

40

50

チル、4-(1-n-ブチル-3-ピラゾリル)ブチル、5-(1-メチル-3-ピラゾリル)ペンチル、5-(1-エチル-3-ピラゾリル)ペンチル、5-(1-n-プロピル-3-ピラゾリル)ペンチル、5-(1-n-ブチル-3-ピラゾリル)ペンチル、6-(1-メチル-3-ピラゾリル)ヘキシル、6-(1-エチル-3-ピラゾリル)ヘキシル、6-(1-n-プロピル-3-ピラゾリル)ヘキシル、6-[1-(3-ブチル)-3-ピラゾリル]ヘキシル基等が含まれる。

【0079】

イミダゾリル低級アルキル基としては、イミダゾリル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]メチル、2-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]エチル、1-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]エチル、3-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]プロピル、4-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]エチル、5-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]ペンチル、6-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]ヘキシル、1-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]イソプロピル、2-メチル-3-[(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル]プロピル基等が含まれる。

【0080】

ピリジル低級アルキル基としては、ピリジル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、(2-, 3-, 又は4-)ピリジルメチル、2-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]エチル、1-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]エチル、3-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]プロピル、4-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]ブチル、1, 1-ジメチル-2-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]エチル、5-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]ペンチル、6-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]ヘキシル、1-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]イソプロピル、2-メチル-3-[(2-, 3-, 又は4-)ピリジル]プロピル基等が含まれる。

【0081】

ピラジニル低級アルキル基(ピラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい)としては、ピラジニル基上に置換基として前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を1~3個(好ましくは1個)有していてもよいピラジニル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、2-ピラジニルメチル、2-(2-ピラジニル)エチル、1-(2-ピラジニル)エチル、3-(2-ピラジニル)プロピル、4-(2-ピラジニル)ブチル、5-(2-ピラジニル)ペンチル、6-(2-ピラジニル)ヘキシル、3-メチル-3-(2-ピラジニル)プロピル、1, 1-ジメチル-2-(2-ピラジニル)エチル、3-メチル-2-ピラジニルメチル、3-エチル-2-ピラジニルメチル、3-n-プロピル-2-ピラジニルメチル、3-n-ブチル-2-ピラジニルメチル、3-n-ペンチル-2-ピラジニルメチル、5-メチル-2-ピラジニルメチル、5-エチル-2-ピラジニルメチル、5-n-プロピル-2-ピラジニルメチル、5-n-ブチル-2-ピラジニルメチル、6-メチル-2-ピラジニルメチル、6-エチル-2-ピラジニルメチル、6-n-プロピル-2-ピラジニルメチル、6-n-ブチル-2-ピラジニルメチル、3, 5-ジメチル-2-ピラジニルメチル、3, 5-ジエチル-2-ピラジニルメチル、3, 5-ジ-n-プロピル-2-ピラジニルメチル、3, 5-ジ-n-ブチル-2-ピラジニルメチル、2-(5-メチル-2-ピラジニル)エチル、2-(5-エチル-2-ピラジニル)エチル、2-(5-n-プロピル-2-ピラジニル)エチル、2-(5-n-ブチル-2-ピラジニル)エチル、3-(5-メチル-2-ピラジニル)プロピル、3-(5-エチル-2

10

20

30

40

50

ーピラジニル) プロピル、3-(5-n-プロピル-2-ピラジニル) プロピル、3-(5-n-ブチル-2-ピラジニル) プロピル、4-(5-メチル-2-ピラジニル) ブチル、4-(5-エチル-2-ピラジニル) ブチル、4-(5-n-プロピル-2-ピラジニル) ブチル、4-(5-n-ブチル-2-ピラジニル) ブチル、5-(5-メチル-2-ピラジニル) ペンチル、5-(5-エチル-2-ピラジニル) ペンチル、5-(5-n-プロピル-2-ピラジニル) ペンチル、5-(5-n-ブチル-2-ピラジニル) ペンチル、6-(5-メチル-2-ピラジニル) ヘキシル、6-(5-エチル-2-ピラジニル) ヘキシル、6-(5-n-プロピル-2-ピラジニル) ヘキシル、6-(5-n-ブチル-2-ピラジニル) ヘキシル基等が含まれる。

【0082】

ピロジニル低級アルキル基(ピロジニル基上には、オキソ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい)としては、ピロリジニル基上に置換基としてオキソ基及び前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)からなる群から選ばれた基を1~3個(好ましくは1個)有していてもよいピロジニル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、

[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] メチル、2-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] エチル、1-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] エチル、3-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] プロピル、4-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] ブチル、5-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] ペンチル、6-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] ヘキシル、1-メチル-2-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] エチル、1, 1-ジメチル-2-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] エチル、2-メチル-3-[(1-, 2-, 又は3-) ピロリジニル] プロピル、1-メチル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1-エチル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1-n-プロピル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1-n-ブチル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1-n-ペンチル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1-n-ヘキシル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、2-メチル-1-ピロリジニルメチル、2-エチル-1-ピロリジニルメチル、2-n-プロピル-1-ピロリジニルメチル、2-n-ブチル-1-ピロリジニルメチル、2-n-ペンチル-1-ピロリジニルメチル、2-n-ヘキシル-1-ピロリジニルメチル、3-メチル-2-ピロリジニルメチル、3-エチル-2-ピロリジニルメチル、3-n-プロピル-2-ピロリジニルメチル、3-n-ブチル-2-ピロリジニルメチル、1, 5-ジメチル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1, 5-ジーエチル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1, 5-ジー-n-プロピル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1, 5-ジー-n-ブチル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1, 4, 5-トリエチル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、1, 4, 5-トリ-n-プロピル-(2-又は3-) ピロリジニルメチル、3-[2-オキソ-(1-ピロリジニル) プロピル、3-[5-オキソ-(2-, 3-, 又は4-) ピロリジニル] プロピル、3-[1-メチル-5-オキソ-(2-, 3-, 又は4-) ピロリジニル] プロピル基等が含まれる。

【0083】

ピペリジル低級アルキル基(ピペリジル基上には、ベンゾイル基及び低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい)としては、ピペリジル基上に置換基としてベンゾイル基及び前記例示の低級アルカノイル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)から選ばれた基を1~3個(好ましくは1個)有するピペリジル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジルメチル、2-[(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] エチル、2-[1-ベンゾイル-(2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] エチル、2-[1-アセチル-(2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] エチル、2-[1-ブ

10

20

30

40

50

チリル- (2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] エチル、1- [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] エチル、3- [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] プロピル、4- [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] ブチル、1, 1-ジメチル-2- [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] エチル、5- [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] ペンチル、6- [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] ヘキシル、1- [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] イソプロピル、2-メチル-3- [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジル] プロピル基等が含まれる。

【0084】

ピペラジニル低級アルキル基 (ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい) としては、ピペラジニル基上に置換基として前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基) を1~3個 (好ましくは1個) 有していてもよいピペラジニル基を1~2個 (好ましくは1個) 有する前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基) を挙げることができる。より具体的には、1-ピペラジニルメチル、2-ピペラジニルメチル、2- (1-ピペラジニル) エチル、2- (2-ピペラジニル) エチル、1- (1-ピペラジニル) エチル、1- (2-ピペラジニル) エチル、3- (1-ピペラジニル) プロピル、3- (2-ピペラジニル) プロピル、4- (1-ピペラジニル) ブチル、4- (2-ピペラジニル) ブチル、2- (4-エチル-2-ピペラジニル) エチル、1- (4-n-プロピル-2-ピペラジニル) エチル、2- (4-n-ブチル-2-ピペラジニル) エチル、2- (4-n-ペンチル-2-ピペラジニル) エチル、1- (4-n-ヘキシル-2-ピペラジニル) エチル、2- (5-メチル-2-ピペラジニル) エチル、1- (5-エチル-2-ピペラジニル) エチル、2- (5-n-プロピル-2-ピペラジニル) エチル、1- (5-n-ブチル-2-ピペラジニル) エチル、2- (5-n-ペンチル-2-ピペラジニル) エチル、1- (5-n-ヘキシル-2-ピペラジニル) エチル、2- (6-メチル-2-ピペラジニル) エチル、1- (6-エチル-2-ピペラジニル) エチル、2- (6-n-プロピル-2-ピペラジニル) エチル、1- (6-n-ブチル-2-ピペラジニル) エチル、2- (6-n-ペンチル-2-ピペラジニル) エチル、2- (6-n-ヘキシル-2-ピペラジニル) エチル、3- (2-メチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (2-エチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (2-n-プロピル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (2-n-ブチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (2-n-ペンチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (2-n-ヘキシル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (3-メチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (3-エチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (3-n-プロピル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (3-n-ブチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (3-n-ペンチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (3-n-ヘキシル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (4-メチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (4-エチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (4-n-プロピル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (4-n-ブチル-1-ピペラジニル) プロピル、3- (4-n-ペンチル-1-ピペラジニル) プロピル、6- (5-n-ブチル-2-ピペラジニル) ヘキシル、6- (5-n-ペンチル-2-ピペラジニル) ヘキシル、6- (5-n-ヘキシル-2-ピペラジニル) ヘキシル、6- (6-メチル-2-ピペラジニル) ヘキシル、6- (6-エチル-2-ピペラジニル) ヘキシル、6- (6-n-プロピル-2-ピペラジニル) ヘキシル、6- (6-n-ブチル-2-ピペラジニル) ヘキシル、6- (6-n-ペンチル-2-ピペラジニル) ヘキシル、6- (6-n-ヘキシル-2-ピペラジニル) ヘキシル、2, 3-ジメチル-1-ピペラジニルメチル、3, 3-ジメチル-1-ピペラジニルメチル、2- (1, 3, 4-トリメチル-2-ピペラジニル) エチル基等が含まれる。

【0085】

モルホリニル低級アルキル基としては、モルホリニル基を1~2個 (好ましくは1個) 有する前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基) を挙げることができる。より具体的には、2-モルホリニルメチル、3-モルホリニル

10

20

30

40

50

メチル、4-モルホリニルメチル、2-(2-モルホリニル)エチル、2-(3-モルホリニル)エチル、2-(4-モルホリニル)エチル、1-(2-モルホリニル)エチル、1-(3-モルホリニル)エチル、1-(4-モルホリニル)エチル、3-(2-モルホリニル)プロピル、3-(3-モルホリニル)プロピル、3-(4-モルホリニル)プロピル、4-(2-モルホリニル)ブチル、4-(3-モルホリニル)ブチル、4-(4-モルホリニル)ブチル、5-(2-モルホリニル)ペンチル、5-(3-モルホリニル)ペンチル、5-(4-モルホリニル)ペンチル、6-(2-モルホリニル)ヘキシル、6-(3-モルホリニル)ヘキシル、6-(4-モルホリニル)ヘキシル、3-メチル-3-(2-モルホリニル)プロピル、3-メチル-3-(3-モルホリニル)プロピル、3-メチル-3-(4-モルホリニル)プロピル、1, 1-ジメチル-2-(2-モルホリニル)エチル、1, 1-ジメチル-2-(3-モルホリニル)エチル、1, 1-ジメチル-2-(4-モルホリニル)エチル基が含まれる。

10

【0086】

チエニル低級アルキル基(チエニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい)としては、チエニル基上に置換基として前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を1~3個(好ましくは1個)有していてもよい。ペラジニル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、(2-又は3-)チエニルメチル、2-[(2-又は3-)チエニル]エチル、1-[(2-又は3-)チエニル]エチル、3-[(2-又は3-)チエニル]プロピル、4-[(2-又は3-)チエニル]ブチル、5-[(2-又は3-)チエニル]ペンチル、6-[(2-又は3-)チエニル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2-又は3-)チエニル]エチル、2-メチル-3-[(2-又は3-)チエニル]プロピル、[3-メチル-(2-, 4-, 又は5-)チエニル]メチル、[5-メチル-(2-, 3-, 又は4-)チエニル]メチル、[4-エチル-(2-又は3-)チエニル]メチル、[5-n-プロピル-(2-, 3-又は4-)チエニル]メチル、[3-n-ブチル-(2-, 4-, 又は5-)チエニル]メチル、[4, 5-ジメチル-(2-又は3-)チエニル]メチル、(3, 4, 5-トリメチル-2-チエニル)メチル、2-[3-メチル-(2-, 4-, 又は5-)チエニル]エチル、1-[4-n-ペンチル-(2-又は3-)チエニル]エチル、3-[3-ヘキシル-2-チエニル]プロピル、4-[4, 5-ジメチル-(2-又は3-)チエニル]ブチル、5-(2, 4, 5-トリメチル-3-チエニル)ペンチル、6-[5-エチル-(2-, 3-, 又は4-)チエニル]ヘキシル基等が含まれる。

20

30

【0087】

チアゾリル基としては、(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル基を挙げることができる。

【0088】

チアゾリル低級アルキル基としては、チアゾリル基を1~2個(好ましくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、(2-, 4-, 又は5-)チアゾリルメチル、2-[(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル]エチル、1-[(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル]エチル、3-[(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル]プロピル、4-[(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル]ブチル、5-[(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル]ペンチル、6-[(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル]エチル、[2-メチル-3-[(2-, 4-, 又は5-)チアゾリル]プロピル]基等が含まれる。

40

【0089】

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

【0090】

50

10

50

ーイル) エチル、3- (1H-2-ベンゾピラン-4-イル) プロピル、4- (1H-2-
 ベンゾピラン-4-イル) ブチル、5- (1H-2-ベンゾピラン-4-イル) ペンチ
 ル、6- (1H-2-ベンゾピラン-4-イル) ヘキシル、(4-オキソ-4H-1-ベ
 ンゾピラン-2-イル) メチル、2- (4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-2-イル)
 エチル、3- (4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-2-イル) プロピル、4- (4-
 オキソ-4H-1-ベンゾピラン-2-イル) ブチル、5- (4-オキソ-4H-1-
 ベンゾピラン-2-イル) ペンチル、6- (4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-2-
 イル) ヘキシル、(4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-3-イル) メチル、2- (4-
 オキソ-4H-1-ベンゾピラン-3-イル) エチル、3- (4-オキソ-4H-1-
 ベンゾピラン-3-イル) プロピル、4- (4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-3-
 イル) ブチル、5- (4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-3-イル) ペンチル、6-
 (4-オキソ-4H-1-ベンゾピラン-3-イル) ヘキシル、(4-オキソ-4H-1-
 ベンゾピラン-4-イル) メチル、(2-オキソ-2H-1-ベンゾピラン-3-イル)
 メチル、2- (2-オキソ-2H-1-ベンゾピラン-3-イル) エチル、3- (2-
 オキソ-2H-1-ベンゾピラン-3-イル) プロピル、4- (2-オキソ-2H-1-
 ベンゾピラン-3-イル) ブチル、5- (2-オキソ-2H-1-ベンゾピラン-3-イ
 ル) ペンチル、6- (2-オキソ-2H-1-ベンゾピラン-3-イル) ヘキシル、(2-
 オキソ-2H-1-ベンゾピラン-4-イル) メチル、2- (2-オキソ-2H-1-
 ベンゾピラン-4-イル) エチル、3- (2-オキソ-2H-1-ベンゾピラン-4-イ
 ル) プロピル、4- (2-オキソ-2H-1-ベンゾピラン-4-イル) ブチル、5- (2-
 オキソ-2H-1-ベンゾピラン-4-イル) ペンチル、6- (2-オキソ-2H-1-
 ベンゾピラン-4-イル) ヘキシル、(1-オキソ-1H-2-ベンゾピラン-3-イ
 ル) メチル、2- (1-オキソ-1H-2-ベンゾピラン-3-イル) エチル、3- (1-
 オキソ-1H-2-ベンゾピラン-3-イル) プロピル、4- (1-オキソ-1H-2-
 ベンゾピラン-3-イル) ブチル、5- (1-オキソ-1H-2-ベンゾピラン-3-
 イル) ペンチル、6- (1-オキソ-1H-2-ベンゾピラン-3-イル) ヘキシル、
 (1-オキソ-1H-2-ベンゾピラン-4-イル) メチル、2- (1-オキソ-1H-2-
 ベンゾピラン-4-イル) エチル、3- (1-オキソ-1H-2-ベンゾピラン-4-
 イル) プロピル、4- (1-オキソ-1H-2-ベンゾピラン-4-イル) ブチル、5-
 (1-オキソ-1H-2-ベンゾピラン-4-イル) ペンチル、6- (1-オキソ-1
 H-2-ベンゾピラン-4-イル) ヘキシル基等が含まれる。

10

20

30

【0092】

ベンズイミダゾリル低級アルキル基としては、ベンズイミダゾリル基を1~2個(好ま
 しくは1個)有する前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝
 鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具体的には、1-ベンズイミダゾリルメチ
 ル、2- (1-ベンズイミダゾリル) エチル、3- (1-ベンズイミダゾリル) プロピル
 、4- (1-ベンズイミダゾリル) ブチル、5- (1-ベンズイミダゾリル) ペンチル、
 6- (1-ベンズイミダゾリル) ヘキシル、2-ベンズイミダゾリルメチル、2- (2-
 ベンズイミダゾリル) エチル、3- (2-ベンズイミダゾリル) プロピル、4- (2-
 ベンズイミダゾリル) ブチル、5- (2-ベンズイミダゾリル) ペンチル、6- (2-
 ベン
 ズイミダゾリル) ヘキシル基が含まれる。

40

【0093】

低級アルキル基上に、低級アルコキシカルボニル基を有していてもよいインドリル低級
 アルキル基としては、インドリル基を1~2個(好ましくは1個)有し、前記例示の低級
 アルコキシカルボニル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボ
 ニル基)を1~3個(好ましくは1個)有していてもよい前記例示の低級アルキル基(好
 ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。より具
 体的には、インドール(-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-、又は-7-)
 イルメチル、2-インドール(-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6-、又は
 -7-) イルエチル、3-インドール(-1-、-2-、-3-、-4-、-5-、-6

50

ー、又はー7ー) イルプロピル、4ーインドール(ー1ー、ー2ー、ー3ー、ー4ー、ー5ー、ー6ー、又はー7ー) イルブチル、5ーインドール(ー1ー、ー2ー、ー3ー、ー4ー、ー5ー、ー6ー、又はー7ー) イルペンチル、6ーインドール(ー1ー、ー2ー、ー3ー、ー4ー、ー5ー、ー6ー、又はー7ー) イルヘキシル、3ーメチルー3ーインドール(ー1ー、ー2ー、ー3ー、ー4ー、ー5ー、ー6ー、又はー7ー) イルプロピル、1, 1ージメチルー2ーインドール(ー1ー、ー2ー、ー3ー、ー4ー、ー5ー、ー6ー、又はー7ー) イルエチル、1ーメトキシカルボニルー2ーインドール(ー1ー、ー2ー、ー3ー、ー4ー、ー5ー、ー6ー、又はー7ー) イルエチル基が含まれる。

【0094】

低級アルキル基上に、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた置換基を有するイミダゾリル低級アルキル基としては、低級アルキル部分が前記例示のものと同一であり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、該アルキル基上に、カルバモイル基及び前記例示の低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた置換基を1～3個、好ましくは1個有するイミダゾリル低級アルキル基を挙げることができる。より具体的には、カルバモイルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、メトキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、エトキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、nーブトキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、イソブトキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、tertーブトキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、secーブトキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、nーペンチルオキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、ネオペンチルオキシー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、nーヘキシルオキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、イソヘキシルオキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、3ーメチルペンチルオキシカルボニルー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]メチル、1ーカルバモイルー2ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]エチル、1ーメトキシカルボニルー2ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]エチル、1, 1ージメトキシカルボニルー2ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]エチル、1, 1ージカルバモイルー2ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]エチル、2ーカルバモイルー1ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]エチル、2ーメトキシカルボニルー3ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]プロピル、2ーカルバモイルー4ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]ブチル、1ーメチルー1ーカルバモイルメチルー2ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]エチル、2ーメトキシカルボニルー5ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]ペンチル、3ーカルバモイルー6ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]ヘキシル、2ーメトキシカルボニルー1ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]イソプロピル、2ーカルバモイルメチルー3ー[(1ー、2ー、4ー、又は5ー)イミダゾリル]プロピル基等が含まれる。

【0095】

置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピリジル基としては、置換基として前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)、前記例示の低級アルコキシ基(好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基)及び2つの低級アルキル部分が夫々前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)である低級アルキルチオ低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～4個(好ましくは1個)有していてもよいピリジル基を挙げることができる。より具体的には、2ーピリジル、3ーピリジル、4ーピリジル、4ーメチルー2ーピリジル、5ーメチルー2ーピリジル、5ーエチルー3ーピリジル、2ーnープロピルー3ーピリジル、4ーnーブチルー2ーピリジル、4ーtertーブチルー2ーピリジル、5ー

10

20

30

40

50

n-ペンチル-3-ピリジル、4-n-ヘキシル-2-ピリジル、4-メトキシ-2-ピリジル、5-メトキシ-2-ピリジル、2-メチルチオメチル-3-ピリジル、5-エチルチオメチル-2-ピリジル、4-n-プロピルチオメチル-2-ピリジル、3-n-ブチルチオメチル-2-ピリジル、5-n-ペンチルチオメチル-3-ピリジル、4-n-ヘキシルチオメチル-3-ピリジル、2-(2-メチルチオエチル)-3-ピリジル、2-(3-メチルチオプロピル)-4-ピリジル、3-(4-メチルチオブチル)-4-ピリジル、3-(5-メチルチオペンチル)-2-ピリジル、4-(6-メチルチオヘキシル)-2-ピリジル、3, 4-ジメチル-2-ピリジル、2, 4, 6-トリエチル-3-ピリジル、2, 3, 5, 6-テトラメチル-4-ピリジル、2-メチル-3-メチルチオメチル-4-ピリジル基等が含まれる。

10

【0096】

置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピロリジニル基としては、置換基として、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）、前記例示の低級アルコキシカルボニル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基、前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）及びアロイル基（好ましくはベンゾイル基）からなる群から選ばれた基を1～3個、好ましくは1個有していることがある、ピロリジニル基を挙げることができる。より具体的には、ピロリジン-1-イル、ピロリジン-2-イル、ピロリジン-3-イル、1-メチルピロリジン-3-イル、2-エチルピロリジン-3-イル、3-n-プロピルピロリジン-3-イル、4-n-ブチルピロリジン-3-イル、1-tert-ブチルピロリジン-3-イル、5-n-ペンチルピロリジン-3-イル、1-n-ヘキシルピロリジン-2-イル、2-メトキシカルボニル-2-イル、3-エトキシカルボニルピロリジン-2-イル、1-tert-ブトキシカルボニルピロリジン-3-イル、4-プロポキシカルボニルピロリジン-2-イル、5-ブトキシカルボニルピロリジン-2-イル、1-ペントキシカルボニル-2-イル、2-ヘキシルオキシカルボニルピロリジン-2-イル、1, 3-ジメトキシカルボニルピロリジン-2-イル、3, 4, 5-トリエチルピロリジン-2-イル、2, 3, 4, 5-テトラメチルピロリジン-1-イル、2, 4-ジメトキシカルボニルピロリジン-1-イル、3, 4, 5-トリエトキシカルボニルピロリジン-1-イル、2-メチル-4-メトキシカルボニルピロリジン-1-イル、1-ベンゾイルピロリジン-3-イル、1-アセチルピロリジン-3-イル、1-ブチルピロリジン-3-イル基等が含まれる。

20

30

【0097】

置換基として低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基及び低級アルキル基及びハロゲンからなる群から選ばれた基を有していてもよいアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペリジル基としては、置換基として、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルコキシ基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）；前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）；及び前記例示の低級アルキル基及び前記例示のハロゲンからなる群から選ばれた基を1～3個、好ましくは1個有していてもよいアロイル基（好ましくはベンゾイル基）からなる群から選ばれた基を1～5個（好ましくは1～4個）有していてもよいピペリジル基を挙げることができる。より具体的には、1-ピペリジル、2-ピペリジル、3-ピペリジル、4-ピペリジル、1-メチル-4-ピペリジル、2-エチル-4-ピペリジル、3-n-プロピル-4-ピペリジル、4-n-ブチル-4-ピペリジル、1-n-ペンチル-4-ピペリジル、2-n-ヘキシル-4-ピペリジル、1-メトキシカルボニル-4-ピペリジル、1-エトキシカルボニル-4-ピペリジル、4-n-プロポキシカルボニル-4-ピペリジル、5-n-ブトキシカルボニル-4-ピペリジル、1-tert-ブトキシカルボニル-4-ピペリジル、1-ホルミル-4-ピペリジル、1-アセチル-4-ピペリジル、1-ブチル-4-ピペリジル、1-ブチル-3-ピペリジル、2-

40

50

プロピオニル-4-ピペリジル、3-ブチル-4-ピペリジル、4-イソブチル-4-ピペリジル、1-n-ペンタノイル-4-ピペリジル、2-tert-ブチルカルボニル-4-ピペリジル、3-n-ヘキサノイル-4-ピペリジル、1-ベンゾイル-4-ピペリジル、1-ベンゾイル-3-ピペリジル、1-(2-, 3-, 又は4-クロロベンゾイル)-4-ピペリジル、1-(2-, 3-, 又は4-フルオロベンゾイル)-4-ピペリジル、1-(2-, 3-, 又は4-メチルベンゾイル)-4-ピペリジル、2, 6-ジメチル-4-ピペリジル、2, 4, 6-トリメチル-3-ピペリジル、2, 2, 6, 6-テトラメチル-4-ピペリジル、2, 2, 4, 4, 6-ペンタメチル-3-ピペリジル基等が含まれる。

【0098】

10

オキシ基を有していてもよいテトラヒドロフリル基としては、2-テトラヒドロフリル、3-テトラヒドロフリル、3-オキシ-2-テトラヒドロフリル、4-オキシ-2-テトラヒドロフリル、5-オキシ-2-テトラヒドロフリル、2-オキシ-3-テトラヒドロフリル、4-オキシ-3-テトラヒドロフリル、5-オキシ-4-テトラヒドロフリル基等を挙げることができる。

【0099】

オキシ基を有していてもよいヘキサヒドロアゼピニル基としては、2-ヘキサヒドロアゼピニル、3-ヘキサヒドロアゼピニル、4-ヘキサヒドロアゼピニル、2-オキシ-3-ヘキサヒドロアゼピニル、3-オキシ-2-ヘキサヒドロアゼピニル、4-オキシ-2-ヘキサヒドロアゼピニル、5-オキシ-2-ヘキサヒドロアゼピニル、6-オキシ-2-ヘキサヒドロアゼピニル基等を挙げることができる。

20

【0100】

置換基として低級アルキル基、アリール基及びフリル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピラゾリル基としては、置換基として、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示のアリール基；及びフリル基からなる群から選ばれた基を1～3個（好ましくは1～2個）有していてもよい、ピラゾリル基を挙げることができる。より具体的には、1-ピラゾリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、1-メチル-5-ピラゾリル、1-エチル-5-ピラゾリル、3-n-プロピル-5-ピラゾリル、4-n-ブチル-5-ピラゾリル、1-tert-ブチル-4-ピラゾリル、1-n-ペンチル-4-ピラゾリル、3-n-ヘキシル-4-ピラゾリル、3-フェニル-5-ピラゾリル、1-(2-ナフチル)-3-ピラゾリル、4-(2-メチルフェニル)-3-ピラゾリル、5-(3-エチルフェニル)-3-ピラゾリル、1-(4-n-プロピルフェニル)-4-ピラゾリル、3-(2-n-ブチルフェニル)-4-ピラゾリル、5-(3-n-ペンチルフェニル)-4-ピラゾリル、1-(4-n-ヘキシルフェニル)-5-ピラゾリル、3-(2-イソブチルフェニル)-5-ピラゾリル、4-(3-tert-ブチルフェニル)-5-ピラゾリル、3-(2-クロロフェニル)-1-ピラゾリル、4-(3-フルオロフェニル)-1-ピラゾリル、5-(4-ブromoフェニル)-1-ピラゾリル、1-(2-アミノフェニル)-3-ピラゾリル、4-(2, 3-ジメチルフェニル)-3-ピラゾリル、5-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)-3-ピラゾリル、1-(2, 3-ジアミノフェニル)-4-ピラゾリル、3-(2-フリル)-5-ピラゾリル、1, 3-ジメチル-5-ピラゾリル、1, 3, 4-トリエチル-5-ピラゾリル、1, 3, 5-トリメチル-4-ピラゾリル、1-メチル-3-フェニル-5-ピラゾリル基等が含まれる。

30

40

【0101】

チアジアゾリル基としては、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、又は1, 3, 4-チアジアゾリル基を挙げることができる。

【0102】

低級アルキル基を有していてもよいチアジアゾリル基としては、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1～3個、好ましくは

50

1個有していてもよい前記例示のチアジアゾリル基を挙げることができる。より具体的には、(4-又は5-)(1, 2, 3-チアジアゾリル)、(3-又は5-)(1, 2, 4-チアジアゾリル)、3-(1, 2, 5-チアジアゾリル)、2-(1, 3, 4-チアジアゾリル)、5-メチル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、4-エチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-イル、5-n-プロピル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、5-n-ブチル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、4-tert-ブチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-イル、5-n-ペンチル-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、5-n-ヘキシル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル基が含まれる。

【0103】

10

低級アルキル基を有していてもよいイソオキサゾリル基としては、前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を1~2個有していてもよいイソオキサゾリル基を挙げることができる。より具体的には、3-イソオキサゾリル、4-イソオキサゾリル、5-イソオキサゾリル、3-メチル-5-イソオキサゾリル、4-エチル-5-イソオキサゾリル、4-n-プロピル-3-イソオキサゾリル、5-メチル-3-イソオキサゾリル、5-n-ブチル-3-イソオキサゾリル、3-tert-ブチル-4-イソオキサゾリル、5-n-ペンチル-4-イソオキサゾリル、3-n-ヘキシル-5-イソオキサゾリル、3, 4-ジメチル-5-イソオキサゾリル基等が含まれる。

【0104】

20

インダゾリル基としては、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-)インダゾリル基を挙げることができる。

【0105】

テトラヒドロベンゾチアゾリル基としては、(2-, 4-, 5-, 6-, 又は7-)(4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチアゾリル基等を挙げることができる。

【0106】

テトラヒドロキノリル基としては、(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 又は8-)(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基等を挙げることができる。

【0107】

置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン及びオキソ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいテトラヒドロキノリル基としては、置換基として、前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)；前記例示の低級アルコキシ基(好ましくは炭素数1~6の直鎖状又は分枝鎖状アルコキシ基)；ハロゲン；及びオキソ基からなる群から選ばれた基を1~3個、好ましくは1~2個有していてもよい、前記例示のテトラヒドロキノリル基を挙げることができる。より具体的には、1-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、3-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、4-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、5-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、6-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、7-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、8-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-メチル-3-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、3-エチル-2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、4-n-プロピル-2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、5-n-ブチル-3-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、6-tert-ブチル-3-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、7-n-ペンチル-2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、8-n-ヘキシル-2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-メトキシ-4-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、3-エトキシ-4-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、4-プロポキシ-5-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、5-ブトキシ-6-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、6-ペントキシ-7-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、7-ヘキシルオキシ-8-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、4-オキソ-3-(

30

40

50

1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-オキソ- (1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) - (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-オキソ-8-メチル- (3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) - (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-オキソ-8-メトキシ-3- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-オキソ-5-メトキシ- (1-, 3-, 4-, 6-, 7-, 又は8-) - (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-オキソ-8-フルオロ- (3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) - (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)、2-オキソ-6, 8-ジメチル-3- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル) 基等が含まれる。

【0108】

キノリル基としては、2-キノリル、3-キノリル、4-キノリル、5-キノリル、6-キノリル、7-キノリル、8-キノリル基を挙げることができる。

低級アルキル基を有していてもよいキノリル基としては、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1～2個有していてもよいキノリル基を挙げることができる。より具体的には、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) キノリル、2-メチル-6-キノリル、4-エチル-5-キノリル、4-n-プロピル-3-キノリル、5-メチル-3-キノリル、5-n-ブチル-3-キノリル、3-tert-ブチル-4-キノリル、5-n-ペンチル-4-キノリル、3-n-ヘキシル-5-キノリル、3, 4-ジメチル-5-キノリル基等が含まれる。

【0109】

ベンゾジオキサリル低級アルキル基としては、ベンゾジオキサリル基を1～2個（好ましくは1個）有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、(2-, 4-, 又は5-) (1, 3-ベンゾジオキサリル) メチル、2- (2-, 4-, 又は5-) (1, 3-ベンゾジオキサリル) エチル、3- (2-, 4-, 又は5-) (1, 3-ベンゾジオキサリル) プロピル基が含まれる。

【0110】

置換基としてハロゲン；低級アルキル基；低級アルコキシ基；ハロゲン置換低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルコキシ基；低級アルケニル基；低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ基；スルファモイル基；低級アルキルチオ基；低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル基；ピロリル基；低級アルキニル基；シアノ基；ニトロ基；アリールオキシ基；アリール低級アルコキシ基；ヒドロキシ基；ヒドロキシ低級アルキル基；低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基；ピラゾリル基；オキソ基を有していてもよいピロリジニル基；オキサゾリル基；低級アルキル基を有していてもよいイミダゾリル基；オキソ基を有していてもよいジヒドロフリル基；オキソ基を有していてもよいチアゾリジニル低級アルキル基；イミダゾリル低級アルカノイル基及びピペリジニルカルボニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアリール基としては、置換基として、前記例示のハロゲン；前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルコキシ基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）；前記例示のハロゲン置換低級アルキル基（好ましくはハロゲン原子が1～7個置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示のハロゲン置換低級アルコキシ基（好ましくはハロゲン原子が1～7個置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）；前記例示の低級アルケニル基（好ましくは炭素数2から6の直鎖又は分枝鎖状で二重結合を1～3個有するアルケニル基（トランス体及びシス体の両者を包含する））；前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）、前記例示の低級アルキルスルホニル基、前記例示の低級アルキル基及び前記例示のアリール基を1～2個有するアミノ基；スルファモイル基；低級アルキル部分が前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）である低級アルキルチオ基；前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカ

10

20

30

40

50

ノイル基) ; 前記例示の低級アルコシカルボニル基 (好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコシカルボニル基) ; ピロリル基 ; 後述例示のアルキニル基 ; シアノ基 ; ニトロ基 ; アリール部分が前記例示のアリールオキシ基 ; アリール部分及び低級アルコキシ部分が前記例示のアリール低級アルコキシ基 ; ヒドロキシ基 ; 低級アルキル部分が前記例示のヒドロキシ低級アルキル基 ; 前記例示の低級アルキル基及び前記例示のアリール基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいカルバモイル基 ; ピラゾリル基 ; オキソ基を1~2個 (好ましくは1個) 有していてもよいピロリジニル基 ; オキサゾリル基 ; 前記例示の低級アルキル基を1~3個 (好ましくは1~2個) 有していてもよいイミダゾリル基 ; オキソ基を1~2個 (好ましくは1個) 有していてもよいジヒドロフリル基 ; オキソ基を1~2個 (好ましくは1個) 有していてもよい、低級アルキル部分が前記例示のチアゾリジニル低級アルキル基 ; 低級アルカノイル部分が前記例示のイミダゾリル低級アルカノイル基及びピペリジニルカルボニル基からなる群より選ばれた基を1~7個、好ましくは1~5個、より好ましくは1~2個有することがある前記例示のアリール基を挙げることができる。より具体的には、フェニル、1-ナフチル、2-ナフチル、(2-、3-、又は4-) ビフェニル、(2-、3-、又は4-) クロロフェニル、(2-、3-、又は4-) フルオロフェニル、(2-、3-、又は4-) ブロモフェニル、(2-、3-、又は4-) メチルフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) エチル-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) n-プロピルフェニル、(2-、3-、又は4-) n-ブチルフェニル、(2-、3-、又は4-) n-ペンチルフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) n-ヘキシル-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) イソブチルフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) tert-ブチル-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) メトキシフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) エトキシ-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) n-プロポキシフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) イソプロポキシ-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) n-ブトキシフェニル、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) イソブトキシ-2-ナフチル、(2-、3-、又は4-) tert-ブトキシフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) sec-ブトキシ-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) n-ペンチルオキシフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) イソペンチルオキシ-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) ネオペンチルオキシフェニル、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) n-ヘキシルオキシ-2-ナフチル、(2-、3-、又は4-) イソヘキシルオキシフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) (3-メチルペンチルオキシ)-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) クロロメチルフェニル、(2-、3-、又は4-) トリフルオロメチルフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) フルオロエチル-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) (3-ブロモプロピル) フェニル、(2-、3-、又は4-) (4-クロロブチル) フェニル、(2-、3-、又は4-) (5-フルオロペンチル) フェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) (6-ブロモヘキシル)-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) (1, 1-ジメチル-2-クロロエチル) フェニル、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) (2-メチル-3-フルオロプロピル)-2-ナフチル、(2-、3-、又は4-) クロロメトキシフェニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) (2-フルオロエトキシ)-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) (3-ブロモプロポキシ) フェニル、(2-、3-、又は4-) (4-クロロブトキシ) フェニル、(2-、3-、又は4-) (5-フルオロペンチルオキシ) フェニル、(2-、3-、又は4-) トリフルオロメトキシフェニル、4-(6-ブロモヘキシルオキシ)-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) (1, 1-ジメチル-2-クロロエトキシ) フェニル、7-(2-メチル-3-フルオロプロポキシ)-2-ナフチル、2-ビニルフェニル、2-(1-メチルビニル) フェニル、2-(1-プロペニル)-1-ナフチル、(2-、3-、又は4-) (1-メチル-1-プロペニル) フェニル、3-(2-メチル-1-プロペニル)-1-ナフチル、(2-、3-、又は

10

20

30

40

50

4- (1-プロペニル) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) (2-プロペニル) フェ
 ニル、4- (2-ブテニル) -1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) (1-ブテニル)
) フェニル、5- (3-ブテニル) -1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) (2-ペ
 ンテニル) フェニル、6- (1-ペンテニル) -1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-
) (3-ペンテニル) フェニル、7- (4-ペンテニル) -1-ナフチル、(2-, 3-
 、又は4-) (1, 3-ブタジエニル) フェニル、8- (1, 3-ペンタジエニル) -1
 -ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) (2-ペンテン-4-イニル) フェニル、1- (2-
 ヘキセニル) -2-ナフチル、4- (1-ヘキセニル) フェニル、3- (5-ヘキセ
 ニル) -2-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) (3-ヘキセニル) フェニル、4- (4-
 ヘキセニル) -2-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) (3, 3-ジメチル-1-
 プロペニル) フェニル、5- (2-エチル-1-プロペニル) -2-ナフチル、4- (1,
 3, 5-ヘキサトリエニル) フェニル、6- (1, 3-ヘキサジエニル) -2-ナフチ
 ル、(2-, 3-, 又は4-) (1, 4-ヘキサジエニル) フェニル、(2-, 3-, 又
 は4-) (N-ホルミルアミノ) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) (N-アセチルア
 ミノ) フェニル、7- (N-アセチルアミノ) -2-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-
) (N-プロピオニルアミノ) フェニル、8- (N-ブチリルアミノ) -2-ナフチル、
 (2-, 3-, 又は4-) (N-イソブチリルアミノ) フェニル、2- (N-ペンタノイ
 ルアミノ) -1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) (N-tert-ブチルカルボ
 ニルアミノ) フェニル、3- (N-ヘキサノイルアミノ) -1-ナフチル、(2-, 3-
 、又は4-) (N, N-ジホルミルアミノ) フェニル、4- (N, N-ジアセチルア
 ミノ) -1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) (N, N-ジメチルアミノ) フェニル、(2-
 -, 3-, 又は4-) (N-フェニルアミノ) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) スル
 ファモイルフェニル、5-スルファモイル-1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) メ
 チルチオフェニル、6-エチルチオ-1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) n-プロ
 ピルチオフェニル、7-イソプロピルチオ-1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) n-
 ブチルチオフェニル、8-tert-ブチルチオ-1-ナフチル、(2-, 3-, 又は
 4-) n-ペンチルチオフェニル、1-n-ヘキシルチオ-2-ナフチル、(2-, 3-
 、又は4-) (N-メチルスルホニルアミノ) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) ホル
 ミルフェニル、(2-, 3-, 又は4-) アセチルフェニル、(2-, 3-, 又は4-)
 ブチリルフェニル、3-アセチル-2-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) プロピオニ
 ルフェニル、4-ブチリル-2-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) イソブチリルフェ
 ニル、5-ペンタノイル-2-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) シアノフェニル、(2-
 -, 3-, 又は4-) メトキシカルボニルフェニル、(2-, 3-, 又は4-) tert-
 ブチルカルボニルフェニル、6-ヘキサノイル-2-ナフチル、(2-, 3-, 又は
 4-) エトキシカルボニルフェニル、7-エトキシカルボニル-2-ナフチル、(2-
 -, 3-, 又は4-) n-プロポキシカルボニルフェニル、8-イソプロポキシカルボ
 ニル-2-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) n-ブトキシカルボニルフェニル、2-イソブ
 トキシカルボニル-1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) tert-ブトキシカルボ
 ニルフェニル、3-sec-ブトキシカルボニル-1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-
) n-ペンチルオキシカルボニルフェニル、4-ネオペンチルオキシ-1-ナフチル、
 (2-, 3-, 又は4-) n-ヘキシルオキシカルボニルフェニル、5-イソヘキシルオ
 キシカルボニル-1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-) (3-メチルペンチルオキシ
 カルボニル) フェニル、6- (1-ピロリル) -1-ナフチル、(2-, 3-, 又は4-
) (1-ピロリル) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) エチニルフェニル、(2-, 3-
 -, 又は4-) (N-メチルカルバモイル) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) (N-
 フェニルカルバモイル) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) (2-ヒドロキシエチル)
 フェニル、(2-, 3-, 又は4-) フェノキシフェニル、(2-, 3-, 又は4-) ニ
 トロフェニル、(2-, 3-, 又は4-) ベンジルオキシフェニル、(2-, 3-, 又は
 4-) ヒドロキシフェニル、(2-, 3-, 又は4-) (2-オキソ-2, 5-ジヒドロ
 フラン-4-イル) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) (1-イミダゾリルアセチル)

10

20

30

40

50

フェニル、(2-, 3-, 又は4-) (2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イルメチル) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) [(1-, 2-, 3-, 又は4-) ピペリジルカルボニル] フェニル、(2-, 3-, 又は4-) [(1-, 3-, 4-, 又は5-) ピラゾリル] フェニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-オキソ- (1-又は3-) ピロリジン]

10

] フェニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 4-, 又は5-) オキサゾリル] フェニル、(2-, 3-, 又は4-) (2-エチル-4-メチルイミダゾール-1-イル) フェニル、(2-, 3-, 又は4-) ビフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、2, 5-ジメトキシフェニル、2, 6-ジメトキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、2-メトキシ-5-クロロフェニル、2-メトキシ-5-メチルフェニル、2-メトキシ-5-アセチルアミノフェニル、2-ビニル-4-メチルフェニル、2-ビニル-5-エチルフェニル、2, 6-ジスルファモイルフェニル、2, 4, 6-トリメトキシフェニル、3, 4, 5-トリエトキシフェニル、2-ビニルナフチル、2, 3-ジメトキシ-1-ナフチル、3, 4-ジエトキシフェニル、2-メトキシ-5-メトキシカルボニルフェニル、3, 5-ジメトキシカルボニルフェニル、3-クロロ-4-ヒドロキシフェニル、2-クロロ-5-(N-アセチルアミノ) フェニル、2-クロロ-5-シアノフェニル、2-クロロ-5-カルバモイルフェニル、2-メトキシ-5-(N-アセチルアミノ) フェニル、2-クロロ-5-エトキシカルボニルフェニル、3, 5, 7-トリエトキシ-1-ナフチル、3, 4, 5, 7-テトラメチル-1-ナフチル、2, 3, 4, 5-テトラメチル-7-(N-ペンタアセチルアミノ)-1-ナフチル、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサエトキシ-1-ナフチル、ヘプタメトキシ-1-ナフチル基等が含まれる。

20

30

【0111】

シアノ低級アルキル基としては、シアノ基を1個有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、シアノメチル、2-シアノエチル、1-シアノエチル、3-シアノプロピル、4-シアノブチル、1, 1-ジメチル-2-シアノエチル、5-シアノペンチル、6-シアノヘキシル、1-シアノイソプロピル、2-メチル-3-シアノプロピル基等が含まれる。

【0112】

低級アルカノイルアミノ低級アルキル基としては、前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）を1～2個有するアミノ基を1～3個、好ましくは1個有する、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、2-(N-ホルミルアミノ) エチル、2-(N-アセチルアミノ) エチル、2-(N-プロピオニルアミノ) エチル、2-(N-ブチリルアミノ) エチル、2-(N-イソブチリルアミノ) エチル、2-(N-ペンタノイルアミノ) エチル、2-(N-tert-ブチルカルボニルアミノ) エチル、2-(N-ヘキサノイルアミノ) エチル、N-アセチルアミノメチル、1-(N-アセチルアミノ) エチル、3-(N-アセチルアミノ) プロピル、4-(N-アセチルアミノ) ブチル、5-(N-アセチルアミノ) ペンチル、6-(N-アセチルアミノ) ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(N-アセチルアミノ) エチル、2-メチル-3-(N-アセチルアミノ) プロピル、2-(N, N-ジアセチルアミノ) エチル基等が

40

50

含まれる。

【0113】

ハロゲン置換低級アルキルアミノ基としては、前記例示のハロゲン置換低級アルキル基（好ましくはハロゲン原子を1～7個（好ましくは1～3個）有するハロゲン置換炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1～2個（好ましくは1個）有するアミノ基を挙げることができる。より具体的には、N-フルオロメチルアミノ、N-ジフルオロメチルアミノ、N-トリフルオロメチルアミノ、N-クロロメチルアミノ、N-ジクロロメチルアミノ、N-トリクロロメチルアミノ、N-ブロモメチルアミノ、N-ジブロモメチルアミノ、N-ジクロロフルオロメチルアミノ、N-2, 2, 2-トリフルオロエチルアミノ、N-ペンタフルオロエチルアミノ、N-2-クロロエチルアミノ、N-3, 3, 3-トリフルオロプロピルアミノ、N-ヘプタフルオロプロピルアミノ、N-ヘプタフルオロイソプロピルアミノ、N-3-クロロプロピルアミノ、N-2-クロロプロピルアミノ、N-3-ブロモプロピルアミノ、N-4, 4, 4-トリフルオロブチルアミノ、N-4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチルアミノ、N-4-クロロブチルアミノ、N-4-ブロモブチルアミノ、N-2-クロロブチルアミノ、N-5, 5, 5-トリフルオロペンチルアミノ、N-5-クロロペンチルアミノ、N-6, 6, 6-トリフルオロヘキシルアミノ、N-6-クロロヘキシルアミノ、N-(1, 1-ジメチル-2-クロロエチル)アミノ、N-(2-メチル-3-フルオロプロピル)アミノ、N, N-ジ(フルオロメチル)アミノ基等が含まれる。

【0114】

低級アルキルチオ低級アルキル基としては、低級アルキル部分が前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）である低級アルキルチオを1～3個有する、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、2-メチルチオエチル、2-エチルチオエチル、2-n-プロピルチオエチル、2-n-ブチルチオエチル、2-tert-ブチルチオエチル、2-n-ペンチルチオエチル、2-n-ヘキシルチオエチル、メチルチオメチル、1-メチルチオエチル、3-メチルチオプロピル、4-メチルチオブチル、5-メチルチオペンチル、6-メチルチオヘキシル、1, 1-ジメチル-2-メチルチオエチル、2-メチル-3-メチルチオプロピル、2, 2-ジエチルチオエチル、2, 2, 2-トリエチルチオエチル基等が含まれる。

【0115】

低級アルキル基を有していてもよいアミジノ基としては、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1～2個有することのあるアミジノ基を挙げることができる。より具体的には、アミジノ、N-メチルアミジノ、N-エチルアミジノ、N-n-プロピルアミジノ、N-n-ブチルアミジノ、N-n-ペンチルアミジノ、N-n-ヘキシルアミジノ、N-イソプロピルアミジノ、N-tert-ブチルアミジノ、N, N-ジメチルアミジノ、N, N'-ジメチルアミジノ、N-メチル-N'-エチルアミジノ基等が含まれる。

【0116】

アミジノ低級アルキル基としては、アミジノ基を1～3個有する、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、アミジノメチル、2-アミジノエチル、3-アミジノプロピル、4-アミジノブチル、5-アミジノプロピル、6-アミジノヘキシル、1-アミジノエチル、1, 1-ジメチル-2-アミジノエチル、2-メチル-3-アミジノプロピル、2, 2-ジアミジノエチル、2, 2, 2-トリアミジノエチル基等が含まれる。

【0117】

低級アルケニルオキシ基としては、低級アルケニル部分が前記例示のものである低級アルケニルオキシ基（好ましくは二重結合を1～3個有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルオキシ基）を挙げることができる。より具体的には、ビニルオキシ、1-プロペニルオキシ、1-メチル-1-プロペニルオキシ、2-メチル-1-プロペニルオキシ

10

20

30

40

50

シ、2-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ、1-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、2-ペンテニルオキシ、1-ペンテニルオキシ、3-ペンテニルオキシ、4-ペンテニルオキシ、1, 3-ブタジエニルオキシ、1, 3-ペンタジエニルオキシ、2-ペンテン-4-イルオキシ、2-ヘキセニルオキシ、1-ヘキセニルオキシ、5-ヘキセニルオキシ、3-ヘキセニルオキシ、4-ヘキセニルオキシ、3, 3-ジメチル-1-プロペニルオキシ、2-エチル-1-プロペニルオキシ、1, 3, 5-ヘキサトリエニルオキシ、1, 3-ヘキサジエニルオキシ、1, 4-ヘキサジエニルオキシ基等が含まれる。

【0118】

低級アルケニルオキシ低級アルキルとしては、低級アルケニルオキシ部分が前記例示の低級アルケニルオキシ基（好ましくは炭素数2から6の直鎖又は分枝鎖状で二重結合を1～3個有するアルケニル基）である低級アルケニルオキシを1～3個有する、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、ビニルオキシメチル、2-ビニルオキシエチル、2-（1-プロペニルオキシ）エチル、2-（1-メチル-1-プロペニルオキシ）エチル、2-（2-メチル-1-プロペニルオキシ）エチル、2-（2-プロペニルオキシ）エチル、2-（2-ブテニルオキシ）エチル、2-（1-ブテニルオキシ）エチル、2-（3-ブテニルオキシ）エチル、2-（2-ペンテニルオキシ）エチル、2-（1-ペンテニルオキシ）エチル、2-（3-ペンテニルオキシ）エチル、2-（4-ペンテニルオキシ）エチル、2-（1, 3-ブタジエニルオキシ）エチル、2-（1, 3-ペンタジエニルオキシ）エチル、2-（2-ペンテン-4-イルオキシ）エチル、2-（2-ヘキセニルオキシ）エチル、2-（1-ヘキセニルオキシ）エチル、2-（5-ヘキセニルオキシ）エチル、2-（3-ヘキセニルオキシ）エチル、2-（4-ヘキセニルオキシ）エチル、2-（3, 3-ジメチル-1-プロペニルオキシ）エチル、2-（2-エチル-1-プロペニルオキシ）エチル、2-（1, 3, 5-ヘキサトリエニルオキシ）エチル、2-（1, 3-ヘキサジエニルオキシ）エチル、2-（1, 4-ヘキサジエニルオキシ）エチル、3-ビニルオキシプロピル、4-ビニルオキシブチル、5-ビニルオキシプロピル、6-ビニルオキシヘキシル、1-ビニルオキシエチル、1, 1-ジメチル-2-ビニルオキシエチル、2-メチル-3-ビニルオキシプロピル、2, 2-ジビニルオキシエチル、2, 2, 2-トリビニルオキシエチル基等が含まれる。

【0119】

アリール基上に低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン置換低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいアリールアミノ基としては、アリール基上に、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルコキシ基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）；前記例示のハロゲン置換低級アルキル基（好ましくはハロゲン原子を1～7個、好ましくは1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；及び前記例示のハロゲン置換低級アルコキシ基（好ましくはハロゲン原子を1～7個、好ましくは1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）からなる群より選ばれた置換基を1～7個、好ましくは1～5個、より好ましくは1～2個有することのある前記例示のアリール基を、1～2個有するアミノ基を挙げることができる。より具体的には、N-フェニルアミノ、N-2-ナフチルアミノ、N-（2-メチルフェニル）アミノ、N-（3-エチル-1-ナフチル）アミノ、N-（4-n-プロピルフェニル）アミノ、N-（2-n-ブチル-1-フェニル）アミノ、N-（3-n-ペンチルフェニル）アミノ、N-（4-n-ヘキシル-1-ナフチル）アミノ、N-（2-イソブチルフェニル）アミノ、N-（3-tert-ブチル-1-ナフチル）アミノ、N-（2-メトキシフェニル）アミノ、N-（3-エトキシ-1-ナフチル）アミノ、N-（4-n-プロポキシフェニル）アミノ、N-（3-イソプロポキシ-1-ナフチル）アミノ、N-（n-ブトキシフェニル）アミノ、N-（1-イソブトキシ-2-ナフチル）アミノ、N-（tert-ブトキシフェニル）アミノ、N-（5-sec-ブトキシ-1-ナフチル）アミノ、N-（n-ペンチルオキシフェニル）アミノ、N-（5-イソペ

ンチルオキシ-1-ナフチル) アミノ、N-(1-ネオペンチルオキシフェニル) アミノ、N-(6-n-ヘキシルオキシ-2-ナフチル) アミノ、N-(イソヘキシルオキシフェニル) アミノ、N-(3-メチルペンチルオキシ-1-ナフチル) アミノ、N-(2-トリフルオロメチルフェニル) アミノ、N-(4-トリフルオロメチルフェニル) アミノ、N-(2-クロロメチルフェニル) アミノ、N-[3-(2-フルオロエチル)-1-ナフチル] アミノ、N-[4-(3-ブロモプロピル) フェニル] アミノ、N-[2-(4-クロロブチル)-1-フェニル] アミノ、N-[3-(5-フルオロペンチル) フェニル] アミノ、N-[4-(6-ブロモヘキシル)-1-ナフチル] アミノ、N-[2-(1, 1-ジメチル-2-クロロエチル) フェニル] アミノ、N-[7-(2-メチル-3-フルオロプロピル)-2-ナフチル] アミノ、N-(2-クロロメトキシフェニル) アミノ、N-(4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノ、N-[3-(2-フルオロエトキシ)-1-ナフチル] アミノ、N-[4-(3-ブロモプロポキシ) フェニル] アミノ、N-[2-(4-クロロブトキシ)-1-フェニル] アミノ、N-[3-(5-フルオロペンチルオキシ) フェニル] アミノ、N-[4-(6-ブロモヘキシルオキシ)-1-ナフチル] アミノ、N-[2-(1, 1-ジメチル-2-クロロエトキシ) フェニル] アミノ、N-[7-(2-メチル-3-フルオロプロポキシ)-2-ナフチル] アミノ、N-(2-クロロメトキシフェニル) アミノ、N-[3-(2-フルオロエトキシ)-1-ナフチル] アミノ、N-[4-(3-ブロモプロポキシ) フェニル] アミノ、N-[2-(4-クロロブトキシ)-1-フェニル] アミノ、N-[3-(5-フルオロペンチルオキシ) フェニル] アミノ、N-[4-(6-ブロモヘキシルオキシ)-1-ナフチル] アミノ、N-[2-(1, 1-ジメチル-2-クロロエトキシ) フェニル] アミノ、N-[7-(2-メチル-3-フルオロプロポキシ)-2-ナフチル] アミノ、N, N-ジフェニルアミノ基等が含まれる。

【0120】

アリール低級アルケニル基としては、前記例示のアリール基を有する前記例示の低級アルケニル(好ましくは1~3個有する炭素数1~6個の直鎖又は分枝鎖状のアルケニル基)を挙げることができる。より具体的には、2-フェニルエテニル、3-フェニル-2-プロペニル、3-[(1-, 又は2-) ナフチル]-2-プロペニル、4-[(2-, 3-, 又は4-) メチルフェニル]-2-ブテニル、4-[(2-, 3-, 又は4-) エチルフェニル]-3-ブテニル、4-[(2-, 3-, 又は4-) n-プロピルフェニル]-1, 3-ブタジエニル、5-[(2-, 3-, 又は4-) n-ブチルフェニル]-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5-[(2-, 3-, 又は4-) n-ペンチルフェニル]-2, 4-ヘキサジエニル、5-[(2-, 3-, 又は4-) n-ヘキシルフェニル]-3-ペンテニル、3-[(2-, 3-, 又は4-) イソブチルフェニル]-2-プロペニル、2-[(2-, 3-, 又は4-) tert-ブチルフェニル] フェニル、3-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) メチル-1-ナフチル]-2-プロペニル、4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) メチル-2-ナフチル]-2-ブテニル、4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) エチル-1-ナフチル]-3-ブテニル、4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) エチル-2-ナフチル]-1, 3-ブタジエニル、5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) n-プロピル-1-ナフチル]-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) n-プロピル-2-ナフチル]-2, 4-ヘキサジエニル、5-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) n-ブチル-1-ナフチル]-3-ペンテニル、3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) n-ブチル-2-ナフチル]-2-プロペニル、2-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) n-ペンチル-1-ナフチル] エテニル、3-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) n-ペンチル-2-ナフチル]-2-プロペニル、4-[(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) n-ヘキシル-1-ナフチル]-2-ブテニル、4-[(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) n-ヘキシル-2-ナフチル]-3-ブテニル、4-[(2-, 3-, 4-,

5-、6-、7-、又は8-) イソブチル-1-ナフチル]-1, 3-ブタジエニル、5- [(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) イソブチル-2-ナフチル]-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) tert-ブチル-1-ナフチル]-2, 4-ヘキサジエニル、5- [(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) tert-ブチル-2-ナフチル]-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5- [(2-, 3-, 又は4-) クロロフェニル、(2-, 3-, 又は4-) フルオロフェニル]-2, 4-ヘキサジエニル、5- [(2-, 3-, 又は4-) ブロモフェニル]-3-ペンテニル、3- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) クロロ-1-ナフチル]-2-プロペニル、2- [(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) クロロ-2-ナフチル] エテニル、3- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) フルオロ-1-ナフチル]-2-プロペニル、4- [(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) フルオロ-2-ナフチル]-2-ブテニル、4- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) プロモ-1-ナフチル]-3-ブテニル、4- [(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) プロモ-2-ナフチル]-1, 3-ブタジエニル、5- [(2-, 3-, 又は4-) アミノフェニル]-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5- [(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) アミノ-1-ナフチル]-2, 4-ヘキサジエニル、5- [(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) アミノ-2-ナフチル]-3-ペンテニル、3- (2, 3-ジメチルフェニル)-2-プロペニル、2- (3, 4-ジメチルフェニル) ビニル、3- (2, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニル、4- (2, 5-ジメチルフェニル)-2-ブテニル、4- (2, 6-ジメチルフェニル)-3-ブテニル、4- (2, 4, 6-トリメチルフェニル)-1, 3-ブタジエニル、5- (3, 4, 5-トリメチルフェニル)-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5- (2, 3, 4, 5-テトラエチルフェニル)-2, 4-ヘキサジエニル、5- (ペンタメチルフェニル)-3-ペンテニル、3- (2-メチル-1-ナフチル)-2-プロペニル、2- (2, 3-ジメチル-1-ナフチル) エテニル、3- (3, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニル、4- (3, 5, 7-トリエチル-1-ナフチル)-2-ブテニル、4- (3, 4, 5, 7-テトラメチル-1-ナフチル)-3-ブテニル、4- (2, 3, 4, 5, 7-ペンタメチル-1-ナフチル)-1, 3-ブタジエニル、5- (2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサエチル-1-ナフチル)-1, 3, 5-ヘキサトリエニル、5- (ヘプタメチル-1-ナフチル)-2, 4-ヘキサジエニル、5- (2, 3-ジアミノフェニル)-3-ペンテニル、3- (2, 4, 6-トリアミノフェニル)-2-プロペニル、2- (2-メチル-5-クロロ-1-ナフチル) エテニル基等が含まれる。

【0121】

低級アルキル基を有していてもよいピリジルアミノ基としては、ピリジル基上及び／又はアミノ基上に、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を、1～3個、好ましくは1～2個有することのある、ピリジルアミノ基を挙げることができる。より具体的には、N-(2-, 3-, 又は4-) ピリジルアミノ、N-(3-メチル-2-ピリジル) アミノ、N-(4-メチル-2-ピリジル) アミノ、N-(5-メチル-2-ピリジル) アミノ、N-(6-メチル-2-ピリジル) アミノ、N-(2-メチル-3-ピリジル) アミノ、N-(4-メチル-3-ピリジル) アミノ、N-(5-メチル-3-ピリジル) アミノ、N-(6-メチル-3-ピリジル) アミノ、N-(2-メチル-4-ピリジル) アミノ、N-(3-メチル-4-ピリジル) アミノ、N-(3-エチル-2-ピリジル) アミノ、N-(4-n-プロピル-2-ピリジル) アミノ、N-(5-n-プロピル-2-ピリジル) アミノ、N-(2-n-ブチル-3-ピリジル) アミノ、N-(4-n-ペンチル-3-ピリジル) アミノ、N-(5-n-ヘキシル-3-ピリジル) アミノ、N-(2-イソプロピル-4-ピリジル) アミノ、N-(3-tert-ブチル-4-ピリジル) アミノ、N-(3-メチル-2-ピリジル)-N-メチル-アミノ、N-(2, 4-ジエチル-3-ピリジル)-N-メチル-アミノ基等が含まれる。

【0122】

アリール低級アルキル基（アリール基上及び／又は低級アルキル基上には、ハロゲン、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が置換していてもよい）としては、前記例示のアリール基を1～3個、好ましくは1個有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。ここで、アリール基上及び／又はアルキル部分上には、前記例示のハロゲン；前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示のハロゲン置換低級アルキル基（好ましくはハロゲン原子が1～7個置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルコキシ基（好ましくはハロゲン原子が1～7個置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）；前記例示の低級アルコキシ基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）；カルバモイル基；及び前記例示の低級アルコキシ基カルボニル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基）からなる群から選ばれた基が1～7個、好ましくは1～5個、より好ましくは1～2個置換していてもよい。アリール低級アルキル基（アリール基上及び／又は低級アルキル基上には、ハロゲン、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、カルバモイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が置換していてもよい）の具体例としては、ベンジル、1-フェニルエチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、1, 1-ジメチル-3-フェニルプロピル、(2-, 3-, 又は4-)フルオロベンジル、2-[(2-, 3-, 又は4-)フルオロフェニル]エチル、1-[(2-, 3-, 又は4-)フルオロフェニル]エチル、1-[(2-, 3-, 又は4-)フルオロフェニル]プロピル、2-[(2, 6-, 又は3, 5-)ジフルオロフェニル]エチル、1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エチル、1-(3, 5-ジフルオロフェニル)プロピル、(2-, 3-, 又は4-)クロロベンジル、2-[(2-, 3-, 又は4-)クロロフェニル]エチル、2-(3, 4-ジクロロフェニル)エチル、1-(3-クロロフェニル)ブチル、1-(4-クロロフェニル)ブチル、(2-, 3-, 又は4-)トリフルオロメチルフェニルベンジル、1-[(2-, 3-, 又は4-)トリフルオロメチルフェニル]エチル、1-[(2-, 3-, 又は4-)トリフルオロメチルフェニル]プロピル、(2-, 3-, 又は4-)メチルベンジル、2-[(2-, 3-, 又は4-)メチルフェニル]エチル、(2-, 3-, 又は4-)トリフルオロメトキシベンジル、1-[(2-, 3-, 又は4-)トリフルオロメチルフェニル]エチル、(2-, 3-, 又は4-)メトキシベンジル、2-[(2-, 3-, 又は4-)メトキシフェニル]エチル、1-[(2-, 3-, 又は4-)メトキシフェニル]プロピル、(2-, 3-, 又は4-)エトキシベンジル、(3, 4-又は3, 5-)ジメトキシベンジル、(3, 4-又は3, 5-)ジ(n-ブトキシ)ベンジル、2-[(3, 5-又は3, 4-)ジメトキシフェニル]エチル、2-(2-エトキシフェニル)エチル、1-(4-メトキシフェニル)ブチル、1-フェニル-1-メトキシカルボニルメチル、1-カルバモイル-2-フェニルエチル、1-メトキシカルボニル-2-フェニルエチル、2-メトキシカルボニル-2-フェニルエチル、2-フェニル-2-ヒドロキシエチル、2-(4-ヒドロキシフェニル)-1-メトキシカルボニルエチル、3-クロロ-4-ジフルオロメトキシフェニルメチル、ナフチルメチル基等が含まれる。

【0123】

低級アルキニル基としては、炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルキニル基を挙げることができる。より具体的には、エチニル、2-プロピニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-ペンチニル、2-ヘキシニル基等が含まれる。

【0124】

アリールオキシ低級アルキル基（アリール基上には、低級アルコキシ基；低級アルコキシ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基；

及びオキソ基を有していてもよいピロリジニル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい)としては、アリール部分及び低級アルキル基が前記例示のアリール低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を挙げることができる。ここで、アリール基上には、前記例示の低級アルコキシ;前記例示の低級アルコキシ基及び前記例示の低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよいカルバモイル基;及びオキソ基からなる群から選ばれた基が1~5個(好ましくは1~2個)置換していてもよい。より具体的には、2-[(2-, 3-, 又は4-)メトキシフェノキシ]エチル、2-[(2-, 3-, 又は4-)カルバモイルフェノキシ]エチル、2-[(2-, 3-, 又は4-)(N-メチル-N-エトキシカルバモイル)フェノキシ]エチル、2-[(2-, 3-, 又は4-)(2-オキソ-1-ピロリジニル)フェノキシ]エチル基等が含まれる。

10

【0125】

オキソ基を有していてもよいイソオキサゾリジニル基としては、オキソ基を1~2個(好ましくは1個)有していてもよいイソオキサゾリジニル基を挙げることができる。より具体的には、3-オキソイソオキサゾリジン-4-又は5-イル、3, 5-ジオキソイソオキサゾリジン-4-イル基等が含まれる。

【0126】

ジヒドロインデニル基としては、(1-, 2-, 4-, 又は5-)-1, 2-ジヒドロインデニル基等を挙げることができる。

【0127】

20

アリール低級アルコキシ低級アルキル基としては、アリール部分、低級アルコキシ部分及び低級アルキル基部分が前記例示のアリール低級アルコキシ低級アルキル基を挙げることができる。より具体的には、ベンジルオキシメチル、2-ベンジルオキシエチル、2-ベンジルオキシブチル基等が含まれる。

【0128】

低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアゼチジニル基としては、前記例示の低級アルカノイル基及び前記例示のアロイル基からなる群から選ばれた基を1~3個(好ましくは1個)有していてもよいアゼチジニル基を挙げることができる。より具体的には、(2-又は3-)アゼチジニル、1-アセチル-(2-又は3-)アゼチジニル、1-ブチル-(2-又は3-)アゼチジニル、1-ベンゾイル-(2-又は3-)アゼチジニル基等が含まれる。

30

【0129】

低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアゼチジニル低級アルキル基としては、前記例示の低級アルカノイル基及び前記例示のアロイル基からなる群から選ばれた基を1~3個(好ましくは1個)有していてもよい、低級アルキル部分が前記例示のアゼチジニル低級アルキル基を挙げることができる。より具体的には、(2-又は3-)アゼチジニルメチル、2-(2-又は3-アゼチジニル)エチル、1-アセチル-(2-又は3-)アゼチジニルメチル、1-ブチル-(2-又は3-)アゼチジニルメチル、1-ベンゾイル-(2-又は3-)アゼチジニルメチル、2-[1-アセチル-(2-又は3-)アゼチジニル]エチル、2-[1-ブチル-(2-又は3-)アゼチジニル]エチル、2-[1-ベンゾイル-(2-又は3-)アゼチジニル]エチル基等が含まれる。

40

【0130】

テトラゾリル基としては、(1-又は5-)テトラゾリル基を挙げることができる。

【0131】

オキソ基を有していてもよいインドリニル基としては、オキソ基を1~2個(好ましくは1個)有していてもよいインドリニル基を挙げることができる。より具体的には、(1-, 3-, 5-, 6-, 7-, 又は8-)インドリニル、2-オキソ-(1-, 3-, 5-, 6-, 7-, 又は8-)インドリニル、2, 3-ジオキソ-(1-, 5-, 6-, 7-, 又は8-)インドリニル基等が含まれる。

50

【0132】

トリアゾリル基としては、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 3, 5-トリアゾリル基等を挙げることができる。

【0133】

低級アルキル基及び低級アルキルチオ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいトリアゾリル基としては、前記例示の低級アルキル基及び前記例示の低級アルキルチオ基からなる群から選ばれた基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよい前記例示のトリアゾリル基を挙げることができる。より具体的には、(1-, 3-, 又は5-) -1, 2, 4-トリアゾリル、(1-, 2-, 又は5-) -1, 3, 5-トリアゾリル、1-メチル-5-メチルチオ-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル、1-メチル-5-メチルチオ-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル等が含まれる。

10

【0134】

カルバモイル基を有していてもよいイミダゾリル基としては、カルバモイル基を1～2個（好ましくは1個）有していてもよいイミダゾリル基を挙げることができる。より具体的には、(1-, 2-, 4-, 又は5-) イミダゾリル、4-カルバモイル-(1-, 2-, 又は5-) イミダゾリル基等が含まれる。

【0135】

低級アルキル基を有していてもよいオキサゾリル基としては、前記例示の低級アルキル基を1～2個（好ましくは1個）有していてもよいオキサゾリル基を挙げることができる。より具体的には、(2-, 3-, 又は4-) オキサゾリル、4-メチル-(2-又は3-) オキサゾリル基等が含まれる。

20

【0136】

低級アルキル基を有していてもよいイソチアゾリル基としては、前記例示の低級アルキル基を1～2個（好ましくは1個）有していてもよいイソチアゾリル基を挙げることができる。より具体的には、(3-, 4-, 又は5-) イソチアゾリル、(3-又は4-) メチル-2-イソチアゾリル基等が含まれる。

【0137】

ジヒドロベンゾチアゾリル基としては、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾリル基等を挙げることができる。

【0138】

オキソ基を有していてもよいジヒドロベンゾチアゾリル基としては、オキソ基を1個有していてもよいジヒドロベンゾチアゾリル基を挙げることができる。より具体的には、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾリル、2-オキソ-(3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾリル基等が含まれる。

30

【0139】

低級アルコキシカルボニル基を有していてもよいチエニル基としては、前記例示の低級アルコキシカルボニル基を1～2個（好ましくは1個）有していてもよいチエニル基を挙げることができる。より具体的には、(2-又は3-) チエニル、3-メトキシカルボニル-2-チエニル基等が含まれる。

40

【0140】

低級アルキル基を有していてもよいオキサゾリル低級アルキル基としては、オキサゾール環上に、前記例示の低級アルキル基を1～3個（より好ましくは1～2個）有していてもよい、低級アルキル基が前記例示の前記例示のオキサゾリル低級アルキル基を挙げることができる。より具体的には、(2-, 4-, 又は5-) オキサゾリルメチル、2-(2-, 4-, 又は5-) オキサゾリルエチル、[2-メチル-(4-又は5-) オキサゾリル]メチル、(2-, 5-ジメチル-4-オキサゾリル)メチル等が含まれる。

【0141】

アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、アリール基、アリール低級アルキル基、アロイル基及びア

50

ミノ置換アルキル基（アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ低級アルキル基としては、アミノ基を1～5個、好ましくは1～3個、より好ましくは1個有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。ここで、アミノ基上には、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示のハロゲン置換低級アルキル基（好ましくはハロゲン原子を1～13個、好ましくは1～7個、より好ましくは1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルコキシカルボニル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基）；前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）；前記例示のアリール基；前記例示のアリール低級アルキル基；前記例示のアロイル基；アミノ基を1～5個、好ましくは1～3個、より好ましくは1有する前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）（アミノ基上には、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）が1～2個置換していてもよい）からなる群から選ばれた基が1～2個置換していてもよい。アミノ基上に、低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、アリール基、アリール低級アルキル基、アロイル基及びアミノ置換アルキル基（アミノ置換アルキル基のアミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ低級アルキル基の具体例としては、N-メチルアミノメチル、N-エチルアミノメチル、N-n-プロピルアミノメチル、N, N-ジメチルアミノメチル、N, N-ジエチルアミノメチル、N-メチル-N-n-プロピルアミノメチル、N-メチル-N-エチルアミノメチル、N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノメチル、N-メチル-N-ベンジルアミノメチル、N-フェニルアミノメチル、N-メチル-N-フェニルアミノメチル、N-ホルミルアミノメチル、N-メチル-N-アセチルアミノメチル、N-メチル-N-プロピオニルアミノメチル、N-[2-(N, N-ジエチルアミノ)エチル]アミノメチル、N-メチル-N-ベンゾイルアミノメチル、2-(N-メチルアミノ)エチル、2-(N-エチルアミノ)エチル、2-[N-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アミノ]エチル、2-(N, N-ジメチルアミノ)エチル、2-(N, N-ジエチルアミノ)エチル、2-(N-メチル-N-アセチルアミノ)エチル、2-(N-メチル-N-ベンゾイルアミノ)エチル、2-(N-メチル-N-プロピオニルアミノ)エチル、2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)エチル、2-(N-メチル-N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)エチル基等を挙げることができる。

【0142】

低級アルキル基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいカルバモイル基が置換した低級アルキル基としては、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）及び前記例示のハロゲン置換低級アルキル基（好ましくはハロゲン原子を1～13個、好ましくは1～7個、より好ましくは1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいカルバモイル基が1～3個（好ましくは1個）置換した、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を挙げることができる。より具体的には、カルバモイルメチル、2-カルバモイルエチル、1-カルバモイルエチル、3-カルバモイルプロピル、4-カルバモイルブチル、5-カルバモイルペンチル、6-カルバモイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-カルバモイルエチル、2-メチル-3-カルバモイルプロピル、1, 2-ジカルバモイルエチル、2, 2-ジカルバモイルエチル、1, 2, 3-トリカルバモイルプロピル、N-メチルカルバモイルメチル、N-エチルカルバモイルメチル、2-(N-n-プロピルカルバモイル)エチル、3-(N-n-ブチルカルバモイル)プロピル、4-(N-イソブチルカルバモイル)ブチル、5-(N-tert-ブチルカルバモイル)ペンチル、6-(N-ペンチルカルバモイル)ヘキシル、N, N-ジメチルカルバモイルメチル、N, N-ジエチ

ルカルバモイルメチル、2-(N-2-フルオロエチルカルバモイル)エチル、3-(N-2-クロロエチルカルバモイル)プロピル、4-(N-2-ブロモエチルカルバモイル)ブチル、2-(N-2, 2-ジクロロエチルカルバモイル)エチル、N-2, 2, 2-トリフルオロエチルカルバモイルメチル、N-ヘプタフルオロプロピルカルバモイルメチル基等が含まれる。

【0143】

低級アルキル基を有していてもよいチオカルバモイル基としては、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6個の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1～2個有することのあるチオカルバモイル基を挙げることができる。より具体的には、チオカルバモイル、N-メチルーチオカルバモイル、N-エチルーチオカルバモイル、N-n-プロピルーチオカルバモイル、N-n-ブチルーチオカルバモイル、N-n-ペンチルーチオカルバモイル、N-n-ヘキシルーチオカルバモイル、N-イソブチルーチオカルバモイル、N-tert-ブチルーチオカルバモイル、N, N-ジメチルーチオカルバモイル、N-メチルーN-エチルーチオカルバモイル基等が含まれる。

10

【0144】

オキシ基を有していてもよいオキサゾリジニル基としては、オキシ基を1～2個（好ましくは1個）有していてもよいオキサゾリジニル基が挙げられる。具体的には、オキサゾリジン-3-イル、オキサゾリジン-4-イル、オキサゾリジン-5-イル、2-オキソオキサゾリジン-4-イル、2-オキソオキサゾリジン-3-イル、2-オキソオキサゾリジン-5-イル基等が含まれる。

20

【0145】

オキシ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいイミダゾリジニル基としては、オキシ基及び前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数が1～6個の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）からなる群から選ばれた置換基を1～3個、好ましくは1～2個有していることのある、イミダゾリジニル基を挙げることができる。より具体的には、イミダゾリジン-1-イル、イミダゾリジン-2-イル、イミダゾリジン-4-イル、2-オキソイミダゾリジン-1-イル、4-オキソイミダゾリジン-1-イル、5-オキソイミダゾリジン-1-イル、4-オキソイミダゾリジン-2-イル、2-オキソイミダゾリジン-4-イル、2-メチルーイミダゾリジン-1-イル、4-エチルーイミダゾリジン-1-イル、5-n-プロピルーイミダゾリジン-1-イル、4-n-ブチルーイミダゾリジン-2-イル、2-n-ペンチルーイミダゾリジン-4-イル、2-n-ヘキシルーイミダゾリジン-1-イル、4-イソブチルーイミダゾリジン-2-イル、2-tert-ブチルーイミダゾリジン-4-イル、2-オキソ-3-メチルーイミダゾリジン-1-イル、2-オキソ-3, 4-ジメチルーイミダゾリジン-1-イル基等が含まれる。

30

【0146】

オキシ基を有していてもよいピロリジニル基としては、オキシ基を1～2個（好ましくは1個）有していてもよいピロリジニル基が挙げられる。具体的には、(1-, 2-, 又は3-)ピロリジニル、(2-又は3-)オキソ-1-ピロリジニル、(3-, 4-, 又は5-)オキソ-2-ピロリジニル、(2-, 4-, 又は5-)オキソ-3-ピロリジニル基を挙げることができる。

40

【0147】

イミダゾリル基としては、(1-, 2-, 4-, 又は5-)イミダゾリル基を挙げることができる。

【0148】

イソオキサゾリル基としては、(3-, 4-, 又は5-)イソオキサゾリル基を挙げることができる。

【0149】

アリールスルホニル基としては、アリール部分が、フェニル、ビフェニル、置換ビフェニル、置換フェニル、ナフチル、置換ナフチル等であり、当該アリール部分上に、炭素数

50

1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～7個、好ましくは1～5個、より好ましくは1～2個有することのあるアリールスルホニルを挙げることができる。当該フェニル、ビフェニル、ナフチル等の置換基としては、例えば、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、ハロゲン、アミノ基等が挙げられる。これらの少なくとも1個が、フェニル、ビフェニル、ナフチル等の環上に1～7個、好ましくは1～5個、より好ましくは1～2個置換していてもよい。このようなアリール基上に低級アルキル基を有していてもよいアリールスルホニル基の具体例としては、フェニルスルホニル、(2-、3-、又は4-)ビフェニルスルホニル、(1-、又は2-)ナフチルスルホニル、(2-、3-、又は4-)メチルフェニルスルホニル、(2-、3-、又は4-)エチルフェニルスルホニル、(2-、3-、又は4-)n-プロピルフェニルスルホニル、(2-、3-、又は4-)n-ブチルフェニルスルホニル、(2-、3-、又は4-)n-ペンチルフェニルスルホニル、(2-、3-、又は4-)n-ヘキシルフェニルスルホニル、(2-、3-、又は4-)イソブチルフェニルスルホニル、(2-、3-、又は4-)tert-ブチルフェニルスルホニル、(3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)メチル-2-ビフェニルスルホニル、(2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)メチル-3-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)メチル-4-ビフェニルスルホニル、(3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)エチル-2-ビフェニルスルホニル、(2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)エチル-3-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)エチル-4-ビフェニルスルホニル、(3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-プロピル-2-ビフェニルスルホニル、(2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-プロピル-3-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-プロピル-4-ビフェニルスルホニル、(3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ブチル-2-ビフェニルスルホニル、(2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ブチル-3-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ブチル-4-ビフェニルスルホニル、(3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ペンチル-2-ビフェニルスルホニル、(2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ペンチル-3-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ペンチル-4-ビフェニルスルホニル、(3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ヘキシル-2-ビフェニルスルホニル、(2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ヘキシル-3-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)n-ヘキシル-4-ビフェニルスルホニル、(3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)イソブチル-2-ビフェニルスルホニル、(2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)イソブチル-3-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)イソブチル-4-ビフェニルスルホニル、(3-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)tert-ブチル-2-ビフェニルスルホニル、(2-、4-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)tert-ブチル-3-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、5-、6-、2'-、3'-、4'-、5'-、又は6'-)tert-ブチル-4-ビフェニルスルホニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)メチル-1-ナフチルスルホニル、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)メチル-2-ナフチルスルホニル、(2-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)エチル-1-ナフチルスルホニル、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-)エチル-2-ナフチルスルホニル、(2-、3-、4-、5-

10

20

30

40

50

ー、6ー、7ー、又は8ー) n-プロピル-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-プロピル-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-ブチル-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-ブチル-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-ペンチル-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-ペンチル-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-ヘキシル-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) n-ヘキシル-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) イソブチル-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) イソブチル-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) t e r t -ブチル-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) t e r t -ブチル-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、又は4ー) クロロフェニルスルホニル、(2ー、3ー、又は4ー) フルオロフェニルスルホニル、(2ー、3ー、又は4ー) ブロモフェニルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) クロロ-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) クロロ-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) フルオロ-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) フルオロ-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) ブロモ-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) ブロモ-2-ナフチルスルホニル、(2ー、3ー、又は4ー) アミノフェニルスルホニル、(2ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) アミノ-1-ナフチルスルホニル、(1ー、3ー、4ー、5ー、6ー、7ー、又は8ー) アミノ-2-ナフチルスルホニル、2, 3-ジメチルフェニルスルホニル、3, 4-ジメチルフェニルスルホニル、2, 4-ジメチルフェニルスルホニル、2, 5-ジメチルフェニルスルホニル、2, 6-ジメチルフェニルスルホニル、2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニル、3, 4, 5-トリメチルフェニルスルホニル、2, 3, 4, 5-テトラエチルフェニルスルホニル、ペンタメチルフェニルスルホニル、2-メチルナフチルスルホニル、2, 3-ジメチルナフチルスルホニル、3, 4-ジメチルフェニルスルホニル、3, 5, 7-トリエチルナフチルスルホニル、3, 4, 5, 7-テトラメチルナフチルスルホニル、2, 3, 4, 5, 7-ペンタメチルナフチルスルホニル、2, 3, 4, 5, 6, 7-ヘキサエチルナフチルスルホニル、ヘプタメチルナフチルスルホニル、2, 3-ジアミノフェニルスルホニル、2, 4, 6-トリアミノフェニルスルホニル、2-メチル-5-クロロナフチルスルホニル基等が挙げられる。

【0150】

低級アルキル基；低級アルカノイル基；アリールスルホニル基；オキソ基；ヒドロキシ基；及び低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基及び低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいピペリジル基としては、置換基として、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）；前記例示のアリールスルホニル基；オキソ基；ヒドロキシ基；及び前記例示の低級アルキル基、前記例示の低級アルカノイル基、前記例示の低級アルコキシカルボニル基及び前記例示の低級アルカノイルアミノ低級アルカノイル基からなる群から選ばれた基を1～2個有していてもよいアミノ基からなる群から選ばれた基からなる群から選ばれた置換基を1～5個、好ましくは1～3個、より好ましくは1個有することのあるピペリジル基を挙げることができる。より具体的には、(1ー、2ー、3ー、又は4ー) ピペリジル、1-メチル-4-ピペリジル、2-エチル-4-ピペリジル、3-n-プロピル-4-ピペリジル、4-イソプロピル-4-ピペリジル、2-n-ブチル-1-ピペリジル、3-イソブチル-1-ピペリジル、4-t e r t -ブチル-1-ピペリジル、1-s

e c-ブチル-2-ピペリジル、2-n-ペンチル-2-ピペリジル、3-(1-エチルプロピル)-2-ピペリジル、4-イソペンチル-2-ピペリジル、5-ネオペンチル-2-ピペリジル、6-n-ヘキシル-2-ピペリジル、1-(1, 2, 2-トリメチルプロピル)-3-ピペリジル、2-(3, 3-ジメチルブチル)-3-ピペリジル、3-(2-エチルブチル)-3-ピペリジル、4-イソヘキシル-3-ピペリジル、5-(3-メチルペンチル基)-3-ピペリジル、6-ホルミル-3-ピペリジル、1-アセチル-4-ピペリジル、2-プロピオニル-4-ピペリジル、3-ブチリル-4-ピペリジル、4-イソブチリル-4-ピペリジル、2-ペンタノイル-1-ピペリジル、3-tert-ブチルカルボニル-1-ピペリジル、4-ヘキサノイル-1-ピペリジル、1-フェニルスルホニル-2-ピペリジル、2-(2-ピフェニルスルホニル)-2-ピペリジル、3-(1-ナフチルスルホニル)-2-ピペリジル、1-トシル-4-ピペリジル、4-(4-エチルフェニルスルホニル)-2-ピペリジル、5-(2-n-プロピルフェニルスルホニル)-2-ピペリジル、6-(3-n-ブチルフェニルスルホニル)-2-ピペリジル、1-(4-n-ペンチルフェニルスルホニル)-3-ピペリジル、2-(2-n-ヘキシルフェニルスルホニル)-3-ピペリジル、3-(3-イソブチルフェニルスルホニル)-3-ピペリジル、4-(4-tert-ブチルフェニルスルホニル)-3-ピペリジル、5-(2-クロロフェニルスルホニル)-3-ピペリジル、6-(4-フルオロフェニルスルホニル)-3-ピペリジル、1-(3-ブromoフェニルスルホニル)-4-ピペリジル、2-(2-アミノフェニルスルホニル)-4-ピペリジル、3-(2, 3-ジメチルフェニルスルホニル)-4-ピペリジル、4-(3, 4, 5-トリメチルフェニルスルホニル)-4-ピペリジル、2-(2, 3-ジアミノフェニルスルホニル)-1-ピペリジル、4-オキソ-1-ピペリジル、2-オキソ-3-ピペリジル、4-ヒドロキシ-1-ピペリジル、2-ヒドロキシ-3-ピペリジル、4-アミノ-1-ピペリジル、2-アミノ-4-ピペリジル、4-メチルアミノ-1-ピペリジル、2-メチルアミノ-4-ピペリジル、4-エチルアミノ-1-ピペリジル、2-エチルアミノ-4-ピペリジル、2-ジメチルアミノ-4-ピペリジル、4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル、4-ホルミルアミノ-1-ピペリジル、4-アセチルアミノ-1-ピペリジル、4-(N-メチル-N-アセチルアミノ)-1-ピペリジル、4-(N-メチル-N-tert-ブトキシカルボニルアミノ)-1-ピペリジル、4-[N-メチル-N-(N-アセチルアミノ)アセチルアミノ]-1-ピペリジル基等が含まれる。

【0151】

置換基として低級アルキル基、ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルカノイル基、カルボキシ低級アルキル基、低級アルキルカルバモイル低級アルキル基、カルバモイル基、低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ基（アミノ基上に低級アルキル基、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基およびアロイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよい）、ピペリジル基（ピペリジル基上には、低級アルカノイル、低級アルコキシカルボニル基およびアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、ピペラジニル基（ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4.5]デシル基、モルホリニル基及びヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基（ヘキサヒドロ-1,4-ジアゼピニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、ピリジル基、ピリジルオキシ基、ピリジル低級アルコキシ基、テトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキソ基を有していてもよい）、ベンゾジオキサリル基、アリール低級アルコキシ基（アリール基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリール基（アリール基上にはハロゲン、低級アルコキシ基及びヒドロキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリールオキシ基（アリール基上にはシアノ基、ハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アリール低級アルキル基（アリール基上にはハロゲン、低級アルキル基

、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい) 及びアロイル基 (アリアル基上にはハロゲン及び低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を有していてもよい) からなる群から選ばれた置換基を有していてもよい。ピペリジルカルボニル基としては、ピペリジル基上には、前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数 1～6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基) ; ヒドロキシ基; 前記例示のヒドロキシ低級アルキル基 (好ましくはヒドロキシ基を 1～3 個有する炭素数 1～6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基) ; 前記例示の低級アルカノイル基、低級アルキル部分が前記例示のカルボキシ低級アルキル基、前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数 1～6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基) を 1～2 個有するカルバモイル基で置換した炭素数 1～6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基; カルバモイル基; 前記例示の低級アルコキシ基 (好ましくは炭素数 1～6 の直鎖又は分枝鎖状のアルコキシ基) ; カルボキシ基; 前記例示の低級アルコキシカルボニル基 (好ましくは炭素数 1～6 の直鎖又は分枝鎖状のアルコキシカルボニル基) ; アミノ基 (アミノ基上に前記例示の低級アルキル基、前記例示の低級アルカノイル、前記例示の低級アルコキシカルボニル基および前記例示のアロイル基からなる群から選ばれた基を 1～2 個有していてもよい) ; ピペリジル基 (ピペリジル基上には、前記例示の低級アルカノイル、前記例示の低級アルコキシカルボニル基および前記例示のアロイル基からなる群から選ばれた基を 1～3 個 (好ましくは 1 個) 有していてもよい) ; ピペラジニル基 (ピペラジニル基上には、前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数 1～6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基) が 1～3 個置換していてもよい) ; 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4. 5] デシル基; モルホリニル基; 及びヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル基 (ヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル基上には、前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数 1～6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基) が 1～3 個置換していてもよい) ; ピリジル基; ピリジルオキシ基; 低級アルコキシ部分が前記例示のピリジル低級アルコキシ基; テトラヒドロキノリル基 (テトラヒドロキノリル基上にはオキシ基を 1～2 個 (好ましくは 1 個) 有していてもよい)、ベンゾジオキサリル基 (好ましくはベンゾ [1. 3] ジオキサリル)、アリアル部分及び低級アルコキシ部分が前記例示のアリアル低級アルコキシ基 (アリアル基上には前記例示のハロゲン、前記例示の低級アルキル基、前記例示の低級アルコキシ基及び前記例示のハロゲン置換低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を 1～3 個 (好ましくは 1～2 個) 有していてもよい)、前記例示のアリアル基 (アリアル基上には前記例示のハロゲン、前記例示の低級アルコキシ基及びヒドロキシ基からなる群から選ばれた基を 1～3 個 (好ましくは 1～2 個) 有していてもよい)、アリアル部分が前記例示のアリアルオキシ基 (アリアル基上にはシアノ基、ハロゲン、前記例示の低級アルキル基、前記例示の低級アルコキシ基及び前記例示のハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を 1～3 個 (好ましくは 1～2 個) 有していてもよい)、アリアル部分及び低級アルキル部分が前記例示のアリアル低級アルキル基 (アリアル基上にはハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基を 1～3 個 (好ましくは 1～2 個) 有していてもよい) 及び前記例示のアロイル基 (アリアル基上には前記例示のハロゲン及び前記例示の低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を 1～3 個 (好ましくは 1～2 個) 有していてもよい) からなる群から選ばれた置換基を 1～3 個 (好ましくは 1 個) 有していてもよい。より具体的には、(1-、2-、3-、又は 4-) ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は 4-) メチル-1-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は 6-) メチル-2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は 6-) メチル-3-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、又は 4-) メチル-4-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、又は 4-) エチル-4-ピペリジルカルボニル、((2-、3-、又は 4-) ヒドロキシ-1-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は 6-) ヒドロキシ-2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は 6-) ヒドロキシ-3-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、又は 4-) ヒドロキシ-4-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は 4-) ヒドロキシメチル-1-ピペリジ

10

20

30

40

50

ルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-) ヒドロキシメチル-2-ピ
 ペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-) ヒドロキシメチル-
 3-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、又は4-) ヒドロキシメチル-4-ピ
 ペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、又は4-) (2-ヒドロキシエチル)-4-
 ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) (N-エチル-カルバモイルメチル)
 -1-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-) (N-エチ
 ル-カルバモイルメチル)-2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-
 -、又は6-) (N-エチル-カルバモイルメチル)-3-ピペリジルカルボニル、(1-
 -、2-、3-、又は4-) N-エチル-カルバモイルメチル-4-ピペリジルカルボニ
 ル、(2-、3-、又は4-) カルバモイル-1-ピペリジルカルボニル、(1-、2- 10
 -、3-、4-、5-、又は6-) カルバモイル-2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-
 -、3-、4-、5-、又は6-) カルバモイル-3-ピペリジルカルボニル、(1-、
 2-、3-、又は4-) カルバモイル-4-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は
 4-) メトキシ-1-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)
 メトキシ-2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)
 メトキシ-3-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、又は4-) メトキシ-4-
 -ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) カルボキシ-1-ピペリジルカルボ
 ニル、(2-、3-、又は4-) カルボキシメチル-1-ピペリジルカルボニル、(2-
 -、3-、又は4-) エトキシカルボニル-1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又
 は4-) メトキシカルボニル-1-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、 20
 5-、又は6-) メトキシカルボニル-2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-
 -、4-、5-、又は6-) メトキシカルボニル-3-ピペリジルカルボニル、(1-、2-
 -、3-、又は4-) メトキシカルボニル-4-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、
 又は4-) エトキシカルボニル-1-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-
 -、5-、又は6-) エトキシカルボニル-2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-
 -、4-、5-、又は6-) エトキシカルボニル-3-ピペリジルカルボニル、(1-、
 2-、3-、又は4-) エトキシカルボニル-4-ピペリジルカルボニル、(2-、3-
 -、又は4-) アセチルアミノ-1-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、
 5-、又は6-) アセチルアミノ-2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-
 -、5-、又は6-) アセチルアミノ-3-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3- 30
 -、又は4-) アセチルアミノ-4-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) t
 e r t-ブトキシカルボニルアミノ-1-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、
 4-、5-、又は6-) t e r t-ブトキシカルボニルアミノ-2-ピペリジルカルボ
 ニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-) t e r t-ブトキシカルボニルアミノ-
 3-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、又は4-) t e r t-ブトキシカル
 ボニルアミノ-4-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) ブチルアミノ-
 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) ベンゾイルアミノ-1-ピペリジ
 ルカルボニル、(2-、3-、又は4-) (N-メチル-N-アセチルアミノ)-1-ピペ
 リジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) (N-メチル-N-ブチルアミノ)-
 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) (N-メチル-N-t e r t-ブ 40
 トキシカルボニルアミノ)-1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) (N-
 メチル-N-ベンゾイルアミノ)-1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-
 -) [(1-、2-、3-、又は4-) ピペリジル]-1-ピペリジルカルボニル、(1-
 -、2-、3-、4-、5-、又は6-) [(1-、2-、3-、又は4-) ピペリジル]
 -2-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-) [(1-、
 2-、3-、又は4-) ピペリジル]-3-ピペリジルカルボニル、(1-、2-、3-
 -、又は4-) [(1-、2-、3-、又は4-) ピペリジル]-4-ピペリジルカルボ
 ニル、(2-、3-、又は4-) [1-アセチル-(2-、3-、又は4-) ピペリジル]
 -1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [1-ブチル-(2-、3-
 -、又は4-) ピペリジル]-1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [

10

20

30

40

50

1-tert-ブトキシカルボニル-(2-, 3-, 又は4-)ピペリジル]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [1-ベンゾイル-(2-, 3-, 又は4-)ピペリジル]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) (1-ピペラジニル)-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [1-(3, 4-ジメチルピペラジニル)]-1-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [1-(3, 4-ジメチルピペラジニル)]-2-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [1-(3, 4-ジメチルピペラジニル)]-3-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 又は4-) [1-(3, 4-ジメチルピペラジニル)]-4-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [1-(4-メチルピペラジニル)]-1-ピペリジルカルボニル、(1-, 3-, 又は4-) [1-

10

4-メチルピペラジニル)]-2-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 又は4-) [1-(4-メチルピペラジニル)]-3-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 又は3-) [1-(4-メチルピペラジニル)]-4-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) モルホリニル]-1-ピペリジルカルボニル、(1-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) モルホリニル]-2-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 4-, 5-, 又は6-) [(2-, 3-, 又は4-) モルホリニル]-3-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 又は3-) [(2-, 3-, 又は4-) モルホリニル]-4-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) (4-メチル-ヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル)-1-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (4-メチル-ヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル)-2-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (4-メチル-ヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル)-3-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 又は4-) (4-メチル-ヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル)-4-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) (1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4. 5] デク-8-イル)-1-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4. 5] デク-8-イル)-2-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4. 5] デク-8-イル)-3-ピペリジルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 又は4-) (1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4. 5] デク-8-イル)-4-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 4-, 又は5-) ベンゾ [1. 3] ジオキソリル]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-オキソ-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]-1-ピペリジルカルボニル、4-[2-オキソ-(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]- (2-又は3-メチル)-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) ピリジル]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) ピリジルオキシ]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) ピリジルメトキシ]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) フルオロベンジルオキシ]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) クロロベンジルオキシ]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) ブロモベンジルオキシ]-1-ピペリジルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(2-, 3-, 又は4-) メチルベンジルオキシ]-1-

20

30

40

50

ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) トリフル
 オロメトキシベンジルオキシ] - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-)
 (3、4-ジクロロベンジルオキシ) - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は
 4-) (3、4-ジメトキシベンジルオキシ) - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-
 1、又は4-) (3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシ) - 1-ピペリジルカルボニ
 ル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) フルオロフェノキシ] - 1-
 ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) クロロフ
 ェノキシ] - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又
 は4-) シアノフェノキシ] - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [
 (2-、3-、又は4-) メトキシフェノキシ] - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、
 3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) メチルフェノキシ] - 1-ピペリジルカル
 ボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) トリフルオロメトキシフ
 ェノキシ] - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) フェニル-1-ピペ
 リジルカルボニル、4-ヒドロキシ- (2-、3-、又は4-) フェニル-1-ピペリジ
 ルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) クロロフェニル]
 - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) メ
 トキシフェニル] - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-
 1、又は4-) ヒドロキシフェノキシ] - 1-ピペリジルカルボニル、4-ヒドロキシ-
 (2-、3-、又は4-) フェニル-1-ピペリジルカルボニル、4-エトキシカルボニ
 ル- (2-、3-、又は4-) フェニル-1-ピペリジルカルボニル、4-ヒドロキシ-
 (2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) クロロフェニル] - 1-ピペリジ
 ルカルボニル、(2-、3-、又は4-) ベンジル-1-ピペリジルカルボニル、(2-
 、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) クロロベンジル] - 1-ピペリジルカル
 ボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) メチルベンジル] - 1-
 ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) メトキシ
 ベンジル] - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又
 は4-) トリフルオロメトキシベンジル] - 1-ピペリジルカルボニル、4-ヒドロキシ
 - (2-、3-、又は4-) ベンジル-1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は
 4-) [(2-、3-、又は4-) クロロベンゾイル] - 1-ピペリジルカルボニル、(
 2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) メトキシベンゾイル] - 1-ピペリ
 ジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-) フルオロベンゾ
 イル] - 1-ピペリジルカルボニル、(2-、3-、又は4-) [(2-、3-、又は4-
 1-) トリフルオロメトキシベンジル] - 1-ピペリジルカルボニル基等が含まれる。

【0152】

置換基としてヒドロキシ低級アルキル基、カルバモイル基、ヒドロキシ基、アミノ基 (アミノ基上には、低級アルキル基、低級アルカノイル基及びアロイル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい)、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、ピペリジル低級アルキル基、ピペラジニル低級アルキル基 (ピペラジニル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい)、アミノ低級アルキル基 (アミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい)、アリールオキシ基 (アリール基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を有していてもよい)、アリールオキシ低級アルキル基 (アリール基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を有していてもよい) 及びテトラヒドロキノリル基 (テトラヒドロキノリル基上にはオキソ基を有していてもよい) からなる群から選ばれた基を有していてもよいピロリジニルカルボニル基としては、ピロリジニル基上に、ヒドロキシ基を1~3個有する前記例示の低級アルキル基 (好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基) ; カルバモイル基; ヒドロキシ基; アミノ基 (アミノ基上には、前記例示の低級アルキル基、前記例示の低級アルカノイル基及び前記例示のアロイル基からなる群から選ばれた基を1~2個有していてもよい) ; 低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基であるモルホリニル低級アルキル基; 低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1~6

10

20

30

40

50

の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基であるピロリジニル低級アルキル基；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基であるピペリジル低級アルキル基；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基であるピペラジニル低級アルキル基（ピペラジニル基上には、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基）が1～3個（好ましくは1個）置換していてもよい）；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基であるアミノ低級アルキル基（アミノ基上には、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基）が1～2個置換していてもよい）；アリー

ル部分が前記例示のアリーロキシ基（アリール基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を1～3個（好ましくは1個）有していてもよい）、アリール部分及び低級アルキル部分が前記例示のアリーロキシ低級アルキル基（アリール基上にはハロゲン置換低級アルコキシ基を1～3個（好ましくは1個）有していてもよい）及びテトラヒドロキノリル基（テトラヒドロキノリル基上にはオキソ基を1個有していてもよい）からなる群から選ばれた置換基を1～3個（好ましくは1個）有していてもよいピロリジニルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、（1－、2－、又は3－）ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）ヒドロキシメチル－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）ヒドロキシメチル－2－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）ヒドロキシメチル－3－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）カルバモイル－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）カルバモイル－2－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）カルバモイル－3－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）ヒドロキシ－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）ヒドロキシ－2－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）ヒドロキシ－3－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）アミノ－1－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）アセトアミド－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）アセトアミド－2－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）アセトアミド－3－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）ブチルアミノ－3－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）（N－メチル－N－アセチルアミノ）－3－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）（N－メチル－N－ブチルアミノ）－3－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）（N－メチル－N－ベンゾイルアミノ）－3－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）〔（2－、3－、又は4－）モルホリニルメチル〕－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）〔（2－、3－、又は4－）モルホリニルメチル〕－2－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）〔（（2－、3－、又は4－）モルホリニルメチル）－3－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）〔（1－、2－、又は3－）ピロリジニルメチル〕－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）〔（1－、2－、又は3－）ピロリジニルメチル〕－2－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）〔（1－、2－、又は3－）ピロリジニルメチル〕－3－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）〔（1－、2－、3－、又は4－）ピペリジルメチル〕〕－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）〔（1－、2－、3－、又は4－）ピペリジルメチル〕－2－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）〔（1－、2－、3－、又は4－）ピペリジルメチル〕－3－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）（4－メチル－1－ピペラジニルメチル）－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）（4－メチル－1－ピペラジニルメチル）－2－ピロリジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、又は5－）（4－メチル－1－ピペラジニルメチル）－3－ピロリジニルカルボニル、（2－又は3－）N，N－ジメチルアミノメチル－1－ピロリジニルカルボニル、（1－、

10

20

30

40

50

2-、3-、4-、又は5-) N, N-ジメチルアミノメチル-2-ピロリジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、又は5-) N, N-ジメチルアミノメチル-3-ピロリジニルカルボニル、(2-、又は3-) N, N-ジエチルアミノメチル-1-ピロリジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、又は5-) N, N-ジエチルアミノメチル-2-ピロリジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、又は5-) N, N-ジエチルアミノメチル-3-ピロリジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、又は5-) (4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-3-ピロリジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、又は5-) (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピロリジニルカルボニル、(1-、3-、4-、5-、6-、7-、又は8-) (2-オキシ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)-3-ピロリジニルカルボニル基等が含まれる。

10

【0153】

置換基として低級アルキル基、シクロC3-C8アルキル基、低級アルカノイル基、ヒドロキシ低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、アミノ低級アルキル基（アミノ基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、ピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、低級アルキル基が置換していてもよい）、モルホリニル低級アルキル基、ピロリジニル低級アルキル基、1,3-ジオキサニル低級アルキル基、テトラヒドロフリル低級アルキル基、ピリジル低級アルキル基（低級アルキル基上には、フェニル基が置換していてもよい）、イミダゾリル低級アルキル基、フリル低級アルキル基、ピロリジニルカルボニル低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有していてもよいピペリジル基、ピリジル基（ピリジル基上には、低級アルキル基、シアノ基及びハロゲン置換低級アルキル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよい）、チエノ[2,3-c]ピリジル、アリール基（アリール基上にハロゲン及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有していてもよい）、アロイル基、フリル低級アルキル基、アリール低級アルコキシカルボニル基及びオキソ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペラジニルカルボニル基としては、ピペラジニル基上に、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基）；前記例示のシクロC3-C8アルキル基；前記例示の低級アルカノイル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基）；前記例示のヒドロキシ低級アルキル基（好ましくはヒドロキシ基を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルコキシ低級アルキル基（好ましくは前記例示の低級アルコキシ基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基）を1～3個有する炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；前記例示の低級アルコキシカルボニル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルコキシカルボニル基）；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアミノ低級アルキル基（アミノ基上には、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）が1～2個置換していてもよい）；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピペリジル低級アルキル基（ピペリジル基上には、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）が1～3個置換していてもよい）；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるモルホリニル低級アルキル基；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピロリジニル低級アルキル基；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1, 3-ジオキサニル低級アルキル基；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるテトラヒドロフリル低級アルキル基；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジル低級アルキル基（アルキル基上には、フェニル基が1～3個置換していてもよい）；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるイミダゾリル低級アルキル基；低級アル

20

30

40

50

キル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフリル低級アルキル基；低級アルキル部分が前記例示のものであり、好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピロリジニルカルボニル低級アルキル基；前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）を1～3個有することのあるピペリジル基；ピリジル基（ピリジル基上には、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）；シアノ基；及び前記例示のハロゲン置換低級アルキル基（好ましくはハロゲン原子が1～7個置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）からなる群から選ばれた基が1～3個（好ましくは1個）置換していてもよい）；チエノ[2,3-*c*]ピリジル基、前記例示のアリール基（アリール基上にハロゲン及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1～3個（好ましくは1個）有していてもよい）、前記例示のアロイル基、低級アルキル部分が前記例示のフリル低級アルキル基、アリール部分及び低級アルコキシカルボニル部分が前記例示のアリール低級アルコキシカルボニル基及びオキソ基からなる群から選ばれた置換基を1～3個（好ましくは1～2個）有していてもよいピペラジニルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、（1－又は2－）ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）メチル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）メチル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）エチル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）エチル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）*n*－プロピル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）*n*－プロピル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）*n*－ブチル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）*n*－ブチル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）〔（1－エチル－*n*－プロピル）〕－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）〔（1－エチル－*n*－プロピル）〕－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）イソプロピル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）イソプロピル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）*tert*－ブチル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）*tert*－ブチル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）*n*－ヘキシル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）*n*－ヘキシル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）シクロペンチル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）シクロペンチル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）シクロヘプチル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）シクロヘプチル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）アセチル－1－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）ブチリル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）アセチル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）（2－ヒドロキシエチル）－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）（2－ヒドロキシエチル）－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）（2－メトキシエチル）－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）（2－メトキシエチル）－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）（3－メトキシプロピル）－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）（3－メトキシプロピル）－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）（4－メトキシブチル）－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）（4－メトキシブチル）－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）エトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）エトキシカルボニル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）*tert*－ブトキシカルボニル－1－ピペラジニルカルボニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）*tert*－ブトキシカルボニル－2－ピペラジニルカルボニル、（2－、3－、又は4－）メトキシカルボニル－

10

20

30

40

50

1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) メトキシカルボニル-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [3-(N, N-ジメチルアミノ) プロピル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [3-(N, N-ジメチルアミノ) プロピル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-(N, N-ジメチルアミノ) エチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [2-(N, N-ジメチルアミノ) エチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) (2-(1-ピペリジル) エチル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (2-(1-ピペリジル) エチル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(1-メチル-3-ピペリジル) メチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [(1-メチル-3-ピペリジル) メチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [(1-メチル-4-ピペリジル) メチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [(1-メチル-4-ピペリジル) メチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-(4-モルホリニル) エチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [2-(4-モルホリニル) エチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-(1-ピロリジニル) エチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [2-(1-ピロリジニル) エチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-(1, 3-ジオキソラニル) メチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [2-(1, 3-ジオキソラニル) メチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) {2-[2-(1, 3-ジオキソラニル)] エチル}-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) {2-[2-(1, 3-ジオキソラニル)] エチル}-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) (2-テトラヒドロフリルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (2-テトラヒドロフリルメチル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) (2-ピリジルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (2-ピリジルメチル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) (3-ピリジルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (3-ピリジルメチル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) (4-ピリジルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) (4-ピリジルメチル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-(4-ピリジル) エチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [2-(4-ピリジル) エチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-(2-ピリジル) エチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [2-(2-ピリジル) エチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-フェニル-2-(4-ピリジル) エチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [2-フェニル-2-(4-ピリジル) エチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-, 又は4-) [2-(1-イミダゾリ

10

20

30

40

ル) エチル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 又は6-) [2-(1-イミダゾリル) エチル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-, 3-

50

、又は4-)(3-フリルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)(3-フリルメチル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)(1-ピロリジニルカルボニルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)(1-ピロリジニルカルボニルメチル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)(1-メチル-4-ピペリジル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)(1-メチル-4-ピペリジル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-){(2-、3-、又は4-)ピリジル}-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)(2-、3-、又は4-ピリジル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)(3-シアノ-2-ピリジル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)(3-シアノ-2-ピリジル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)(4-メチル-2-ピリジル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)(4-メチル-2-ピリジル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)(3-メチル-2-ピリジル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)(3-メチル-2-ピリジル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)(3-トリフルオロメチル-2-ピリジル)-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)(3-トリフルオロメチル-2-ピリジル)-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)[(2-、3-、4-、5-、又は6-)チエノ[2, 3-c]ピリジル]-1-ピペラジニルカルボニル、(1-、2-、3-、4-、5-、又は6-)[(2-、3-、4-、5-、又は6-)チエノ[2, 3-c]ピリジル]-2-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)フェニル-1-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)[(2-、3-、又は4-)クロロフェニル]-1-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)[(2-、3-、又は4-)メチルフェニル]-1-ピペラジニルカルボニル、3-オキソ-(2-又は4-)フェニル-1-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)ベンゾリル-1-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)[(2-又は3-)フリルカルボニル]-1-ピペラジニルカルボニル、(2-、3-、又は4-)ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル基等が含まれる。

【0154】

ヘキサヒドロアゼピニルカルボニル基としては、(1-、2-、3-、又は4-)ヘキサヒドロアゼピニルカルボニル基を挙げることができる。

【0155】

置換基として低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた置換基を有していてもよいヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニルカルボニル基としては、前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)及びピリジル基からなる群から選ばれた置換基を1~3個、好ましくは1個有していてもよいヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、(ヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピン-(1-、2-、5-、又は6-)イル)カルボニル、(4-メチル-ヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピン-1-イル)カルボニル、(4-(4-ピリジル)-メチル-ヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピン-1-イル)カルボニル基等が含まれる。

【0156】

ジヒドロピロリルカルボニル基としては、2, 3-ジヒドロピロリルカルボニル、2, 5-ジヒドロピロリルカルボニル基が挙げられる。

【0157】

低級アルキル基を有していてもよいジヒドロピロリルカルボニル基としては、前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)を1~4個、好ましくは1~2個有することのある前記例示のジヒドロピロリルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、(1-、2-、又は3-)(2, 5-ジヒドロピロリル

10

20

30

40

50

ルカルボニル)、2, 5-ジメチル-1-(2, 5-ジヒドロピロリルカルボニル)、2, 5-ジメチル-1-(2, 3-ジヒドロピロリルカルボニル)基等が含まれる。

【0158】

チオモルホリニルカルボニル基としては、(2-, 3-, 又は4-)チオモルホリニルカルボニル基を挙げることができる。

【0159】

低級アルキル、ピペリジル低級アルキル基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよいモルホリニルカルボニル基としては、前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)(低級アルキル基上には、1~3個、好ましくは1個のピペリジル基が置換していてもよい)及び前期例示のアリール基からなる群から選ばれた基を1~5個、より好ましくは1~2個有していてもよいモルホリニルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、(2-, 3-, 又は4-)モルホリニルカルボニル、2, 6-ジメチル-4-モルホリニルカルボニル、2-(1-ピペリジルメチル)-4-モルホリニルカルボニル、2-フェニル-4-モルホリニルカルボニル基等が含まれる。

【0160】

チアゾリジニルカルボニル基としては、(2-, 3-, 4-, 又は5-)チアゾリジニルカルボニル基を挙げることができる。

【0161】

低級アルコキシ基及びシアノ基からなる群から選ばれた基を有していてもよいアリール基を有していてもよいチアゾリジニルカルボニル基としては、前記例示の低級アルコキシ基及びシアノ基からなる群から選ばれた基を1~3個(好ましくは1個)有していてもよい前記例示のアリール基を1~3個(好ましくは1個)有していてもよいチアゾリジニルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、(2-, 3-, 4-, 又は5-)チアゾリジニルカルボニル、(2-, 4-, 又は5-)[(2-, 3-, 又は4-)メトキシフェニル]-3-チアゾリジニルカルボニル、(2-, 4-, 又は5-)[(2-, 3-, 又は4-)シアノフェニル]-3-チアゾリジニルカルボニル基等が含まれる。

【0162】

アザビシクロ[3.2.2]ノニルカルボニル基としては、1-アザビシクロ[3.2.2]ノン-(2-, 3-, 5-, 又は6-)イルカルボニル、2-アザビシクロ[3.2.2]ノン-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-)イルカルボニル、3-アザビシクロ[3.2.2]ノン-(1-, 2-, 3-, 又は6-)イルカルボニル、6-アザビシクロ[3.2.2]ノン-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 又は9-)イルカルボニル基等を挙げることができる。

【0163】

ハロゲン置換又は無置換のアリールオキシ基を有していてもよいアザビシクロ[3.2.1]オクチルカルボニル基としては、前記例示のハロゲン置換アリール(好ましくはハロゲン原子を1~3個、好ましくは1個の置換していてもよいアリール基)又は前記例示の無置換のアリール基を1~2個(好ましくは1個)有していてもよいアザビシクロ[3.2.1]オクチルカルボニル基を挙げることができる。具体的には、1-アザビシクロ[3.2.1]オクト-(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-)イルカルボニル、2-アザビシクロ[3.2.1]オクト-(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-)イルカルボニル、3-アザビシクロ[3.2.1]オクト-(1-, 2-, 3-, 6-, 又は8-)イルカルボニル、3-(フェニルオキシ)-1-アザビシクロ[3.2.1]オクト-2-イルカルボニル、3-(2-ビフェニルオキシ)-1-アザビシクロ[3.2.1]オクト-3-イルカルボニル、3-(1-ナフチルオキシ)-1-アザビシクロ[3.2.1]オクト-4-イルカルボニル、3-(3-メチルフェニルオキシ)-1-アザビシクロ[3.2.1]オクト-5

10

20

30

40

50

－イルカルボニル、3－（4－エチルフェニルオキシ）－1－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー6－イルカルボニル、3－（2－*n*－プロピルフェニルオキシ）－1－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー7－イルカルボニル、3－（3－*n*－ブチルフェニルオキシ）－1－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー8－イルカルボニル、3－（4－*n*－ペンチルフェニルオキシ）－2－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー1－イルカルボニル、3－（2－*n*－ヘキシルフェニルオキシ）－2－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー2－イルカルボニル、3－（3－イソブチルフェニルオキシ）－2－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー3－イルカルボニル、3－（4－*tert*－ブチルフェニルオキシ）－2－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー4－イルカルボニル、3－（2－クロロフェニルオキシ）－2－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー5－イルカルボニル、3－（3－フルオロフェニルオキシ）－8－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー8－イルカルボニル、3－（3－ブromoフェニルオキシ）－2－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー6－イルカルボニル、3－（2－アミノフェニルオキシ）－2－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー7－イルカルボニル、3－（2, 3－ジメチルフェニルオキシ）－2－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー8－イルカルボニル、3－（3, 4, 5－トリメチルフェニルオキシ）－8－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー1－イルカルボニル、3－（2, 3－ジアミノフェニルオキシ）－8－アザビシクロ〔3. 2. 1〕オクトー2－イルカルボニル基等が含まれる。

10

【0164】

インドリニルカルボニル基としては、（1－、2－、3－、4－、5－、6－、又は7－）インドリニルカルボニル基を挙げることができる。

20

【0165】

テトラヒドロピリド〔3.4-*b*〕インドリルカルボニル基としては、（1－、2－、3－、4－、5－、6－、7－、8－、又は9－）（2, 3, 4, 9－テトラヒドロピリド〔3.4-*b*〕インドリルカルボニル）基等を挙げることができる。

【0166】

ピペラジニル基上に低級アルキル基を有していてもよいピペラジニル低級アルキル基としては、低級アルキル部分が前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）であり、ピペラジニル基上に、前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基）を1～7個、好ましくは1～5個、より好ましくは1個有していてもよい、ピペラジニル低級アルキル基を挙げることができる。より具体的には、（1－又は2－）ピペラジニルメチル、2－〔（1－又は2－）ピペラジニル〕エチル、1－〔（1－又は2－）ピペラジニル〕エチル、3－〔（1－又は2－）ピペラジニル〕プロピル、4－〔（1－又は2－）ピペラジニル〕ブチル、5－〔（1－又は2－）ピペラジニル〕ペンチル、6－〔（1－又は2－）ピペラジニル〕ヘキシル、1, 1－ジメチル－2－〔（1－又は2－）ピペラジニル〕エチル、2－メチル－3－〔（1－又は2－）ピペラジニル〕プロピル、4－メチル－1－ピペラジニルメチル、2－（4－メチル－2－ピペラジニル）エチル、3－（2－エチル－1－ピペラジニル）プロピル、4－（3－*n*－プロピル－1－ピペラジニル）ブチル、5－（4－*n*－ブチル－1－ピペラジニル）ペンチル、6－（1－*n*－ペンチル－2－ピペラジニル）ヘキシル、2－*n*－ヘキシル－2－ピペラジニルメチル、2－（3－イソブチル－2－ピペラジニル）エチル、3－（4－*tert*－ブチル－2－ピペラジニル）プロピル基等が含まれる。

30

40

【0167】

モルホリニルカルボニル低級アルキル基としては、低級アルキル部分が前記例示の低級アルキル基（好ましくは炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基）であるモルホリニルカルボニル低級アルキル基を挙げることができる。より具体的には、2－モルホリニルカルボニルメチル、3－モルホリニルカルボニルメチル、4－モルホリニルカルボニルメチル、2－（2－モルホリニルカルボニル）エチル、2－（3－モルホリニルカルボニル）エチル、2－（4－モルホリニルカルボニル）エチル、1－（2－モルホリニルカルボ

50

ニル) エチル、1-(3-モルホリニルカルボニル) エチル、1-(4-モルホリニルカルボニル) エチル、3-(2-モルホリニルカルボニル) プロピル、3-(3-モルホリニルカルボニル) プロピル、3-(4-モルホリニルカルボニル) プロピル、4-(2-モルホリニルカルボニル) ブチル、4-(3-モルホリニルカルボニル) ブチル、4-(4-モルホリニルカルボニル) ブチル、5-(2-モルホリニルカルボニル) ペンチル、5-(3-モルホリニルカルボニル) ペンチル、5-(4-モルホリニルカルボニル) ペンチル、6-(2-モルホリニルカルボニル) ヘキシル、6-(3-モルホリニルカルボニル) ヘキシル、6-(4-モルホリニルカルボニル) ヘキシル、3-メチル-3-(2-モルホリニルカルボニル) プロピル、3-メチル-3-(3-モルホリニルカルボニル) プロピル、3-メチル-3-(4-モルホリニルカルボニル) プロピル、1, 1-ジメチル-2-(2-モルホリニルカルボニル) エチル、1, 1-ジメチル-2-(3-モルホリニルカルボニル) エチル、1, 1-ジメチル-2-(4-モルホリニルカルボニル) エチル基が含まれる。

【0168】

ピペラジニル基上に低級アルキル基を有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基としては、低級アルキル部分が前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基)であり、ピペラジニル基上に、前記例示の低級アルキル基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基)を1~7個、好ましくは1~5個、より好ましくは1個有していてもよい、ピペラジニルカルボニル低級アルキル基を挙げることができる。より具体的には、(1-又は2-)ピペラジニルカルボニルメチル、2-[(1-又は2-)ピペラジニルカルボニル]エチル、1-[(1-又は2-)ピペラジニルカルボニル]エチル、3-[(1-又は2-)ピペラジニルカルボニル]プロピル、4-[(1-又は2-)ピペラジニルカルボニル]ブチル、5-[(1-又は2-)ピペラジニルカルボニル]ペンチル、6-[(1-又は2-)ピペラジニルカルボニル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(1-又は2-)ピペラジニルカルボニル]エチル、2-メチル-3-[(1-又は2-)ピペラジニルカルボニル]プロピル、4-メチル-1-ピペラジニルカルボニルメチル、2-(4-メチル-2-ピペラジニルカルボニル)エチル、3-(2-エチル-1-ピペラジニルカルボニル)プロピル、4-(3-n-プロピル-1-ピペラジニルカルボニル)ブチル、5-(4-n-ブチル-1-ピペラジニルカルボニル)ペンチル、6-(1-n-ペンチル-2-ピペラジニルカルボニル)ヘキシル、2-n-ヘキシル-2-ピペラジニルカルボニルメチル、2-(3-イソブチル-2-ピペラジニルカルボニル)エチル、3-(4-tert-ブチル-2-ピペラジニルカルボニル)プロピル基等が含まれる。

【0169】

アミノ低級アルコキシ基(アミノ基上に低級アルキル基を有していてもよい)としては、前記例示の低級アルキル基を1~2個有していてもよいアミノ基を1~5個、好ましくは1個有する、前記例示の低級アルコキシ基(好ましくは炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基)を挙げることができる。より具体例には、アミノメトキシ、2-アミノエトキシ、1-アミノトキシ、3-アミノプロポキシ、4-アミノブトキシ、5-アミノペントキシ、6-アミノヘキシルオキシ、1, 1-ジメチル-2-アミノエトキシ、N, N-ジメチルアミノメトキシ、N-メチル-N-エチルアミノメトキシ、N-メチルアミノメトキシ、2-(N-メチルアミノ)エトキシ、2-(N, N-ジメチルアミノ)エトキシ、2-(N, N-ジエチルアミノ)エトキシ、2-(N, N-ジイソプロピルアミノ)エトキシ、3-(N, N-ジメチルアミノ)プロポキシ基等が含まれる。

【0170】

低級アルコキシ低級アルコキシ基としては、低級アルコキシ部分が前記例示の低級アルコキシ低級アルコキシ基を挙げることができる。より具体的には、メトキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、1-エトキシエトキシ、2-エトキシエトキシ、2-イソブトキシエトキシ、2, 2-ジメトキシエトキシ、2-メトキシ-1-メチルエトキシ基等が含まれる。

【0171】

オキソ基、低級アルキル基、低級アルカノイル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を有していてもよいピペラジニル基としては、オキソ基、前記例示の低級アルキル基、前期例示の低級アルカノイル基及び前記例示の低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1～3個（1～2個）有していてもよいピペラジニル基を挙げることができる。より具体的には、（1－又は2－）ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）メチル－1－ピペラジニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）メチル－2－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）エチル－1－ピペラジニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）エチル－2－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）*n*－プロピル－1－ピペラジニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）*n*－プロピル－2－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）ホルミル－1－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）アセチル－1－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）プロピオニル－1－ピペラジニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）プロピオニル－2－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）ブチリル－1－ピペラジニル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）ブチリル－2－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）メトキシカルボニル－1－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）エトキシカルボニル－1－ピペラジニル、（2－、3－、又は4－）*tert*-ブトキシカルボニル－1－ピペラジニル、（2－又は3－）オキソ－1－ピペラジニル、2－オキソ－（3－、4－、5－、又は6－）アセチル－1－ピペラジニル、2－オキソ－（3－、4－、5－、又は6－）ブチリル－1－ピペラジニル、2－オキソ－（3－、4－、5－、又は6－）メトキシカルボニル－1－ピペラジニル、2－オキソ－（3－、4－、5－、又は6－）メトキシカルボニル－1－ピペラジニル基等が含まれる。

10

20

【0172】

オキソ基及びアリール基からなる群から選ばれた基を有していてもよい1, 3, 8－トリアザスピロ [4.5] デカニルカルボニル基としては、オキソ基及び前述のアリール基からなる群から選ばれた基を1～3個（1～2個）有していてもよい1, 3, 8－トリアザスピロ [4.5] デカニルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、1, 3, 8－トリアザスピロ [4.5] デク－（1－、2－、3－、4－、又は8－）イルカルボニル、1－フェニル－1, 3, 8－トリアザスピロ [4.5] デク－8－イルカルボニル、1－フェニル－4－オキソ－1, 3, 8－トリアザスピロ [4.5] デク－8－イルカルボニル基等が含まれる。

30

【0173】

テトラヒドロピリジル基としては、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）1, 2, 3, 4－テトラヒドロピリジル、（1－、2－、3－、4－、5－、又は6－）1, 2, 3, 6－テトラヒドロピリジル基等を挙げることができる。ピリジル基を有していてもよいテトラヒドロピリジルカルボニル基としては、ピリジル基を1～3個（好ましくは1個）有していてもよい前記例示のテトラヒドロピリジルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、（2－、3－、又は4－）ピリジル－1, 2, 3, 6－テトラヒドロピリジン－1－イルカルボニル基等が含まれる。

40

【0174】

チオキソ基を有していてもよいイミダゾリジニルカルボニル基としては、チオキソ基を1～2個（好ましくは1個）有していてもよいイミダゾリジニルカルボニル基を挙げることができる。より具体的には、2－チオキソ－1－イミダゾリジニルカルボニル基等が含まれる。

【0175】

テトラヒドロナフチル基としては、（1－又は2－）1, 2, 3, 4－テトラヒドロナフチル基等を挙げることができる。

窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から4個有する飽和又は不飽和複素単環基としては、下記（1）～（9）に示される複素単環基等を挙げることができる。

50

・ 1～4個(好ましくは1～2個)の窒素原子を含有する飽和3～8員(好ましくは5～6員)複素単環基(例えば、ピロリジニル、イミダゾリジニル、ピペリジル、ヘキサヒドロピリミジニル、ピペラジニル、アゼパニル、アゾカニル等)；

(2) 1～4個(好ましくは1～3個)の窒素原子を含有する不飽和3～8員(好ましくは5又は6員)複素単環基(例えばピロリル、ジヒドロピロリル(例えば1H-2、5-ジヒドロピロリル等)、イミダゾリル(例えば1H-イミダゾリル等)、ジヒドロイミダゾリル(例えば、1H-2、3-ジヒドロイミダゾリル等)、トリアゾリル(例えば4H-1, 2, 4-トリアゾリル、1H-1, 2, 3-トリアゾリル、2H-1, 2, 3-トリアゾリル等)、ジヒドロトリアゾリル(例えば、1H-4, 5-ジヒドロ-1, 2, 4-トリアゾリル等)、ピラゾリル、ピリジル、ジヒドロピリジル(例えば、1, 2-ジヒドロピリジル等)、ピリミジニル、ジヒドロピリミジニル(1, 6-ジヒドロピリミジニル等)、ピラジニル、ジヒドロピラジニル(例えば、1, 2-ジヒドロピラジニル等)、ピリダジニル、テトラゾリル(例えば1H-テトラゾリル、2H-テトラゾリル等)等)；

(3) 1～2個(好ましくは1個)の酸素原子と1～3個(好ましくは1～2個)の窒素原子とを含有する不飽和3～8員(より好ましくは5又は6員)複素単環基、例えばオキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル(例えば1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 5-オキサジアゾリル等)等；

1～2個(好ましくは1個)の酸素原子と1～3個(好ましくは1～2個)の窒素原子とを含有する飽和3～8員(より好ましくは5又は6員)複素単環基(例えば、オキサゾリジニル、イソオキサゾリジニル、モルホリニル等)；

(4) 1～2個の硫黄原子と1～3個の窒素原子とを含有する不飽和3～8員(より好ましくは5員)複素単環基、例えばチアゾリル、ジヒドロチアゾリル(例えば、2, 3-ジヒドロチアゾリル)、イソチアゾリル、チアジアゾリル(例えば1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル等)、ジヒドロチアジニル等；

(5) 1～2個の硫黄原子と1～3個の窒素原子とを含有する飽和3～8員(より好ましくは5又は6員)複素単環基、例えばチアゾリジニル等；

(6) 1～2個の酸素原子を含有する飽和3～8員(より好ましくは5又は6員)複素単環基、例えばテトラヒドロフリル、テトラヒドロピラニル等；

(7) 1～2個の酸素原子を含有する不飽和3～8員(より好ましくは5又は6員)複素単環基、例えばピラニル(例えば、2H-ピラニル等)等；

(8) 1～2個の硫黄原子を含有する飽和3～8員(好ましくは5又は6員)複素単環基、例えばテトラヒドロチオフリル、テトラヒドロチオピラニル等；

(9) 1～2個の硫黄原子を含有する不飽和3～8員(より好ましくは5又は6員)複素単環基、例えばチエニル、チオピラニル(例えば、2H-チオピラニル等)等；

等の複素単環基が挙げられる。なかでも、より好ましくは、ピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ピラニル、チエニルから選ばれた窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれるヘテロ原子を1から2個有する飽和又は不飽和複素単環基、さらに好ましくはピロリジニル、ピペリジル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジニル及びチアゾリルから選ばれた窒素原子を1～2個有する飽和又は不飽和複素単環基が好ましい。

【0176】

テトラヒドロキノキサリニル基としては、(1-, 2-, 5-, 又は6-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリニル、(1-, 2-, 5-, 又は6-) 5, 6, 7, 8-テトラヒドロキノキサリニル等を挙げることができる。

【0177】

テトラヒドロキナゾリニル基としては、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリニル、(1-, 2-, 3-, 4-,

10

20

30

40

50

5-、6-、7-、又は8-) 5, 6, 7, 8-テトラヒドロキナゾリニル基等を挙げることができる。

【0178】

ジヒドロキナゾリニル基としては、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) 3, 4-ジヒドロキナゾリニル、(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) 1, 2-ジヒドロキナゾリニル基等を挙げることができる。

【0179】

ジヒドロベンゾイミダゾリル基としては、(1-, 2-, 4-, 又は5-) 2, 3-ジヒドロ-1H-ベンゾイミダゾリル基等を挙げることができる。

【0180】

テトラヒドロベンゾアゼピニル基としては、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 又は9-) 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] アゼピニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 又は9-) 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [c] アゼピニル基等を挙げることができる。

【0181】

テトラヒドロベンゾジアゼピニル基としては、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 又は9-) 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [b] [1. 4] ジアゼピニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 又は9-) 2, 3, 4, 5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ [e] [1. 4] ジアゼピニル基等を挙げることができる。

【0182】

ヘキサヒドロベンゾアゾシニル基としては、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, 又は10-) 1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロベンゾ [b] アゾシニル、(1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 9-, 又は10-) 1, 2, 3, 4, 5, 6-ヘキサヒドロベンゾ [c] アゾシニル基等を挙げることができる。

【0183】

ジヒドロベンゾオキサジニル基としては、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [b] [1. 4] オキサジニル、(1-, 2-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) 2, 4-ジヒドロ-1H-ベンゾ [d] [1. 3] オキサジニル基等を挙げることができる。

【0184】

ジヒドロベンゾオキサゾリル基としては、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) 2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾリル基等を挙げることができる。

【0185】

ベンゾイソオキサゾリル基としては、(3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) ベンゾ [d] イソオキサゾリル、(3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) ベンゾ [c] イソオキサゾリル基等を挙げることができる。

【0186】

ベンゾオキサジアゾリル基としては、(4-, 又は5-) ベンゾ [c] [1. 2. 5] オキサジアゾリル基等を挙げることができる。

【0187】

テトラヒドロベンゾオキサゼピニル基としては、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 又は9-) 2, 3, 4, 5-テトラヒドロベンゾ [b] [1. 4] オキサゼピニル、(1-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 又は9-) 1, 3, 4, 5-テトラヒドロベンゾ [e] [1. 3] オキサゼピニル、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 8-, 又は9-) 2, 3, 4, 5-テトラヒドロベンゾ [f] [1. 4] オキサゼピニル基等を挙げることができる。

【0188】

ジヒドロベンゾチアジニル基としては、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は

10

20

30

40

50

8-3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [b] [1, 4] チアジニル、(2-, 3-, 4-, 5-, 6-, 7-, 又は8-) 3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ [e] [1, 3] チアジニル基等を挙げることができる。

【0189】

ベンゾオキサチオリル基としては、(2-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) ベンゾ [d] [1, 3] オキサチオリル、(3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) 3H-ベンゾ [c] [1, 2] オキサチオリル、(3-, 4-, 5-, 6-, 又は7-) 3H-ベンゾ [d] [1, 2] オキサチオリル基等を挙げることができる。

【0190】

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

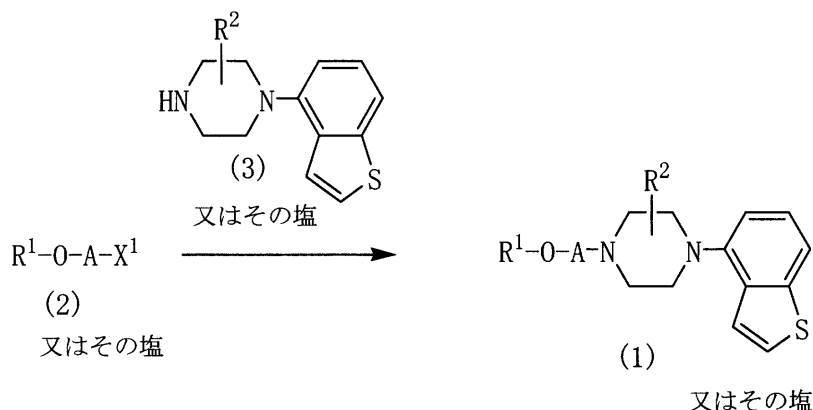
【0191】

上記一般式(1)で表される複素環化合物(以下、化合物(1)とする)は、種々の方法により製造され得るが、その一例を示せば、例えば下記反応式-1又は反応式-2で示される方法により製造される。

反応式-1

【0192】

【化4】



【0193】

[式中、 R^1 、 R^2 及び A は、前記と同じ意味を有し、 X^1 は、ハロゲン原子又はハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基を示す。]

ここで、ハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基としては、例えば、低級アルカンスルホニルオキシ基、アリールスルホニルオキシ基、アラルキルスルホニルオキシ基などを例示できる。

【0194】

一般式(2)において、 X^1 で示されるハロゲン原子は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子である。

【0195】

X^1 で示される低級アルカンスルホニルオキシ基としては、具体的には、メタンスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシ、イソプロパンスルホニルオキシ、 n -プロパンスルホニルオキシ、 n -ブタンスルホニルオキシ、 $tert$ -ブタンスルホニルオキシ、 n -ペンタンスルホニルオキシ、 n -ヘキサンスルホニルオキシ基などの炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルカンスルホニルオキシ基を例示できる。

【0196】

X^1 で示されるアリールスルホニルオキシ基としては、例えば、フェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、ニトロ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるフェニルスルホニルオキシ基、ナフチルスルホニルオキシ基などを挙げることができる。

。上記置換基を有することのあるフェニルスルホニルオキシ基の具体例としては、フェニルスルホニルオキシ、4-メチルフェニルスルホニルオキシ、2-メチルフェニルスルホニルオキシ、4-ニトロフェニルスルホニルオキシ、4-メトキシフェニルスルホニルオキシ、2-ニトロフェニルスルホニルオキシ、3-クロロフェニルスルホニルオキシなどを例示できる。ナフチルスルホニルオキシ基の具体例としては、 α -ナフチルスルホニルオキシ、 β -ナフチルスルホニルオキシ基などを例示できる。

【0197】

X¹で示されるアルキルスルホニルオキシ基としては、例えばフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、ニトロ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェニル基が置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキルスルホニルオキシ基、ナフチル基が置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルキルスルホニルオキシ基などを挙げることができる。上記フェニル基が置換したアルキルスルホニルオキシ基の具体例としては、ベンジルスルホニルオキシ、2-フェニルエチルスルホニルオキシ、4-フェニルブチルスルホニルオキシ、2-メチルベンジルスルホニルオキシ、4-メトキシベンジルスルホニルオキシ、4-ニトロベンジルスルホニルオキシ、3-クロロベンジルスルホニルオキシなどを例示できる。上記ナフチル基が置換したアルキルスルホニルオキシ基の具体例としては、 α -ナフチルメチルスルホニルオキシ、 β -ナフチルメチルスルホニルオキシ基などを例示できる。

【0198】

化合物(1)は、一般式(2)の化合物(以下、化合物(2)とする)と一般式(3)の化合物(以下、化合物(3)とする)とを反応させることによって製造することができる。

【0199】

本反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、例えば、水；メタノール、エタノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、トリフルオロエタノール、エチレングリコールなどのアルコール系溶媒；アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン系溶媒；テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライムなどのエーテル系溶媒；酢酸メチル、酢酸エチルなどのエステル系溶媒；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどの非プロトン性極性溶媒；塩化メチレン、塩化エチレンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒；又は他の有機溶媒中で行われる。さらに、本反応は、これらの慣用の溶媒の混合溶媒中で行われる。この反応は、通常、アルカリ金属(例えば、ナトリウム、カリウムなど)、アルカリ金属炭酸水素塩(例えば、炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなど)、アルカリ金属水酸化物(例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化セシウムなど)、アルカリ金属炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなど)、アルカリ金属低級アルコキシド(例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドなど)、水素化物(例えば、水素化ナトリウム、水素化カリウムなど)などの無機塩基、トリアルキルアミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミンなど)、ピリジン、キノリン、ピペリジン、イミダゾール、ピコリン、ジメチルアミノピリジン、ジメチルアニリン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノン-5-エン(DBN)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)などの有機塩基の存在下で行う。また、これらの塩基が液状の場合、溶媒として用いることができる。

【0200】

これらの塩基性化合物は、1種単独で又は2種以上混合して使用される。

【0201】

塩基性化合物の使用量は、化合物(2)に対して、通常0.5～10倍モル、好ましくは0.5～6倍モルである。

【0202】

上記反応は、必要に応じて、反応促進剤として、ヨウ化カリウム、ヨウ化ナトリウムなどのヨウ化アルカリ金属を添加して行うことができる。

【0203】

上記反応式－1における化合物（2）と化合物（3）との使用割合は、通常前者に対し後者を少なくとも0.5倍モル、好ましくは0.5～5倍モル程度とすればよい。

【0204】

反応温度は特に限定されず、通常、冷却ないし加熱下で反応が行われる。好ましくは、室温付近から約150℃の温度条件下に1～30時間反応させるのがよい。

【0205】

ここで、本発明の化合物の原料化合物である化合物（2）は、新規化合物を含み、種々の方法により製造され得るが、その一例を示せば、例えば下記反応式－3で示される方法により製造される。

【0206】

また、本発明の化合物の原料化合物である化合物（3）は、公知の化合物であるか、又は公知の化合物から容易に製造することができる。

【0207】

また、化合物（2）のかわりに化合物（2）の塩を、化合物（3）かわりに化合物（3）の塩を用いることができる。化合物（2）又は化合物（3）の塩には、酸付加塩が含まれる。かかる酸付加塩は、化合物（2）又は（3）に医薬的に許容される酸を作用させることによって調製することができる。ここで、酸としては、例えば、硫酸、硝酸、塩酸、リン酸、臭化水素酸などの無機酸、p-トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸などのスルホン酸、酢酸、シユウ酸、マレイン酸、フマル酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、コハク酸、安息香酸などの有機酸を例示できる。

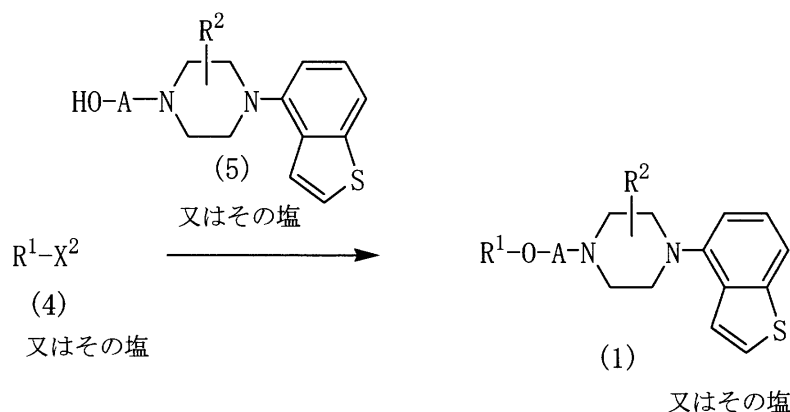
【0208】

また、化合物（2）の内、酸性基を有する化合物は、医薬的に許容し得る塩基性化合物を作用させることにより容易に塩を形成させることができる。かかる塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム、水酸化カルシウムなどの金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなどのアルカリ金属炭酸塩又は重炭酸塩、ナトリウムメチラート、カリウムエチラートなどのアルカリ金属アルコラートなどを例示することができる。

反応式－2

【0209】

【化5】



【0210】

[式中、 R^1 、 R^2 及びAは、前記と同じ意味を有し、 X^2 は、水酸基、ハロゲン原子又はハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基を示す。]

ここで、一般式（4）において、 X^2 で示されるハロゲン原子及びハロゲン原子と同様

の置換反応を起こす基としては、前記と同じ基を例示できる。

【0211】

化合物(1)は、一般式(4)の化合物(以下、化合物(4)とする)と一般式(5)の化合物(以下、化合物(5)とする)とを反応させることによって製造することができる。

【0212】

本反応は、前記反応式-1における反応と同様の反応条件下に行われる。

【0213】

X²が水酸基を示す化合物(4)の場合は、本反応は、適当な溶媒中、適当な縮合剤の存在下行うこともできる。

10

【0214】

本反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、例えば、水；メタノール、エタノール、イソプロパノール、n-ブタノール、トリフルオロエタノール、エチレングリコールなどのアルコール系溶媒；アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン系溶媒；テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライムなどのエーテル系溶媒；酢酸メチル、酢酸エチルなどのエステル系溶媒；アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどの非プロトン性極性溶媒；塩化メチレン、塩化エチレンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒；又は他の有機溶媒中で行われる。さらに、ここで使用される溶媒としては、これら慣用の溶媒の混合溶媒中を挙げることもできる。

【0215】

20

縮合剤としては、ジエチルアゾジカルボキシレートなどのアゾカルボキシレート類及びトリフェニルホスフィンなどの燐化合物の混合物などを挙げることもできる。

【0216】

縮合剤の使用量は、化合物(4)に対して、通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～2倍モルとするのがよい。

【0217】

上記反応式-2におけるの化合物(4)と化合物(5)との使用割合は、通常前者に対し後者を少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル程度とすればよい。

【0218】

反応温度は特に限定されず、通常、冷却ないし加熱下で反応が行われる。好ましくは、0℃～150℃の温度条件下に1～10時間反応させるのがよい。

30

【0219】

ここで、本発明の化合物の原料化合物である化合物(4)は、公知の化合物であるか、又は公知の化合物から容易に製造することができる。

【0220】

また、本発明の化合物の原料化合物である化合物(5)は、新規化合物を含み、種々の方法により製造され得るが、その一例を示せば、例えば下記反応式-4又は反応式-5で示される方法により製造される。

【0221】

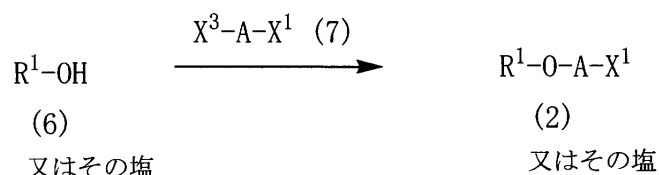
また、化合物(4)のかわりに化合物(4)の塩を、化合物(5)のかわりに化合物(5)の塩を用いることができる。化合物(4)の好適な塩としては、化合物(2)で示したものと同一ものを挙げることもできる。化合物(5)の好適な塩としては、化合物(3)で示したものと同一ものを挙げることもできる。

40

反応式-3

【0222】

【化 6】



【0223】

〔式中、 R^1 、 X^1 及び A は、前記と同じ意味を有し、 X^3 は、ハロゲン原子又はハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基を示す。〕 10

ここで、一般式 (7) において、 X^3 で示されるハロゲン原子及びハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基としては、前記と同じ基を例示できる。

【0224】

化合物 (2) は、一般式 (6) の化合物 (以下、化合物 (6) とする) と一般式 (7) の化合物 (以下、化合物 (7) とする) とを反応させることによって製造することができる。

【0225】

本反応は、前記反応式－1 における反応と同様の反応条件下に行われる。

【0226】

ここで、本発明の化合物の原料化合物である化合物 (6) 及び (7) は、公知の化合物であるか、又は公知の化合物から容易に製造することができる。 20

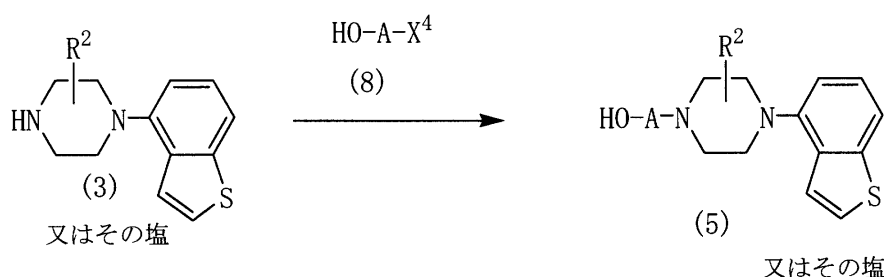
【0227】

また、化合物 (6) のかわりに化合物 (6) の塩を用いることができる。化合物 (6) の好適な塩としては、化合物 (2) で示したものと同一ものを挙げることができる。

反応式－4

【0228】

【化 7】



【0229】

〔式中、 R^2 及び A は、前記と同じ意味を有し、 X^4 は、ハロゲン原子又はハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基を示す。〕 40

ここで、一般式 (8) において、 X^4 で示されるハロゲン原子及びハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基としては、前記と同じ基を例示できる。

【0230】

化合物 (5) は、化合物 (3) と一般式 (8) の化合物 (以下、化合物 (8) とする) とを反応させることによって製造することができる。

【0231】

本反応は、前記反応式－1 における反応と同様の反応条件下に行われる。

【0232】

ここで、本発明の化合物の原料化合物である化合物 (8) は、公知の化合物であるか、又は公知の化合物から容易に製造することができる。 50

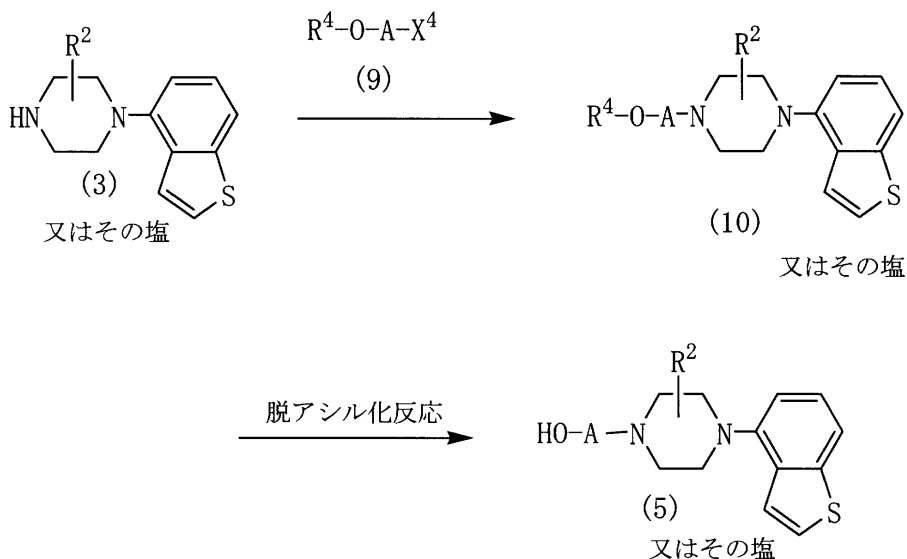
【0233】

また、化合物（3）のかわりに化合物（3）の塩を用いることができる。化合物（3）の好適な塩としては、前記と同様のものを挙げることができる。

反応式－5

【0234】

【化8】



10

20

【0235】

「式中、 R^2 及び A は、前記と同じ意味を有し、 R^4 は、低級アルカノイル基を、 X^4 は、ハロゲン原子又はハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基を示す。」

ここで、一般式（9）及び（10）において、 R^4 における低級アルカノイル基としては、前記と同じ基を例示できる。

【0236】

また、一般式（9）において、 X^4 で示されるハロゲン原子及びハロゲン原子と同様の置換反応を起こす基としては、前記と同じ基を例示できる。

30

【0237】

一般式（10）の化合物（以下、化合物（10）とする）は、化合物（3）と化合物（9）とを反応させることによって製造することができる。

【0238】

本反応は、前記反応式－1 における反応と同様の反応条件下に行われる。

【0239】

ここで、本発明の化合物の原料化合物である化合物（9）は、公知の化合物であるか、又は公知の化合物から容易に製造することができる。

【0240】

また、化合物（3）のかわりに化合物（3）の塩を用いることができる。化合物（3）の好適な塩としては、前記と同様のものを挙げることができる。

40

【0241】

次いで、化合物（10）を脱アシル化反応に付すことによって、化合物（5）を製造することができる。

【0242】

この反応の好適な方法としては、加水分解などの慣用のものが挙げられる。加水分解反応は、塩基あるいはルイス酸を含めての酸の存在下に実施するのが好ましい。好適な塩基としては、アルカリ金属（例えば、ナトリウム、カリウムなど）、アルカリ金属炭酸水素塩（例えば、炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムなど）、アルカリ金属水酸化物（例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化

50

セシウムなど)、アルカリ金属炭酸塩(例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムなど)、アルカリ金属低級アルコキシド(例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシドなど)、水素化物(例えば、水素化ナトリウム、水素化カリウムなど)などの無機塩基、トリアルキルアミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミンなど)、ピリジン、キノリン、ピペリジン、イミダゾール、ピコリン、ジメチルアミノピリジン、ジメチルアニリン、N-メチルモルホリン、DBN、DABCO、DBUなどの有機塩基が挙げられる。好適な酸としては、有機酸(たとえば蟻酸、酢酸、プロピオン酸、トリクロロ酢酸、トリフルオロ酢酸など)及び無機酸(たとえば塩酸、臭化水素酸、硫酸、塩化水素、臭化水素など)が挙げられる。トリハロ酢酸(たとえばトリクロロ酢酸、トリフルオロ酢酸など)などのルイス酸を用いての脱離は、カチオン補捉剤(たとえばアニソール、フェノールなど)の存在下に実施するのが好ましい。

10

【0243】

本反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、例えば、水;メタノール、エタノール、イソプロパノール、n-ブタノール、トリフルオロエタノール、エチレングリコールなどのアルコール系溶媒、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン系溶媒、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライムなどのエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチルなどのエステル系溶媒、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどの非プロトン性極性溶媒、塩化メチレン、塩化エチレンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒、又は他の有機溶媒中で行われる。さらに、本反応は、これらの慣用の溶媒の混合溶媒中で行われてもよい。これらの内ではエタノールが好ましい。反応温度は特に限定されず、通常、冷却ないし加熱下で反応が行われる。好ましくは、室温付近から使用する溶媒の沸点付近までの温度条件下に0.5~7.5時間反応させるのがよい。

20

【0244】

ここで、化合物(10)のかわりに化合物(10)の塩を用いることができる。化合物(10)の好適な塩としては、化合物(3)で示したものと同一ものを挙げるができる。

【0245】

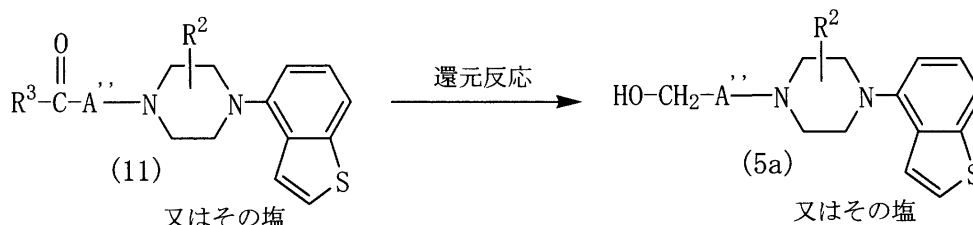
また、化合物(5)においてAが $-CH_2-A''-$ である化合物[ここで、A''は、C1-C5アルキレン基を示す。](以下、化合物(5a)とする)は、例えば、下記の反応式-6で示される方法により製造される。

30

反応式-6

【0246】

【化9】



40

【0247】

[式中、R²は、前記と同じ意味を有し、R³は、低級アルコキシ基を示す。A''はC1-C5アルキレン基を示す。]ここで、一般式(11)において、R³における低級アルコキシ基としては、前記と同じ基を例示できる。

また、

ここで、一般式(11)及び(5a)において、A''におけるC1-C5アルキレン基としては、メチレン、エチレン、メチルメチレン、トリメチレン、テトラメチレン、1-

50

メチルトリメチレン、２－メチルトリメチレン、３－メチルトトラメチレン、ペンタメチレン、２，２－ジメチルトリメチレンなどの炭素数１～５の直鎖又は分岐鎖状アルキレン基を挙げることができる。

【０２４８】

一般式（１１）の化合物（以下、化合物（１１）とする）を、還元反応に付することにより、化合物（５ａ）を製造することができる。

【０２４９】

この反応は後述の参考例６で示された方法又はこれと同様の方法で実施でき、また、本反応は、還元剤を使用して慣用の方法に従って行うことができる。

【０２５０】

好適な還元剤としては、水素化物（たとえば水素化アルミニウムリチウム、水素化硼素ナトリウム、水素化硼素リチウム、ジボラン、水素化シアノ硼素ナトリウムなど）などが挙げられる。

【０２５１】

本反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ｎ－ブタノール、トリフルオロエタノール、エチレングリコールなどのアルコール系溶媒、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン系溶媒、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライムなどのエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチルなどのエステル系溶媒、アセトニトリル、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどの非プロトン性極性溶媒、塩化メチレン、塩化エチレンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒又は他の有機溶媒中で行われる。さらに、本反応は、これら慣用の溶媒の混合溶媒中で行われてもよい。反応温度は特に限定されず、通常、冷却ないし加熱下で反応が行われる。好ましくは、室温付近から使用する溶媒の沸点付近までの温度条件下に０．５～７５時間反応させるのがよい。

【０２５２】

ここで、本発明の化合物の原料化合物である化合物（１１）は、公知の化合物であるか、又は公知の化合物から容易に製造することができる。

【０２５３】

また、化合物（１１）のかわりに化合物（１１）の塩を用いることができる。化合物（１１）の好適な塩としては、化合物（２）で示したものと同一ものを挙げることができる。

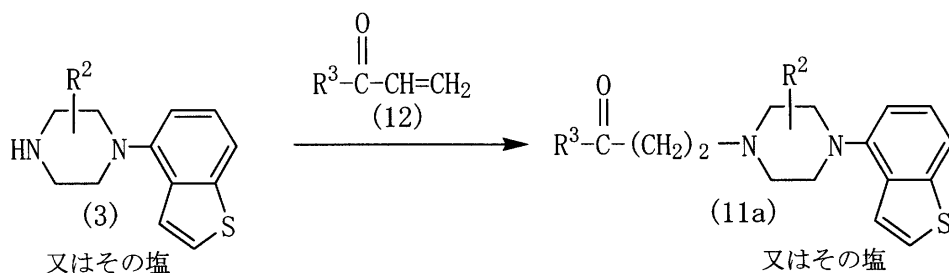
【０２５４】

さらに、化合物（１１）のうち、Ａ’が－（ＣＨ_２）_２－である化合物（以下、化合物（１１ａ）とする）は、例えば、下記の反応式－７で示される方法により製造される。

反応式－７

【０２５５】

【化１０】



【０２５６】

[式中、Ｒ^２及びＲ^３は、前記と同じ意味を示す。]

化合物（１１ａ）は、化合物（３）と一般式（１２）の化合物（以下、化合物（１２）とする）とを反応させることによって製造することができる。

【0257】

この反応は後述の参考例5で示された方法又はこれと同様の方法で実施できるが、本反応は、通常、反応に悪影響を及ぼさない慣用の溶媒、例えば、水；メタノール、エタノール、イソプロパノール、n-ブタノール、トリフルオロエタノール、エチレングリコールなどのアルコール系溶媒、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン系溶媒、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライムなどのエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチルなどのエステル系溶媒、アセトニトリル、N，N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどの非プロトン性極性溶媒、塩化メチレン、塩化エチレンなどのハロゲン化炭化水素系溶媒、又は他の有機溶媒中で行われる。さらに、本反応は、これらの慣用の溶媒の混合溶媒中で行われてもよい。反応温度は特に限定されず、通常、冷却ないし加熱下で反応が行われる。好ましくは、室温付近から使用する溶媒の沸点付近までの温度条件下に0.5～7.5時間反応させるのがよい。

10

【0258】

ここで、本発明の化合物の原料化合物である化合物(12)は、公知の化合物であるか、又は公知の化合物から容易に製造することができる。

【0259】

また、化合物(3)のかわりに化合物(3)の塩を、化合物(12)のかわりに化合物(12)の塩を用いることができる。化合物(3)の好適な塩としては、前記と同様のものを挙げることができる。化合物(12)の好適な塩としては、化合物(2)で示したものと同一ものを挙げることができる。

20

【0260】

上記各反応式において用いられる原料化合物は、好適な塩であってもよく、また各反応で得られる目的化合物も好適な塩を形成していてもよい。それらの好適な塩は以下に例示されている化合物(1)の好適な塩が挙げられる。

【0261】

化合物(1)の好適な塩は、薬理的に許容される塩であって、例えば、アルカリ金属塩(例えばナトリウム塩、カリウム塩等)、アルカリ土類金属塩(例えばカルシウム塩、マグネシウム塩等)等の金属塩、アンモニウム塩、炭酸アルカリ金属(例えば、炭酸リチウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸セシウム等)、炭酸水素アルカリ金属(例えば、炭酸水素リチウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等)、アルカリ金属水酸化物(例えば、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化セシウム等)等の無機塩基の塩；例えば、トリ(低級)アルキルアミン(例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等)、ピリジン、キノリン、ピペリジン、イミダゾール、ピコリン、ジメチルアミノピリジン、ジメチルアニリン、N-(低級)アルキルモルホリン(例えば、N-メチルモルホリン等)、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基の塩；塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の無機酸の塩；ギ酸、酢酸塩、プロピオン酸塩、シュウ酸塩、マロン酸塩、コハク酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、乳酸塩、リンゴ酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、炭酸塩、ピクリン酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、グルタミン酸塩等の有機酸の塩等が挙げられる。

30

40

【0262】

また、各反応式において示された原料及び目的化合物に溶媒和物(例えば、水和物、エタノレート等)が付加された形態の化合物も、各々の一般式に含まれる。好ましい溶媒和物としては水和物が挙げられる。

【0263】

上記各反応式で得られる各々の目的化合物は、反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、反応混合物から単離精製することができる。

50

【0264】

本発明の一般式(1)で表される化合物には、幾何異性体、立体異性体、光学異性体等の異性体も当然に包含される。

【0265】

一般式(1)の化合物及びその塩は、一般的な医薬製剤の形態で用いられる。製剤は通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。この医薬製剤としては各種の形態が治療目的に応じて選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤(液剤、懸濁剤等)等が挙げられる。

【0266】

錠剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来よりよく知られている各種のものを広く使用することができる。その例としては、例えば乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース、ケイ酸等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、カンテン末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等を使用できる。更に錠剤は必要に応じ通常の剤皮を施した錠剤、例えば糖衣錠、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。

【0267】

丸剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用できる。その例としては、例えばブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、カンテン等の崩壊剤等を使用できる。

【0268】

坐剤の形態に成形するに際しては、担体として従来公知のものを広く使用できる。その例としては、例えばポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等を挙げることができる。

【0269】

カプセル剤は常法に従い通常有効成分化合物を上記で例示した各種の担体と混合して硬質ゼラチンカプセル、軟質カプセル等に充填して調製される。

【0270】

注射剤として調製される場合、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、且つ血液と等張であるのが好ましく、これらの形態に成形するに際しては、希釈剤としてこの分野において慣用されているものをすべて使用でき、例えば水、エチルアルコール、マクロゴール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類等を使用できる。

【0271】

なお、この場合等張性の溶液を調製するに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有せしめてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を添加してもよい。更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を医薬製剤中に含有させることもできる。

【0272】

本発明の医薬製剤中に含有されるべき一般式(1)の化合物又はその塩の量としては、特に限定されず広範囲から適宜選択されるが、通常製剤組成物中に約1~70重量%、好

10

20

30

40

50

ましくは約1～30重量%とするのがよい。

【0273】

本発明の医薬製剤の投与方法は特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等に応じた方法で投与される。例えば錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には、経口投与される。また注射剤の場合には単独で又はブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内投与され、更に必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内投与される。坐剤の場合には直腸内投与される。

【0274】

本発明医薬製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等により適宜選択されるが、通常有効成分化合物の量が、1日当たり体重1kg当たり、約0.1～10mg程度とするのがよい。また投与単位形態の製剤中には有効成分化合物が約1～200mgの範囲で含有されるのが望ましい。

【発明の効果】

【0275】

本発明の化合物は、 D_2 受容体パーシャルアゴニスト作用、 $5-HT_{2A}$ 受容体アンタゴニスト作用及びセロトニン取り込み阻害作用（あるいはセロトニン再取り込み阻害作用）を有している。

【0276】

D_2 受容体パーシャルアゴニスト作用は、ドパミン（DA）作動性神経伝達が亢進している場合にはこれを抑制し、一方、DA作動性神経伝達が低下している場合にはこれを促進してDA神経伝達を正常な状態へ安定化させる働き（dopamine system stabilizer、ドパミンシステムスタビライザー）を有している。この働きにより、副作用を発現することなく、DA神経伝達異常（亢進及び低下）に基づく症状に対して、優れた臨床改善作用、例えば、陽性及び陰性症状改善作用、認知障害改善作用、うつ症状改善作用等を発現する（融道男：精神医学，第46巻，第855～864頁（2004）、菊地哲朗及び廣瀬毅：脳の科学，第25巻，第579～583頁（2004）及びHarrison, T. S. and Perry, C. M.: Drugs 64: 1715-1736, 2004 参照）。

【0277】

$5-HT_{2A}$ 受容体アンタゴニスト作用は、錐体外路系副作用を軽減すると共に、優れた臨床効果を発現し、例えば、陰性症状改善、認知障害改善、うつ症状改善、不眠改善等に有効である（石郷岡純及び稲田健：臨床精神薬理，第4巻，第1653～1664頁（2001）、村崎光邦：臨床精神薬理，第1巻，第5～22頁（1998）、Pullar, I.A. et al., : Eur. J. Pharmacol., 407: 39-46, 2000及びMeltzer, H. Y. et al.: Prog. Neuro-psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1159-1172, 2003 参照）。

【0278】

セロトニン取り込み阻害作用（あるいはセロトニン再取り込み阻害作用）は、例えば、うつ症状の改善に有効である（村崎光邦：臨床精神薬理，第1巻，第5～22頁（1998）参照）。

【0279】

本発明の化合物は、これら3つの作用が全て優れているか、又はこれら作用のうち1つ又は2つが顕著に優れている。

【0280】

また、本発明の化合物のうちのあるものは、上記作用に加えて、 α_1 受容体アンタゴニスト作用を有している。 α_1 受容体アンタゴニスト作用は、統合失調症の陽性症状の改善に有効である（Svensson, T. H.: Prog. Neuro-psychopharmacol. Biol. Psychiatry 27: 1145-1158, 2003 参照）。

【0281】

そのため、本発明の化合物は、統合失調症及び他の中枢神経疾患に対して広い治療スペクトラムを有し、優れた臨床効果を備えている。

【0282】

10

20

30

40

50

従って、本発明の化合物は、統合失調症、治療抵抗性、難治性又は慢性統合失調症、失調感情障害、精神病性障害、気分障害、双極性障害（例えば、双極性Ⅰ型障害及び双極性Ⅱ型障害）、うつ病、内因性うつ病、大うつ病、メランコリー及び治療抵抗性うつ病、気分変調性障害、気分循環性障害、不安障害（例えば、パニック発作、パニック障害、広場恐怖、社会恐怖、強迫性障害、外傷後ストレス障害、全般性不安障害、急性ストレス障害等）、身体表現性障害（例えば、ヒステリー、身体化障害、転換性障害、疼痛性障害、心気症等）、虚偽性障害、解離性障害、性障害（例えば、性機能不全、性的欲求障害、性的興奮障害、勃起障害等）、摂食障害（例えば、神経性無食欲症、神経性大食症等）、睡眠障害、適応障害、物質関連障害（例えば、アルコール乱用、中毒及び薬物耽溺、覚醒剤中毒、麻薬中毒等）、無快感症（快感消失症、*anhedonia*、例えば医原性無快感症、心理的、精神的な原因での無快感症、鬱病に伴う無快感症、統合失調症に伴う無快感症等）、せん妄、認知障害、アルツハイマー病、パーキンソン病、その他の神経変性疾患に伴う認知障害、アルツハイマー病、パーキンソン病及び関連障害の神経変性疾患に起因した認知障害、統合失調症の認知障害、治療抵抗性、難治性又は慢性統合失調症等に起因する認知障害、嘔吐、乗物酔い、肥満、偏頭痛、疼痛、精神遅滞、自閉性障害（自閉症）、トウレット障害、チック障害、注意欠陥多動性障害、行為障害、ダウン症候群等、中枢神経系の種々の障害の改善に極めて有効である。

【0283】

更に、本発明の化合物は、副作用が殆どなく、忍容性及び安全性の点において優れている。

【0284】

以下に、参考例、実施例、薬理試験例及び製剤例を掲げて、本発明をより一層明らかにする。

【0285】

参考例 1

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩の合成

4-ブロモベンゾ[b]チオフェン 14.4 g、無水ピペラジン 29.8 g、ナトリウムt-ブトキシド 9.3 g、(R)-(+)-2, 2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフチル(BINAP) 0.65 g、トリス(ジベンジリデンアセトン)ニパラジウム(0) 0.63 g、及びトルエン 250 ml からなる混合物を、窒素雰囲気下、1時間加熱還流した。反応液に水を注ぎ、酢酸エチルで抽出し、水洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ジクロロメタン：メタノール：25%アンモニア水=100：10：1)により精製して、黄色油状の1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン 9.5 g を得た。

【0286】

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン 9.5 gのメタノール溶液に、濃塩酸 3.7 mlを加え、減圧下に溶媒を留去した。得られた残渣に酢酸エチルを加え、析出した結晶をろ取し、メタノールから再結晶して、無色針状晶の1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩を得た。

融点：276 - 280 °C

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm: 3.25-3.35 (8H, m), 6.94 (1H, d, J=7.6Hz), 7.30 (1H, dd, J=7.8Hz, J=7.8Hz), 7.51 (1H, d, J=5.5Hz), 7.68 (1H, d, J=8.1Hz), 7.73 (1H, d, J=5.5Hz), 9.35 (2H, brs)。

【0287】

参考例 2

4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-3-メチルピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの合成

3-メチルピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル及び4-ブロモベンゾ[b]チオフェンを用い、参考例 1 と同様にして目的化合物を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.85-1.95 (3H, m), 1.50 (9H, s), 2.8-2.9 (1H, m), 3

10

20

30

40

50

.15-3.35 (2H, m), 3.4-3.5 (1H, m), 3.5-3.65 (1H, m), 3.65-3.7 (1H, m), 3.7-3.9 (1H, m), 6.98 (1H, d, J = 7.5Hz), 7.29 (1H, dd, J = 8Hz, J=8Hz), 7.38 (1H, d, J = 5.5Hz), 7.61 (1H, d, J = 8Hz)。

【0288】

参考例 3

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-2-メチルピペラジン二塩酸塩の合成

4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-3-メチルピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル 1.22 g (3.7ミリモル) のジクロロメタン溶液 (12 ml) にトリフルオロ酢酸 6 ml を加えて室温で1時間攪拌した。反応混合物を減圧下に濃縮し、残渣に5%炭酸カリウム水溶液を加えてジクロロメタンで抽出した。ジクロロメタン抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣に濃塩酸 0.6 ml 及びメタノール 10 ml を加えて減圧下に濃縮した。得られた残渣をアセトニトリルから結晶化して微褐色粉末の1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-2-メチルピペラジン二塩酸塩 0.98 g を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm: 0.92 (3H, d, J = 6.5Hz), 2.8-3.6 (6H, m), 3.6-4.0 (1H, m), 5.3-6.8 (1H, m), 7.20 (1H, br), 7.38 (1H, dd, J = 8 Hz, J=8 Hz), 7.5-8.0 (3H, m), 9.4-10.1 (2H, m)。

【0289】

参考例 4

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-3-メチルピペラジン二塩酸塩の合成

2-メチルピペラジン及び4-ブロモベンゾ[b]チオフェンを用い、参考例 1 と同様にして目的化合物を得た。

¹H-NMR (DMSO-d₆) δ ppm: 1.34 (3H, d, J = 6.5Hz), 2.85-2.95 (1H, m), 3.05-3.15 (1H, m), 3.2-3.6 (6H, m), 6.97 (1H, d, J = 7.5Hz), 7.31 (1H, dd, J = 8Hz, J = 8Hz), 7.54 (1H, d, J = 5.5Hz), 7.69 (1H, d, J = 8Hz), 7.75 (1H, d, J = 5.5Hz), 9.2-9.3 (1H, m), 9.64 (1H, br)。

【0290】

参考例 5

3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)プロピオン酸エチルの合成

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩 5.05 g (19.8ミリモル) を水酸化ナトリウム水溶液に加えてジクロロメタンで抽出した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をエタノール 50 ml に溶解し、アクリル酸エチル 2.44 ml (21.8ミリモル) を加えて4時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却後、減圧下に濃縮し、残渣にジイソプロピルエーテルを加えて析出した不溶物をろ取り、ジイソプロピルエーテルで洗浄後乾燥して白色粉末の3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)プロピオン酸エチル 5.26 g を得た。

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm: 1.28(3H, t, J=7.0Hz), 2.50-2.63(2H, m), 2.67-2.87(6H, m), 3.11-3.24(4H, m), 4.17(2H, q, J=7.0Hz), 6.89(1H, d, J=7.8Hz), 7.27(1H, t, J=7.8Hz), 7.37-7.42(2H, m), 7.55(1H, d, J=7.8Hz)。

【0291】

参考例 6

3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)プロパン-1-オール

3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)プロピオン酸エチル 5.26 g (16.5ミリモル) のテトラヒドロフラン (THF) 溶液 (55 ml) に氷冷下、水素化リチウムアルミニウム 1.18 g (24.8ミリモル) を加えて室温で4時間攪拌した。反応液に水 1.2 ml、15%水酸化ナトリウム水溶液 1.2 ml、水 3.6 ml の順に加えて室温で攪拌した。不溶物をろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン：酢酸エチル = 3 : 2 → 酢酸エチル) で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色粉末の3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)プロパン-1-オール 0.23 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.75-1.85 (2H, m), 2.74 (2H, t, $J=5.8$ Hz), 2.75-2.85 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 3.85 (2H, t, $J=5.3$ Hz), 5.19 (1H, brs), 6.88 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.27 (1H, dd, $J=7.9$ Hz, $J=7.8$ Hz), 7.39 (2H, s), 7.56 (1H, d, $J=8.0$ Hz)

。

【0292】

参考例7

酢酸4-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)ブチルの合成

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩 1.0 g (3.9ミリモル) をジメチルホルムアミド (DMF) 20 ml に懸濁し、炭酸カリウム 1.3 g (9.4ミリモル) 及び酢酸4-ブロモブチル 0.7 ml (4.8ミリモル) を加えて 80℃ で6時間 10
攪拌した。室温まで冷却し、反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (ジクロロメタン:メタノール=30:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して淡黄色油状物の酢酸4-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)ブチル 0.72 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.60-1.73 (4H, m), 2.07 (3H, s), 2.47 (2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.60-2.72 (4H, m), 3.17-3.22 (4H, m), 4.11 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 6.90 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.27 (1H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=8.0$ Hz), 7.37-7.42 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz)。

【0293】

参考例8

4-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)ブタン-1-オールの合成

酢酸4-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)ブチルエステル 7.76 g (23.3ミリモル) の90%メタノール溶液 (150 ml) に炭酸カリウム 3.87 g (28ミリモル) を加えて室温で2時間攪拌した。反応液に水を加えてジクロロメタンで抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1→1:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して無色油状物の4-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)ブタン-1- 20
オール 6.65 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.60-1.74 (4H, m), 2.50-2.55 (2H, m), 2.70-2.80 (4H, m), 3.20-3.30 (4H, m), 3.60-3.63 (2H, m), 6.2 (1H, brs), 6.90 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.27 (1H, dd, 30
 $J=7.6$ Hz, $J=8.0$ Hz), 7.39 (1H, s), 7.56 (1H, d, $J=8.0$ Hz)。

【0294】

参考例9

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-4-(3-クロロプロピル)ピペラジンの合成

3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン-1-イル)プロパン-1-オール 3.56 g (12.9ミリモル) をジクロロメタン 30 ml に懸濁し、四塩化炭素 30 ml 及びトリフェニルホスフィン 4.06 g (15.5ミリモル) を加えて、3時間加熱還流した。室温まで冷却し、反応液にメタノールとジクロロメタンを加えて均一溶液とした。この溶液にシリカゲル 30 g を加えて減圧下に溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラム (300 g) に乗せ、n-ヘキサンと酢酸エチルとの混合溶媒 (2:1) で溶出した。溶出液 40
を減圧下に濃縮して無色油状物の1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-4-(3-クロロプロピル)ピペラジン 2.36 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.2$ Hz), 2.65-2.75 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 3.65 (2H, t, $J=6.6$ Hz), 6.89 (1H, dd, $J=7.6$ Hz, $J=0.7$ Hz), 7.27 (1H, dd, $J=7.9$ Hz, $J=7.8$ Hz), 7.38 (1H, d, $J=5.6$ Hz), 7.41 (1H, d, $J=5.7$ Hz), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz) 。

【0295】

参考例10

4-ヒドロキシチオフェン-2-カルボン酸メチルの合成

4-ヒドロキシチオフェン-2-カルボン酸 1.1 g (7.6ミリモル) のメタノール溶 50

液 (20 ml) に氷冷下塩化チオニル 1.6 ml を滴下し、5 時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却し、反応液を氷水にあげ酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 4 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色粉末の 4-ヒドロキシチオフェン-2-カルボン酸メチル 0.7 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 3.90 (3H, s), 5.50-6.60 (1H, br), 6.64 (1H, d, $J=1.9$ Hz), 7.43 (1H, d, $J=1.8$ Hz)。

【0296】

参考例 11

6-ヒドロキシピリミジン-4-カルボン酸エチルの合成

10

6-ヒドロキシピリミジン-4-カルボン酸を用い、参考例 10 と同様にして目的化合物を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.29 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 4.29 (2H, q, $J=7.0\text{Hz}$), 6.87 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$), 8.27 (1H, d, $J=1.0\text{Hz}$), 10.54 (1H, br)。

【0297】

参考例 12

5-ヒドロキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチルの合成

アセチレンジカルボン酸ジメチル 5.0 g (35 ミリモル) のジエチルエーテル溶液 (35 ml) を寒剤 (食塩-氷) で冷却し、これにメチルヒドラジン 0.63 ml (35 ミリモル) のジエチルエーテル溶液 (15 ml) を滴下した (滴下中 0°C 以下に保った)。滴下終了後、この溶液を 0°C で 1 時間攪拌した。析出した不溶物をろ取り、ジエチルエーテルで洗浄した。ろ物を 30 分間 130°C に加熱し、室温まで冷却した。メタノールを加えて減圧下に濃縮し、残渣に酢酸エチルを加えて減圧下に濃縮した。得られた残渣に酢酸エチルを加えて生成した不溶物をろ取り、酢酸エチルで洗浄後、乾燥して淡黄色粉末の 5-ヒドロキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチル 3.26 g を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ ppm: 3.58 (3H, s), 3.73 (3H, s), 5.77 (1H, s), 11.41 (1H, br)。

【0298】

参考例 13

6-クロロ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ニコチンアミドの合成

6-クロロニコチン酸 0.58 g (3.6 ミリモル) のアセトニトリル溶液 (12 ml) に氷冷下、トリエチルアミン 1.03 ml (7.4 ミリモル) 及びクロロ蟻酸イソブチル 0.76 ml (5.5 ミリモル) を加えて 0°C で 30 分攪拌した。これに 2,2,2-トリフルオロエチルアミン 0.88 ml (11.2 ミリモル) を加えて室温で 10 分攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 5 : 1 $\rightarrow$ 1 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣にジイソプロピルエーテル及び n-ヘキサンを加えて析出した不溶物をろ取り、乾燥して淡黄色粉末の 6-クロロ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ニコチンアミド 0.58 g を得た。

30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 4.15 (2H, dq, $J=6.5\text{Hz}$, 9.0Hz), 6.35 (1H, br), 7.46 (1H, dd, $J=0.7\text{Hz}$, $J=8.5\text{Hz}$), 8.11 (1H, dd, $J=2.5\text{Hz}$, $J=8.5\text{Hz}$), 8.77 (1H, dd, $J=0.7\text{Hz}$, $J=2.5\text{Hz}$)

40

【0299】

参考例 14

N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-4-クロロピリジン-2-カルボキサミドの合成

4-クロロピリジン-2-カルボン酸 0.5 g (3.17 ミリモル) のジクロロメタン溶液 (5 ml) に 1-ヒドロキシベンゾトリアゾール 0.53 g (3.5 ミリモル)、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (WSC) 0.67 g (3.5 ミリモル) 及び 2,2,2-トリフルオロエチルアミン 0.51 ml (6.35 ミリモル) を加えて室温で 1 時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラム

50

クロマト (n-ヘキサン：酢酸エチル = 1 : 1 → 5 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色粉末のN-(2,2,2-トリフルオロエチル)-4-クロロピリジン-2-カルボキサミド 435 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 4.13(2H, dq, $J=6.8\text{Hz}$, 9.0Hz), 7.49(1H, dd, $J=2.1\text{Hz}$, $J=5.3\text{Hz}$), 8.22(1H, dd, $J=0.4\text{Hz}$, $J=2.1\text{Hz}$), 8.30(1H, br), 8.49(1H, dd, $J=0.4\text{Hz}$, $J=5.3\text{Hz}$)。

【0300】

参考例 15

2-クロロチアゾール-4-カルボキサミドの合成

2-クロロチアゾール-4-カルボン酸 0.5 g (3.06 mmol) のジクロロメタン溶液 (10 ml) に 1-ヒドロキシベンゾトリアゾール 0.56 g (3.7 mmol)、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (WSC) 0.7 g (3.7 mmol) 及びアンモニア水 (28%) 0.5 ml を加えて室温で 46 時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン：酢酸エチル = 3 : 5 → 酢酸エチル) で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色粉末の 2-クロロチアゾール-4-カルボキサミド 475 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 5.70(1H, br), 7.01(1H, br), 8.06(1H, s)。

【0301】

参考例 16

N-メチル-2-クロロチアゾール-5-カルボキサミドの合成

2-クロロチアゾール-5-カルボン酸を用い、参考例 13 と同様にして目的化合物を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 3.00(3H, d, $J=4.9\text{Hz}$), 5.92(1H, br), 7.84(1H, br)。

【0302】

参考例 17

6-メトキシ-2,2-ジメチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オンの合成

2-(4-メトキシ-2-ニトロフェノキシ)-2-メチルプロピオン酸エチル 14.6 g (51.6 mmol) のエタノール溶液 (250 ml) に 5%パラジウム炭素 1.5 g を加えて室温で接触還元した。触媒をろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。得られた残渣に水を加えて酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン：酢酸エチル = 9 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色粉末の 6-メトキシ-2,2-ジメチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン 7.0 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.53(6H, s), 3.78(3H, s), 6.40(1H, d, $J=2.8\text{Hz}$), 6.52(1H, dd, $J=2.8\text{Hz}$, $J=8.8\text{Hz}$), 6.88(1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 8.66(1H, brs)。

【0303】

参考例 18

6-ヒドロキシ-2,2-ジメチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オンの合成

6-メトキシ-2,2-ジメチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン 5.0 g (26 mmol) のジクロロメタン溶液に氷冷下 2M-三臭化ホウ素ジクロロメタン溶液 36 ml を滴下した。室温で一晩攪拌し、反応液に水を加えて過剰の試薬を分解した。この反応液を水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン：酢酸エチル = 2 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色粉末の 6-ヒドロキシ-2,2-ジメチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オン 4.02 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1.34 (6H, s), 6.25-6.40 (2H, m), 6.70 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 9.09 (1H, s), 10.41 (1H, brs)。

【0304】

参考例 19

6-ヒドロキシ-2-メチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オンの合成

6-メトキシ-2-メチル-4H-ベンゾ[1,4]オキサジン-3-オンを用い、参考例18と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ ppm: 1.34 (3H, d, $J=6.8$ Hz), 4.46 (1H, q, $J=6.8$ Hz), 6.23-6.27 (1H, m), 6.33 (1H, d, $J=2.7$ Hz), 6.70 (1H, d, $J=8.6$ Hz), 9.11 (1H, s), 10.44 (1H, brs)。

【0305】

参考例20

4-(4-メトキシフェニル)-1-(トルエン-4-スルホニル)ピペリジンの合成

10

4-(4-メトキシフェニル)ピペリジン 4.0 g (21ミリモル)のピペリジン溶液 (30 ml) に p-トルエンスルホニルクロリド 4.39 g (23ミリモル)を加えて室温で一晩攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を塩酸及び水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン:酢酸エチル=1:1)で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色粉末の4-(4-メトキシフェニル)-1-(トルエン-4-スルホニル)ピペリジン 4.8 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.60-1.90 (4H, m), 2.30-2.40 (3H, m), 2.46 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.90-3.95 (2H, m), 6.84 (2H, dd, $J=1.9$, $J=6.8$ Hz), 7.07 (2H, dd, $J=1.9$, $J=6.8$ Hz), 7.35 (2H, d, $J=8.2$ Hz), 7.68 (2H, d, $J=8.2$ Hz)。

20

【0306】

参考例21

4-(4-ヒドロキシフェニル)-1-(トルエン-4-スルホニル)ピペリジンの合成

4-(4-メトキシフェニル)-1-(トルエン-4-スルホニル)ピペリジンを用い、参考例18と同様にして目的化合物を得た。

褐色粉末

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.60-1.90 (4H, m), 2.30-2.50 (3H, m), 2.45 (3H, s), 3.90-3.95 (2H, m), 6.67 (1H, brs), 6.80 (2H, dd, $J=1.9$, $J=6.8$ Hz), 7.02 (2H, dd, $J=1.8$, $J=6.9$ Hz), 7.35 (2H, d, $J=8.1$ Hz), 7.68 (2H, d, $J=8.1$ Hz)。

【0307】

30

参考例22

4-ブロモ-2-ヒドロキシメチル-6-メトキシフェノールの合成

5-ブロモ-2-ヒドロキシ-3-メトキシベンズアルデヒド 3.2 g (13.8ミリモル)のTHF溶液 (30 ml)に氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム 0.28 g (6.9ミリモル)を加えて0℃で2時間攪拌した。反応液に酢酸を加えpH=3とし、これに10%塩酸を加えて酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン:酢酸エチル=5:1→1:1)で精製し、減圧下に濃縮して淡黄色油状物の4-ブロモ-2-ヒドロキシメチル-6-メトキシフェノール 3.23 gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 3.88 (3H, s), 4.71 (2H, s), 6.94 (1H, d, $J=2.0$ Hz), 7.03 (1H, d, $J=2.0$ Hz)。

40

【0308】

参考例23

5-ブロモ-3-メトキシ-2-メトキシメトキシベンズアルデヒドの合成

5-ブロモ-2-ヒドロキシ-3-メトキシベンズアルデヒド 3.3 g (14.3ミリモル)のジクロロメタン溶液 (30 ml)に氷冷下エチルジイソプロピルアミン 3.0 ml (17.1ミリモル)及びメトキシメチルクロリド 1.5 ml (15.7ミリモル)を加えて室温で2時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン:酢酸エチル=3:1→11:9)で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して淡黄色固体の5-ブロモ-

50

3-メトキシ-2-メトキシメトキシベンズアルデヒド 4. 2 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 3.56(3H, s), 3.89(3H, s), 5.21(2H, s), 7.23(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 7.56(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 10.39(1H, s)。

【0309】

参考例 24

3-メトキシ-2-メトキシメトキシ-5-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)ベンズアルデヒドの合成

5-ブロモ-3-メトキシ-2-メトキシメトキシベンズアルデヒド 1.0 g (3.6 ミリモル) のジオキサン溶液 (20 ml) に 2-オキサゾリジノン 0.38 g (4.36 ミリモル)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム 0.17 g (0.18 ミリモル)、9,9-ジメチル-4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)キサンテン (XANTPHOS) 0.32 g (0.55 ミリモル) 及び炭酸セシウム 1.66 g (5.1 ミリモル) を加え、アルゴン雰囲気下、100℃で24時間攪拌した。この反応液を室温まで冷却し、酢酸エチルを加えて、セライトろ過した。ろ液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (n -ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1 $\rightarrow$ 1:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣に酢酸エチルとジイソプロピルエーテルを加えて精製した不溶物をろ取し、乾燥して白色粉末の3-メトキシ-2-メトキシメトキシ-5-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)ベンズアルデヒド 0.5 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 3.57(3H, s), 3.93(3H, s), 4.06-4.12(2H, m), 4.48-4.54(2H, m), 5.21(2H, s), 6.96(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 8.18(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 10.45(1H, s)。

【0310】

参考例 25

3-(3-メトキシ-4-メトキシメトキシ-5-メチルフェニル)オキサゾリジン-2-オンの合成

3-メトキシ-2-メトキシメトキシ-5-(2-オキソオキサゾリジン-3-イル)ベンズアルデヒド 0.5 g (1.79 ミリモル) を酢酸 5 ml エタノール 5 ml の混合溶媒に溶解し、10%パラジウム炭素 0.05 g を加えて、50℃1気圧で4時間接触還元した。室温まで冷却し、セライトろ過した。ろ液を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸 10 ml に溶解し、10%パラジウム炭素 0.05 g を加えて、50℃1気圧で6時間接触還元した。減圧下に溶媒を留去して淡褐色油状物の3-(3-メトキシ-4-メトキシメトキシ-5-メチルフェニル)オキサゾリジン-2-オンを得た。粗生成物のまま次の反応に用いた。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.32(3H, s), 3.56(3H, s), 3.85(3H, s), 3.98-4.06(2H, m), 4.43-4.50(2H, m), 5.05(2H, s), 6.61(1H, d, $J=2.3\text{Hz}$), 7.36(1H, d, $J=2.3\text{Hz}$)。

【0311】

参考例 26

3-(4-ヒドロキシ-3-メトキシ-5-メチルフェニル)オキサゾリジン-2-オンの合成

3-(3-メトキシ-4-メトキシメトキシ-5-メチルフェニル)オキサゾリジン-2-オン 0.48 g (1.79 ミリモル) のメタノール溶液 (5 ml) に 10%塩酸 5 ml を加えて 50℃で10分間攪拌した。反応液に水を加えて、酢酸エチルで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮乾固して淡黄色粉末の3-(4-ヒドロキシ-3-メトキシ-5-メチルフェニル)オキサゾリジン-2-オン 434 mg を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.26(3H, s), 3.90(3H, s), 4.02(2H, dd, $J=7.0\text{Hz}$, $J=8.5\text{Hz}$), 4.46(2H, dd, $J=7.0\text{Hz}$, $J=8.5\text{Hz}$), 5.55(1H, br), 6.56(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 7.31(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$)。

【0312】

参考例 27

1-(8-メトキシ-2,2-ジメチル-4H-ベンゾ[1,3]ジオキシン-6-イル)ピロリジン-2-オンの合成

6-ブロモ-8-メトキシ-2,2-ジメチル-4H-ベンゾ[1,3]ジオキシン及び2-ピロリドンを用い、参考例25と同様にして目的化合物を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.59(6H, s), 2.09-2.21(2H, m), 2.60(2H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 3.82(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.88(3H, s), 4.83(2H, s), 6.67(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 7.24(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$)。

【0313】

参考例28

1-(4-ヒドロキシ-3-ヒドロキシメチル-5-メトキシフェニル)ピロリジン-2-オンの合成

1-(8-メトキシ-2,2-ジメチル-4H-ベンゾ[1,3]ジオキシン-6-イル)ピロリジン-2-オン0.36g(1.3ミリモル)のTHF溶液(7ml)に10%塩酸4mlを加えて、室温で17時間攪拌した。反応液に水を加えてジクロロメタンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(ジクロロメタン:メタノール=300:1→30:1)で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して淡褐色粉末の1-(4-ヒドロキシ-3-ヒドロキシメチル-5-メトキシフェニル)ピロリジン-2-オン0.31gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.05-2.28(3H, m), 2.26(2H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 3.84(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.91(3H, s), 4.74(2H, s), 5.90(1H, br), 6.78(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 7.52(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$)。

【0314】

参考例29

3-メトキシ-2-メトキシメトキシ-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンズアルデヒドの合成

5-ブロモ-3-メトキシ-2-メトキシメトキシベンズアルデヒド及び2-ピロリドンを用い、参考例25と同様にして目的化合物を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.11-2.24(2H, m), 2.63(2H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 3.56(3H, s), 3.89(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.92(3H, s), 5.21(2H, s), 7.08(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 8.28(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 10.46(1H, s)。

【0315】

参考例30

1-(4-ヒドロキシ-3-メトキシ-5-メチルフェニル)ピロリジン-2-オンの合成

3-メトキシ-2-メトキシメトキシ-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)ベンズアルデヒド0.72g(2.56ミリモル)を酢酸4ml及びエタノール7mlの混合溶媒に溶解し、10%パラジウム炭素70mgを加えて50℃で10時間接触還元した。反応液を室温まで冷却した後、セライトろ過し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をジクロロメタン15mlに溶解し、氷冷下トリフルオロ酢酸2.0ml(25.6ミリモル)及びトリエチルシラン2.0ml(12.8ミリモル)を加えて室温で16時間攪拌した。減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト(n-ヘキサン:酢酸エチル=5:1→酢酸エチル)で精製した。精製物を減圧下に濃縮して淡黄色油状物の1-(4-ヒドロキシ-3-メトキシ-5-メチルフェニル)ピロリジン-2-オン0.41gを得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.17-2.25(5H, m), 2.72(2H, t, $J=8.3\text{Hz}$), 3.88(2H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 3.89(3H, s), 6.66(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 7.15(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$)。

【0316】

参考例31

3,4-ジアセトキシ-5-メチルベンズアルデヒドの合成

3,4-ジヒドロキシ-5-メチルベンズアルデヒド0.72g(4.7ミリモル)のピロリジン溶液(4ml)に氷冷下、無水酢酸1.2ml(12ミリモル)を加えて、0℃で1時間攪拌した。反応液に10%塩酸を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(n-ヘキサン:酢酸エチル=5:1→3:1)で精製した

。精製物を減圧下に濃縮して淡黄色油状物の 3, 4 -ジアセトキシ-5-メチルベンズアルデヒド 0.98 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.29(3H, s), 2.32(3H, s), 2.35(3H, s), 7.58(1H, d, $J=1.6\text{Hz}$), 7.67(1H, d, $J=1.6\text{Hz}$), 9.93(1H, s)。

【0317】

参考例 32

7-ヒドロキシ-1, 4-ジヒドロベンゾ[d][1, 3]オキサジン-2-オンの合成

7-メトキシメトキシ-1, 4-ジヒドロベンゾ[d][1, 3]オキサジン-2-オンを用い、参考例 26 と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末

10

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ ppm: 5.14 (2H, s), 6.35 (1H, d, $J=2.2\text{ Hz}$), 6.39 (1H, dd, $J=8.1$, $J=2.2\text{ Hz}$), 6.97 (1H, d, $J=8.1\text{ Hz}$), 9.98 (1H, br-s)。

【0318】

参考例 33

7-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キナゾリン-2-オンの合成

2-アミノメチル-5-メトキシアニリン 1.2 g (7.9 ミリモル) 及びカルボニルジイミダゾール 1.53 g (9.5 ミリモル) を THF 100 ml に加えて室温で一夜攪拌した。生成した不溶物をろ取り、ジクロロメタン及び水で洗浄後、乾燥して白色粉末の 7-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キナゾリン-2-オン 1.11 g を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ ppm: 3.68(3H, s), 4.23(2H, s), 6.35(1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 6.42(1H, dd, $J=8.3\text{Hz}$, $J=2.5\text{Hz}$), 6.96(1H, d, $J=8.3\text{Hz}$), 8.90(1H, brs)。

20

【0319】

参考例 34

7-ヒドロキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キナゾリン-2-オンの合成

7-メトキシ-3, 4-ジヒドロ-1H-キナゾリン-2-オンを用い、参考例 18 と同様にして目的化合物を得た。

淡褐色粉末

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ ppm: 4.18 (2H, brs), 6.75-6.85 (1H, m), 7.01 (1H, dd, $J=2.0\text{ Hz}$, $J=9.0\text{Hz}$), 8.07 (1H, d, $J=9.0\text{Hz}$), 8.87 (1H, brs), 9.48 (1H, brs), 13.21 (1H, brs)。

30

【0320】

参考例 35

5-(3-クロロプロポキシ)-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチルの合成

5-ヒドロキシ-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチル 0.83 g (5.3 ミリモル) の DMF 溶液 (5 ml) に炭酸セシウム 2.08 g (6.4 ミリモル) 及び 1-ブロモ-3-クロロプロパン (1.6 ml) を加えて、室温で 21 時間攪拌した。反応液に水を加えて、酢酸エチルで抽出し、有機層を水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。この反応液を減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (n -ヘキサン: 酢酸エチル = 100 : 1 $\rightarrow$ 4 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色固体の 5-(3-クロロプロポキシ)-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチル 1.17 g を得た。

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.21-2.32(2H, m), 3.72(2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 3.72(2H, s), 3.91(3H, s), 4.24(2H, t, $J=5.8\text{Hz}$), 6.10(1H, s)。

【0321】

参考例 36

7-(3-クロロプロポキシ)-2H-1, 4-ベンゾオキサジン-3(4H)-オンの合成

7-ヒドロキシ-2H-1, 4-ベンゾオキサジン-3(4H)-オン及び 1-ブロモ-3-クロロプロパンを用い、参考例 35 と同様にして目的化合物を得た。

淡褐色針状晶 (エタノール- n -ヘキサン)

融点 119-120°C。

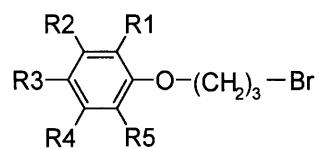
50

【 0 3 2 2 】

適当な出発物質を用い、上記参考例 1 ～ 3 6 と同様にして、下記表 1 ～ 表 1 2 の化合物を製造した。

【 0 3 2 3 】

【表 1】



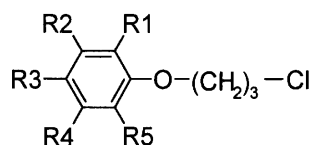
参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
37	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm : 1.25(3H, t, J=7.5Hz), 2.29-2.39 (2H, m), 3.43-3.54(2H, m), 3.61 (2H, t, J = 6.3Hz), 4.15 (2H, t, J = 5.8Hz), 5.99(1H, br), 6.89-6.95 (2H, m), 7.70-7.75 (2H, m)
38	-H	-H	-CONHC ₃ H ₇	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 0.99(3H, t, J=7.5Hz), 1.57-1.68(2H, m), 2.23-2.36 (2H, m), 3.37-3.45(2H, m), 3.61 (2H, t, J = 6.3Hz), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.12-4.18 (2H, m), 6.02(1H, br), 6.71-6.95 (2H, m), 7.71-7.75 (2H, m)

10

【 0 3 2 4 】

20

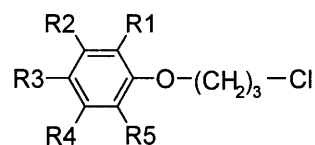
【表 2】



参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
39	-H	-H	-NO ₂	-H	-F	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.20-2.45 (2H, m), 3.70-3.80 (2H, m), 4.30-4.35 (2H, m), 7.07 (1H, dd, J=8.2, 8.9 Hz), 8.00 (1H, dd, J=2.7, 10.7 Hz), 8.07 (1H, dd, J=0.9, 9.0Hz).
40	-H	-H	-NH ₂	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.14-2.24 (2H, m), 3.26(2H, br), 3.73(2H, t, J=6.3Hz), 4.04(2H, t, J=5.8Hz), 6.61-5.67(2H, m), 6.72-6.78(2H, m)
41	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.15-2.25 (2H, m), 3.74 (2H, t, J = 6.3Hz), 3.76(3H, s), 4.09 (2H, t, J = 5.8Hz), 6.42(1H, br), 6.85 (2H, dd, J = 2.5, 6.8Hz), 7.21-7.33 (2H, m)
42	-H	-H	-CH ₂ CON(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.07-1.14(6H, m), 2.17-2.30 (2H, m), 3.26-3.42(4H, m), 3.63 (2H, s), 3.74 (2H, t, J = 6.3Hz), 4.09(2H, t, J=5.8Hz), 6.83-6.88 (2H, m), 7.14-7.19 (2H, m)
43	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.28-2.37 (2H, m), 3.74(2H, t, J=6.5Hz), 3.77 (3H, s), 4.11 (2H, t, J = 6.0Hz), 6.50-6.67 (2H, m), 6.83(1H, dd, J=1.5Hz, 7.8Hz), 7.16-7.22 (2H, m)
44	-H	-H	-NHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.37 (3H, t, J=7.4 Hz), 2.15-2.30 (2H, m), 3.07 (2H, q, J=7.4 Hz), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.10 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.41 (1H, brs), 6.88 (2H, dt, J=8.9, 3.4 Hz), 7.19 (2H, dt, J=8.9, 3.4 Hz).
45	-H	-H	-NH ₂	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 3.20-3.70 (2H, br), 3.75-3.95 (2H, m), 3.83(3H, s), 4.07 (2H, t, J=3 Hz), 6.24 (1H, dd, J=2.6, 8.4 Hz), 6.33 (1H, d, J=2.7 Hz), 6.77 (1H, d, J=8.4Hz).
46	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.77 (3H, s), 3.86 (3H, s), 4.13 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.55 (1H, brs), 6.73 (1H, dd, J=2.4, 8.6 Hz), 6.84 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.20 (1H, brs).
47	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.23 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.20-2.30 (2H, m), 3.40-3.50 (2H, m), 3.74 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.13 (1H, brs), 6.85-6.95 (2H, m), 7.70-7.75 (2H, m).
48	-H	-H	-NHCON(CH ₃) ₂	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.15-2.25 (2H, m), 3.02 (6H, s), 3.74 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.08 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.20 (1H, brs), 6.84 (2H, dd, J=2.0, 6.8 Hz), 7.26 (2H, dd, J=2.1, 6.8 Hz).
49	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Cl	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.39(3H, t, J=7.0Hz), 2.27-2.37 (2H, m), 3.81(2H, t, J=6.8Hz), 4.25(2H, t, J=6.3Hz), 4.36(2H, q, J=7.0Hz), 6.96(1H, d, J=8.5Hz), 7.93(1H, dd, J=2.0Hz, 8.5Hz), 8.06(1H, d, J=2.0Hz)

【 0 3 2 5 】

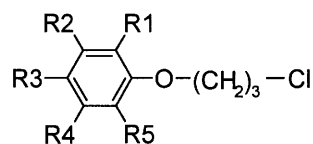
【表 3】



参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	
50	-H	-H	$-CH_2CO_2C_2H_5$	-H	-Cl	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.26(3H, t, J=7.0Hz), 2.23-2.33 (2H, m), 3.52(2H, s), 3.80(2H, t, J=6.3Hz), 4.15(2H, q, J=7.0Hz), 6.90(1H, d, J=8.3Hz), 7.13(1H, dd, J=2.0Hz, 8.3Hz), 7.30(1H, d, J=2.0Hz)	10
51	-H	-H	$-CH_2CONHCH_3$	-H	-H	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 2.19-2.29(2H, m), 2.76(3H, d, J=4.8Hz), 3.52(2H, s), 3.76(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 5.35(1H, br), 6.86-6.92(2H, m), 7.13-7.18(2H, m)	
52	-H	-H	$-CH_2CH_2NHCH_3$	-H	-H	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 2.18-2.27 (2H, m), 2.43(2H, s), 2.72-2.83(4H, m), 3.71(3H, s), 3.75(4H, t, J=6.3Hz), 4.09(2H, t, J=5.8Hz), 6.83-6.86(2H, m), 7.10-7.14(2H, m)	
53	-H	-H	$-(CH_2)_2N(CH_3)CO_2C(CH_3)_3$	-H	-H	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.42(9H, s), 2.17-2.27 (2H, m), 2.67-2.86(5H, m), 3.35-3.41(2H, m), 3.74(2H, t, J=6.3Hz), 4.09(2H, t, J=5.8Hz), 6.83(2H, d, J=8.5Hz), 7.00-7.16(2H, m)	20
54	-H	-H	$-NH_2$	-H	-F	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 2.15-2.25 (2H, m), 3.54 (2H, brs), 3.76 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.05-4.15 (2H, m), 6.35-6.40 (1H, m), 6.46 (1H, dd, J=0.9, 12.6 Hz), 6.82 (1H, dd, J=8.5, 8.5Hz)	
55	-H	-H	$-NHCO_2CH_3$	-H	-F	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.77 (2H, t, J=6.5 Hz), 3.77 (3H, s), 4.10-4.20 (2H, m), 6.57 (1H, brs), 6.85-7.00 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m)	
56	-H	-H	$-CH_2CO_2C_2H_5$	-H	-F	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.26(3H, t, J=7.0Hz), 2.21-2.30 (2H, m), 3.5382H, s), 3.77(2H, t, J=6.3Hz), 4.11-4.20(4H, m), 6.89-7.06(3H, m)	30
57	-H	-H	$-CO_2C_2H_5$	-H	-Br	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.39(3H, t, J=7.0Hz), 2.27-2.37 (2H, m), 3.82(2H, t, J=6.3Hz), 4.24(2H, t, J=5.8Hz), 4.35(2H, q, J=7.0Hz), 6.92(1H, d, J=8.5Hz), 7.98(1H, dd, J=2.0Hz, 8.5Hz), 8.23(1H, d, J=2.0Hz)	
58	-H	-H	$-CHO$	$-OCH_3$	-H	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 2.23-2.34 (2H, m), 3.76(2H, t, J=6.3Hz), 3.91(3H, s), 4.20(2H, t, J=5.8Hz), 6.46(1H, d, J=2.0Hz), 6.56(1H, dd, J=2.0Hz, 8.3Hz), 7.81(1H, d, J=8.3Hz), 10.29(1H, s)	40
59	-H	-H	$-CO_2C_2H_5$	-H	$-NO_2$	^1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 1.41(3H, t, J=7.0Hz), 2.26-2.40(2H, m), 3.81(2H, t, J=6.3Hz), 4.32-4.44(4H, m), 7.15(1H, d, J=8.8Hz), 8.22(1H, dd, J=2.0Hz, 8.8Hz), 8.52(1H, d, J=2.0Hz)	

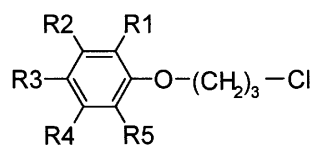
【 0 3 2 6 】

【表 4】



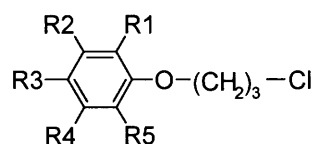
参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	
60	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-NO ₂	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.26 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.25-2.35 (2H, m), 3.45-3.55 (2H, m), 3.80 (2H, t, J=6.1 Hz), 4.30-4.35 (2H, m), 6.34 (1H, brs), 7.15 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.04 (1H, dd, J=2.3, 8.8 Hz), 8.25 (1H, d, J=2.3 Hz).	10
61	-H	-H	-CONH ₂	-OCH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.21-2.35 (2H, m), 3.75 (2H, t, J=6.3Hz), 3.95(3H, s), 4.18 (2H, t, J=5.8Hz), 5.67(1H, br), 6.51(1H, d, J=2.5Hz), 6.61(1H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.59 (1H, br), 8.18 (1H, d, J=8.8Hz)	
62	-H	-H	-CONHCH ₃	-OCH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.99(3H, d, J=5.0Hz), 3.75 (2H, t, J=6.3Hz), 3.94(3H, s), 4.17 (2H, t, J=6.0Hz), 6.49(1H, d, J=2.5Hz), 6.60(1H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.70 (1H, br), 8.19 (1H, d, J=8.8Hz)	
63	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-OCH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.23(3H, t, J=7.3Hz), 2.20-2.30 (2H, m), 3.43-3.54(2H, m), 3.75 (2H, t, J=6.3Hz), 3.94(3H, s), 4.17 (2H, t, J=6.3Hz), 6.49(1H, d, J=2.5Hz), 6.60(1H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.70 (1H, br), 8.18 (1H, d, J=8.8Hz)	20
64	-H	-H	-CONHCH ₂ CF ₃	-OCH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.21-2.31 (2H, m), 3.75 (2H, t, J=6.3Hz), 3.98(3H, s), 4.07-4.21 (4H, m), 6.51(1H, d, J=2.5Hz), 6.62(1H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 8.09 (1H, br), 8.18 (1H, d, J=8.8Hz)	
65	-H	-H	-CH=CHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.33(3H, t, J=7.0Hz), 2.20-2.30(2H, m), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.15(2H, t, J=5.8Hz), 4.25(2H, q, J=7.0Hz), 6.31(1H, d, J=16.0Hz), 6.88-6.93(2H, m), 7.44-7.50(2H, m), 7.64(1H, d, J=16.0Hz)	30
66	-F	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 2.25-2.34 (2H, m), 3.78(2H, t, J=6.3Hz), 4.25(2H, t, J=5.8Hz), 4.37(2H, q, J=7.0Hz), 7.08-7.15(1H, m), 7.62-7.70(2H, m)	
67	-H	-H	-CO ₂ H	-CH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.21-2.31 (2H, m), 2.64(3H, s), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.18(2H, t, J=5.8Hz), 6.77-6.81(2H, m), 8.06(1H, d, J=9.5Hz), 11.00(1H, br)	
68	-Cl	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 2.25-2.37 (2H, m), 3.82(2H, t, J=6.3Hz), 4.25(2H, t, J=5.8Hz), 4.38(2H, q, J=7.0Hz), 7.42(1H, d, J=8.5Hz), 7.58-7.62(2H, m)	40
69	-CH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.39(3H, t, J=7.0Hz), 2.24-2.34 (2H, m), 2.26(3H, s), 3.78(2H, t, J=6.3Hz), 4.19(2H, t, J=5.8Hz), 4.37(2H, q, J=7.0Hz), 7.19(1H, d, J=7.8Hz), 7.49(1H, d, J=1.5Hz), 7.57(1H, dd, J=1.5Hz, 7.8Hz)	

【表 5】



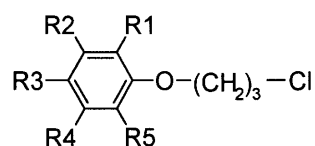
参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	
70	-H	-H	-CONH ₂	-CH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.19-2.29 (2H, m), 2.51(3H, s), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.14(2H, t, J=6.3Hz), 6.53(2H, br), 6.71(2H, m), 7.45 (1H, d, J=8.3Hz)	10
71	-H	-H	-CONHCH ₃	-CH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.18-2.28 (2H, m), 2.45(3H, s), 2.98(3H, d, J=4.9Hz), 3.74(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 5.72(1H, br), 6.68-6.75(2H, m), 7.32 (1H, d, J=8.3Hz)	
72	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-CH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.24(3H, t, J=7.3Hz), 2.19-2.28 (2H, m), 2.45(3H, s), 3.41-3.52(2H, m), 3.74(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=6.0Hz), 5.68(1H, br), 6.68-6.75(2H, m), 7.32 (1H, d, J=8.3Hz)	
73	-CH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.38(3H, t, J=7.0Hz), 2.21-2.28 (2H, m), 2.31(6H, s), 3.84(2H, t, J=6.3Hz), 3.93(2H, t, J=5.8Hz), 4.35(2H, t, J=7.0Hz), 7.72(2H, s)	20
74	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.39(3H, t, J=7.1Hz), 2.26-2.36 (2H, m), 3.78(2H, t, J=6.3Hz), 3.91(3H, s), 4.22(2H, t, J=5.8Hz), 4.36(2H, q, J=7.1Hz), 6.89(1H, d, J=8.3Hz), 7.58(1H, d, J=2.0Hz), 7.70 (1H, d, J=8.3Hz)	
75	-OCH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.40(3H, t, J=7.0Hz), 2.13-2.23 (2H, m), 3.85(2H, t, J=6.3Hz), 3.90(6H, s), 4.17(2H, t, J=5.8Hz), 4.38(2H, q, J=7.0Hz), 7.30(2H, s)	30
76	-CH ₃	-H	-CHO	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.17-2.29 (2H, m), 2.34(3H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.91(3H, s), 4.18(2H, t, J=5.8Hz), 7.31(1H, s), 9.86(1H, s)	
77	-CH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.18-2.28 (2H, m), 2.32(6H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.90(3H, s), 4.16(2H, t, J=5.8Hz), 7.50(1H, d, J=2.0Hz), 7.60(1H, d, J=2.0Hz)	
78	-CH ₃	-H	-CONH ₂	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.17-2.27 (2H, m), 2.30(3H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.89(3H, s), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 5.24-6.26(2H, br), 7.15(1H, d, J=2.0Hz), 7.32 (1H, d, J=2.0Hz)	40
79	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.17-2.26 (2H, m), 2.29(3H, s), 3.00(3H, d, J=5.0Hz), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.88(3H, s), 4.10(2H, t, J=5.8Hz), 6.06(1H, br), 7.08(1H, d, J=1.9Hz), 7.28 (1H, d, J=1.9Hz)	

【表 6】



参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	
80	-CH ₃	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.25(3H, t, J=7.3Hz), 2.17-2.26 (2H, m), 2.30(3H, s), 3.43-3.54(2H, m), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.89(3H, s), 4.10(2H, t, J=5.8Hz), 6.02(1H, br), 7.07(1H, d, J=2.0Hz), 7.28 (1H, d, J=2.0Hz)	10
81	-CH ₃	-H	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.51(9H,s), 2.14-2.26 (2H, m), 2.23(3H, s), 3.82(2H, t, J=6.3Hz), 3.83(3H, s), 3.99(2H, t, J=5.8Hz), 6.34(1H, br), 6.59(1H, d, J=2.5Hz), 7.01(1H, d, J=2.5Hz)	
82	-CH ₃	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.17-2.29 (2H, m), 2.30(3H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.89(6H, s), 4.13(2H, t, J=5.8Hz), 7.44(1H, d, J=2.0Hz), 7.51 (1H, d, J=2.0Hz)	
83	-CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 2.29 (3H, s), 3.75-3.90 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 4.13 (2H, t, J=5.9 Hz), 7.43 (1H, d, J=1.8 Hz), 7.50 (1H, d, J=1.4Hz).	20
84	-CH ₃	-H	-NH ₂	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.14-2.22 (2H, m), 2.19(3H, s), 3.47(2H, br), 3.82(2H, t, J=5.3Hz), 3.95(2H, t, J=4.8Hz), 6.09-6.13(2H, m)	
85	-CH ₃	-H	-NHCOCH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.11-2.28 (2H, m), 2.15(3H, s), 2.24(3H, s), 3.82(2H, t, J=6.3Hz), 3.83(3H, s), 4.01(2H, t, J=5.8Hz), 6.66(1H, d, J=2.1Hz), 7.02(1H, br), 7.23 (1H, d, J=2.1Hz)	
86	-CH ₃	-H	-CHO	-H	-OCOCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.17-2.27(2H, m), 2.37(6H, s), 3.79(2H, t, J=5.6Hz), 4.11(2H, t, J=5.8Hz), 7.46(1H, d, J=2.0Hz), 7.62(1H, d, J=2.0Hz), 9.88(1H, s)	30
87	-CH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-OCOCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.16-2.26(2H, m), 2.35(3H, s), 2.36(3H, s), 3.79(2H, t, J=6.3Hz), 4.09(2H, t, J=5.8Hz), 7.67(1H, d, J=2.0Hz), 7.84(1H, d, J=2.0Hz)	
88	-OH	-H	-CONHCH ₃	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.21-2.35(2H, m), 2.32(3H, s), 2.99(3H, d, J=4.9Hz), 3.85(2H, t, J=6.3Hz), 4.05(2H, t, J=5.8Hz), 5.90(1H, br), 6.02(1H, br), 7.15(1H, d, J=1.8Hz), 7.20(1H, d, J=2.0Hz)	
89	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OC ₂ H ₅	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.46(3H, t, J=7.0Hz), 2.17-2.27 (2H, m), 2.28(3H, s), 2.99(3H, d, J=5.0Hz), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 4.06-4.15(4H, m), 6.04(1H, br), 7.07(1H, d, J=1.8Hz), 7.25 (1H, d, J=1.8Hz)	40
90	-H	-H	-CO ₂ H	-OCH ₃	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.22-2.32 (2H, m), 3.75(2H, t, J=6.3Hz), 4.05(3H, s), 4.21(2H, t, J=5.8Hz), 6.55(1H, d, J=2.5Hz), 6.66(1H, d, J=8.8Hz), 8.14(1H, d, J=8.8Hz), 10.43(1H, br)	

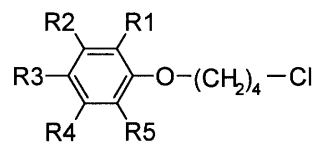
【表 7】



参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
91	-H	-H		-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.2-2.3 (2H, m), 3.77 (2H, t, J = 6.3Hz), 4.16 (2H, t, J = 5.8Hz), 7.00 (2H, dd, J = 2.2, 6.7Hz), 7.15-7.25 (2H, m), 7.25-7.35 (2H, m), 7.76 (1H, s).
92	-H	-H		-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.26 (2H, t, J=6.1 Hz), 3.75 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.15 (2H, t, J=5.7 Hz), 7.00 (1H, dd, J=2.1, 6.9 Hz), 7.56 (1H, dd, J=2.2, 7.1 Hz), 8.07 (1H, s), 8.45(1H, s).
93	-H	-H		-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.70-1.90 (4H, m), 2.10-2.40 (3H, m), 2.45 (3H, s), 3.55-3.75 (2H, m), 3.90-3.95 (2H, m), 4.05-4.15 (2H, m), 6.84 (2H, dd, J=1.9, 6.8 Hz), 7.06 (2H, dd, J=1.8, 6.9 Hz), 7.34 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.2 Hz).
94	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.16-2.25 (2H, m), 2.28(3H, s), 3.83(2H, t, J=6.3Hz), 3.86(3H, s), 3.99-4.06(4H, m), 4.46(2H, dd, J=6.3Hz, 8.8Hz), 6.61(1H, d, J=2.5Hz), 7.33 (1H, d, J=2.5Hz).
95	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.09-2.28 (2H, m), 2.61(2H, t, J=7.8Hz), 3.79-3.87(4H, m), 3.88(3H, s), 4.13(2H, t, J=5.5Hz), 4.71(2H, d, J=5.8Hz), 6.85(1H, d, J=2.5Hz), 7.59 (1H, d, J=2.5Hz).
96	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.05-2.25 (4H, m), 2.27(3H, s), 2.60(2H, t, J=8.3Hz), 3.79-3.89(4H, m), 3.86(3H, s), 6.71(1H, d, J=2.5Hz), 7.37 (1H, d, J=2.5Hz).

【0330】

【表 8】



参考例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR
97	-H	-H	-H	-NO ₂	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.93-2.11 (4H, m), 3.59-3.70(2H, m), 4.00-4.13(2H, m), 7.20-7.24(1H, m), 7.43(1H, t, J=8.0Hz), 7.72(1H, t, J=2.3Hz), 7.80-7.84(1H, m)
98	-H	-H	-H	-CN	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.96-2.00 (4H, m), 3.60-3.65 (2H, m), 3.99-4.14(2H, m), 7.10-7.14 (2H, m), 7.22-7.26 (1H, m), 7.34-7.40 (1H, m)

10

【 0 3 3 1 】

【表 9】

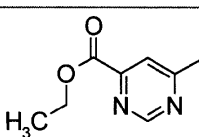
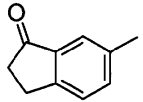
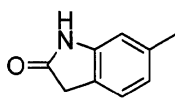
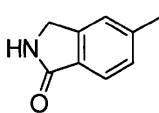
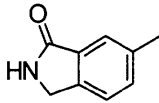
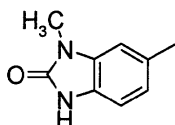
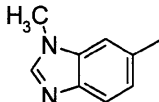
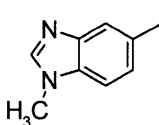
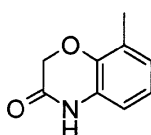
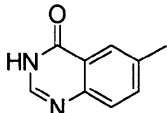
R1-O-(CH₂)₃-Cl

参考例 R1	NMR
99	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 3.72 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.87 (3H, s), 4.05-4.15 (2H, m), 6.55 (1H, d, J=1.8 Hz), 7.42 (1H, d, J=1.8 Hz).
100	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.21-2.31(2H, m), 3.70(2H, t, J=6.3Hz), 3.95(3H, s), 4.46(2H, t, J=6.0Hz), 6.54(1H, s)
101	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.21-2.32(2H, m), 3.72(2H, t, J=6.3Hz), 3.72(2H, s), 3.91(3H, s), 4.24(2H, t, J=5.8Hz), 6.10(1H, s)
102	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.39(3H, t, J=7.0Hz), 1.39(3H, t, J=7.3Hz), 2.22-2.32(2H, m), 3.71(2H, t, J=6.3Hz), 4.10(2H, q, J=7.3Hz), 4.24(2H, t, J=5.8Hz), 4.39(2H, q, J=7.0Hz), 6.08(1H, s)
103	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.20-2.29(2H, m), 2.46(3H, s), 3.72(2H, t, J=6.3Hz), 4.12(2H, t, J=5.8Hz), 6.84(1H, dd, J=2.5Hz, 8.8Hz), 7.13(1H, d, J=8.8Hz), 8.07(1H, d, J=2.5Hz)
104	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.13(3H, s), 2.21-2.31(2H, m), 3.76(2H, t, J=6.3Hz), 4.18(2H, t, J=5.8Hz), 5.17(2H, s), 7.19-7.32(2H, m), 8.30(1H, d, J=2.5Hz)
105	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.27-2.36(2H, m), 3.77(2H, t, J=6.0Hz), 4.28(2H, t, J=5.8Hz), 7.33(1H, dd, J=2.5Hz, 8.5Hz), 7.97(1H, dd, J=2.5Hz, 8.5Hz), 8.44(1H, d, J=2.5Hz), 10.00(1H, s)
106	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.26(3H, t, J=7.3Hz), 2.24-2.34(2H, m), 3.55(2H, dq, J=6.0Hz, 7.3Hz), 3.77(2H, t, J=6.3Hz), 4.22(2H, t, J=5.8Hz), 7.29(1H, dd, J=2.3Hz, 8.8Hz), 7.83(1H, br), 8.18(1H, d, J=8.8Hz), 8.20(1H, d, J=2.3Hz)
107	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.25-2.34(2H, m), 3.77(2H, t, J=6.3Hz), 4.23(2H, t, J=5.8Hz), 5.48(1H, br), 7.31(1H, dd, J=2.3Hz, 8.8Hz), 7.68(1H, br), 8.16(1H, d, J=8.8Hz), 8.23(1H, d, J=2.3Hz)
108	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.24-2.34(2H, m), 3.73(2H, t, J=6.3Hz), 4.00(3H, s), 4.58(2H, t, J=6.0Hz), 8.28(1H, d, J=1.3Hz), 8.87(1H, d, J=1.3Hz)

【 0 3 3 2 】

【表 10】

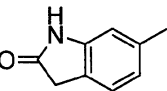
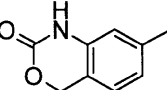
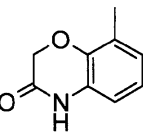
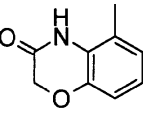
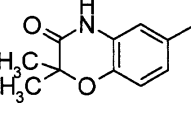
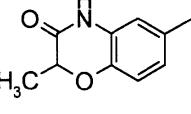
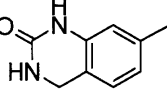
R1-O-(CH₂)₃-Cl

参考例 R1		NMR	
109		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.44(3H, t, J=7.0Hz), 2.22-2.31(2H, m), 3.72(2H, t, J=6.3Hz), 4.48(2H, q, J=7.0Hz), 4.59(2H, t, J=6.0Hz), 7.44(1H, d, J=1.0Hz), 8.90(1H, d, J=1.0Hz)	
110		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.70-2.75 (2H, m), 3.07 (2H, t, J=5.8 Hz), 3.74 (2H, t, J=6.4 Hz), 7.15-7.20 (2H, m), 7.37 (1H, d, J=8.2 Hz).	10
111		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.1-2.2 (2H, m), 3.37 (2H, s), 3.78 (2H, t, J=6.5Hz), 4.04 (2H, t, J=6Hz), 6.40 (1H, d, J=2.5Hz), 6.49 (1H, dd, J=2.5, 8Hz), 7.08 (1H, d, J=8Hz), 10.33 (1H, bs).	
112		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.27 (2H, t, J=6.1 Hz), 3.76 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.41 (2H, s), 6.96 (1H, s), 7.01 (1H, dd, J=2.2, 8.5 Hz), 7.17 (1H, brs), 7.77 (1H, d, J=8.4 Hz).	
113		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.27 (2H, t, J=6.1 Hz), 3.76 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.19 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.40 (2H, s), 6.50-6.60 (1H, br), 7.15 (1H, dd, J=2.3, 8.5 Hz), 7.35-7.40 (2H, m).	20
114		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.20-2.35 (2H, m), 3.39 (3H, s), 3.75-3.80 (2H, m), 4.05-4.15 (2H, m), 6.55-6.65 (2H, m), 6.98 (1H, d, J=7.5 Hz), 9.92 (1H, brs).	
115		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.28 (2H, t, J=6.0 Hz), 3.75-3.80 (5H, m), 4.18 (2H, t, J=5.7 Hz), 6.85 (1H, d, J=2.1 Hz), 6.90-6.95 (1H, m), 7.66 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.76 (1H, s).	
116		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 3.78 (2H, t, J=6.9 Hz), 3.82 (3H, s), 4.18 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.97 (1H, dd, J=2.3, 8.8 Hz), 7.25-7.30 (2H, m), 7.81 (1H, s).	30
117		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.20-2.35 (2H, m), 3.77 (2H, t, J=6.2 Hz), 4.19 (2H, t, J=6.0 Hz), 4.66 (2H, s), 6.47 (1H, dd, J=7.9, 1.2 Hz), 6.67 (1H, dd, J=8.3, 1.1 Hz), 6.90 (1H, dd, J=8.2, 8.1 Hz), 8.29 (1H, brs).	
118		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.24 (2H, tt, J=6.2, 6.2 Hz), 3.70(2H, t, J=6.4 Hz), 3.77 (3H, s), 4.45 (2H, t, J=6.1 Hz), 6.70 (1H, d, J=8.9 Hz), 6.98 (1H, dd, J=8.9, 3.0 Hz), 7.35 (1H, d, J=3.0 Hz)	40

【0333】

【表 1 2】

R1-O-(CH₂)₄-Cl

参考例 R1	NMR
122 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.85-2.05 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.33 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.72 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.85 (1H, dt, J=0.8, 5.1 Hz), 7.56 (1H, dt, J=2.0, 8.4 Hz), 8.14 (1H, dd, J=5.1, 1.4 Hz).
123 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.95-2.05 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.2 Hz), 4.05 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.80 (2H, dd, J=4.8, 1.6 Hz), 8.43 (2H, dd, J=4.9, 1.5 Hz).
124 	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.75-1.9 (4H, m), 3.36 (2H, s), 3.70 (2H, t, J=6.5 Hz), 3.96 (2H, t, J=6 Hz), 6.38 (1H, d, J=2 Hz), 6.48 (1H, dd, J=2.5, 8 Hz), 7.07 (1H, d, J=8 Hz), 10.32 (1H, bs).
125 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.91-2.00 (4H, m), 3.62 (2H, t, J=6.2 Hz), 3.98 (2H, t, J=5.6 Hz), 5.26 (2H, s), 6.36 (1H, d, J=2.3 Hz), 6.57 (1H, dd, J=8.4, 2.3 Hz), 7.00 (1H, d, J=8.4 Hz), 8.08 (1H, br-s).
126 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.95-2.04 (4H, m), 3.61-3.65 (2H, m), 4.06-4.09 (2H, m), 4.66 (2H, s), 6.46 (1H, d, J=8.0 Hz), 6.63 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.89 (1H, dd, J=8.0, 8.3 Hz), 8.41 (1H, br).
127 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.80-2.00 (4H, m), 3.77 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.24 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.63 (2H, s), 6.55-6.70 (2H, m), 6.90 (1H, dd, J=8.4, 8.4 Hz), 8.00 (1H, brs).
128 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.52 (6H, s), 1.90-2.10 (4H, m), 3.63 (2H, t, J=6.3 Hz), 3.95 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.38 (1H, d, J=2.8 Hz), 6.50 (1H, dd, J=2.8, 8.7 Hz), 6.86 (1H, d, J=8.8 Hz), 8.57 (1H, brs).
129 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.56 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-2.10 (4H, m), 3.61 (2H, t, J=6.2 Hz), 3.94 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.59 (1H, q, J=6.8 Hz), 6.38 (1H, d, J=2.8 Hz), 6.49 (1H, dd, J=2.8, 8.7 Hz), 6.88 (1H, d, J=8.7 Hz), 8.60 (1H, brs).
130 	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.81-2.10 (4H, m), 3.54-3.70 (2H, m), 3.89-4.03 (2H, m), 4.47 (2H, brs), 5.02 (1H, brs), 6.22 (1H, d, J=2.4 Hz), 6.49 (1H, dd, J=8.3, 2.4 Hz), 6.86-7.00 (2H, m).

【0335】

実施例 1

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチルエステルの合成

5-(3-クロロプロポキシ)-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチルエステル 1.17 g (5.0ミリモル)、1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩 1.35 g (5.3ミリモル)、炭酸カリウム 1.74 g (12.6ミリモル)及びヨウ化ナトリウム 0.75 g (5.0ミリモル)をDMF 12 mlに加え、80℃で3時間攪拌した。この反応液を室温まで冷却し、水を加えて、酢酸エチルで抽出した。有機層を水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。この反応液を減圧下に濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマト (n-ヘキサン:酢酸エチル=7:3→ジクロロメタン:メタノール=100:3)で精製した。精製物を減圧下に濃縮して淡黄色油状物 1.97 gを得た。この油状物を室温で放置して固化したのでジイソプロピルエーテルで洗浄後、乾燥して白色粉末の5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]

シ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチルエステル 1.49 g を得た。

融点 109.0-110.5°C。

MS 414 (M^+)。

【0336】

実施例 2

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸の合成

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチルエステル 1.62 g (3.9ミリモル)のエタノール溶液 (10 ml) に 6 N-水酸化ナトリウム水溶液 2 ml を加えて室温で 4 日間攪拌した。氷冷下、反応液に 6 N-塩酸 2 ml を加えて攪拌した。反応液にジクロロメタンを加え、析出した沈殿をろ取し、ろ液を分液し、有機層を減圧下に濃縮した。ろ物と残渣を合わせて水で洗浄後乾燥して白色粉末の 5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 1.53 g を得た。

融点 114.5-118.0°C。

【0337】

実施例 3

N-メチル-5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド塩酸塩の合成

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 0.3 g (0.75ミリモル)のDMF溶液を氷冷し、トリエチルアミン 0.73 ml (5.2ミリモル)、メチルアミン塩酸塩 0.3 g (4.5ミリモル)、及びジエチルホスホロシアンデート (DEPC) 0.25 ml (1.4ミリモル)を加えて室温で 24 時間攪拌した。反応液にトリエチルアミン 0.73 ml (5.2ミリモル)、メチルアミン塩酸塩 0.3 g (4.5ミリモル)、及び DEPC 0.25 ml (1.4ミリモル)を加えて室温で 4 日間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。この反応液を減圧下に濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマト (n -ヘキサン:酢酸エチル=5:1→酢酸エチル)で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、4 N-塩化水素酢酸エチル溶液を加え、生成した不溶物をろ取し、乾燥して白色粉末の N-メチル-5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミド塩酸塩 0.24 g を得た。

融点 228.0-232.5°C (分解)。

【0338】

実施例 4

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボキサミドの合成

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸及び塩化アンモニウムを用い、実施例 3 と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末 (酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル)

融点 186.5-188.5°C。

【0339】

実施例 5

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5, N-ジメチルベンズアミドの合成

4-(3-クロロプロポキシ)-3-メトキシ-5, N-ジメチルベンズアミド及び 1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩を用い、実施例 1 と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末(酢酸エチル-メタノール)

融点 141.5-142.5℃。

【0340】

実施例6

N-メチル-2-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]チアゾール-4-カルボキサミド塩酸塩の合成

3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロパノール 0.2 g (0.7ミリモル) 及び N-メチル-2-クロロチアゾール-4-カルボキサミド 0.26 g (1.45ミリモル) の DMF 溶液 (2 ml) に氷冷下水素化ナトリウム (5.5%油性) 90 mg (2.2ミリモル) を加えた。この溶液を 80℃で1.5時間攪拌後、室温まで冷却し、反応液に水を加えて、酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル抽出液を水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(ジクロロメタン:酢酸エチル=5:1→酢酸エチル)で精製した。精製物を減圧下に濃縮後、残渣を酢酸エチルに溶解し、4N-塩化水素酢酸エチル溶液を加え、生成した不溶物をろ取り、乾燥して淡黄色粉末の N-メチル-2-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]チアゾール-4-カルボキサミド塩酸塩 0.24 g を得た。

融点 199.5-202.5℃。

【0341】

実施例7

2-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]チアゾール-4-カルボキサミドの合成

3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロパノール 0.2 g (0.7ミリモル) 及び 2-クロロチアゾール-4-カルボキサミドを用い、実施例6と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末(酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル)

融点 139.5-140.5℃。

【0342】

実施例8

{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}カルバミン酸 tert-ブチルエステルの合成

4-(3-クロロプロポキシ)-3-メトキシ-5-メチルフェニルカルバミン酸 tert-ブチルエステル及び 1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩を用い、実施例1と同様にして目的化合物を得た。

淡褐色油状物

¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm : 1.51(9H, s), 1.95-2.10 (2H, m), 2.24(3H, s), 2.66-2.81(6H, m), 3.14-3.31(2H, m), 3.84(3H, s), 3.95(2H, t, J=6.3Hz), 6.36(1H, br), 6.60(1H, d, J=2.5Hz), 6.87-6.92(1H, m), 7.01 (1H, d, J=2.0Hz), 7.24-7.31(1H, m), 7.37-7.44(2H, m), 7.55(1H, d, J=8.0Hz)

MS 511 (M⁺)。

【0343】

実施例9

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルアニリンの合成

{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}カルバミン酸 tert-ブチルエステル 2.18 g (4.3ミリモル) のメタノール溶液 (10 ml) に 6N-塩酸 3 ml を加えて室温で一晩攪拌した。60℃で15分攪拌後、室温まで冷却し、6N-水酸化ナトリウム水溶液を加えて中和した。反応混合物にジクロロメタンを加え、ジクロロメタン抽出物

を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝3：2→酢酸エチル）で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して淡黄色固体の4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルアニリン1.26 gを得た。

融点 155.0-158.0°C

MS 411 (M^+)。

【0344】

実施例10

N-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}ホルムアミド塩酸塩の合成

10

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルアニリン0.9 g (2.2ミリモル)を蟻酸エチル10 mlに加えて33時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却後、減圧下に濃縮した。得られた残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマト（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝5：1→酢酸エチル）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣の酢酸エチル溶液に4N-塩化水素酢酸エチル溶液を加え、生成した不溶物をろ取して白色粉末のN-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}ホルムアミド塩酸塩0.3 gを得た。

融点 247.5-253.0°C(分解)。

【0345】

20

実施例11

N-メチル-4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルアニリン塩酸塩の合成

N-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}ホルムアミド塩酸塩0.23 g (0.48ミリモル)に6N-水酸化ナトリウム水溶液を加え、ジクロロメタンで抽出した。ジクロロメタン抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。得られた残渣をテトラヒドロフラン(THF)5 mlに溶解し、氷冷下水素化リチウムアルミニウム30 mg (0.71ミリモル)を加えて15分加熱還流した。反応液を氷冷し、水0.03 ml、15%水酸化ナトリウム水溶液0.03 ml及び水0.09 mlをこの順に加えて攪拌した。不溶物をろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。得られた残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマト（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝5：1→3：1）で精製した。減圧下に濃縮し、残渣の酢酸エチル溶液に4N-塩化水素酢酸エチル溶液を加え、生成した不溶物をろ取して白色粉末のN-メチル-4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルアニリン塩酸塩63 mgを得た。

30

融点 239.5-244.0°C(分解)。

【0346】

実施例12

3-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}オキサゾリジン-2-オン塩酸塩の合成

40

3-[4-(3-クロロプロポキシ)-3-メトキシ-5-メチルフェニル]オキサゾリジン-2-オン及び1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩を用い、実施例1と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末(エタノール)

融点 247.5-251.0°C(分解)。

【0347】

実施例13

N-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロ

50

ロポキシ] - 3-メトキシ-5-メチルフェニル} アセトアミドの合成

N-[4-(3-クロロプロポキシ)-3-メトキシ-5-メチルフェニル]アセトアミド及び1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩を用い、実施例1と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末(酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル)

融点 121.5-122.0°C。

【0348】

実施例14

N-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}-N-メチルアセトアミド塩酸塩の合成

N-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}アセトアミド0.45g(0.99ミリモル)のDMF溶液(5ml)に氷冷下、水素化ナトリウム(55%油性)0.06g(1.3ミリモル)を加えて0°Cで15分撹拌した。反応液にヨウ化メチル0.07ml(1.1ミリモル)を加えて0°Cで1時間撹拌した。反応液にさらに水素化ナトリウム(55%油性)0.06g(1.3ミリモル)とヨウ化メチル0.07ml(1.1ミリモル)を加えて0°Cで2時間撹拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、水で洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した。この反応液を減圧下に濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマト(n-ヘキサン:酢酸エチル=5:1→酢酸エチル)で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣の酢酸エチル溶液に4N-塩化水素酢酸エチル溶液を加えて生成した不溶物をろ取して白色粉末のN-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}-N-メチルアセトアミド塩酸塩325mgを得た。

融点 230.0-234.0°C(分解)。

【0349】

実施例15

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-N,N-ジメチル-3-メトキシ-5-メチルアニリン塩酸塩の合成

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルアニリン0.32g(0.78ミリモル)のメタノール溶液(6ml)に氷冷下、ホルマリン(37%)0.29ml(3.9ミリモル)及び水素化シアノホウ素ナトリウム0.21g(3.1ミリモル)を加えて0°Cで15分撹拌した。反応液に酢酸0.18ml(3.1ミリモル)を加えて室温で1時間撹拌した。氷冷下、反応液に炭酸カリウム水溶液を加えて酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥した。この反応液を減圧下に濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマト(n-ヘキサン:酢酸エチル=11:1→3:1)で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣の酢酸エチル溶液に4N-塩化水素酢酸エチル溶液を加え、生成した不溶物をろ取して白色粉末の4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-N,N-ジメチル-3-メトキシ-5-メチルアニリン塩酸塩137mgを得た。

融点 234.5-240.5°C(分解)。

【0350】

実施例16

{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}カルバミン酸メチルエステル塩酸塩の合成

4-(3-クロロプロポキシ)-3-メトキシ-5-メチルフェニルカルバミン酸メチルエステル及び1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イルピペラジン塩酸塩を用い、実施例1と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末(酢酸エチル)

融点 230.0-235.5°C。

【0351】

実施例17

N-メチルー {4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-メトキシ-5-メチルフェニル} カルバミン酸メチルエステル塩酸塩の合成

{4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-メトキシ-5-メチルフェニル} カルバミン酸メチルエステル塩酸塩及びヨウ化メチルを用い、実施例14と同様にして目的化合物を得た。

白色粉末(酢酸エチル)

融点 228.0-233.5°C。

10

【0352】

実施例18

6-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン塩酸塩の合成

水素化リチウムアルミニウム 86 mg (2.3ミリモル) を THF 20 ml に懸濁し、アルゴン雰囲気下、これに 6-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-3-オン 0.8 g (1.9ミリモル) の THF 溶液 (10 ml) を滴下した。滴下終了後、1時間加熱還流した。氷冷下、反応液に水 0.1 ml、15% 水酸化ナトリウム水溶液 0.1 ml、水 0.3 ml を加えて攪拌した。不溶物をセライトろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (ジクロロメタン: メタノール = 1: 0 → 20: 1) で精製した。減圧下に濃縮後、残渣を酢酸エチル 10 ml に溶解し 1N-塩化水素エタノール溶液 0.34 ml を加えて室温で 15分攪拌した。析出した不溶物をろ取し、酢酸エチルで洗浄後、乾燥して白色固体の 6-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン塩酸塩 0.11 g を得た。

融点 207.9-208.8°C。

20

【0353】

実施例19

7-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン塩酸塩の合成

7-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン-3-オンを用い、実施例18と同様にして目的化合物を得た。

淡褐色固体(酢酸エチル)

融点 214.0-215.9°C。

30

【0354】

実施例20

7-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -4-メチルー 3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン塩酸塩の合成

7-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3, 4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン 0.30 g (0.67ミリモル) のメタノール溶液 (15 ml) にホルマリン (37%) 0.22 ml (2.7ミリモル) 及びMP-シアノボロヒドリド (2.41ミリモル/g) 1.12 g (2.7ミリモル) を加えて室温で一夜攪拌した。不溶物をろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト (ジクロロメタン: メタノール = 1: 0 → 50: 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮後、残渣を酢酸エチル 15 ml に溶解し、1N-塩化水素エタノール溶液 0.64 ml を加えて室温で 15分攪拌した。析出した不溶物をろ取し、酢酸エチルで洗浄後、乾燥して淡褐色固体の 7-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -4-メチルー 3, 4-ジヒドロ

40

50

ー2H-ベンゾ[1, 4]オキサジン塩酸塩0.23gを得た。

融点 248.1-249.6°C。

【0355】

実施例21

6-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン-4-オール塩酸塩及び6-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン塩酸塩の合成

6-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メチルキナゾリン0.25g(0.58ミリモル)のTHF溶液(20ml)を氷冷し、アルゴン雰囲気下、これに水素化リチウムアルミニウム26mg(0.69ミリモル)のTHF溶液(5ml)を滴下した。滴下終了後、溶液を室温で20分攪拌し、1時間加熱還流した。氷冷下、反応液に水0.03ml、15%水酸化ナトリウム水溶液0.03ml、水0.1mlを加えて攪拌した。不溶物をセライトろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマト(ジクロロメタン:メタノール=1:0→25:1)で精製した。精製物を減圧下に濃縮後、残渣を酢酸エチル5mlに溶解し、1N-塩化水素エタノール溶液0.189mlを加えて室温で15分攪拌した。析出した不溶物をろ取し、酢酸エチルで洗浄後、乾燥して白色固体の6-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン-4-オール塩酸塩87mgを得た。MS 438(M⁺)。

【0356】

上記のシリカゲルカラムクロマトにジクロロメタン-メタノール(10:1)の溶離液を通した。得られる溶出液を、減圧下に濃縮後、残渣を酢酸エチル5mlに溶解し1N-塩化水素エタノール溶液0.226mlを加え、室温で15分攪拌した。析出した不溶物をろ取し、酢酸エチルで洗浄後、乾燥して白色固体の6-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロキナゾリン塩酸塩49mgを得た。

融点 203.1-204.4°C。

【0357】

実施例22

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール塩酸塩の合成

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1H-インドール228mg(0.71ミリモル)のトリフルオロ酢酸溶液(5ml)にトリエチルシラン1.14ml(7.14ミリモル)を加えて50°Cで2時間攪拌した。減圧下に濃縮し、残渣をジクロロメタンに溶解した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、分液した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水、及び飽和食塩水の順で洗浄後、減圧下に濃縮した。得られた残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマト(n-ヘキサン:酢酸エチル=5:1→1:1)で精製した。精製物を減圧下に濃縮後、残渣を酢酸エチル5mlに溶解し1N-塩化水素エタノール溶液0.10mlを加えて室温で15分攪拌した。析出した不溶物をろ取し、酢酸エチルで洗浄後乾燥して白色固体の5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-2, 3-ジヒドロ-1H-インドール塩酸塩32mgを得た。

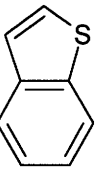
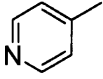
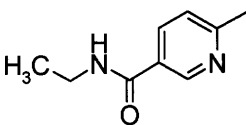
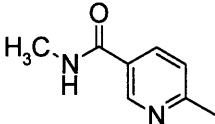
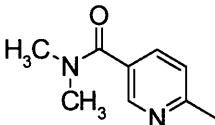
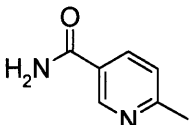
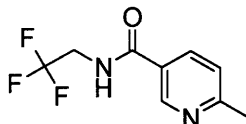
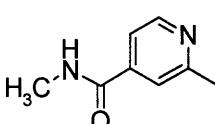
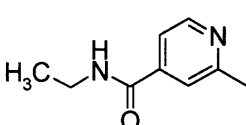
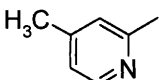
融点 222.4-223.9°C。

【0358】

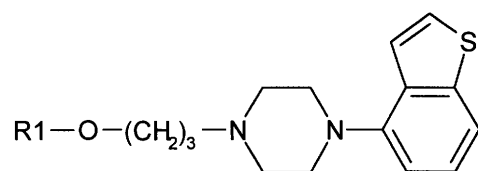
適当な出発物質を用いて、上記参考例1~36又は実施例1~22と同様にして、下記表13~表120の化合物を製造した。

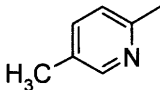
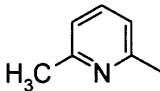
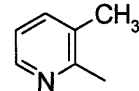
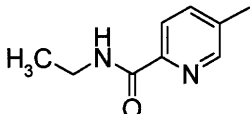
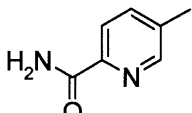
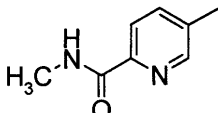
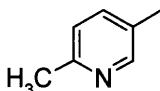
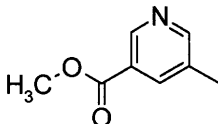
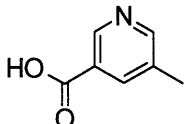
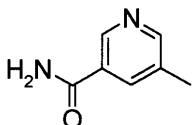
【0359】

【表 1 3】

R1—O—(CH ₂) ₃ —N				
実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
23		白色固体 (エタノール)	225-228	3 塩酸塩
24		白色針状晶 (エタノール— 酢酸エチル)	165.0-167.0	塩酸塩
25		白色粉末 (エタノール)	204-206	塩酸塩
26		白色粉末 (酢酸エチル)	201.5-207.5	塩酸塩
27		白色粉末 (酢酸エチル— イソプロピルエーテル)	132.5-133.5	—
28		白色粉末 (酢酸エチル)	205.5-208.0	塩酸塩
29		白色粉末 (2-プロパノール)	206.5-208.0	—
30		淡黄色粉末 (酢酸エチル)	201.5-204.0	塩酸塩
31		白色粉末 (酢酸エチル)	155.5-162.0	塩酸塩
32		白色粉末 (酢酸エチル)	140.0-141.5	塩酸塩
33		淡黄色粉末 (エタノール)	192-194	2 塩酸塩

【表 1 4】



実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点 (°C)	塩
34		淡黄色粉末 (エタノール)	201-203	2 塩酸塩
35		白色粉末 (エタノール)	201-203	塩酸塩
36		白色粉末 (エタノール)	214.0-215.0	塩酸塩
37		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	131.5-132.0	—
38		白色粉末 (酢酸エチル)	193.0-194.0	—
39		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	128.0-129.5	—
40		白色粉末 (エタノール)	234.0-236.0	塩酸塩
41		淡黄色粉末 (酢酸エチル)	224.0-226.0	2 塩酸塩
42		白色粉末 (水)	230.0 (分解)	塩酸塩
43		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	171.0-174.5	—

【 0 3 6 1 】

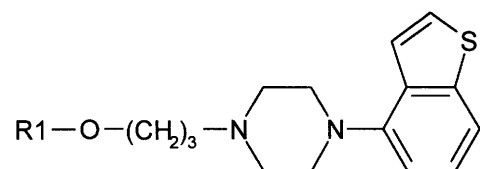
10

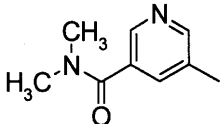
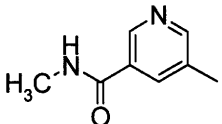
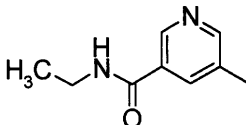
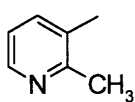
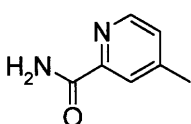
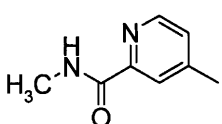
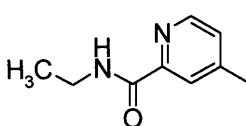
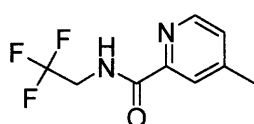
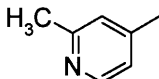
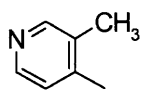
20

30

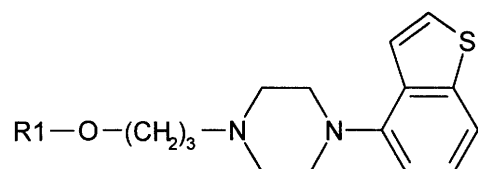
40

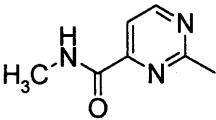
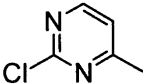
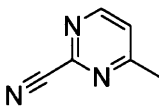
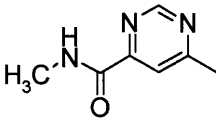
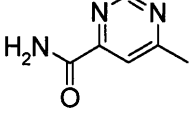
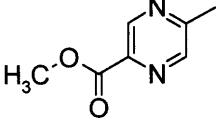
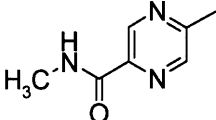
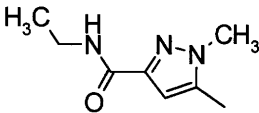
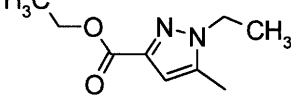
【表 1 5】



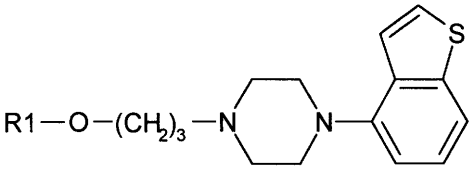
実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
44		淡黄色粉末 (酢酸エチル)	166.0 (分解)	2 塩酸塩
45		淡黄色粉末 (酢酸エチル)	198.5-204.0	2 塩酸塩
46		白色粉末 (酢酸エチル)	211.5-214.5	2 塩酸塩
47		白色粉末 (エタノール)	241.0-243.0	塩酸塩
48		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	150.0-150.5	—
49		白色粉末 (酢酸エチル)	199.0-200.5	2 塩酸塩
50		白色粉末 (酢酸エチル)	206.0-208.5	塩酸塩
51		白色粉末 (酢酸エチル)	208.0-213.0	塩酸塩
52		白色粉末 (エタノール)	157-159	塩酸塩
53		白色粉末 (エタノール)	197.0-199.0	2 塩酸塩

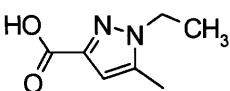
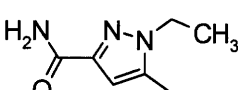
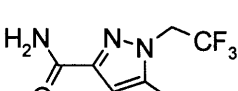
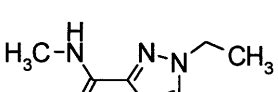
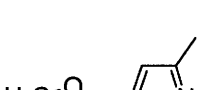
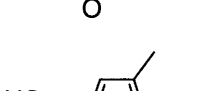
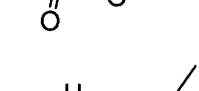
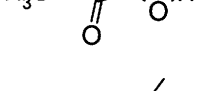
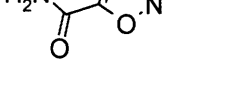
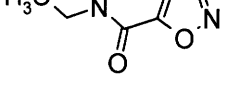
【表 16】



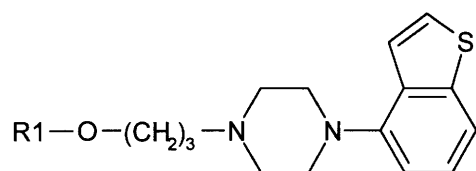
実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
54		白色粉末 (エタノール)	205-207	塩酸塩
55		白色粉末 (酢酸エチル)	178.0-182.5	塩酸塩
56		淡黄色粉末 (酢酸エチル)	191.5-195.5	塩酸塩
57		淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	112.0-115.5	—
58		白色粉末 (メタノール)	205.0-209.5	塩酸塩
59		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	149.5-151.0	—
60		淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	114.5-115.5	—
61		白色粉末 (メタノール)	116.5-118.0	—
62		白色粉末 (酢酸エチル)	210.5-214.5	塩酸塩
63		淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	109.0-110.0	—

【表 17】



実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
64		白色粉末 (エタノール-水)	129.0-131.0	—
65		白色粉末 (酢酸エチル)	247.5 (分解)	塩酸塩
66		白色粉末 (酢酸エチル)	231.0-234.0	塩酸塩
67		白色粉末 (酢酸エチル)	245.5 (分解)	塩酸塩
68		白色粉末 (酢酸エチル)	199.5-201.5	塩酸塩
69		白色粉末 (エタノール-水)	252.5-255.0 (分解)	—
70		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	131.5-132.5	—
71		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	167.5-169.0	—
72		白色粉末 (酢酸エチル)	219.5-222.5 (分解)	塩酸塩
73		淡黄色粉末 (酢酸エチル)	151.0-153.5	塩酸塩

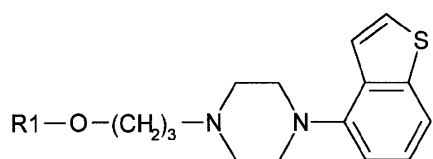
【表 1 8】



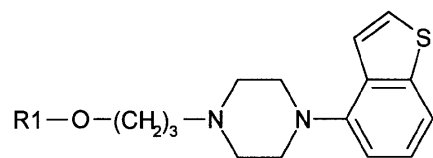
実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
74		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	138.5-140.0	—

【 0 3 6 5】

【表 1 9】



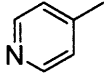
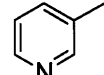
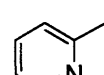
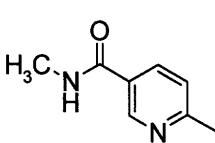
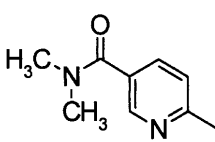
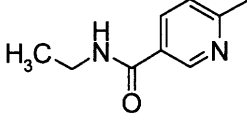
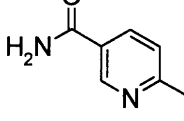
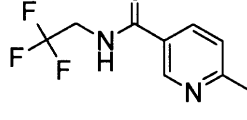
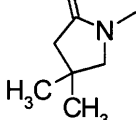
実施例	R1	NMR	塩
75		^1H -NMR (DMSO- d_6) δ ppm: 2.10-2.30 (2H, m), 2.80-3.90 (16H, m), 4.09 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.88 (1H, d, J=1.5 Hz), 6.96 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.17 (1H, d, J=1.4 Hz), 7.31 (1H, dd, J=7.8, 7.8 Hz), 7.48 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.70 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.6 Hz), 10.68 (1H, brs).	塩酸塩
76		^1H -NMR (CDCl $_3$) δ ppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.62 (2H, t, J=7.0 Hz), 2.65-2.80 (4H, m), 2.98 (3H, d, J=4.9 Hz), 3.15-3.25 (4H, m), 4.05 (2H, t, J=6.3 Hz), 5.94 (1H, brs), 6.43 (1H, d, J=1.8 Hz), 6.90 (1H, dd, J=1.4, 7.6 Hz), 7.15 (1H, d, J=1.7 Hz), 7.20-7.35 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz).	—
77		^1H -NMR (CDCl $_3$) δ ppm: 1.23 (3H, t, J=7.3 Hz), 1.95-2.05 (2H, m), 2.61 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.65-2.80 (4H, m), 3.10-3.30 (4H, m), 3.40-3.55 (2H, m), 4.04 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.01 (1H, brs), 6.43 (1H, d, J=1.6 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.16 (1H, d, J=1.7 Hz), 7.27 (1H, dd, J=7.8, 7.8 Hz), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz).	—
78		^1H -NMR (CDCl $_3$) δ ppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.63 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70-2.80 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 4.06 (2H, t, J=6.3 Hz), 5.74 (2H, brs), 6.51 (1H, d, J=1.7 Hz), 6.90 (1H, dd, J=0.5, 7.6 Hz), 7.19 (1H, d, J=1.7 Hz), 7.28 (1H, dd, J=7.8, 7.8 Hz), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz).	—



実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
79		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	183-186	塩酸塩

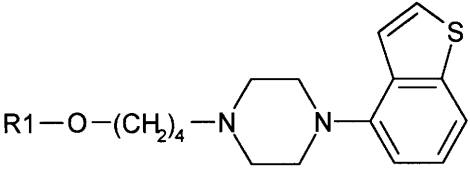
【 0 3 6 6】

【表 20】

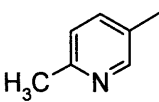
R1—O—(CH ₂) ₄ —N				
実施例 R1		結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
80		白色粉末 (エタノール— 酢酸エチル)	183.0-185.0	2 塩酸塩
81		白色粉末 (エタノール— 酢酸エチル)	205.0-207.0	塩酸塩
82		白色粉末 (エタノール— 酢酸エチル)	197.0-199.0	塩酸塩
83		白色粉末 (酢酸エチル)	166.5-168.0	塩酸塩
84		白色粉末 (酢酸エチル)	196.0-201.0	塩酸塩
85		白色粉末 (酢酸エチル)	175.0-176.0	塩酸塩
86		白色粉末 (酢酸エチル— イソプロピルエーテル)	150.0-154.5	—
87		白色粉末 (酢酸エチル)	172.0-175.0	塩酸塩
88		白色粉末 (酢酸エチル— エーテル)	201-205	塩酸塩

【0367】

【表 2 1】

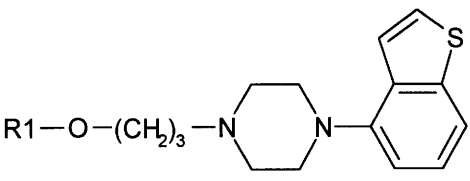


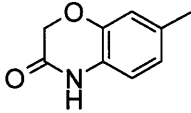
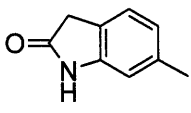
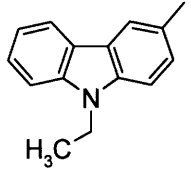
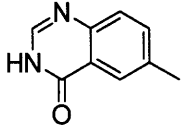
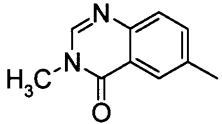
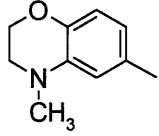
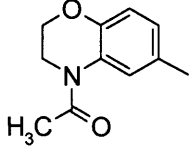
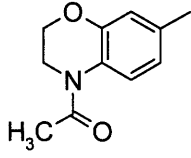
$R1-O-(CH_2)_4-N$ (piperazine ring) $-N$ (benzothiophene system)

実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
89		白色粉末 (エタノール)	195-197	塩酸塩
90		白色粉末 (エタノール)	190-192	塩酸塩

【 0 3 6 8 】

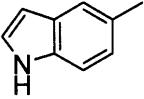
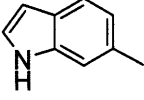
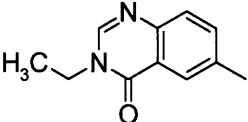
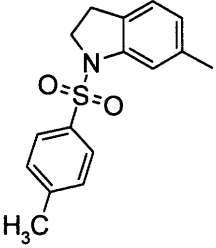
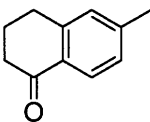
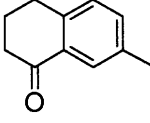
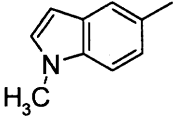
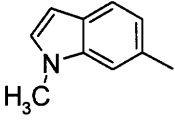
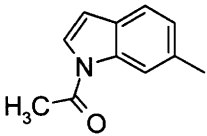
【表 2 2】



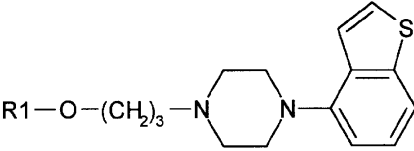
実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
91		白色粉末 (酢酸エチル)	149-150	—
92		微桃色粉末 (エタノール)	161-163	—
93		白色固体 (酢酸エチル)	226.8-229.0	塩酸塩
94		白色固体 (酢酸エチル)	213.1-218.5	—
95		白色固体 (酢酸エチル)	252.9-254.3	塩酸塩
96		白色固体 (酢酸エチル)	238.7-239.9	塩酸塩
97		白色固体 (酢酸エチル)	238.9-240.7	塩酸塩
98		淡褐色固体 (酢酸エチル)	218.4-220.4	塩酸塩

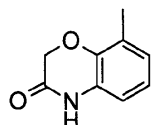
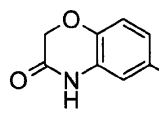
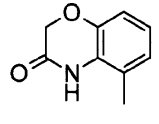
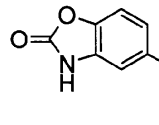
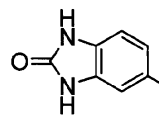
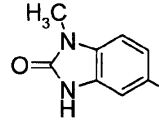
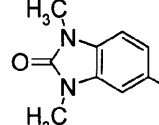
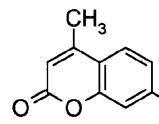
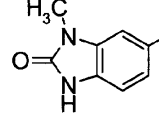
【 0 3 6 9 】

【表 2 3】

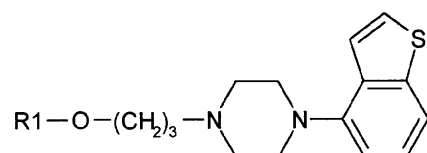
$\text{R1-O-(CH}_2\text{)}_3\text{-N}\begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array}\text{N}\begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array}\text{-}\begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array}\text{-}\begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array}\text{-S} \\ \text{Thienophene}$				
実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
99		白色固体 (酢酸エチル)	267.0-271.0	塩酸塩
100		白色固体 (酢酸エチル- ヘキサン)	143.8-145.2	—
101		白色固体 (酢酸エチル)	250.6-252.1	塩酸塩
102		白色固体 (酢酸エチル)	233.3-235.2	塩酸塩
103		白色固体 (エタノール- 酢酸エチル)	251.1-253.6	塩酸塩
104		白色固体 (酢酸エチル)	249.8-252.3	塩酸塩
105		白色固体 (酢酸エチル)	255.1-256.6	塩酸塩
106		白色固体 (酢酸エチル)	207.9-208.7	塩酸塩
107		白色固体 (酢酸エチル)	214.5-216.8	塩酸塩

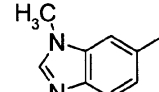
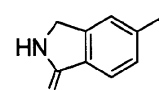
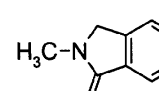
【表 2 4】



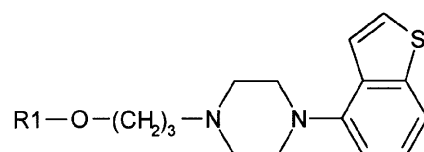
実施例	R1	NMR	塩
108		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.04-2.13 (2H, m), 2.65 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.73 (4H, br), 3.19 (4H, br), 4.15 (2H, t, J=6.6 Hz), 4.67 (2H, s), 6.42 (1H, dd, J=1.3, 8.0 Hz), 6.69 (1H, dd, J=1.3, 8.3 Hz), 6.87-6.92 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.42 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.84 (1H, br)	—
109		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.80-2.00 (2H, m), 2.45-2.55 (2H, m), 2.55-2.65 (4H, br), 3.00-3.10 (4H, br), 3.93 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.47 (2H, s), 6.45-6.55 (2H, m), 6.80-6.90 (2H, m), 7.26 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.38 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.60 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.67 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.59 (1H, s)	—
110		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.06 (2H, quint, J=6.5 Hz), 2.66 (2H, t, J=6.9 Hz), 2.70-2.80 (4H, m), 3.20-3.25 (4H, m), 4.12 (2H, t, J=6.1 Hz), 4.60 (2H, s), 6.55-6.70 (2H, m), 6.88 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.91 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.20-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.43 (1H, brs)	—
111		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.80-1.90 (2H, m), 2.41 (2H, t, J=6.6 Hz), 2.50-2.55 (4H, m), 2.95-3.00 (4H, m), 3.83 (2H, t, J=6.7 Hz), 6.47 (1H, dd, J=2.4, 8.6 Hz), 6.70 (1H, d, J=2.4 Hz), 6.85 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.09 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.27 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.36 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.60 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.67 (1H, d, J=5.6 Hz), 9.46 (1H, brs)	—
112		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.88 (2H, t, J=6.8 Hz), 2.50-2.55 (2H, m), 2.60 (4H, brs), 3.06 (4H, brs), 3.95 (2H, t, J=6.4 Hz), 6.45-6.55 (2H, m), 6.78 (1H, d, J=9.1 Hz), 6.88 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.26 (1H, dd, J=7.8, 7.8 Hz), 7.39 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.55-7.70 (2H, m), 10.35 (1H, brs), 10.49 (1H, brs)	—
113		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.45-2.55 (2H, m), 3.00-3.80 (11H, m), 4.06 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.60-6.70 (2H, m), 6.90-7.00 (2H, m), 7.33 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.67 (1H, brs), 10.81 (1H, brs)	2塩酸塩
114		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.00-2.10 (4H, m), 2.70-2.85 (6H, m), 3.20-3.25 (4H, m), 3.40 (6H, s), 4.097 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.61 (1H, d, J=2.2 Hz), 6.68 (1H, dd, J=2.3, 8.4 Hz), 6.85 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.92 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.25-7.35 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.57 (1H, d, J=8.0 Hz)	—
115		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.25-2.35 (2H, m), 2.40 (3H, s), 3.20-3.70 (10H, m), 4.22 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.22 (1H, s), 6.95-7.05 (3H, m), 7.31 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.49 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.65-7.80 (3H, m), 10.93 (1H, brs)	塩酸塩
116		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.00-2.10 (2H, m), 2.60-2.70 (2H, m), 2.75 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 3.39 (3H, s), 4.05-4.15 (2H, m), 6.55-6.70 (2H, m), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.96 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 9.12 (1H, brs)	—

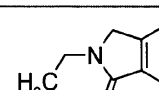
【表 2 5】



実施例	R1	NMR	塩
117		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.10 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70 (2H, t, J=7.4 Hz), 2.77 (4H, brs), 3.22 (4H, brs), 3.80 (3H, s), 4.14 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.85-7.00 (3H, m), 7.25-7.35 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.77 (1H, s).	—
118		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.07 (2H, t, J=7.0 Hz), 2.65 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.74 (4H, brs), 3.20 (4H, brs), 4.13 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.40 (2H, s), 6.38 (1H, brs), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.97 (1H, s), 7.02 (1H, dd, J=2.1, 8.4 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.78 (1H, d, J=8.4 Hz).	—
119		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.07 (2H, t, J=7.0 Hz), 2.66 (2H, t, J=5.7 Hz), 2.74 (4H, brs), 3.17 (3H, s), 3.20 (4H, brs), 4.12 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.31 (2H, s), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.90-7.00 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m), 7.39 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.41 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.74 (1H, d, J=8.4 Hz).	—

10



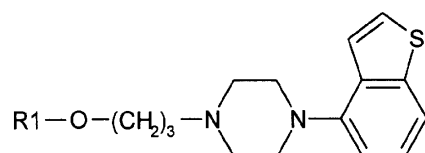
実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
120		白色粉末 (メタノール)	242-246	塩酸塩

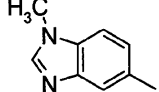
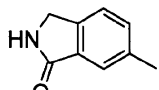
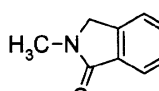
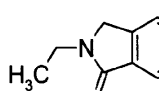
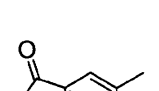
20

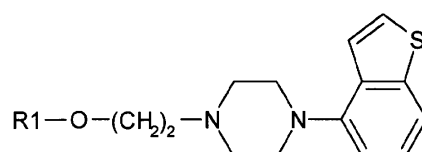
【 0 3 7 2 】

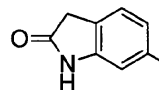
30

【表 2 6】



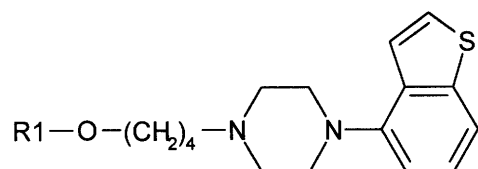
実施例	R1	NMR	塩
121		^1H -NMR (CDCl ₃) δppm: 2.08 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.69 (2H, t, J=7.4 Hz), 2.76 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 3.82 (3H, s), 4.13 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.91 (1H, d, J=6.3 Hz), 6.99 (1H, dd, J=2.3, 8.7 Hz), 7.25-7.35 (3H, m), 7.39 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.43 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.81 (1H, s).	—
122		^1H -NMR (CDCl ₃) δppm: 2.00-2.10 (2H, m), 2.65 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.74 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 4.13 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.40 (2H, s), 6.84 (1H, brs), 6.91 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.16 (1H, dd, J=2.3, 8.3 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (4H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz).	—
123		^1H -NMR (CDCl ₃) δppm: 2.06 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.65 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.74 (4H, brs), 3.20 (7H, brs), 4.12 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.31 (2H, s), 6.91 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.10 (1H, dd, J=2.4, 8.3 Hz), 7.25-7.35 (2H, m), 7.35 (1H, d, J=2.3 Hz), 7.39 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.42 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz).	—
124		^1H -NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.15 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.20-2.30 (2H, m), 3.15-3.30 (2H, m), 3.30-3.40 (4H, m), 3.45-3.70 (6H, m), 4.16 (2H, t, J=5.8 Hz), 4.39 (2H, s), 6.97 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.10-7.25 (2H, m), 7.31 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.45-7.55 (2H, m), 7.69 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.6 Hz), 10.74 (1H, brs).	塩酸塩
125		^1H -NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.64 (2H, t, J=5.8 Hz), 3.01 (2H, t, J=5.5 Hz), 3.20-3.40 (6H, m), 3.53 (2H, d, J=12.3 Hz), 3.64 (2H, d, J=11.2 Hz), 4.15 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.95 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.13 (1H, d, J=2.4 Hz), 7.25-7.35 (2H, m), 7.45-7.55 (2H, m), 7.69 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.75 (1H, d, J=5.6 Hz), 11.12 (1H, brs).	塩酸塩

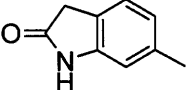
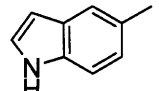
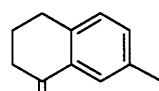
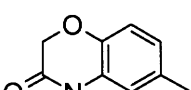
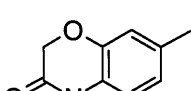
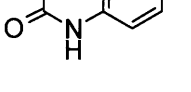
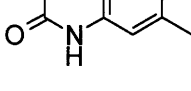
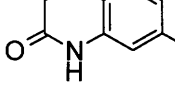
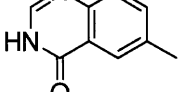


実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
126		赤褐色粉末 (アセトニトリル)	191-193	—

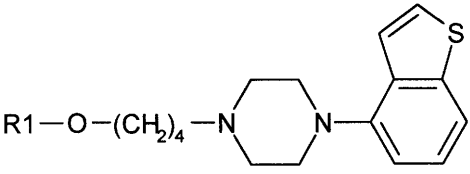
【 0 3 7 3 】

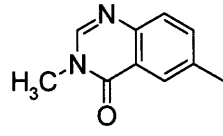
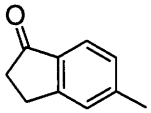
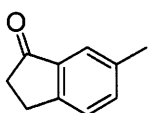
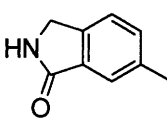
【表 2 7】



実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
127 	赤褐色粉末 (エタノール)	215-217	塩酸塩
128 	白色固体 (酢酸エチル)	209.2-210.9	塩酸塩
129 	白色固体 (エタノール- 酢酸エチル)	242.0-244.9	塩酸塩
130 	白色粉末 (エタノール)	211-213	塩酸塩
131 	微紫色粉末 (酢酸エチル)	180-182	—
132 	淡桃色粉末 (エタノール)	170.2-171.9	—
133 	白色粉末 (エタノール- 酢酸エチル)	253-258 (分解)	塩酸塩
134 	白色粉末 (2-プロパノール)	213.7-220.6	塩酸塩
135 	白色固体 (酢酸エチル)	152.6-155.3	塩酸塩
136 	白色粉末 (エタノール- 酢酸エチル)	226-228	塩酸塩

【表 2 8】



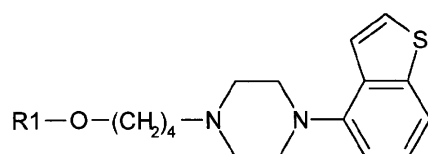
実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
137		白色固体 (酢酸エチル)	238.8-241.8	塩酸塩
138		白色粉末 (酢酸エチル- エーテル)	198-201	塩酸塩
139		白色粉末 (酢酸エチル- エーテル)	206-209	塩酸塩
140		白色粉末 (酢酸エチル- エーテル)	157-161	—

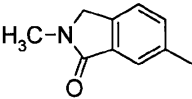
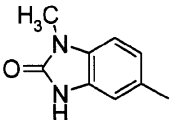
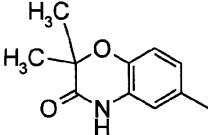
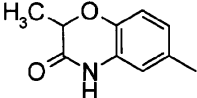
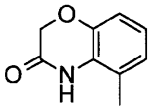
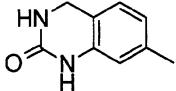
10

20

【 0 3 7 5 】

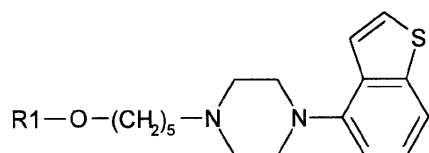
【表 2 9】

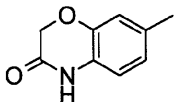
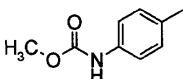
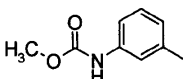


実施例	R1	NMR	塩
141		$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm: 1.75-1.85 (2H, m), 1.90-1.95 (2H, m), 3.05 (3H, s), 3.15-3.35 (6H, m), 3.55-3.65 (4H, m), 4.08 (2H, t, $J=6.1$ Hz), 4.36 (2H, s), 6.95 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 7.10-7.20 (2H, m), 7.30 (1H, dd, $J=7.9$, 7.9 Hz), 7.45-7.50 (2H, m), 7.69 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.75 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 10.75 (1H, brs).	2 塩酸塩
142		$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm: 1.70-1.80 (2H, m), 1.85-2.00 (2H, m), 3.22 (3H, s), 3.15-3.35 (6H, m), 3.45-3.60 (4H, m), 3.95 (2H, t, $J=6.1$ Hz), 6.60-6.65 (2H, m), 6.90-7.00 (2H, m), 7.30 (1H, dd, $J=7.9$, 7.9 Hz), 7.45-7.50 (1H, m), 7.68 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.75 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 10.82 (1H, s), 11.31 (1H, brs).	塩酸塩
143		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm: 1.52 (6H, s), 1.60-1.90 (4H, m), 2.53 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.70-2.80 (4H, m), 3.10-3.30 (4H, m), 3.97 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 6.37 (1H, d, $J=2.7$ Hz), 6.53 (1H, dd, $J=2.7$, 8.8 Hz), 6.85-6.95 (2H, m), 7.25-7.35 (2H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 8.06 (1H, s).	—
144		$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm: 1.37 (3H, d, $J=6.7$ Hz), 1.50-1.80 (4H, m), 2.41 (2H, t, $J=6.9$ Hz), 2.55-2.65 (4H, br), 3.90 (2H, t, $J=6.2$ Hz), 4.51 (1H, q, $J=6.7$ Hz), 6.45-6.50 (2H, m), 6.80-6.90 (2H, m), 7.25 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.38 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.59 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.67 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 10.53 (1H, s).	—
145		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm: 1.65-1.95 (4H, m), 2.53 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.70-2.75 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 4.08 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.61 (2H, s), 6.57 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 6.61 (1H, d, $J=8.3$ Hz), 6.85-6.95 (2H, m), 7.20-7.35 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.80 (1H, brs).	—
146		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm: 1.60-1.88 (4H, m), 2.51 (2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.63-2.77 (4H, m), 3.13-3.25 (4H, m), 3.95 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.46 (2H, s), 5.28 (1H, brs), 6.25 (1H, d, $J=2.4$ Hz), 6.50 (1H, dd, $J=8.4$, 2.4 Hz), 6.90 (1H, d, $J=7.7$ Hz), 6.92 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 7.27 (1H, dd, $J=7.8$, 8.0 Hz), 7.38 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 7.41 (1H, d, $J=5.5$ Hz), 7.51 (1H, brs), 7.54 (1H, d, $J=8.0$ Hz).	—

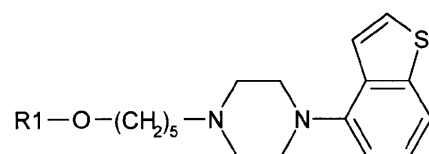
【 0 3 7 6 】

【表 3 0】

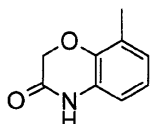
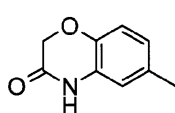
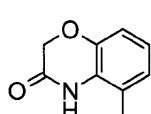


実施例	R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
147		白色粉末 (酢酸エチル)	143-144	—
148		淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	112.5-114.5	—
149		白色粉末 (酢酸エチル)	208.0-211.5	塩酸塩

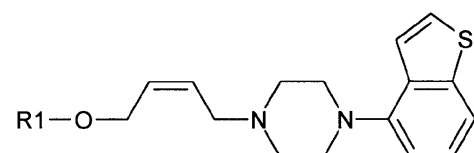
10

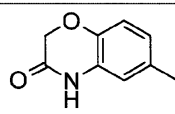


20

実施例	R1	NMR	塩
150		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.40-1.67 (2H, m), 1.73-1.90 (4H, m), 3.13-3.30 (6H, m), 3.52-3.62 (4H, m), 3.96-4.01 (2H, m), 4.54 (2H, s), 6.50 (1H, d, J=7.7 Hz), 6.67 (1H, d, J=7.3 Hz), 6.83-6.88 (1H, m), 6.96 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.28-7.34 (1H, m), 7.48 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.70 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.6 Hz), 10.42 (1H, br), 10.67 (1H, br)	塩酸塩
151		¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.40-1.60 (4H, m), 1.60-1.80 (2H, m), 2.35-2.45 (2H, m), 2.55-2.65 (4H, br), 3.90 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.49 (2H, s), 6.45-6.55 (2H, m), 6.80-6.95 (2H, m), 7.28 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.40 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.62 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.69 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.61 (1H, s)	—
152		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.45-1.70 (4H, m), 1.80-1.90 (2H, m), 2.45-2.55 (2H, m), 2.65-2.75 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 4.05 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.61 (2H, s), 6.50-6.65 (2H, m), 6.85-6.95 (2H, m), 7.20-7.35 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.80 (1H, brs)	—

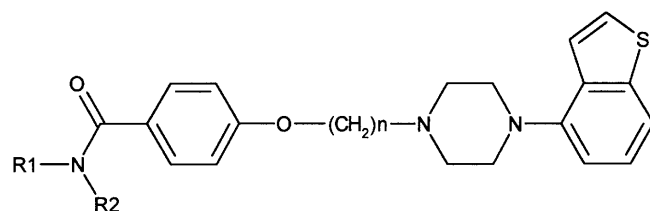
30



実施例	R1	NMR	塩
153		¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.73 (4H, m), 3.19-3.20 (6H, m), 4.56 (2H, s), 4.54-4.62 (2H, m), 5.76-5.92 (2H, m), 6.38 (1H, d, J=2.7 Hz), 6.54 (1H, dd, J=8.8, 2.7 Hz), 6.89-6.92 (2H, m), 7.25 (1H, m), 7.39-7.41 (2H, m), 7.53-7.56 (2H, m)	—

40

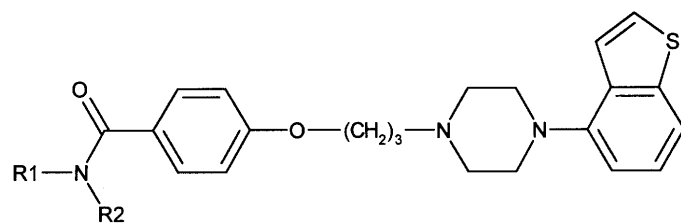
【表 3 1】



実施例	R1	R2	n	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
154	-H	-C ₂ H ₅	3	白色粉末 (酢酸エチル)	218.5-222.0 (分解)	塩酸塩
155	-H	-C ₃ H ₇	3	淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	127.0-128.5	—
156	-H	-CH ₃	3	淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	151.0-154.5	—
157	-CH ₃	-CH ₃	3	白色粉末 (酢酸エチル)	206.5-211.5	塩酸塩
158	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	3	白色粉末 (酢酸エチル)	205.5-209.0	塩酸塩
159	-H	-CH ₂ CF ₃	3	白色粉末 (酢酸エチル)	217.0 (分解)	塩酸塩
160	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	3	白色粉末 (酢酸エチル)	229.5-232.5	2 塩酸塩
161	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	3	白色粉末 (酢酸エチル)	218.5-221.0	塩酸塩
162	-H	-cyclo-C ₃ H ₅	3	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	165.5-167.0	—
163	-H	-CH(CH ₃) ₂	3	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	131.5-132.5	—
164	-H	-H	3	白色粉末 (ジクロロメタン)	186.0-191.0	—
165	-H	-(CH ₂) ₅ OH	3	白色固体 (エタノール)	202-203	塩酸塩
166	-H		3	淡褐色固体 (エタノール)	215-216	塩酸塩
167	-H	-C ₂ H ₅	4	白色粉末 (酢酸エチル)	198.0-199.5	塩酸塩
168	-H	-CH ₂ CF ₃	4	白色粉末 (酢酸エチル)	194.5-196.0	塩酸塩
169	-H	-H	4	白色粉末 (2-プロパノール)	150.0-151.5	—
170	-H	-CH ₃	4	白色粉末 (酢酸エチル)	154.0-156.0	—
171	-CH ₃	-CH ₃	4	白色粉末 (酢酸エチル)	226.0 (分解)	塩酸塩

【 0 3 7 8 】

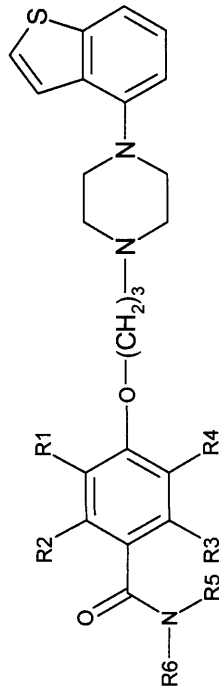
【表 3 2】



実施例	R1	R2	NMR	塩
172	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.1-2.2 (2H, m), 3.1-3.8 (14H, m), 4.17 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.6-4.8 (1H, br), 6.9-7.1 (3H, m), 7.33 (1H, dd, J=7.9, 8.1 Hz), 7.51 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.72 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.86 (2H, d, J=8.8 Hz), 8.2-8.3 (1H, br), 10.2-10.4 (1H, br).	塩酸塩

【 0 3 7 9 】

【表 3 3】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
173	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	199.0-204.0	塩酸塩
174	-OCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	162.0-163.0	-
175	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	154.0-155.5	-
176	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	145.0-148.0	-
177	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	213.0 (分解)	塩酸塩
178	-H	-H	-H	-Cl	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	211.0 (分解)	塩酸塩
179	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	128.5-131.0	-
180	-F	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	153.5-156.0	-

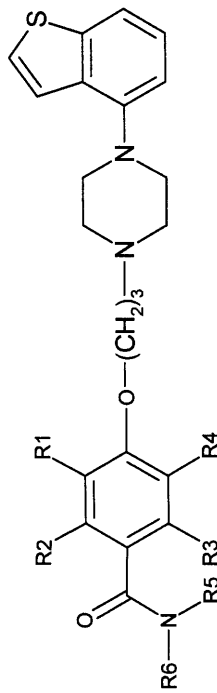
【0380】

10

20

30

【表 3 4】



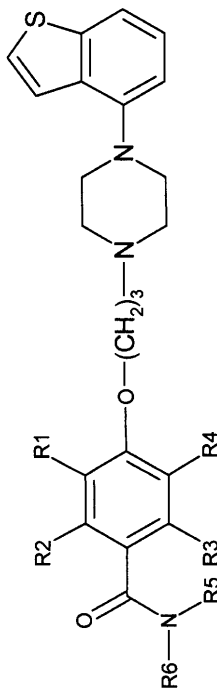
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
181	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	232.0 (分解)	塩酸塩
182	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	198.0-202.0	塩酸塩
183	-H	-H	-H	-F	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	210.5-213.0	塩酸塩
184	-F	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	176.5-179.5	—
185	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	イソプロピルエーテル 白色粉末 (2-プロパノール)	178.5-180.0	—
186	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	156.5-158.0	—
187	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	220.0-222.0 (分解)	塩酸塩
188	-CH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	140.5-143.0	—
189	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	154.5-157.0	—
190	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	162.0-163.5	—

【 0 3 8 1 】

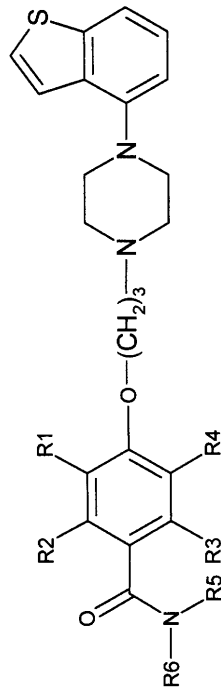
【表 3 5】

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
191	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	160.5-162.0	—
192	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	淡黄色粉末 (2-プロパノール)	144.5-146.0	—
193	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	白色粉末	120-122	—
194	-H	-H	-H	-F	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	白色粉末 (エタノール- 酢酸エチル)	215.0-217.0	塩酸塩
195	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	白色粉末 (エタノール- ヘキサン)	120.0-121.0	—
196	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	白色粉末 (エタノール- 酢酸エチル)	194-196	塩酸塩
197	-Br	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	152.5-154.0	—
198	-Br	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	148.0-150.0	—
199	-H	-H	-H	-Br	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	225.0 (分解)	塩酸塩
200	-H	-H	-H	-Br	-C ₂ H ₅	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	214.5-220.5 (分解)	塩酸塩

【 0 3 8 2 】



【表 3 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
201	-H	-H	-H	-Br	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル- インプロピルエーテル)	230.0-234.5	塩酸塩
202	-CN	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	182.0-185.0	-
203	-CN	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	177.5-181.5	-
204	-H	-H	-H	-CN	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	213.5-214.0	塩酸塩
205	-CN	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	162.5-166.0	-
206	-H	-H	-H	-CN	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	217.0-222.0	塩酸塩
207	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	133.5-135.5	-
208	-H	-Cl	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	137.0-139.0	-
209	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	236.0 (分解)	塩酸塩
210	-H	-H	-Cl	-H	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	223.0-224.0	塩酸塩

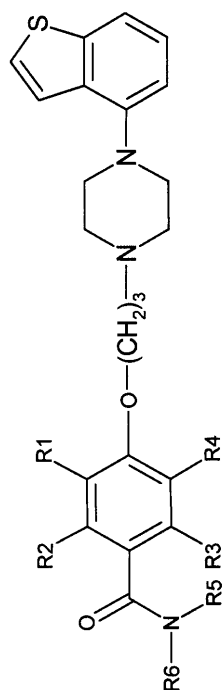
【 0 3 8 3 】

10

20

30

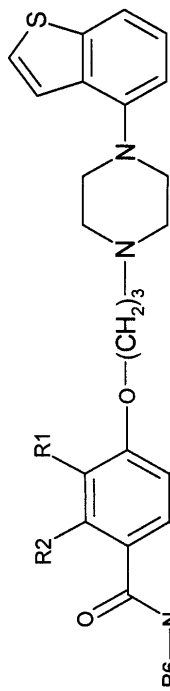
【表 3 7】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
211	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	210.5-216.0	塩酸塩
212	-H	-H	-CF ₃	-H	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	212.0-219.5	塩酸塩
213	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (ジクロロメタン- イソプロピルエーテル)	139.5-141.0	塩酸塩
214	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	214.0-218.5	塩酸塩
215	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	252.5 (分解)	塩酸塩
216	-H	-H	-CF ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	216.0-218.5	塩酸塩
217	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	173.5-178.5	—

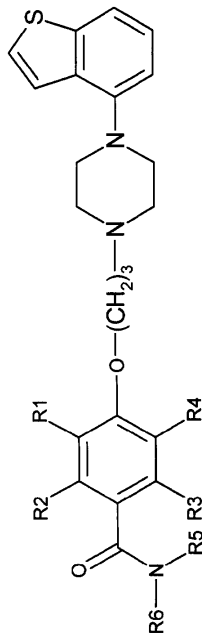
【 0 3 8 4 】

【表 3 8】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	NMR	塩
218	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.20-1.30 (3H, m), 2.10-2.20 (2H, m), 2.69 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70-2.75 (4H, m), 2.85 (6H, s), 3.20-3.25 (4H, m), 3.45-3.55 (2H, m), 4.10-4.20 (2H, m), 6.00 (1H, brs), 6.85-6.95 (2H, m), 7.25-7.30 (3H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.1 Hz).	-
219	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.20-1.30 (3H, m), 2.05-2.15 (2H, m), 2.25 (3H, s), 2.65 (2H, t, J=7.1 Hz), 2.70-2.80 (4H, m), 3.20-3.25 (4H, m), 3.40-3.55 (2H, m), 4.21 (2H, t, J=6.4 Hz), 6.22 (1H, brs), 6.91 (1H, d, J=7.7 Hz), 6.98 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.82 (1H, brs), 8.70 (1H, s).	-

【表 3 9】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
220	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	221.5-223.0	塩酸塩
221	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	207.5-215.0	塩酸塩
222	-H	-H	-OCH ₃	-H	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	197.0-202.0	塩酸塩
223	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	219.0-227.0	塩酸塩
224	-NO ₂	-H	-H	-H	-H	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	157.5-161.0	—
225	-NO ₂	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	イソプロピルエーテル 淡黄色粉末 (酢酸エチル)	157.5-161.5	—
226	-H	-H	-H	-NO ₂	-CH ₂ CF ₃	-H	イソプロピルエーテル 淡黄色粉末 (酢酸エチル)	217.5-219.5 (分解)	塩酸塩
227	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	163.5-165.5	—
228	-NH ₂	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	172.5-173.0	—
229	-CF ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	イソプロピルエーテル 白色粉末 (95%-2-プロパノール)	158.5-162.0	—
230	-CF ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	146.5-148.5	—

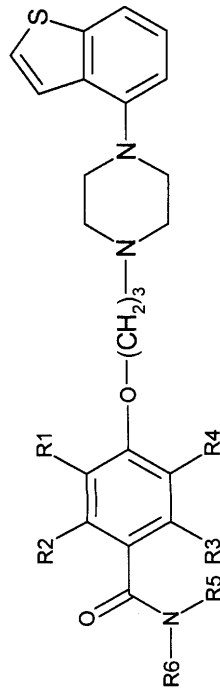
【 0 3 8 6 】

10

20

30

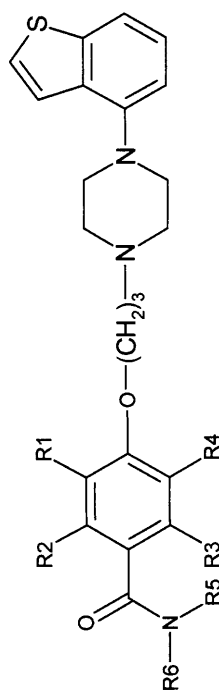
【表 4 0】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
231	-CF ₃	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	144.5-150.0	-
232	-NH ₂	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	124.0-125.5	-
233	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	143.0-145.0	-
234	-H	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	219.0-223.0	塩酸塩
235	-NH ₂	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	125.0-126.0	-
236	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	147.5-148.5	-
237	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	150.5-152.5	-
238	-H	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	138.0-139.0	-
239	-H	-CH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	137.5-139.0	-
240	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	167.0-168.0	-

【 0 3 8 7 】

【表 4 1】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
241	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	白色粉末 (95%-2-プロピノール)	152.5-154.5	-
242	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (95%-2-プロピノール)	184.0-185.5	-
243	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	147.5-148.0	-
244	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	233.0-237.5 (分解)	塩酸塩
245	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	145.5-147.5	-
246	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	186.5-188.0	塩酸塩
247	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	(酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	126.0-130.0	-
248	-C ₃ H ₇	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	(酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	137.5-140.0	-
249	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	180.5-186.0	塩酸塩
250	-OCH ₃	-H	-H	-C ₃ H ₇	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	186.5-192.0	塩酸塩

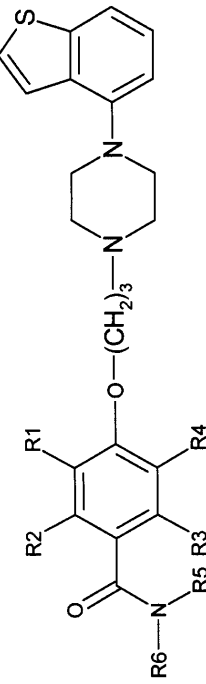
【 0 3 8 8 】

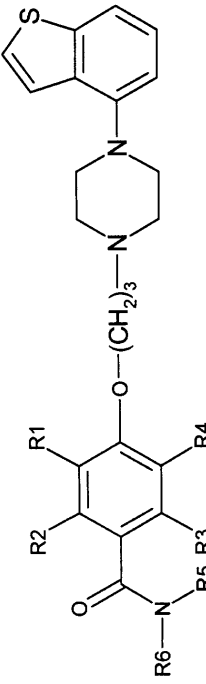
10

20

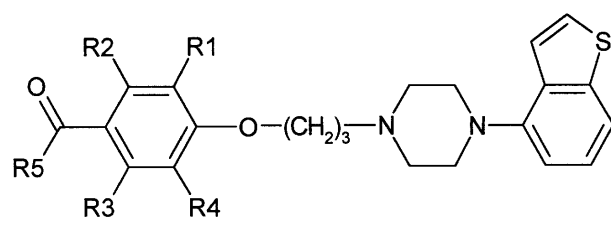
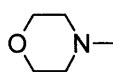
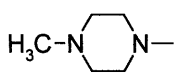
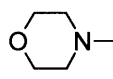
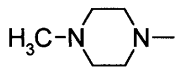
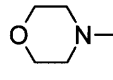
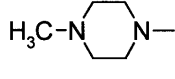
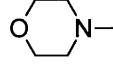
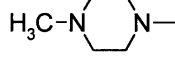
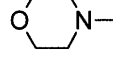
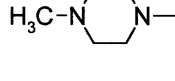
30

【表 4 2】

									
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
251	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	156.0-157.0	-
252	-CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル- メタノール)	141.5-142.5	-
253	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	220.5-224.5	塩酸塩
254	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-OCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	223.0-227.5	塩酸塩

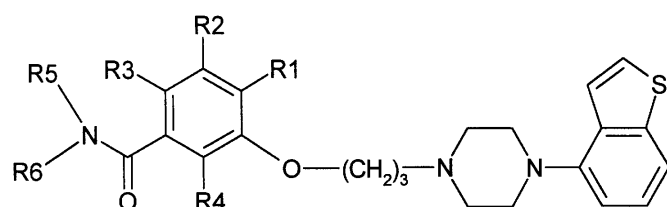
									
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	NMR		
255	-H	-H	-H	-NO ₂	-C ₂ H ₅	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.28 (3H, t, J=7.3 Hz), 2.05-2.15 (2H, m), 2.68 (2H, t, J=7.0 Hz), 2.73 (4H, brs), 3.19 (4H, brs), 3.45-3.55 (2H, m), 4.29 (2H, t, J=6.2 Hz), 6.14 (1H, brs), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.18 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.04 (1H, dd, J=2.3, 8.8 Hz), 8.23 (1H, d, J=2.2 Hz).		

【表 4 3】

						結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
実施例	R1	R2	R3	R4	R5			
256	-H	-H	-H	-H		白色粉末 (酢酸エチル)	234.5-238.0	塩酸塩
257	-H	-H	-H	-H		白色粉末 (酢酸エチル)	244.0 (分解)	2 塩酸塩
258	-H	-H	-H	-Cl		白色粉末 (酢酸エチル)	218.5-222.0	塩酸塩
259	-H	-H	-H	-Cl		白色粉末 (酢酸エチル)	255.0 (分解)	2 塩酸塩
260	-H	-H	-H	-F		白色粉末 (酢酸エチル)	224.5-227.5 (分解)	塩酸塩
261	-H	-H	-H	-F		白色粉末 (酢酸エチル)	255.0 (分解)	2 塩酸塩
262	-H	-H	-H	-CH ₃		白色粉末 (酢酸エチル)	236.0 (分解)	塩酸塩
263	-H	-H	-H	-CH ₃		白色粉末 (酢酸エチル)	255.5 (分解)	2 塩酸塩
264	-H	-H	-H	-OCH ₃		白色粉末 (酢酸エチル)	226.0-228.0 (分解)	塩酸塩
265	-H	-H	-H	-OCH ₃		白色粉末 (酢酸エチル)	232.0 (分解)	2 塩酸塩

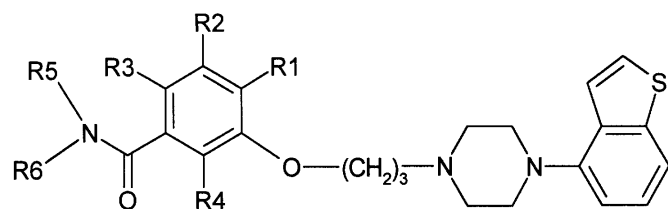
【 0 3 9 0 】

【表 4 4】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
266	-H	-H	-H	-H	-H	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	158.0-160.0	—
267	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	183.0-186.0	塩酸塩
268	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	158.0-161.5	塩酸塩
269	-H	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	168.5-173.0	塩酸塩
270	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	187.5-189.0	塩酸塩
271	-F	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	156.5-159.0	—
272	-F	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	214.5-218.0	塩酸塩
273	-F	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	211.0-218.0	塩酸塩
274	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	139.0-140.5	—
275	-Cl	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	218.5-222.5	塩酸塩
276	-Cl	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	247.0 (分解)	塩酸塩
277	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	129.5-130.0	—
278	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	148.5-151.0	—
279	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	133.0-134.5	—
280	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	155.5-160.0	—
281	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	163.5-165.0	塩酸塩

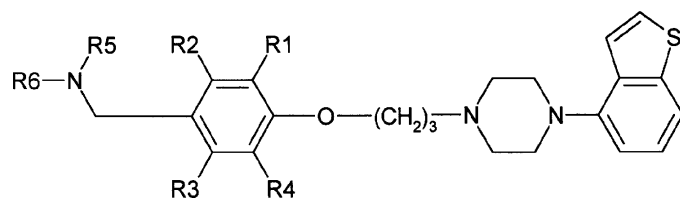
【表 4 5】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
282	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	187.0-188.5	塩酸塩
283	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	132.0-134.0	—
284	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	201.0-206.0	塩酸塩
285	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	156.0-158.5	—

【 0 3 9 2 】

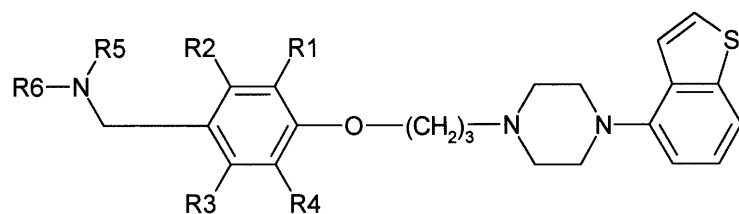
【表 4 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
286	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	228.0-241.0 (分解)	2 塩酸塩
287	-H	-H	-H	-H	-C ₃ H ₇	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	232.0-236.0 (分解)	2 塩酸塩
288	-H	-H	-H	-H	-C ₃ H ₇	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	210.0-222.0 (分解)	2 塩酸塩
289	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	235.5 (分解)	2 塩酸塩
290	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	257.5 (分解)	2 塩酸塩
291	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	232.0 (分解)	2 塩酸塩
292	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	238.5-240.5 (分解)	2 塩酸塩
293	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	209.5 (分解)	3 塩酸塩
294	-H	-H	-H	-H	-H	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	245.5 (分解)	2 塩酸塩
295	-H	-H	-H	-H	-CHO	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	207.5-213.0	塩酸塩
296	-H	-H	-H	-H	-COCH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	196.5-201.0	塩酸塩
297	-H	-H	-H	-H	-COC ₂ H ₅	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	194.5-198.0	塩酸塩
298	-H	-H	-H	-H	-COC ₆ H ₅	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	192.5-195.5	塩酸塩
299	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	236.5 (分解)	2 塩酸塩
300	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	191.0-193.5	2 塩酸塩
301	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	101.0-103.0	—
302	-H	-H	-H	-H	-C ₆ H ₅	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	207.5-214.5	3 塩酸塩
303	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	259.0 (分解)	2 塩酸塩
304	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	247.0 (分解)	2 塩酸塩
305	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	237.0 (分解)	2 塩酸塩
306	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-COCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	196.0-199.0	塩酸塩

【 0 3 9 3 】

【表 4 7】



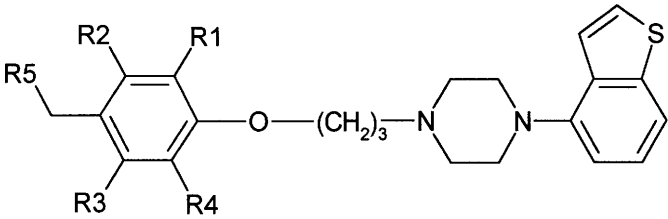
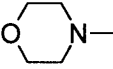
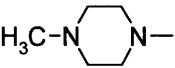
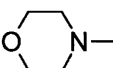
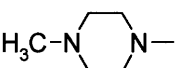
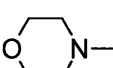
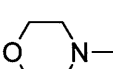
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
307	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	256.5 (分解)	2 塩酸塩
308	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	254.5 (分解)	2 塩酸塩
309	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	277.5 (分解)	2 塩酸塩
310	-H	-H	-H	-CH ₃	-COCH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	230.0-232.0 (分解)	塩酸塩
311	-OCH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	239.5 (分解)	2 塩酸塩
312	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-COCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	206.0-211.5	塩酸塩

【 0 3 9 4 】

10

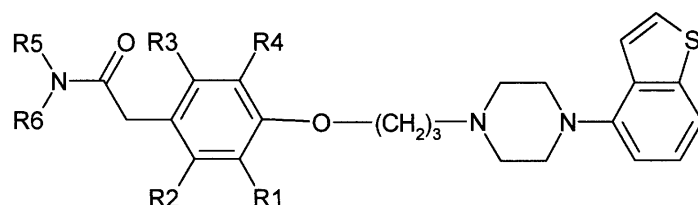
20

【表 4 8】

						結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
実施例	R1	R2	R3	R4	R5			
313	-H	-H	-H	-H		白色粉末 (酢酸エチル)	243.5 (分解)	2 塩酸塩
314	-H	-H	-H	-H		白色粉末 (酢酸エチル)	261.5 (分解)	2 塩酸塩
315	-H	-H	-H	-Cl		白色粉末 (酢酸エチル)	249.0 (分解)	2 塩酸塩
316	-H	-H	-H	-Cl		白色粉末 (酢酸エチル)	253.5 (分解)	3 塩酸塩
317	-H	-H	-H	-F		白色粉末 (酢酸エチル)	252.0 (分解)	2 塩酸塩
318	-H	-H	-H	-CH3		白色粉末 (酢酸エチル)	242.0 (分解)	2 塩酸塩

【 0 3 9 5 】

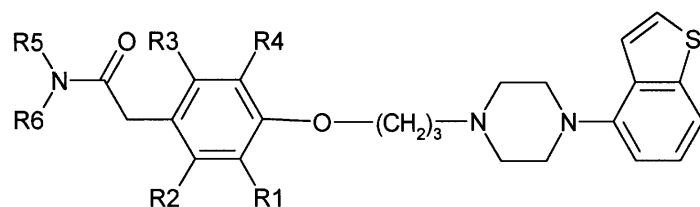
【表 4 9】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
319	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	179.0-183.5	塩酸塩
320	-H	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル-水)	150.0-154.5	—
321	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	198.0-207.0	塩酸塩
322	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	128.0-129.5	—
323	-H	-H	-H	-H	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	112.5-113.5	—
324	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CF ₃	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	126.0-127.0	—
325	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	161.5-166.0	—
326	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	194.5-197.0	塩酸塩
327	-H	-H	-H	-Cl	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	197.5-201.0	塩酸塩
328	-H	-H	-H	-Cl	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	227.5 (分解)	塩酸塩
329	-H	-H	-H	-Cl	-H	-CH ₂ CF ₃	(酢酸エチル)	204.0-206.0	塩酸塩
330	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	129.0-130.0	—
331	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	176.0-178.5	塩酸塩
332	-H	-H	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	188.5-192.0	塩酸塩
333	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	178.0-184.0	塩酸塩
334	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	-CH ₂ CF ₃	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	187.5-192.0	塩酸塩

【 0 3 9 6 】

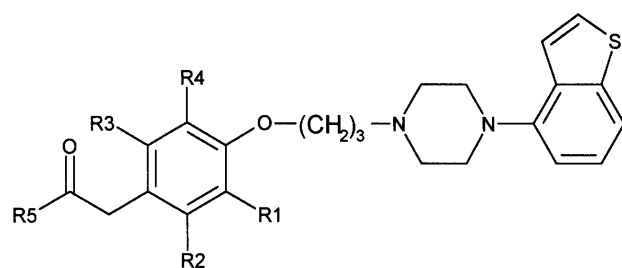
【表 5 0】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
335	-F	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	146.5-150.0	—
336	-H	-H	-H	-F	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	191.0-193.0	塩酸塩
337	-H	-H	-H	-F	-CH ₃	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	192.5-197.0	塩酸塩
338	-H	-H	-H	-F	-H	-C ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	216.0-220.5	塩酸塩
339	-H	-H	-H	-F	-H	-CH ₂ CF ₃	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	197.0-202.0	塩酸塩
340	-H	-H	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	149.5-150.5	—

【 0 3 9 7 】

【表 5 1】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
341	-H	-H	-H	-H		白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	130.5-131.5	—
342	-H	-H	-H	-H		白色粉末 (酢酸エチル)	227.5 (分解)	2 塩酸塩

【 0 3 9 8 】

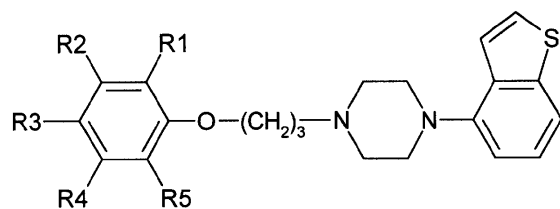
10

20

30

40

【表 5 2】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
343	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	白色粉末 (エタノール)	283.0-285.0	塩酸塩
344	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	149.5-150.5	—
345	-H	-H	-NHCO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	淡黄色粉末 (エタノール- 酢酸エチル)	174-176	2 塩酸塩
346	-H	-H	-NHC ₂ H ₅	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	225 (分解)	塩酸塩
347	-H	-H	-N(CH ₃)CO ₂ CH ₃	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	196.0-202.0	塩酸塩
348	-H	-H	-N(CH ₃)COCH ₃	-H	-H	白色粉末 (エタノール)	246-247	塩酸塩
349	-H	-H	-NH ₂	-H	-H	白色粉末 (含水エタノール)	266-271 (分解)	塩酸塩
350	-H	-H	-NHCH ₃	-H	-H	白色粉末 (エタノール)	264-266	2 塩酸塩
351	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	白色粉末 (エタノール)	269-270	2 塩酸塩
352	-CH ₃	-H	-NH ₂	-H	-OCH ₃	淡黄色固体 (酢酸エチル)	155.0-158.0	—
353	-OCH ₃	-H	-NHCON(CH ₃) ₂	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	206.0-210.0	塩酸塩
354	-OCH ₃	-H	-NHCHO	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	247.5-253.0 (分解)	塩酸塩
355	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	230.0-235.5	塩酸塩

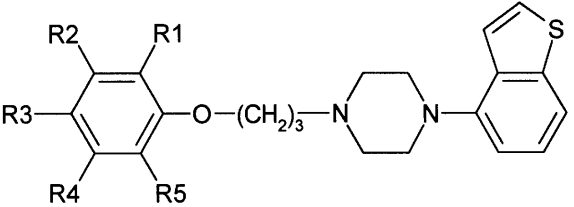
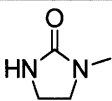
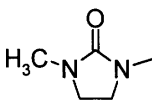
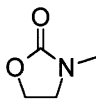
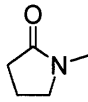
10

20

30

【 0 3 9 9 】

【表 5 3】

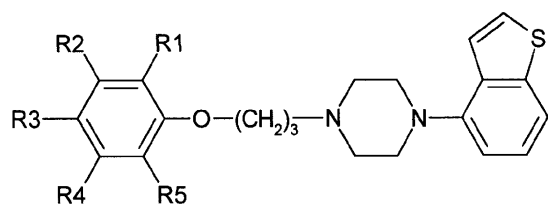
								
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
356	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- 2-プロパノール)	154.5-156.5	—
357	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (2-プロパノール)	141.0-144.5	—
358	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (エタノール)	247.5-251.0 (分解)	塩酸塩
359	-CH ₂ OH	-H		-H	-OCH ₃	白色粉末 (エタノール)	144.0-145.0	塩酸塩

10

20

【 0 4 0 0 】

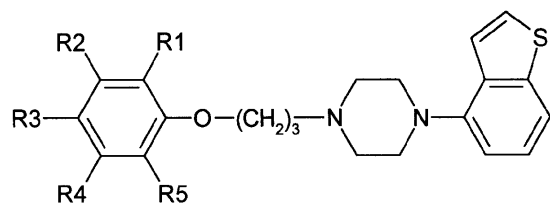
【表 5 4】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	塩
360	-H	-H	-NHCH(CH ₃) ₂	-H	-H	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.24 (6H, d, J = 6.5Hz), 2.2-2.4 (2H, m), 3.15-3.8 (12H, m), 4.15 (2H, t, J = 6Hz), 6.99 (1H, d, J = 7.5Hz), 7.11 (2H, d, J = 9Hz), 7.33 (1H, dd, J = 8, 8Hz), 7.4-7.55 (3H, m), 7.71 (1H, d, J = 8Hz), 7.78 (1H, d, J = 5.5Hz), 10.87 (3H, br).	3 塩酸塩
361	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.00-2.15 (2H, m), 2.60-2.70 (2H, m), 2.73 (4H, brs), 3.20 (4H, brs), 3.77 (3H, s), 3.88 (3H, s), 4.10 (2H, t, J=6.6 Hz), 6.52 (1H, brs), 6.74 (1H, dd, J=2.5, 8.6 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.6 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.19 (1H, brs), 7.28 (1H, dd, J=7.8, 7.8 Hz), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=7.8 Hz).	—
362	-H	-H	-NHCON(CH ₃) ₂	-H	-H	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.20-2.30 (2H, m), 2.91 (6H, s), 3.20-3.40 (6H, m), 3.55 (2H, d, J=12.4 Hz), 3.65 (2H, d, J=11.4 Hz), 4.05 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.86 (2H, d, J=9.0 Hz), 6.98 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.30-7.40 (3H, m), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 8.16 (1H, brs), 11.05 (1H, brs).	2 塩酸塩
363	-F	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.24 (2H, brs), 3.10-3.25 (2H, m), 3.30-3.50 (4H, m), 3.50-3.60 (2H, m), 3.66 (3H, s), 3.65-3.70 (2H, m), 4.13 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.98 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.10-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J=7.9, 7.9 Hz), 7.40 (1H, d, J=13.3 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 9.69 (1H, brs), 10.56 (1H, brs).	塩酸塩
364	-H	-H	-NHCONH ₂	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.64 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.70-2.75 (4H, m), 3.15-3.20 (4H, m), 4.03 (2H, t, J=6.3 Hz), 4.83 (2H, brs), 6.83 (1H, brs), 6.85-6.95 (3H, m), 7.20 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz).	—
365	-H	-H	-NHCON(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.06 (6H, t, J=7.0 Hz), 2.15-2.30 (2H, m), 3.20-3.45 (10H, m), 3.54 (2H, d, J=12 Hz), 3.64 (2H, d, J=12 Hz), 4.03 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.84 (2H, d, J=8.9 Hz), 6.97 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.25-7.40 (3H, m), 7.49 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.70 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.6 Hz), 8.01 (1H, s), 10.95 (1H, s).	2 塩酸塩

【 0 4 0 1 】

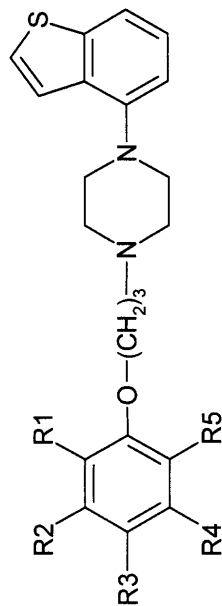
【表 5 5】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	塩
366	-H	-H		-H	-H	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.05-2.10 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.76 (4H, brs), 3.22 (4H, brs), 4.11 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.91 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.01 (2H, d, J=8.9 Hz), 7.20 (2H, d, J=9.6 Hz), 7.25-7.35 (3H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, s).	—
367	-H	-H		-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.05-2.15 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7.2 Hz), 2.75 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 4.12 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.91 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.00-7.05 (2H, m), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.50-7.60 (3H, m), 8.08 (1H, s), 8.45 (1H, s).	—

【 0 4 0 2 】

【表 5 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
368	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	224.0-232.0 (分解)	2 塩酸塩
369	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	178.0-181.0 (分解)	塩酸塩
370	-H	-H	-CN	-H	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	105.5-107.0	-
371	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	263.0 (分解)	塩酸塩
372	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	242.0 (分解)	塩酸塩
373	-H	-H	-Br	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	119.0-120.0	-
374	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-H	白色粉末 (水)	121.0-124.5	-
375	-Cl	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	淡黄色粉末 (エタノール)	122.0-123.5	-
376	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	213.5-221.5 (分解)	塩酸塩
377	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-F	白色粉末 (酢酸エチル)	231.5-233.5	塩酸塩

【0 4 0 3】

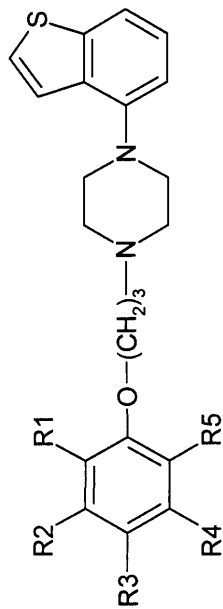
10

20

30

40

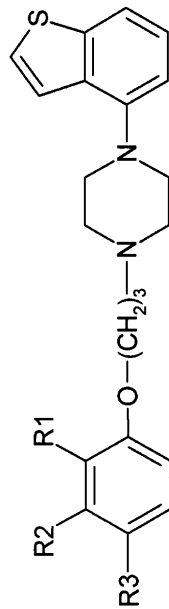
【表 5 7】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
378	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-Cl	白色粉末 (塩酸-酢酸)	273.0 (分解)	塩酸塩
379	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	217.0-222.0	塩酸塩
380	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-F	白色粉末 (塩酸-酢酸)	267.0 (分解)	塩酸塩
381	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHCH ₃	-H	-H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	258.0 (分解)	2 塩酸塩
382	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	236.5 (分解)	2 塩酸塩
383	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COCH ₃	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	215.0-217.0	塩酸塩
384	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COC ₂ H ₅	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	211.0-217.0	塩酸塩
385	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)COC ₆ H ₅	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	210.5-212.0	塩酸塩
386	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	196.0-202.0 (分解)	2 塩酸塩
387	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHC ₂ H ₅	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	230.0 (分解)	2 塩酸塩
インゾプロピルエーテル								

【 0 4 0 4 】

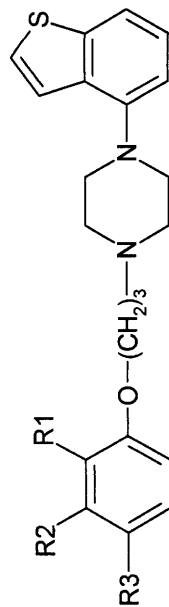
【表 5 8】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
388	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CF ₃	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	223.0 (分解)	2 塩酸塩
389	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Cl	白色粉末 (酢酸エチル)	225.0-228.5	塩酸塩
390	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-Cl	白色粉末 (塩酸-酢酸)	208.0-209.5	塩酸塩
391	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	205.5-213.5	塩酸塩
392	-CH ₃	-H	-CN	-H	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	105.5-106.0	—
インゾプロピルエーテル)								
393	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-OCH ₃	白色粉末 (塩酸-酢酸)	198.5-201.0	塩酸塩
394	-H	-H	-SO ₂ NH ₂	-H	-H	白色粉末 (エタノール)	199.0-203.0	—
395	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CH ₃	白色粉末 (塩酸-酢酸)	280.0 (分解)	塩酸塩
396	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-F	白色粉末 (酢酸エチル)	220.5-224.0	塩酸塩
397	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-F	白色粉末 (塩酸-酢酸)	181.5-184.5	塩酸塩

【0 4 0 5】

【表 5 9】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
398	-H	-H	-CN	-OCH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	238.0 (分解)	塩酸塩
399	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-Br	白色粉末 (酢酸エチル)	237.5-242.5 (分解)	塩酸塩
400	-H	-CN	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	217.5-221.0 (分解)	塩酸塩
401	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-Br	白色粉末 (塩酸-酢酸)	271.0 (分解)	塩酸塩
402	-H	-H	-H	-CO ₂ H	-H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	242.5-244.5	塩酸塩
403	-H	-H	-H	-H	-CN	白色粉末 (酢酸エチル)	221.5-226.0	塩酸塩
404	-CN	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	128.5-130.0	—
405	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CN	白色粉末 (ジクロロメタン-水)	271.0 (分解)	塩酸塩
406	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	220.0-227.5	塩酸塩
407	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	224.5-232.0	塩酸塩

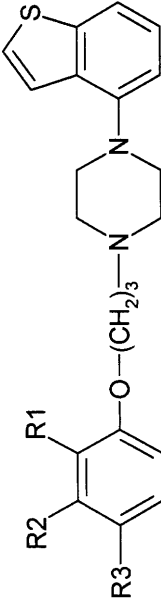
【0406】

10

20

30

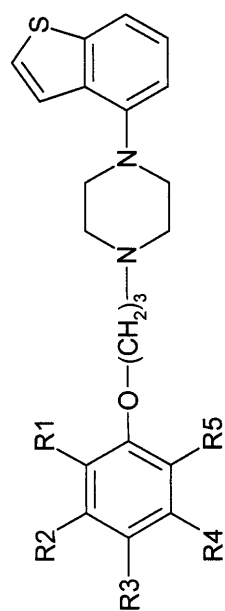
【表 6 0】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
408	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-Cl	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	216.5-219.0	塩酸塩
409	-H	-H	-CO ₂ H	-Cl	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	259.0 (分解)	塩酸塩
410	-H	-OCH ₃	-CHO	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	118.0-119.5	-
411	-H	-H	-CO ₂ H	-CF ₃	-H	2-プロパノール 白色粉末 (水)	240.0 (分解)	塩酸塩
412	-H	-H	-CN	-CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	230.0-237.0	塩酸塩
413	-NO ₂	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	113.0-114.0	-
414	-H	-H	-CHO	-H	-H	イソプロピルエーテル 白色粉末 (酢酸エチル)	102.5-105.5	-
415	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-NO ₂	白色粉末 (塩酸-酢酸)	259.0 (分解)	2 塩酸塩
416	-H	-H	-CH=CHCO ₂ H	-H	-H	白色粉末 (塩酸-水)	265.0 (分解)	塩酸塩
417	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-CF ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	211.5-221.0	塩酸塩

【 0 4 0 7 】

【表 6 1】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
418	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-CF ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	269.0 (分解)	塩酸塩
419	-H	-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	206.0-208.0	塩酸塩
420	-H	-H	-CH=CHCONH ₂	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	210.5-215.0	—
421	-H	-CH ₂ CO ₂ H	-H	-H	-H	淡褐色粉末 (酢酸エチル)	255.0 (分解)	塩酸塩
422	-H	-H	-CH=CHCONHCH ₃	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	165.5-169.0	—
423	-H	-H	-CH=CHCON(CH ₃) ₂	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	130.5-131.5	—
424	-H	-H	-CH=CHCONHC ₂ H ₅	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	158.0-159.0	—
425	-H	-H	-CH=CHCONHCH ₂ CF ₃	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	177.5-180.0	—
426	-H	-H	-(CH ₂) ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	235.0-237.5	塩酸塩
427	-F	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	218.5-224.0	塩酸塩

【0408】

10

20

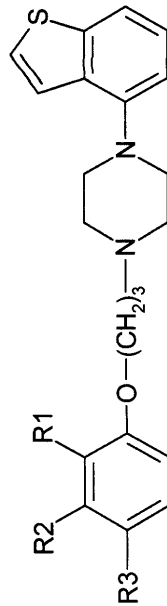
30

40

【表 6 2】

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
428	H	H	-CH ₂ CH ₂ CO ₂ H	H	H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	240.0 (分解)	塩酸塩
429	F	H	H	-CO ₂ H	H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	260.0 (分解)	塩酸塩
430	Cl	H	H	-CO ₂ C ₂ H ₅	H	白色粉末 (酢酸エチル)	241.0-245.0	塩酸塩
431	Cl	H	H	-CO ₂ H	H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	268.0 (分解)	塩酸塩
432	-CH ₃	H	H	-CO ₂ C ₂ H ₅	H	白色粉末 (酢酸エチル)	238.0-242.0 (分解)	塩酸塩
433	-CH ₃	H	-CO ₂ C ₂ H ₅	H	-CH ₃	白色粉末 (イソプロピルエーテル)	106.0-108.0	—
434	-CH ₃	H	H	-CO ₂ H	H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	256.5 (分解)	塩酸塩
435	-CH ₃	H	-CO ₂ H	H	-CH ₃	白色粉末 (水)	252.5 (分解)	塩酸塩
436	-OCH ₃	-OCH ₃	H	-CO ₂ C ₂ H ₅	H	白色粉末 (酢酸エチル)	225.0-234.0	塩酸塩
437	H	H	-C(CH ₃) ₂ CO ₂ CH ₃	H	H	白色粉末 (酢酸エチル)	222.0-226.5	塩酸塩

【0409】

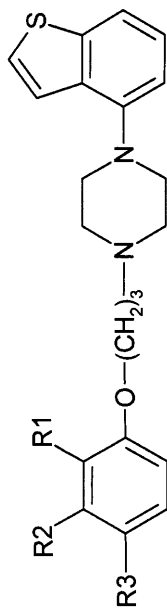


10

20

30

【表 6 3】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
438	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	208.0-213.5	塩酸塩
439	-H	-H	-C(CH ₃) ₂ CO ₂ H	-H	-H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	257.5 (分解)	塩酸塩
440	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CONH ₂	-H	-H	淡黄色粉末 (95%-2-プロパノール)	167.5-170.0	-
441	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CONHCH ₃	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	128.0-132.0	-
442	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ H	-H	白色粉末 (塩酸-水)	250.0 (分解)	塩酸塩
443	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ CONHC ₂ H ₅	-H	-H	白色粉末 (95%-2-プロパノール)	130.5-132.0	塩酸塩
444	-H	-CH ₂ CONH ₂	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	132.5-134.0	塩酸塩
445	-H	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	173.5-175.0	塩酸塩
446	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	白色粉末 (水)	154.0-155.5	塩酸塩
447	-OCH ₃	-H	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-OCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	239.0-242.0 (分解)	塩酸塩

【 0 4 1 0 】

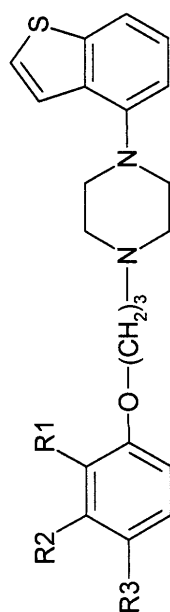
10

20

30

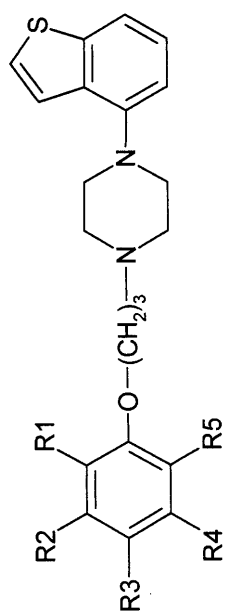
40

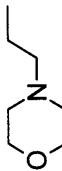
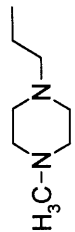
【表 6 4】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
448	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	白色粉末 (水)	191.0-196.0	—
449	-H	-H	-CSNHC ₂ H ₅	-H	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル -THF)	193.0-196.5	2 塩酸塩
450	-OCH ₃	-H	-COCH ₃	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	243.0 (分解)	塩酸塩
451	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	白色粉末 (水)	97.0-102.0	—
452	-C ₃ H ₇	-H	-CO ₂ H	-H	-OCH ₃	白色粉末 (水)	145.5-150.5	—

【表 6 5】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
453	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	112.5-113.5	-
454	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	112.0-113.0	-

【 0 4 1 2 】

【表 6 6】

						NMR		塩
実施例	R1	R2	R3	R4	R5			塩酸塩
455	-H	-H	-F	-H	-H	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.15-2.30 (2H, m), 3.10-3.25 (2H, m), 3.25-3.60 (4H, m), 3.55-3.75 (4H, m), 4.10 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.90-7.10 (4H, m), 7.25-7.40 (3H, m), 7.51 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.72 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.12 (1H, brs).		塩酸塩
456	-H	-H	-H	-H	-H			塩酸塩

						結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
実施例	R1	R2	R3	R4	R5			
457	-H	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	無色針状晶 (エタノール)	243.7 - 244.8	-

【 0 4 1 3 】

10

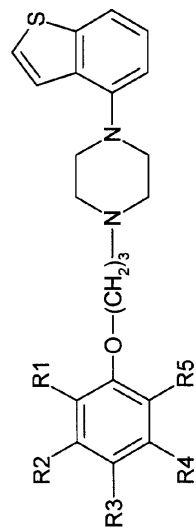
20

30

40

【表 6 7】

【 0 4 1 4 】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	塩
458	-H	-H	-COCH ₃	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm : 2.20-2.40 (2H, m), 2.53 (3H, s), 3.20-3.70 (10H, m), 3.83 (3H, s), 4.19 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.96 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.10 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.31 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.45-7.50 (2H, m), 7.62 (1H, dd, J=2.0, 8.4 Hz), 7.69 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.5 Hz), 11.14 (1H, brs).	塩酸塩
459	-OCH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.95-2.10 (6H, m), 2.60-2.75 (7H, m), 2.96 (2H, t, J=11.3 Hz), 3.21 (4H, brs), 3.55 (2H, d, J=12.4 Hz), 4.06 (2H, t, J=6.2 Hz), 6.80-6.95 (3H, m), 7.17 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.25-7.35 (1H, m), 7.40 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.43 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.57 (1H, d, J=8.1 Hz).	塩酸塩
460	-H	-H		-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.55-1.65 (2H, m), 1.80-1.95 (2H, m), 2.00-2.10 (2H, m), 2.13 (3H, s), 2.55-2.75 (7H, m), 3.10-3.20 (6H, m), 3.93 (1H, d, J=13.7 Hz), 4.05 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.78 (1H, d, J=13.3 Hz), 6.85-6.95 (3H, m), 7.11 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.39 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.42 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz).	-
461	-H	-H		-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.75-1.85 (4H, m), 2.00-2.10 (4H, m), 2.32 (3H, s), 2.35-2.45 (1H, m), 2.63 (2H, t, J=7.4 Hz), 2.73 (4H, brs), 2.96 (2H, d, J=11.5 Hz), 3.20 (4H, brs), 4.04 (2H, t, J=6.3 Hz), 6.85-6.95 (3H, m), 7.14 (2H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.1 Hz).	-
462	-H	-H		-H	-H		

10

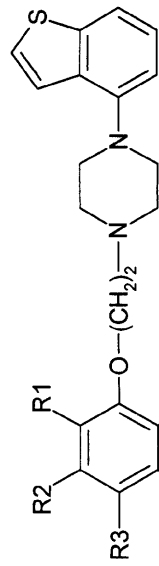
20

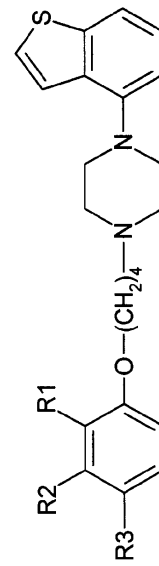
30

40

【表 6 8】

【 0 4 1 5】

					
実施例	R1	R2	R3	R4	R5
463	-H	-H	-F	-H	-H
NMR					
¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 3.10-3.25 (2H, m), 3.40-3.75 (8H, m), 4.40-4.45 (2H, m), 6.98 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.00-7.25 (4H, m), 7.33 (1H, dd, J=7.9, 7.8 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.78 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.37 (1H, brs).					
464	-H	-H	-H	-H	-H
¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 3.10-3.35 (2H, m), 3.40-3.80 (8H, m), 4.48 (2H, t, J=4.8 Hz), 6.95-7.10 (4H, m), 7.25-7.40 (3H, m), 7.51 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.80-11.20 (1H, br).					
塩酸塩					
塩酸塩					

					
実施例	R1	R2	R3	R4	R5
465	-H	-H	-H	-H	-H
NMR					
¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.70-2.00 (4H, m), 3.10-3.40 (6H, m), 3.50-3.80 (4H, m), 4.03 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.90-7.00 (5H, m), 7.25-7.40 (3H, m), 7.50 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.59 (1H, brs)					
466	-H	-H	-F	-H	-H
¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.75-1.95 (4H, m), 3.10-3.50 (6H, m), 3.50-3.65 (4H, m), 4.00 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.90-7.00 (3H, m), 7.00-7.20 (2H, m), 7.32 (1H, dd, J=7.9, 7.8 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.40-10.60 (1H, br).					
467	-H	-H	-COCH ₃	-H	-OCH ₃
¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.80-1.95 (4H, m), 2.52 (3H, s), 3.20-3.35 (6H, m), 3.50-3.65 (4H, m), 3.83 (3H, s), 4.00-4.15 (2H, m), 6.95 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.08 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.30 (1H, dd, J=7.8, 7.8 Hz), 7.40-7.50 (2H, m), 7.61 (1H, dd, J=1.9, 8.4 Hz), 7.69 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.75 (1H, d, J=5.6 Hz), 11.0 (1H, brs).					
塩酸塩					
塩酸塩					

10

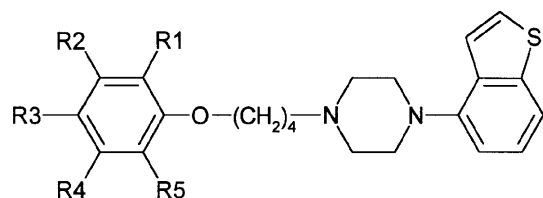
20

30

40

50

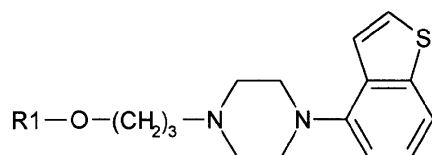
【表 6 9】

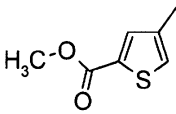
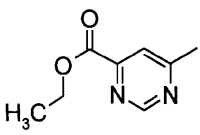
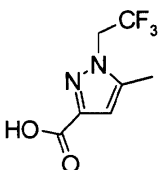


実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点 (°C)	塩
468	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	241.0 (分解)	塩酸塩
469	-H	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	203.0-209.5	塩酸塩
470	-H	-H	-CN	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	220.0-223.0 (分解)	塩酸塩
471	-H	-H	-CO ₂ H	-H	-H	白色粉末 (塩酸-酢酸)	247.5-250.0 (分解)	塩酸塩
472	-H	-CN	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	196.0-198.5	塩酸塩
473	-H	-H	-H	-CO ₂ H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	255.5-258.5	塩酸塩
474	-CN	-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	187.5-188.5	塩酸塩
475	-H	-H	-H	-CONHCH ₂ CF ₃	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	137.0 (分解)	塩酸塩
476	-H	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	2-プロパノール) 淡黄色粉末 (酢酸エチル)	130.0-135.0	塩酸塩
477	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ H	2-プロパノール) 白色粉末 (ジクロロメタン- 水)	192.0-197.0	塩酸塩
478	-H	-CONH ₂	-H	-H	-H	淡黄色粉末 (2-プロパノール)	148.0-151.0	—
479	-H	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	234.0-239.0	塩酸塩
480	-H	-H	-H	-CON(CH ₃) ₂	-H	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	135.0-141.5	塩酸塩
481	-H	-H	-H	-H	-CONHC ₂ H ₅	白色粉末 (酢酸エチル)	209.5-213.0	塩酸塩

【 0 4 1 6 】

【表 7 0】



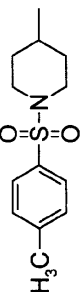
実施例	R1	NMR	塩
482		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.00-2.10 (2H, m), 2.63 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.70-2.80 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 3.89 (3H, s), 4.00-4.10 (2H, m), 6.57 (1H, d, $J=1.9$ Hz), 6.91 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.20-7.35 (2H, m), 7.35-7.50 (3H, m), 7.56 (1H, d, $J=8.0$ Hz).	—
483		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.44(3H, t, 7.0Hz), 2.01-2.12(2H, m), 2.63(2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.67-2.81(4H, m), 3.12-3.29(4H, m), 4.44-4.55(4H, m), 6.90(1H, d, $J=7.5$ Hz), 7.27(1H, dd, $J=5.5$ Hz, 7.5Hz), 7.40(2H, dd, $J=5.5$ Hz, 8.0Hz), 7.44(1H, d, $J=1.0$ Hz), 7.55(1H, d, $J=8.0$ Hz), 8.90(1H, d, $J=1.0$ Hz)	—
484		$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ ppm : 1.83-2.00 (2H, m), 2.59-2.70 (4H, m), 3.00-3.15(4H, m), 3.17(1H, d, $J=4.5$ Hz), 3.31(1H, d, $J=4.5$ Hz), 4.15 (2H, t, $J=6.0$ Hz), 4.77(2H, q, $J=8.8$ Hz), 6.90 (1H, d, $J=7.3$ Hz), 7.27 (1H, t, $J=7.8$ Hz), 7.40(1H, d, $J=5.5$ Hz), 7.61(1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.69(1H, d, $J=5.5$ Hz).	—

10

20

【 0 4 1 7 】

【表 7 1】

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	塩
485	-H	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.43(9H, s), 1.97-2.07 (2H, m), 2.64(2H, t, J=7.5Hz), 2.69-2.87(6H, m), 2.81(3H, s), 3.15-3.27(4H, m), 3.38 (2H, t, J=7.5Hz), 4.04 (2H, t, J=6.3Hz), 6.83-6.92 (3H, m), 7.02-7.15(2H, m), 7.28(1H, t, J=7.8Hz), 7.37-7.43 (2H, m), 7.55(1H, d, J=8.0Hz) ¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.60-2.10 (6H, m), 2.30-2.40 (2H, m), 2.47 (3H, s), 2.60-2.70 (1H, m), 2.74 (4H, br), 2.85-3.00 (2H, m), 3.20 (4H, br), 3.90-4.10 (4H, m), 6.85-6.95 (2H, m), 7.07 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.25-7.45 (3H, m), 7.56 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.2 Hz)	-
486	-H	-H		-H	-H	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.20-2.43 (2H, m), 3.17-3.77 (10H, m), 4.30 (2H, t, J=6.0 Hz), 6.90-7.20 (2H, m), 7.30-7.40 (2H, m), 7.50-7.63 (1H, m), 7.70-7.79 (4H, m), 11.00 (1H, br), 12.71 (1H, br) ¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.60-2.80 (6H, m), 3.10-3.30 (4H, m), 3.89 (6H, s), 4.10 (2H, t, J=6.4Hz), 6.90 (1H, dd, J=0.5, 7.6Hz), 7.27 (1H, dd, J=7.8, 7.8Hz), 7.35-7.45 (3H, m), 7.50-7.60 (2H, m)	-
487	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ H	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.90-2.05 (2H, m), 2.26 (3H, s), 2.55-3.30 (10H, m), 3.85 (3H, s), 4.03 (2H, t, J=6.1Hz), 6.93 (1H, d, J=7.6Hz), 7.29 (1H, dd, J=7.8, 7.8Hz), 7.35-7.50 (3H, m), 7.65 (1H, d, J=8.0Hz), 7.72 (1H, d, J=5.5Hz), 11.50-13.50 (1H, br)	-
488	-OCH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.98-2.09(2H, m), 2.70-2.83(6H, m), 3.13-3.30(4H, m), 3.45(2H, d, J=6.5Hz), 3.89(3H, s), 4.10(2H, t, J=6.4Hz), 5.04-5.11(2H, m), 5.91-6.09(1H, m), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.24-7.31(1H, m), 7.38-7.44(2H, m), 7.47-7.57(3H, m)	-
489	-OCH ₃	-H	-CO ₂ H	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 0.97(3H, t, J=7.3Hz), 1.52-1.74(2H, m), 1.93-2.13(2H, m), 2.57-2.85(6H, m), 3.07-3.30(4H, m), 3.89(6H, s), 4.09(2H, t, J=6.3Hz), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.24-7.31(1H, m), 7.38-7.45(3H, m), 7.52-7.57(2H, m)	-
490	-CH ₂ CH=CH ₂	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃		-
491	-C ₃ H ₇	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-OCH ₃		-

【表 7 2】

$R1-(CH_2)_n-N$ (with H_3C and benzothiophenyl substituents)

実施例	R1	n	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
492		3	白色粉末 (酢酸エチル)	129.0-138.5	塩酸塩
493		3	白色粉末 (酢酸エチル)	130.0-136.0	塩酸塩
494		3	白色粉末		フマル酸塩
495		4	白色粉末 (アセトニトリル)	154-156	2 塩酸塩

10

20

【 0 4 1 9 】

【表 7 3】

$R1-(CH_2)_n-N$ (with CH_3 and benzothiophenyl substituents)

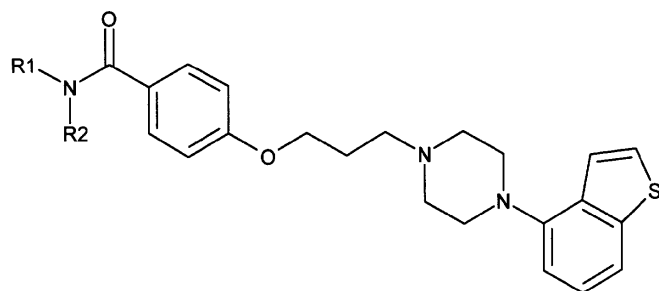
実施例	R1	n	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
496		3	白色粉末 (酢酸エチル)	151.5-156.5	塩酸塩
497		4	白色粉末 (エタノール- 酢酸エチル)	220-225	2 塩酸塩

30

40

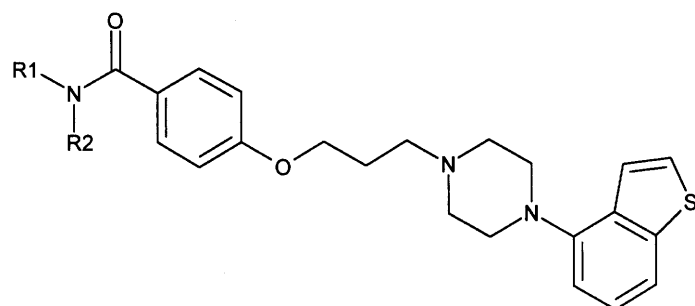
【 0 4 2 0 】

【表 7 4】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
498	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	478
499	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	508
500	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	484
501	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	481
502	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	512
503	-C ₃ H ₇	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	492
504	-CH ₂ CH=CH ₂	-cyclo-C ₅ H ₉	504
505	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	452
506	-H	-C ₄ H ₉	452
507	-H	-C(CH ₃) ₃	452
508	-H	-cyclo-C ₇ H ₁₃	492
509	-C ₂ H ₅	-cyclo-C ₆ H ₁₁	506
510	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	466
511	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	452
512	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	454
513	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	468
514	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	482
515	-H	-1-CH ₃ -CYCLOHEXYL	492
516	-H	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	450
517	-H	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	492
518	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	468
519	-H	-CH ₂ CONH ₂	453
520	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	482
521	-H	-CH ₂ CCH	434
522	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	452
523	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	466
524	-H	-CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	480
525	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	467
526	-CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	464
527	-H	-CH ₂ CF ₃	478
528	-CH ₃	-cyclo-C ₆ H ₁₁	492
529	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	468
530	-CH ₂ CH ₂ OH	-cyclo-C ₆ H ₁₁	522
531	-H	-cyclo-C ₅ H ₉	464
532	-H	-3-PYRIDYL	473
533	-H	-4-PYRIDYL	473
534	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₆ H ₅	516

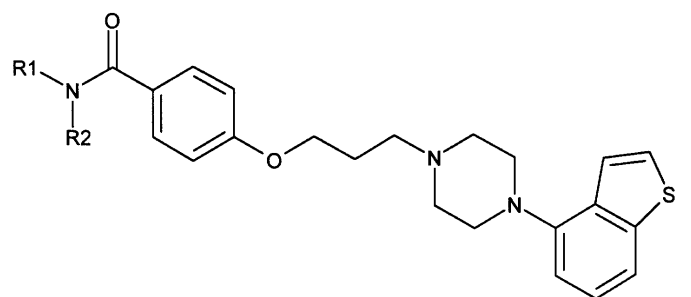
【表 7 5】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
535	-H	-C ₆ H ₅	435
536	-H	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	468
537	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	449
538	-H	-CH ₂ CN	566
539	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	523
540	-H	-CH ₂ CH ₂ CN	523
541	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	481
542	-CH ₃	-(CH ₂) ₃ N(C ₂ H ₅) ₂	482
543	-C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	523
544	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	481
545	-H	-(CH ₂) ₅ OH	495
546	-H	-(CH ₂) ₂ N(I-Pr) ₂	524
547	-H	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	524
548	-H	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	563
549	-CH ₃	-(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	509
550	-H	-(CH ₂) ₄ CO ₂ C ₂ H ₅	493
551	-cyclo-C ₅ H ₉	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	528
552	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	484
553	-H	-NHCH ₂ CF ₃	496
554	-H	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	482
555	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	442
556	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	467
557	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	470
558	-H	-CH ₂ CH ₂ F	435
559	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	468
560	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	449

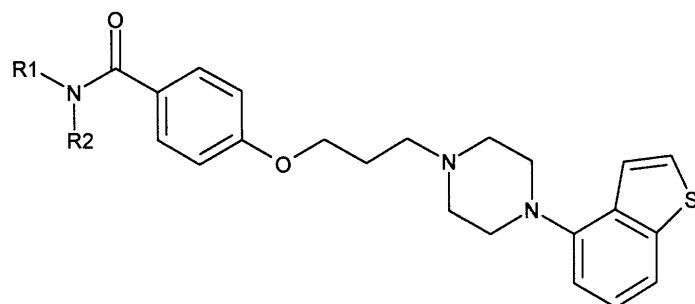
【 0 4 2 2 】

【表 7 6】



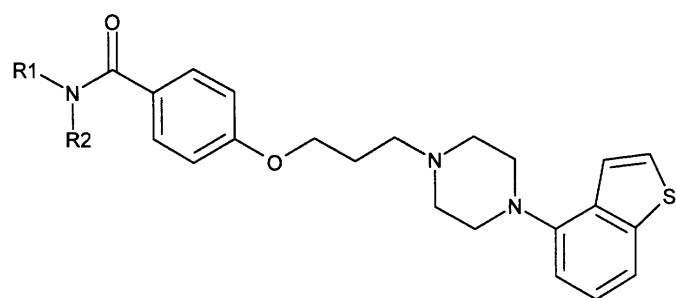
実施例	R1	R2	MS (M+1)
561	-H		510
562	-H		524
563	-H		495
564	-H		496
565	-H		482
566	-H		467
567	-H		466
568	-H		480
569	-H		568
570	-H		554

【表 7 7】



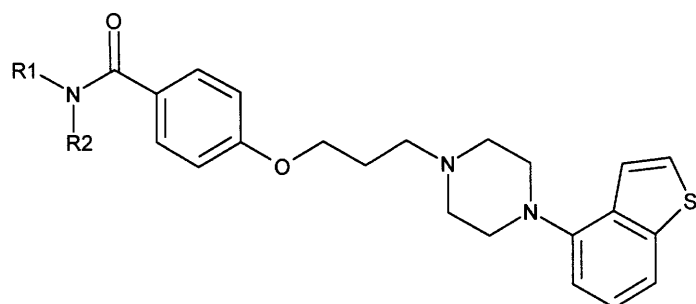
実施例	R1	R2	MS (M+1)
571	-H		496
572	-H		482
573	-H		468
574	-H		470
575	-H		450
576	-H		509
577	-H		481
578	-H		450
579	-H		478

【表 7 8】



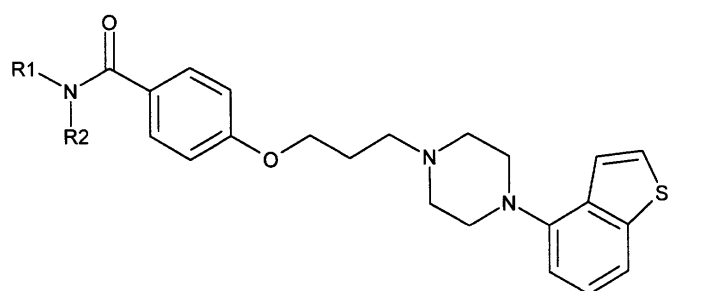
実施例	R1	R2	MS (M+1)
580	-H		494
581	-H		492
582	-H		536
583	-CH ₃		516
584	-CH ₃		520
585	-H		551
586	-H		506
587	-H		502
588	-H		502
589	-H		502

【表 7 9】



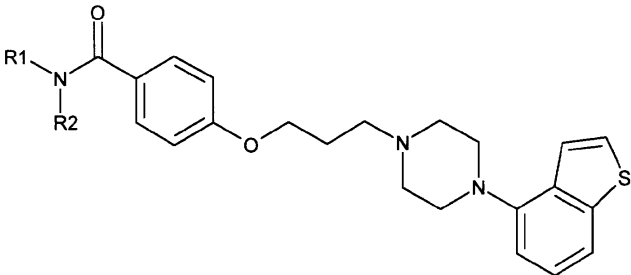
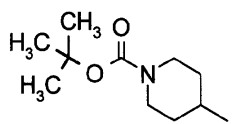
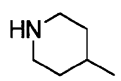
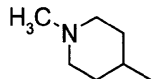
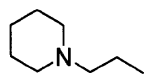
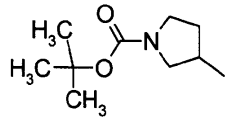
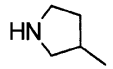
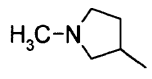
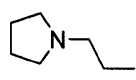
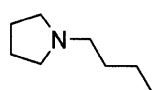
実施例	R1	R2	MS (M+1)
590	-H		506
591	-H		506
592	-H		540
593	-H		554
594	-H		554
595	-H		487
596	-H		533
597	-CH ₃		515
598	-H		487

【表 8 0】

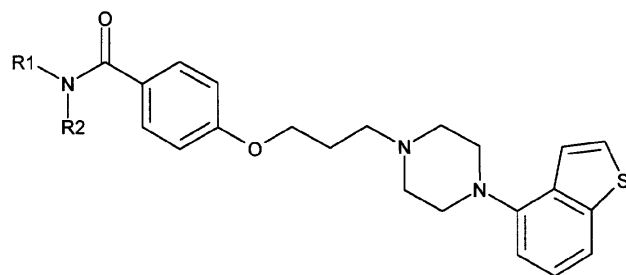


実施例	R1	R2	MS (M+1)
599	-H		487
600	-H		487
601	-C ₂ H ₅		529
602	-C ₂ H ₅		515
603	-H		501
604	-H		501
605	-H		501
606	-CH ₃		507
607	-CH ₃		535
608	-H		535

【表 8 1】

			
実施例	R1	R2	MS (M+1)
609	-H	EtO ₂ C- 	551
610	-H		579
611	-H		479
612	-H	H ₃ C- 	493
613	-H		507
614	-H		565
615	-H		465
616	-H	H ₃ C- 	479
617	-H		493
618	-H		507

【表 8 2】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
619	-H		507
620	-H		521
621	-H		507
622	-H		536
623	-H		507
624	-H		509
625	-H		523
626	-H		476
627	-H		490
628	-H		504

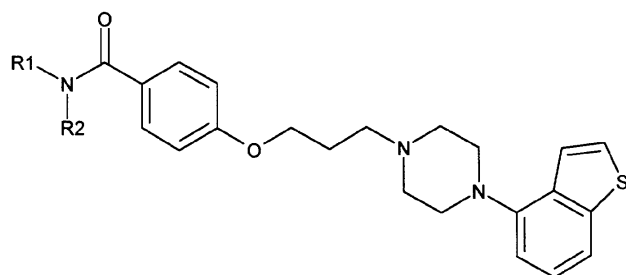
10

20

30

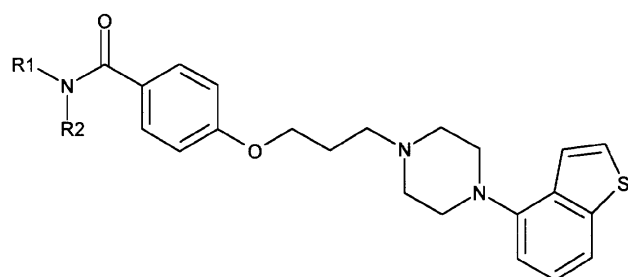
40

【表 8 3】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
629	-H		476
630	-H		480
631	-H		480
632	-C ₂ H ₅		522
633	-H		494
634	-H		482
635	-H		496
636	-H		492
637	-H		506
638	-H		492

【表 8 4】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
639	-H		506
640	-H		489
641	-H		503
642	-H		489
643	-H		490
644	-H		538
645	-H		528
646	-H		518
647	-H		518
648	-H		504

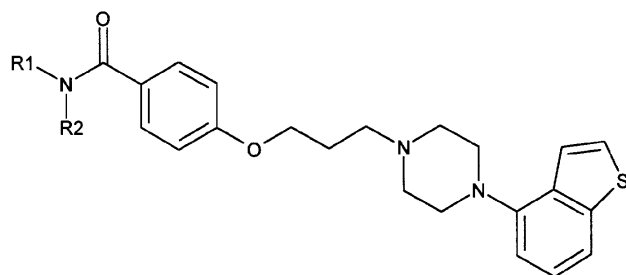
10

20

30

40

【表 8 5】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
649	-H		520
650	-H		504
651	-H		533
652	-H		490
653	-H		479
654	-H		494
655	-H		491
656	-H		502
657	-H		526
658	-H		533

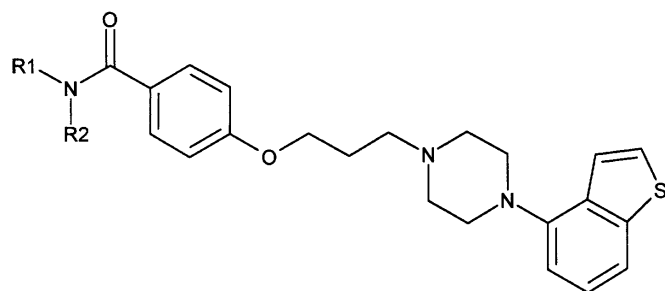
10

20

30

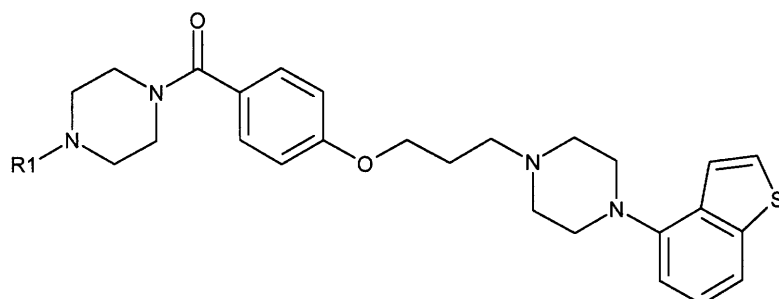
40

【表 8 6】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
659	-H		512
660	-H		511
661	-H		539
662	-H		528
663	-H		523
664	-H		523
665	-H		555
666	-H		571
667	-H		555
668	-H		570

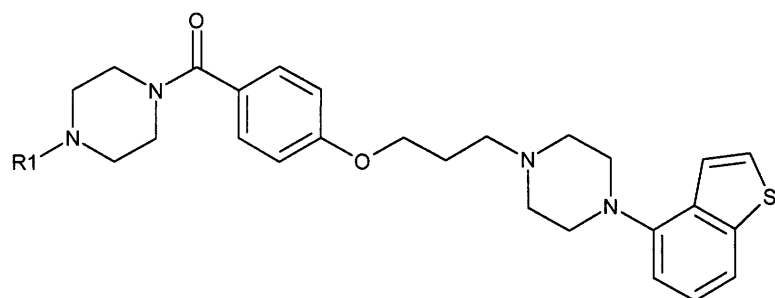
【表 8 7】



実施例	R1	MS (M+1)
669	-H	465
670	-C ₄ H ₉	521
671	-CH(C ₂ H ₅) ₂	535
672	-CH(CH ₃) ₂	507
673	-C(CH ₃) ₃	535
674	-C ₃ H ₇	507
675	-C ₂ H ₅	493
676	-C ₆ H ₁₃	549
677	-cyclo-C ₅ H ₉	533
678	-cyclo-C ₇ H ₁₃	561
679	-CH ₂ CH ₂ OH	509
680	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	523
681	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	537
682	-(CH ₂) ₄ OCH ₃	551
683	-CO ₂ C ₂ H ₅	537
684	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	565
685	-COCH ₃	507
686	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	550
687	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	536

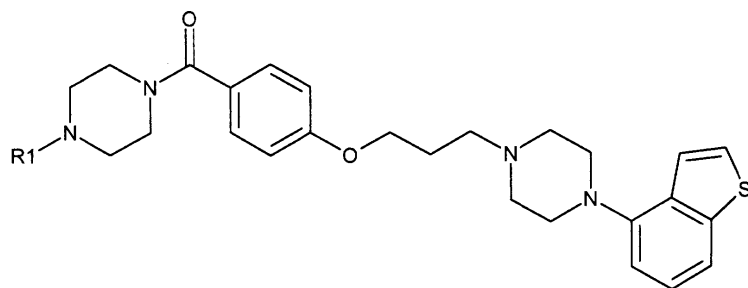
【 0 4 3 4 】

【表 8 8】



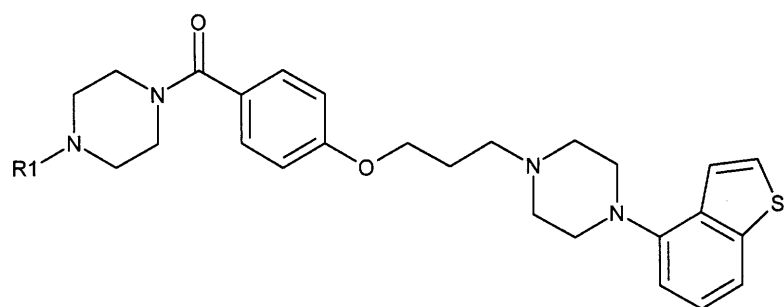
実施例	R1	MS (M+1)
688		576
689		578
690		562
691		551
692		565
693		549
694		576
695		576
696		576
697		556
698		556

【表 8 9】



実施例	R1	MS (M+1)
699		556
700		570
701		570
702		632
703		559
704		545
705		561
706	-4-PYRIDYL	542
707	-3-PYRIDYL	542
708	-2-PYRIDYL	542
709		567
710		556
711		556

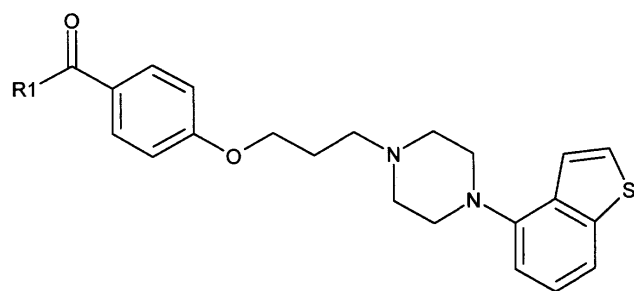
【表 9 0】



実施例	R1	MS (M+1)
712		610
713		598

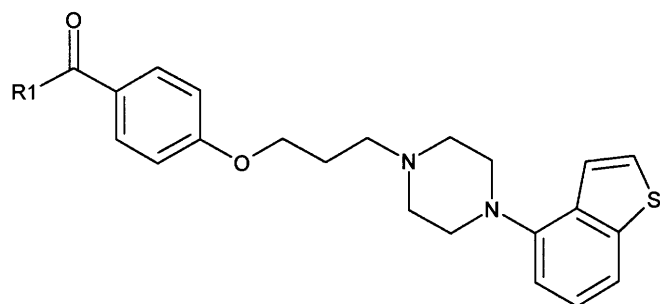
【 0 4 3 7 】

【表 9 1】



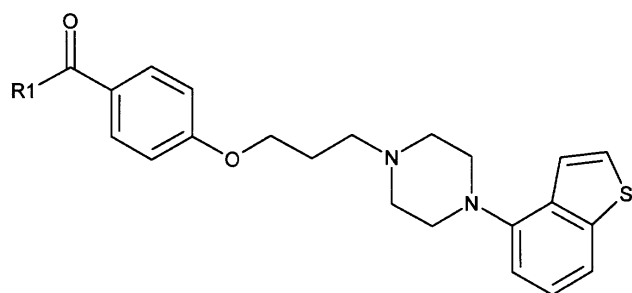
実施例	R1	MS (M+1)
714		450
715		480
716		493
717		466
718		507
719		549
720		507
721		533
722		547
723		562
724		535

【表 9 2】



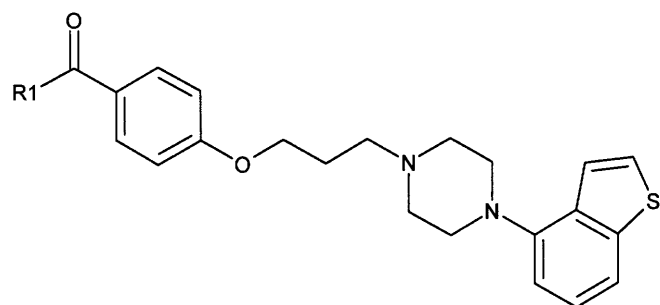
実施例	R1	MS (M+1)
725		464
726		492
727		480
728		480
729		494
730		494
731		549
732		507
733		494
734		564

【表 9 3】



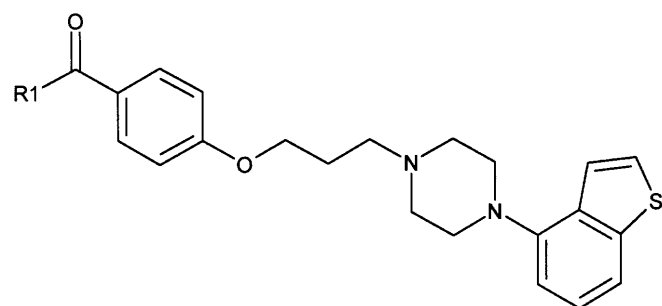
実施例	R1	MS (M+1)
735		536
736		536
737		536
738		521
739		579
740		547
741		576
742		562
743		549
744		576
745		522

【表 9 4】



実施例	R1	MS (M+1)
746		478
747		482
748		494
749		563
750		479
751		493
752		556
753		476
754		468
755		504

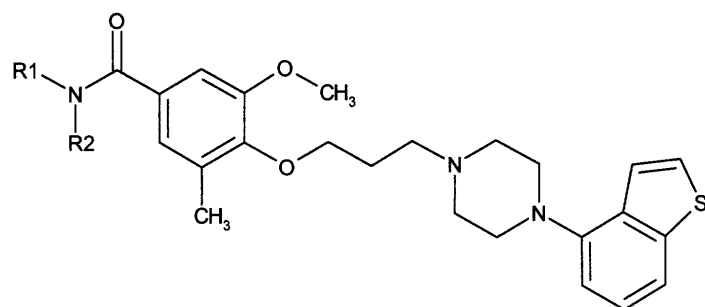
【表 9 5】



実施例	R1	MS (M+1)
756		600
757		498
758		512
759		551

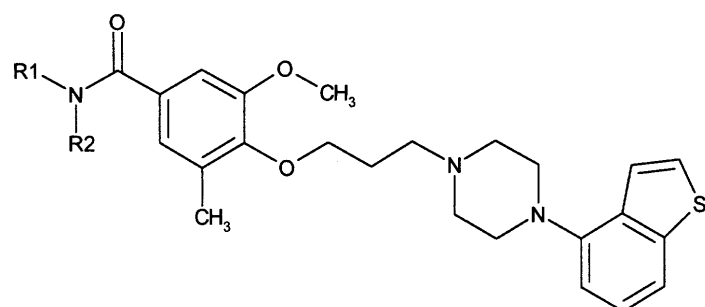
【 0 4 4 2 】

【表 9 6】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
760	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	522
761	-H	-CH(CH ₃) ₂	482
762	-H	-C ₄ H ₉	496
763	-H	-cyclo-C ₃ H ₅	480
764	-H	-cyclo-C ₇ H ₁₃	536
765	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	530
766	-H	-C ₃ H ₇	482
767	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	496
768	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	498
769	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	512
770	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	526
771	-H	-1-CH ₃ -CYCLOHEXYL	536
772	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	560
773	-H	-cyclo-C ₅ H ₉	508
774	-H	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	494
775	-H	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	536
776	-H	-CH(CH ₃)C ₆ H ₅	544
777	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	544
778	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	512
779	-H	-CH ₂ CONH ₂	497
780	-H	-CH ₂ CCH	478
781	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	510
782	-H	-CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	524
783	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	510
784	-CH ₃	-cyclo-C ₆ H ₁₁	536
785	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	496
786	-H	-C(CH ₃) ₃	496
787	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	544
788	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	510
789	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	526
790	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	496
791	-CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	508
792	-H	-CH ₂ CF ₃	522
793	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	510

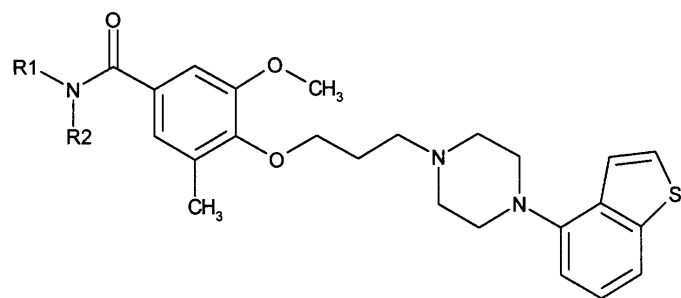
【表 9 7】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
794	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	512
795	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	484
796	-H	-CH ₂ CN	479
797	-C ₂ H ₅	-2-PYRIDYL	545
798	-H	-3-PYRIDYL	517
799	-H	-C ₆ H ₅	516
800	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	525
801	-H	-CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂	524
802	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	528
803	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	540
804	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	526
805	-H	-CH ₂ CH ₂ F	486
806	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	511
807	-H	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	514
808	-H	-CH ₂ CHF ₂	504

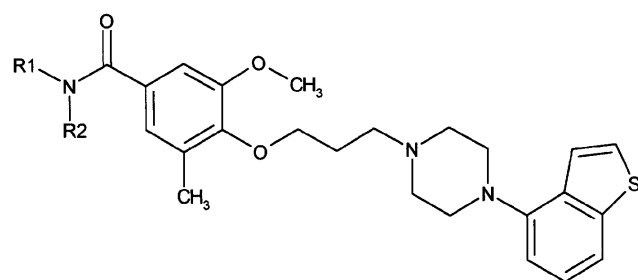
【 0 4 4 4 】

【表 9 8】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
809	-H		554
810	-H		568
811	-H		539
812	-H		598
813	-H		540
814	-H		526
815	-H		511
816	-H		494
817	-H		540
818	-H		612
819	-C ₂ H ₅		522

【表 9 9】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
820	-H		526
821	-H		512
822	-H		514
823	-H		496
824	-H		494
825	-H		522
826	-H		538
827	-H		536
828	-H		580
829	-CH ₃		560
830	-CH ₃		544

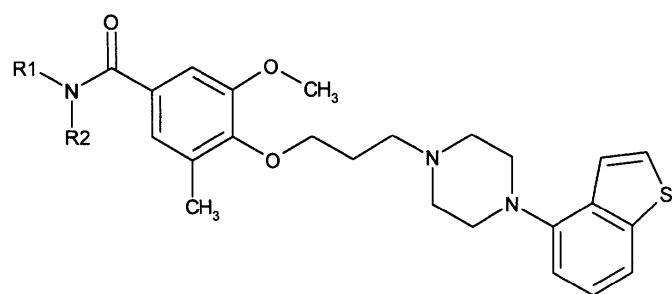
10

20

30

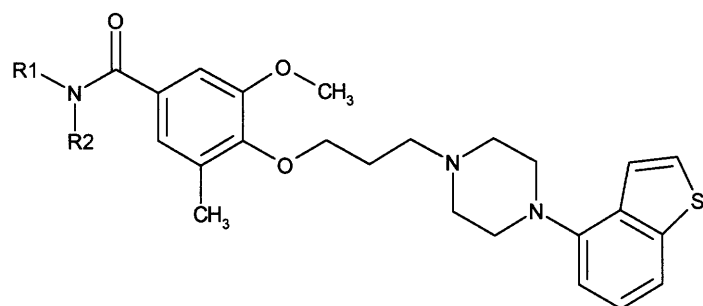
40

【表 1 0 0】



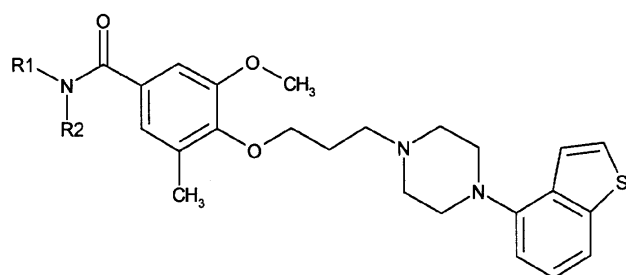
実施例	R1	R2	MS (M+1)
831	-CH ₃		564
832	-H		562
833	-H		562
834	-H		584
835	-H		600
836	-H		572
837	-H		550
838	-H		546
839	-H		546
840	-H		546
841	-H		550

【表 101】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
842	-H		550
843	-H		530
844	-H		558
845	-H		574
846	-H		576
847	-H		592
848	-H		581
849	-H		580
850	-H		576
851	-H		576

【表 1 0 2】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
852	-H		560
853	-H		603
854	-H		576
855	-H		556
856	-H		558
857	-H		564
858	-H		564
859	-H		564
860	-H		572
861	-H		560
862	-H		560

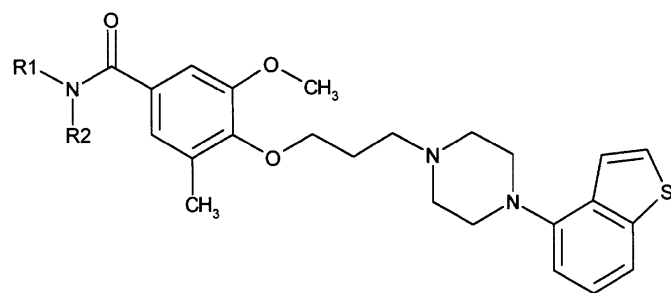
10

20

30

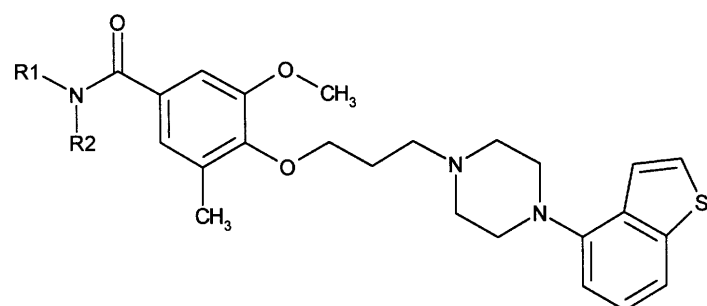
40

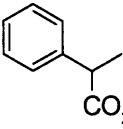
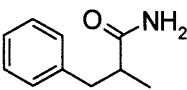
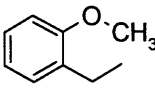
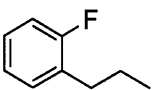
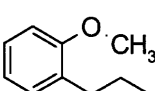
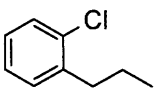
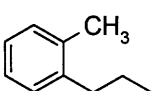
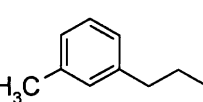
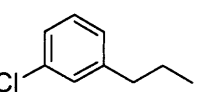
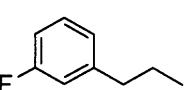
【表 1 0 3】



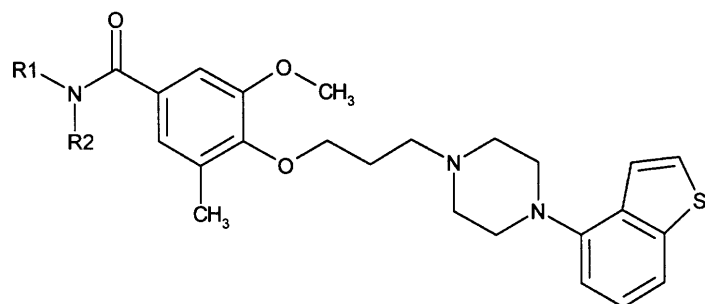
実施例	R1	R2	MS (M+1)
863	-H		574
864	-H		574
865	-H		578
866	-H		598
867	-H		614
868	-H		574
869	-H		548
870	-H		590
871	-H		544
872	-H		562
873	-H		602

【表 1 0 4】



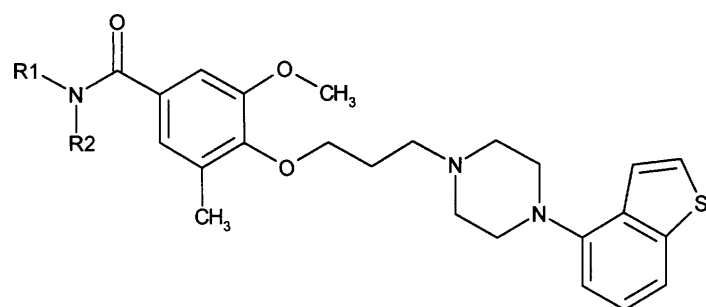
実施例	R1	R2	MS (M+1)
874	-H		588
875	-H		587
876	-H		560
877	-H		562
878	-H		574
879	-H		578
880	-H		558
881	-H		558
882	-H		578
883	-H		562

【表 105】



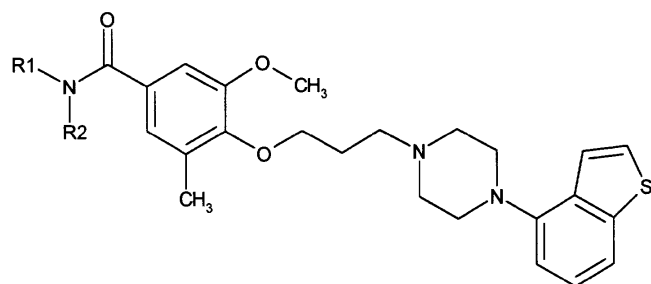
実施例	R1	R2	MS (M+1)
884	-H		590
885	-H		574
886	-H		630
887	-CH ₃		558
888	-CH ₃		588
889	-CH ₃		574
890	-H		598
891	-H		548
892	-H		598
893	-H		548

【表 106】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
894	-H		566
895	-H		614
896	-H		562
897	-H		562
898	-H		562
899	-H		580
900	-H		612
901	-H		612
902	-H		612

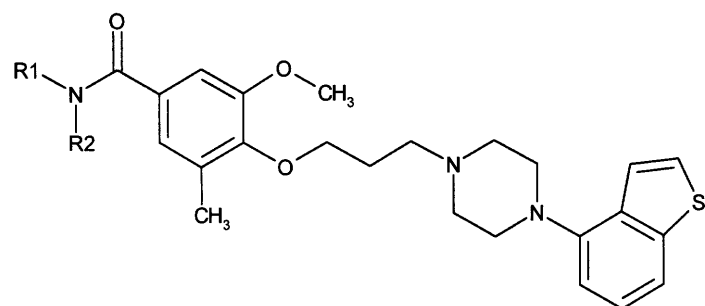
【表 1 0 7】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
903	-H		576
904	-H		576
905	-H		576
906	-H		594
907	-H		626
908	-H		626
909	-H		626
910	-H		566
911	-H		628

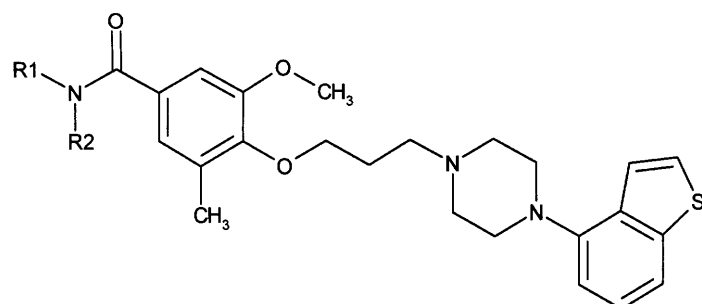
【 0 4 5 4 】

【表 108】



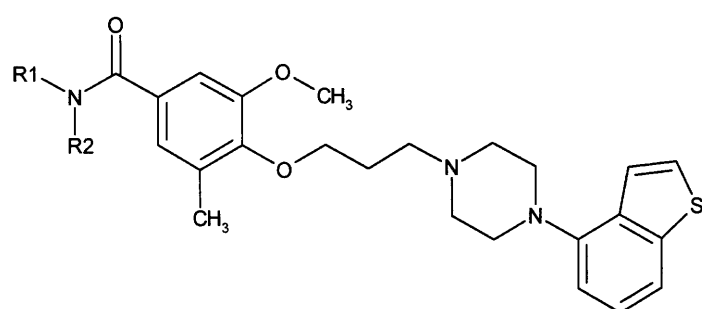
実施例	R1	R2	MS (M+1)
912	-H		602
913	-H		606
914	-C ₂ H ₅		584
915	-H		566
916	-H		580
917	-H		531
918	-H		531
919	-H		531
920	-H		545
921	-C ₂ H ₅		573

【表 109】



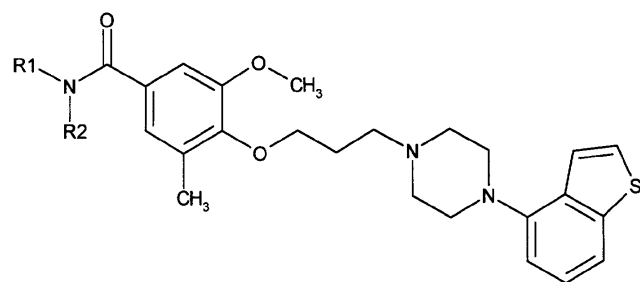
実施例	R1	R2	MS (M+1)
922	-C ₂ H ₅		559
923	-H		545
924	-H		545
925	-H		579
926	-CH ₃		675
927	-H		565
928	-H		551
929	-H		520
930	-H		534
931	-H		548

【表 1 1 0】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
932	-H		520
933	-H		524
934	-H		524
935	-H		538
936	-H		526
937	-H		540
938	-H		536
939	-H		550
940	-H		536
941	-H		550

【表 1 1 1】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
942	-H		533
943	-H		533
944	-H		562
945	-H		548
946	-H		548
947	-H		577
948	-H		592
949	-H		534
950	-H		537
951	-H		546
952	-H		556

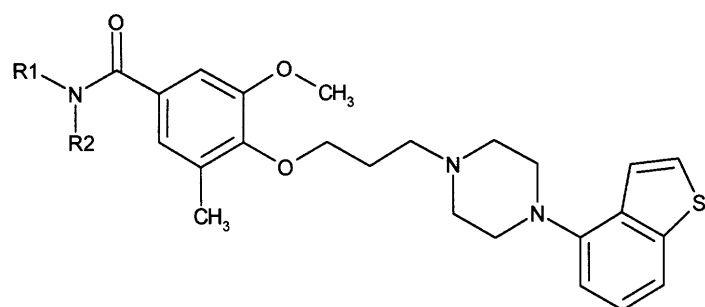
10

20

30

40

【表 1 1 2】



実施例	R1	R2	MS (M+1)
953	-H		583
954	-H		598
955	-H		570
956	-H		572
957	-H		599
958	-H		615
959	-H		598

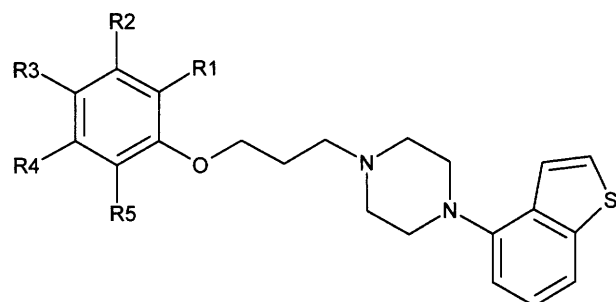
【 0 4 5 9 】

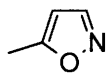
10

20

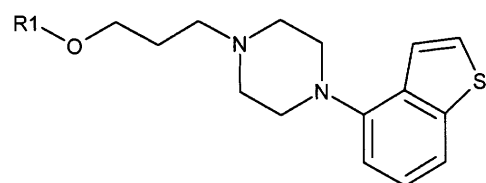
30

【表 1 1 3】



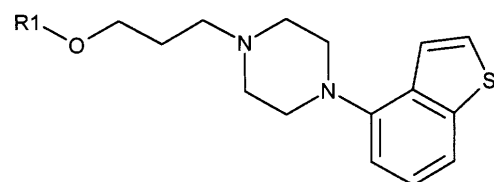
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS (M+1)
960	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	410
961	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	410
962	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	383
963	-H	-H	-Cl	-H	-H	387
964	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	367
965	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	421
966	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	437
967	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	399
968	-H	-H	-C ₆ H ₅	-H	-H	429
969	-H	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	459
970	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	398
971	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	395
972	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	413
973	-OCH ₃	-H	-H	-H	-OCH ₃	413
974	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	413
975	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	367
976	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	381
977	-F	-H	-H	-H	-H	371
978	-H	-F	-H	-H	-H	371
979	-H	-H	-F	-H	-H	371
980	-F	-H	-F	-H	-H	389
981	-H	-F	-H	-H	-F	389
982	-F	-H	-H	-H	-F	389
983	-F	-H	-H	-CH ₃	-H	385
984	-H	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	-H	425
985	-CH ₃	-H	-COCH ₃	-H	-H	409
986	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	-H	445
987		-H	-H	-H	-H	420
988	-H	-H		-H	-H	419

【表 1 1 4】



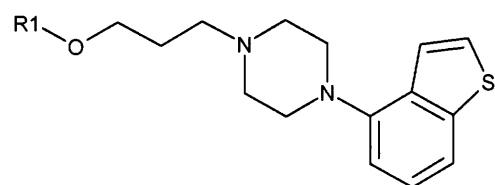
実施例	R1	MS (M+1)
989	-3-PYRIDYL	354
990		368
991		385
992		407
993		393
994		407
995		407
996		421
997		421
998		419
999		419
1000		428

【表 1 1 5】



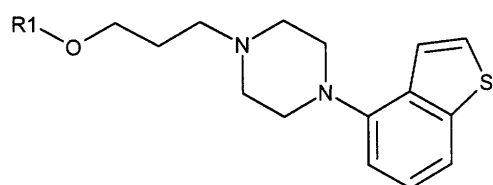
実施例	R1	MS (M+1)
1001		433
1002		433
1003		437
1004		409
1005		423
1006		409
1007		421
1008		435
1009		451
1010		427
1011		394

【表 1 1 6】



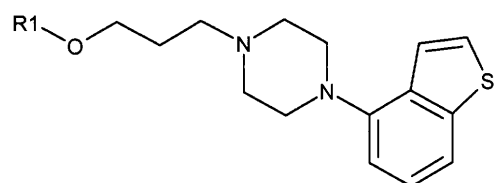
実施例	R1	MS (M+1)
1012		395
1013		450
1014		436
1015		410
1016		424
1017		424
1018	-2-BENZTHIAZOLYL	410
1019		438
1020		440
1021		451
1022		465

【表 1 1 7】



実施例	R1	MS (M+1)
1023		465
1024		436
1025		450
1026		436
1027		438
1028		452
1029		438
1030		438
1031		479
1032		451

【表 1 1 8】



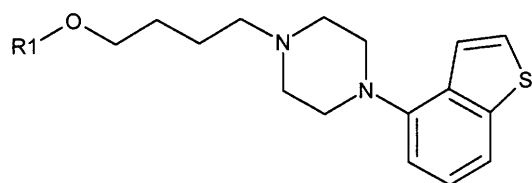
実施例	R1	MS (M+1)
1033		465
1034		479
1035		450
1036		443

10

20

【 0 4 6 5】

【表 1 1 9】



実施例	R1	MS (M+1)
1037		464
1038		450
1039		424
1040		438
1041		438
1042		452
1043		454
1044		479
1045		465

【 0 4 6 6 】

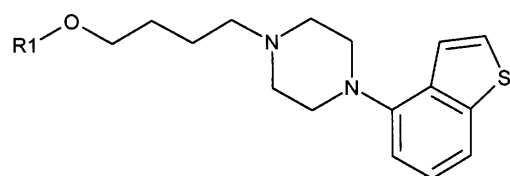
10

20

30

40

【表 1 2 0】



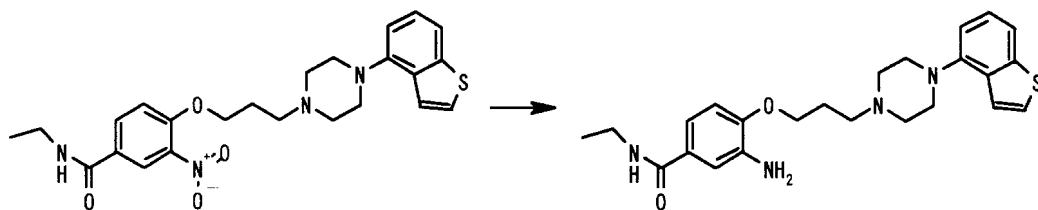
実施例	R1	MS (M+1)
1046		479
1047		450
1048		464
1049		450
1050		466
1051		465
1052		493
1053		479
1054		493
1055		464

実施例 1056

3-アミノ-4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-N-エチルベンズアミドの合成

【0468】

【化11】



10

【0469】

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-N-エチル-3-ニトロベンズアミド 1.0 g (2.1ミリモル)のエタノール溶液 (30 ml) に 5%パラジウム炭素 0.8 g を加えて室温常圧で接触還元した。触媒をろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン:メタノール=30:1→20:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して黄色無定形固体の3-アミノ-4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-N-エチルベンズアミド 0.78 g (収率 83%) を得た。

20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.23 (3H, t, $J=7.4$ Hz), 2.00-2.15 (2H, m), 2.67 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.75 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 3.40-3.50 (2H, m), 3.50-4.30 (2H, br), 4.13 (2H, t, $J=6.5$ Hz), 5.99 (1H, brs), 6.80 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 6.90 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.08 (1H, dd, $J=2.1, 8.3$ Hz), 7.19 (1H, d, $J=2.1$ Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz)。

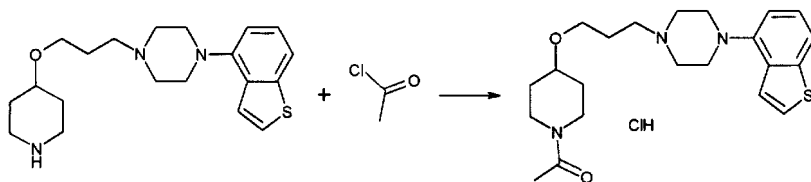
【0470】

実施例 1057

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-4-[3-(1-アセチルピペリジン-4-イルオキシ)プロピル]ピペラジン 塩酸塩の合成

【0471】

【化12】



40

【0472】

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-4-[3-(ピペリジン-4-イルオキシ)プロピル]ピペラジン 0.45 g (1.25ミリモル)のジクロロメタン溶液 (15 ml) にトリエチルアミン 0.28 ml (2.0ミリモル)を加え、氷水浴で冷却した。この溶液に塩化アセチル 0.1 ml (1.4ミリモル)を加え、得られた混合液を室温で一晩攪拌した。反応液に水を加えてジクロロメタンで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン:メタノール=30:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣に 0.5N塩

50

化水素メタノール溶液 3 m l を加えて生成した結晶をろ取り、乾燥して白色粉末の 1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4-[3-(1-アセチルピペラジン-4-イルオキシ)プロピル]ピペラジン 塩酸塩 0.36 g (収率 66%) を得た。

融点 208-210°C。

【0473】

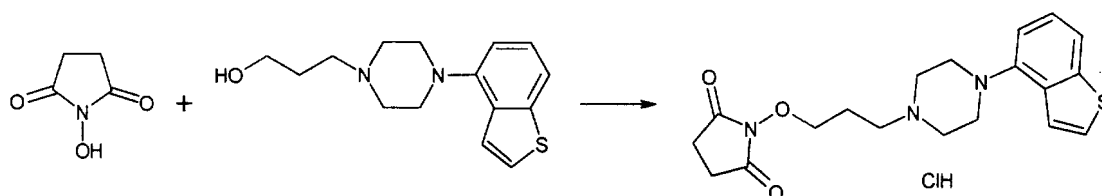
実施例 1058

1-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]ピロリジン-2,5-ジオン 塩酸塩の合成

【0474】

10

【化13】



【0475】

20

3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロパノール 1.00 g (3.6 mmol) の THF 溶液 (50 ml) に PS-トリフェニルホスフィン (3 mmol/g) 1.80 g、ジ tert-ブチルアゾジカルボキシレート 1.27 g (5.4 mmol) 及び N-ヒドロキシスクシンイミド 510 mg (4.3 mmol) を加え、混合液を室温で 4 時間攪拌した。レジンを通過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 1：2) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して白色無定形固体 762 mg (収率 47%) を得た。157 mg をエタノールに溶解し 1 N-塩化水素エタノール溶液 0.42 ml を加え、エーテルを加えて冷蔵庫に放置した。生成した結晶をろ取り、乾燥して白色粉末の 1-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]ピロリジン-2,5-ジオン 塩酸塩 158 mg を得た。

30

融点 255.0-257.0°C。

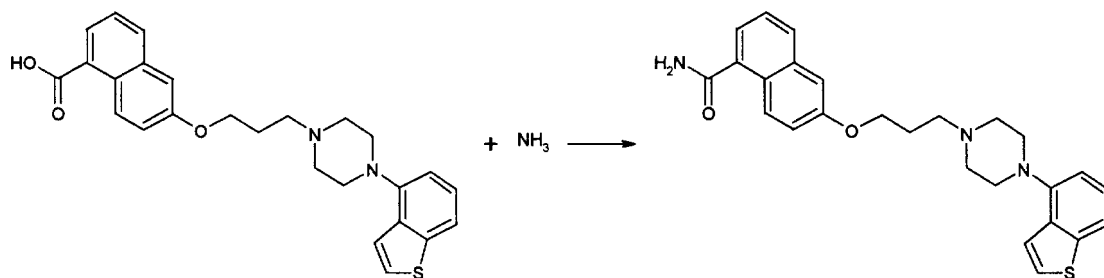
【0476】

実施例 1059

6-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-ナフトアミドの合成

【0477】

【化14】



40

【0478】

6-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-ナフトアミドの合成

50

キシ] - 1 - ナフタレンカルボン酸 0.52 g (1.2 ミリモル) のアセトニトリル溶液 (10 ml) に氷冷下トリエチルアミン 0.24 ml (1.7 ミリモル) 及びクロロ炭酸イソブチル 0.19 ml (1.4 ミリモル) を加え、混合液を 20 分攪拌した。この溶液にアンモニア水 (28%) 0.5 ml を加え、得られた溶液を室温で 20 分攪拌した。反応液に酢酸エチルを加えて水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 2 : 1 → 0 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の 6 - [3 - (4 - ベンゾ [b] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル) プロポキシ] - 1 - ナフトアミド 0.27 g (収率 53%) を得た。

融点 167.0-169.0°C。

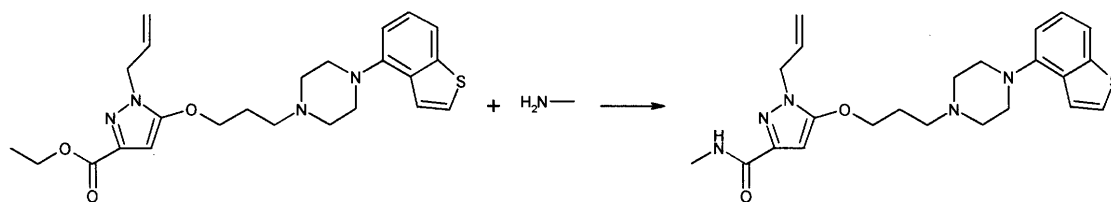
【0479】

実施例 1060

1 - アリル - 5 - [3 - (4 - ベンゾ [b] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル) プロポキシ] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸メチルアミドの合成

【0480】

【化 15】



【0481】

1 - アリル - 5 - [3 - (4 - ベンゾ [b] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル) プロポキシ] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸エチルエステル 0.5 g (1.1 ミリモル) のメタノール溶液 (5 ml) に 40% メチルアミンメタノール溶液 5 ml を加えて室温で 3 日間攪拌した。減圧下に濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 5 : 1 → 0 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の 1 - アリル - 5 - [3 - (4 - ベンゾ [b] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル) プロポキシ] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸メチルアミド 0.32 g (収率 67%) を得た。

融点 138.5-140.5°C。

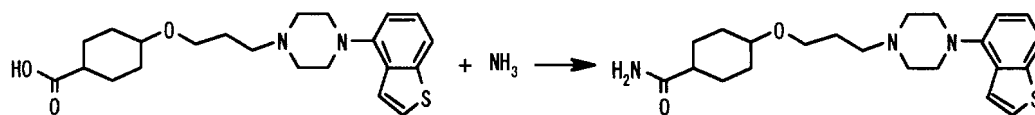
【0482】

実施例 1061

4 - [3 - (4 - ベンゾ [b] チオフェン - 4 - イル - ピペラジン - 1 - イル) プロポキシ] シクロヘキサンカルボキサミドの合成

【0483】

【化 16】



【0484】

4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] シクロヘキサンカルボン酸 0.5 g (1.2 ミリモル) のジクロロメタン溶液 (10 ml) にアンモニア水 (28%) 0.5 ml、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (WSC) 0.36 g (1.9 ミリモル) 及び 4-ジメチルアミノピリジン (DMAP) 0.05 g (0.4 ミリモル) を加え、この混合液を室温で 19 時間攪拌した。反応液にジクロロメタンを加えて水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 3:1 → 0:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の 4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] シクロヘキサンカルボキサミド 0.1 g (収率 22%) を得た。

10

融点 107.5-108.5°C。

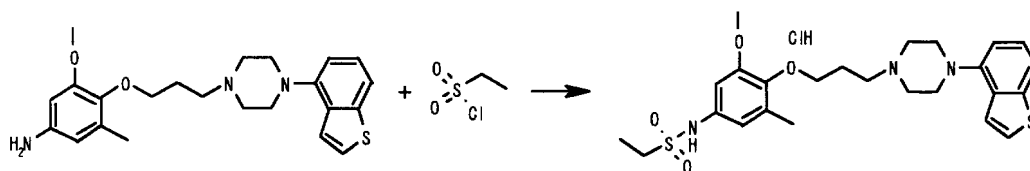
【0485】

実施例 1062

エタンスルホン酸 {4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル} アミド 塩酸塩の合成

【0486】

【化17】



20

【0487】

4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミン 0.2 g (0.49 ミリモル) のジクロロメタン溶液 (4 ml) を氷冷し、N-エチルジイソプロピルアミン 0.15 ml (0.87 ミリモル) 及びエタンスルホンクロリド 0.07 ml (0.73 ミリモル) を加え、混合液を室温で 1 時間攪拌した。N-エチルジイソプロピルアミン 0.15 ml (0.87 ミリモル) 及びエタンスルホンクロリド 0.07 ml (0.73 ミリモル) を追加して室温で 19 時間攪拌した。得られた溶液に 6N-水酸化ナトリウム水溶液 0.5 ml 及びエタノール 2 ml を加えて室温で一夜攪拌した。反応液にジクロロメタンを加えて水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン: 酢酸エチル = 2:1 → 0:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣に 4N-塩化水素酢酸エチル溶液を加え、生成した結晶をろ取し、乾燥して白色粉末のエタンスルホン酸 {4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル} アミド 塩酸塩 222 mg (収率 85%) を得た。

30

融点 235.5-237.5°C。

【0488】

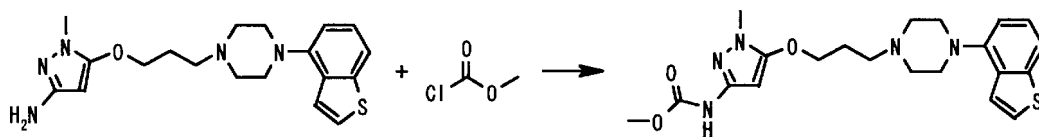
実施例 1063

5-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルカルバミン酸メチルエステルの合成

【0489】

40

【化 18】



【0490】

5-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルアミン 0.17 g (0.47 ミリモル) のジクロロメタン溶液 (2 ml) を氷冷し、この溶液にピリジン 0.08 ml (0.94 ミリモル) 及びクロロ炭酸メチル 0.04 ml (0.52 ミリモル) を加え、得られた溶液を室温で 17 時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加えて水で洗浄した。水層を酢酸エチルで抽出した。有機層を合わせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2:1→1:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の 5-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルカルバミン酸メチルエステル 0.10 g (収率 51%) を得た。

融点 162.5-165.0°C。

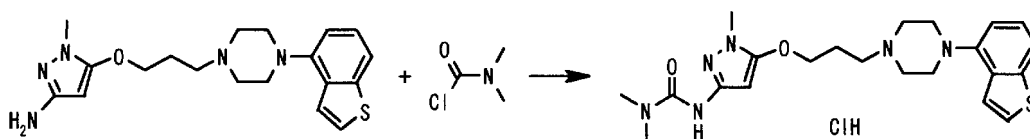
【0491】

実施例 1064

3-{5-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} 1,1-ジメチル尿素 塩酸塩の合成

【0492】

【化 19】



【0493】

5-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルアミン 0.27 g (0.73 ミリモル) のジクロロメタン溶液 (5 ml) を氷冷し、この溶液にトリエチルアミン 0.36 ml (2.5 ミリモル)、ジメチルカルバモイルクロリド 0.20 ml (2.1 ミリモル) 及びピリジン 0.06 ml (0.73 ミリモル) を加え、得られた溶液を室温で一晩攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=3:1→0:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、4N-塩化水素酢酸エチル溶液を加えて生成した結晶をろ取し、乾燥して淡黄色粉末の 3-{5-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} 1,1-ジメチル尿素 塩酸塩 0.10 g (収率 30%) を得た。

融点 174.0-176.5°C。

【0494】

10

20

30

40

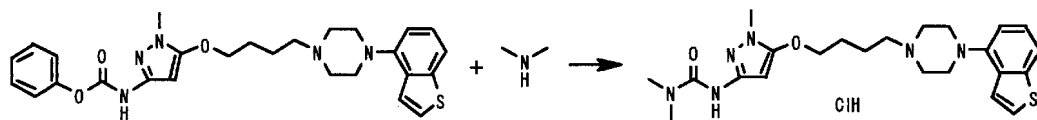
50

実施例 1065

3- {5- [4- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) ブトキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} 1, 1-ジメチル尿素 塩酸塩の合成

【0495】

【化20】



10

【0496】

5- [4- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) ブトキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルカルバミン酸フェニルエステル 0.26 g (0.52ミリモル) のDMF溶液 (3ml) にジメチルアミン水溶液 (50%) 0.16 ml (1.6ミリモル) を加えて室温で16時間攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=7：3→0：1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して残渣を酢酸エチルに溶解し、得られた溶液に1N-塩化水素エタノール溶液を加えた。生成した結晶をろ取り、乾燥して白色粉末の3- {5- [4- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) ブトキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} 1, 1-ジメチル尿素 塩酸塩 95 mg (収率37%) を得た。

20

融点 186.0-187.5°C。

【0497】

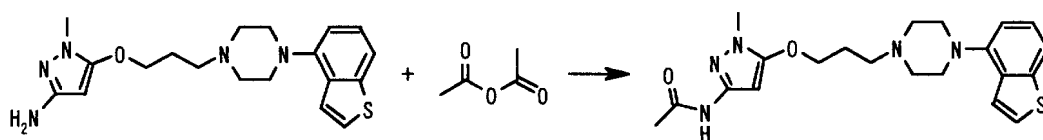
実施例 1066

N- {5- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} アセトアミドの合成

30

【0498】

【化21】



【0499】

5- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルアミン 0.20 g (0.54ミリモル) のジクロロメタン溶液 (4ml) に無水酢酸 1ml 及びトリエチルアミン 0.09 ml (0.65ミリモル) を加え、混合液を室温で6時間攪拌した。反応液に炭酸カリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2：1→0：1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末のN- {5- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} アセトアミド 0.19 g (収率89%) を得た。

40

50

融点 137.0-139.0℃。

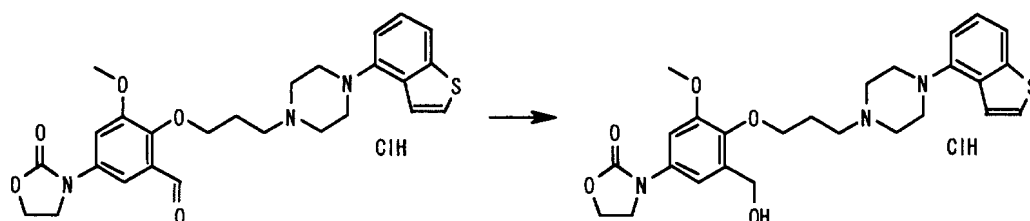
【0500】

実施例1067

3- {4- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-ヒドロキシメチル-5-メトキシフェニル} オキサゾリジン-2-オン
塩酸塩の合成

【0501】

【化22】



10

【0502】

2- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-メトキシ-5- (2-オキソオキサゾリジン-3-イル) ベンズアルデヒド

20

塩酸塩 1.28 g (2.4 ミリモル) を炭酸カリウム水溶液に加えジクロロメタンで抽出した。抽出物を減圧下に濃縮し、残渣を THF 15 ml に溶解した。得られた溶液に氷冷水素化硼素ナトリウム 0.05 g (1.2 ミリモル) を加え、混合液を室温で 3 時間攪拌した。反応液に氷冷水 10% 塩酸を加えて過剰の試薬を分解した。得られた溶液に 6 N-水酸化ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性にした後、反応物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン：酢酸エチル = 3：7 → ジクロロメタン：メタノール = 100：3) で精製した。精製物を減圧下に濃縮して残渣をエタノールに溶解し、1 N-塩化水素エタノール溶液を加えた。生成した結晶をエタノールから再結晶して白色粉末の 3- {4- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-ヒドロキシメチル-5-メトキシフェニル} オキサゾリジン-2-オン 塩酸塩 0.52 g (収率 41%) を得た。

30

融点 224.0-226.5℃ (分解)。

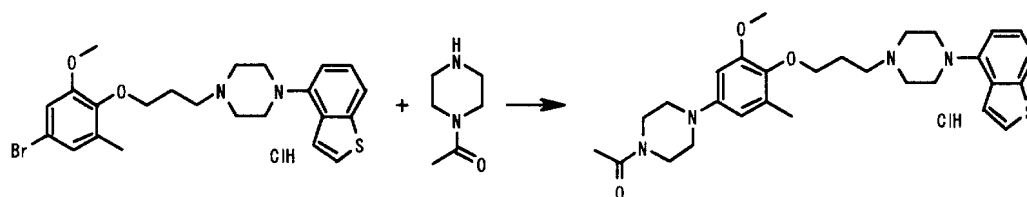
【0503】

実施例1068

1-アセチル-4- {4- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-メトキシ-5-メチルフェニル} ピペラジン 塩酸塩の合成

【0504】

【化23】



40

【0505】

50

1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4-[3-(4-ブロモ-2-メトキシ-6-メチルフェノキシ)プロピル]ピペラジン 塩酸塩 0.5 g (0.98ミリモル)、1-アセチルピペラジン 0.15 g (1.2ミリモル)、酢酸パラジウム 11 mg (0.048ミリモル)、2, 2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフチル (BINAP) 63 mg (0.098ミリモル) 及びナトリウムt-ブトキシド 0.23 g (2.3ミリモル) をトルエン 10 ml に加え、混合液をアルゴン雰囲気下 90℃ で 22 時間攪拌した。得られた反応液を室温まで冷却し、セライトろ過した。ろ物は酢酸エチルで洗浄し、ろ液と洗液を合わせて減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 11 : 1 → 1 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、得られた溶液に 1 N-塩化水素エタノール溶液を加えた。生成した結晶をろ取し、乾燥して白色粉末の 1-アセチル-4-{4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}ピペラジン 塩酸塩 75 mg (収率 14%) を得た。
融点 257.0-261.0℃ (分解)。

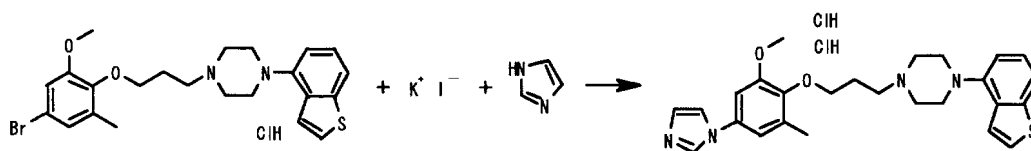
【0506】

実施例 1069

1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4-[3-(4-イミダゾール-1-イル-2-メトキシ-6-メチルフェノキシ)プロピル]ピペラジン 二塩酸塩の合成

【0507】

【化24】



【0508】

1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4-[3-(4-ヨード-2-メトキシ-6-メチルフェノキシ)プロピル]ピペラジン 0.6 g (0.69ミリモル)、イミダゾール 0.07 g (1.03ミリモル)、よう化銅 (I) 13 mg (0.069ミリモル)、trans-N, N'-ジメチル-1, 2-シクロヘキサンジアミン 0.02 ml (0.14ミリモル) 及び炭酸セシウム 0.47 g (1.38ミリモル) を 1, 4-ジオキサン 6 ml に加えてアルゴン雰囲気下 50 時間加熱還流した。室温まで冷却し、反応液に水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 5 : 1 → 1 : 1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、得られた溶液に 1 N-塩化水素エタノール溶液を加えた。生成した結晶をろ取し、乾燥して淡黄色粉末の 1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4-[3-(4-イミダゾール-1-イル-2-メトキシ-6-メチルフェノキシ)プロピル]ピペラジン 二塩酸塩 60 mg (収率 17%) を得た。

融点 234.0-240.0℃ (分解)。

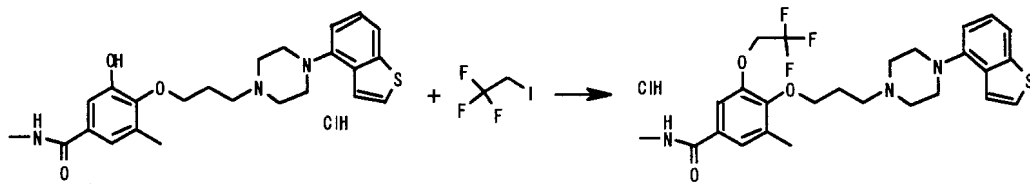
【0509】

実施例 1070

4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3, N-ジメチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)ベンズアミド 塩酸塩の合成

【0510】

【化 2 5】



10

【0 5 1 1】

4-〔3-〔4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル〕プロポキシ〕-3-ヒドロキシ-5, N-ジメチルベンズアミド 188 mg (0.39ミリモル) の DMF 溶液 (2 ml) に炭酸セシウム 0.34 g (0.99ミリモル) 及び 1, 1, 1-トリフルオロ-2-ヨードエタン 0.05 ml (0.47ミリモル) を加え、混合液を 40℃ で 2 時間攪拌した。攪拌後の混合液に 1, 1, 1-トリフルオロ-2-ヨードエタン 0.1 ml (0.94ミリモル) を追加し、この混合液を 40℃ で 5 時間攪拌した。得られた反応液を室温まで冷却し、これに水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=3：1→0：1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣をイソプロピルアルコールに溶解し、得られた溶液に 1 N-塩化水素エタノール溶液を加えて減圧下に濃縮した。残渣をイソプロピルアルコール-酢酸エチル混合溶媒から再結晶して淡黄色粉末の 4-〔3-〔4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル〕プロポキシ〕-3, N-ジメチル-5-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)ベンズアミド 塩酸塩 88 mg (収率 40%) を得た。融点 156.0-157.5℃。

20

【0 5 1 2】

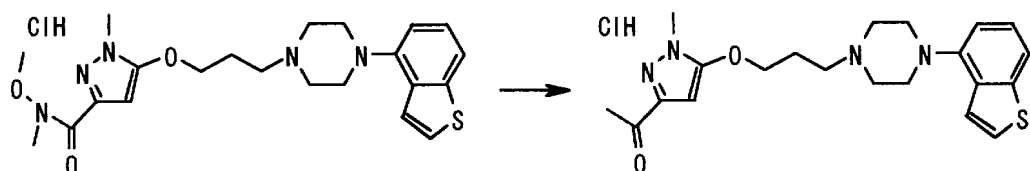
実施例 1071

3-アセチル-5-〔3-〔4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル〕プロポキシ〕-1-メチル-1H-ピラゾール 塩酸塩の合成

30

【0 5 1 3】

【化 2 6】



40

【0 5 1 4】

5-〔3-〔4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル〕プロポキシ〕-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 メトキシメチルアミド 塩酸塩 0.61 g (1.3ミリモル) を水酸化ナトリウム水溶液に加えてジクロロメタンで抽出した。抽出物を減圧下に濃縮し、残渣を THF 12 ml に溶解した。得られた溶液を -78℃ に冷却し、これに 1 N-メチルリチウムエーテル溶液 1.2 ml を加え、混合液を同温度で 2 時間攪拌した。反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、これを室温まで加熱し、炭酸カリウムを加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロ

50

メタン：酢酸エチル＝３：１→０：１）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣をエタノールに溶解し、１Ｎ－塩化水素エタノール溶液を加えた。得られた結晶を含水エタノールから再結晶して白色粉末の３－アセチル－５－〔３－（４－ベンゾ〔b〕チオフェン－４－イル－ピペラジン－１－イル）プロポキシ〕－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール塩酸塩０．２２ｇ（収率４０％）を得た。

融点 ２４５．０℃（分解）。

【０５１５】

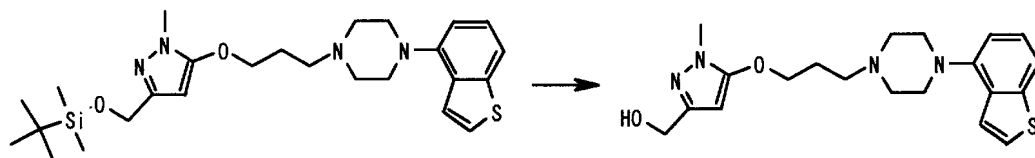
実施例１０７２

３－〔３－（４－ベンゾ〔b〕チオフェン－４－イル－ピペラジン－１－イル）プロポキシ〕－５－ヒドロキシメチル－１－メチル－１Ｈ－ピラゾールの合成

10

【０５１６】

【化２７】



20

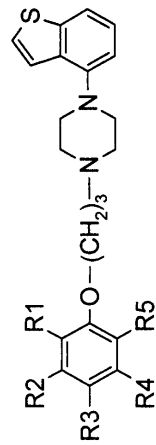
【０５１７】

３－〔３－（４－ベンゾ〔b〕チオフェン－４－イル－ピペラジン－１－イル）プロポキシ〕－５－（tert-ブチルジメチルシラニルオキシメチル）－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール０．７５ｇ（１．５ミリモル）のTHF溶液（８ｍｌ）を氷冷し、この溶液に１Ｍ－テトラブチルアンモニウムフルオリドTHF溶液１．７ｍｌを加え、混合液を室温で１６時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン：メタノール＝１：０→３０：１→１５：１）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル－ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の３－〔３－（４－ベンゾ〔b〕チオフェン－４－イル－ピペラジン－１－イル）プロポキシ〕－５－ヒドロキシメチル－１－メチル－１Ｈ－ピラゾール０．４６ｇ（収率７９％）を得た。

30

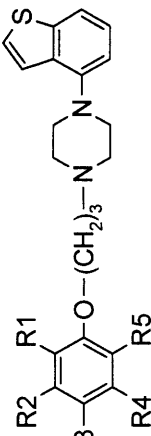
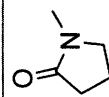
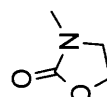
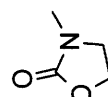
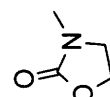
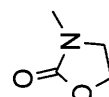
融点 １２３．５－１２６．０℃。

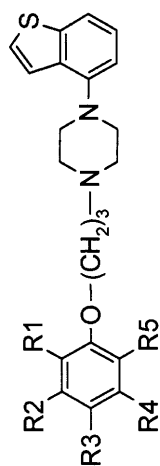
【０５１８】

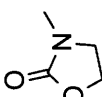
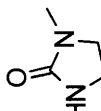
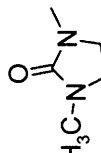
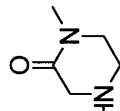


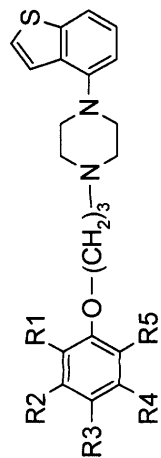
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1056	-OCH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	235.5-237.5	塩酸塩
1057	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OH	白色粉末 (酢酸エチル)	246.5 (分解)	塩酸塩
1058	-CH ₃	-H	-Br	-H	-OCH ₃	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	265.0 (分解)	塩酸塩
1059	-OCH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	140.5-142.5	—
1060	-CH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NH ₂	-H	-OCH ₃	イソプロピルエーテル- 白色粉末 (メタノール-水)	268.0 (分解)	二塩酸塩
1061	-OCH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCOCH ₃	-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	167.5-170.5	—
1062	-OCH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCO ₂ CH ₃	-H	-CH ₃	イソプロピルエーテル- 白色粉末 (酢酸エチル)	157.0-159.5	—
1063	-CH ₃	-H	-NHCOCH ₂ NHCHO	-H	-OCH ₃	イソプロピルエーテル- 白色粉末 (ジクロロメタン-水)	235.5 (分解)	塩酸塩
1064	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-O(CH ₂) ₂ N(CH ₃) ₂	白色粉末 (酢酸エチル)	235.5-240.5 (分解)	二塩酸塩
1065	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-O(CH ₂) ₂ OCH ₃	白色粉末 (イソプロピルアルコール- イソプロピルエーテル)	194.0-197.5	塩酸塩
1066	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OCH ₂ CF ₃	淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	156.0-157.5	塩酸塩

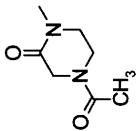
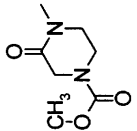
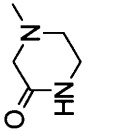
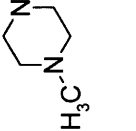
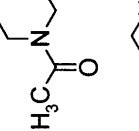
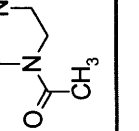
【 0 5 2 0 】

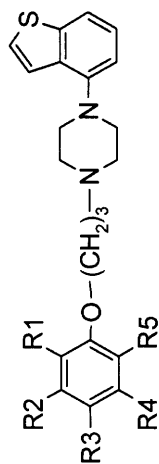
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1067		-H	-H	-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	114.0-115.5	—
1068	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	245.0 (分解)	塩酸塩
1069	-H	-H		-H	-H	白色粉末 (酢酸エチル)	217.0-224.5 (分解)	塩酸塩
1070	-OCH ₃	-H		-H	-CHO	白色粉末 (エタノール)	218.0 (分解)	塩酸塩
1071	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	白色粉末 (エタノール)	224.0-226.5 (分解)	塩酸塩
1072	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OCH ₃	白色粉末 (エタノール)	224.0-226.0	塩酸塩

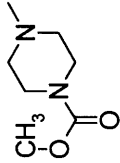
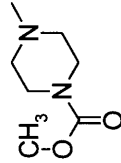
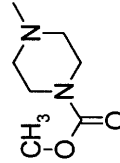
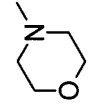
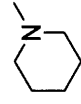


実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1073	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ N(CH ₃) ₂	白色粉末 (エタノール-エーテル)	151.0-152.0	ニフマル酸塩
1074	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	淡黄色粉末 (エタノール-水)	264.0 (分解)	塩酸塩
1075	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	淡黄色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	143.5-151.0	—
1076	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	246.5-249.0 (分解)	塩酸塩
1077	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	234.0-240.0 (分解)	二塩酸塩
1078	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (メタノール-水)	286.5 (分解)	二塩酸塩

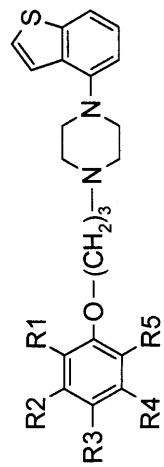


実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1079	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (エタノール-水)	218.0-221.5	塩酸塩
1080	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	223.0-228.0	塩酸塩
1081	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	139.5-142.0	—
1082	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	270.0 (分解)	三塩酸塩
1083	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	257.0-261.0 (分解)	塩酸塩
1084	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	白色粉末 (酢酸エチル)	217.5-221.0	塩酸塩



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1085	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	250.0 (分解)	塩酸塩
1086	-OCH ₃	-H		-H	-CHO	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	225.0 (分解)	塩酸塩
1087	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₂ OH	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	128.0-130.0	—
1088	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	246.0 (分解)	塩酸塩
1089	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	248.0-251.0 (分解)	二塩酸塩

【表 1 2 6】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	塩
1090	-NH ₂	-H	-CONHC ₂ H ₅	-H	-H	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.23 (3H, t, J=7.4 Hz), 2.00-2.15 (2H, m), 2.67 (2H, t, J=7.3 Hz), 2.75 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 3.40-3.50 (2H, m), 3.50-4.30 (2H, br), 4.13 (2H, t, J=6.5 Hz), 5.99 (1H, brs), 6.80 (1H, d, J=8.4 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.6 Hz), 7.08 (1H, dd, J=2.1, 8.3 Hz), 7.19 (1H, d, J=2.1 Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz).	-

【 0 5 2 4】

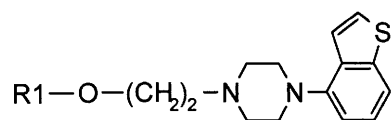
10

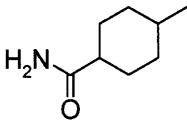
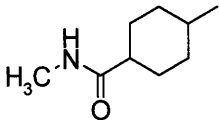
20

30

40

【表 1 2 7】



実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1091 	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	166.0-171.0	—
1092 	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	138.5-141.0	—

【 0 5 2 5 】

R1-O-(CH2)3-N1CCN(C1)c2cc3ccsc3cc2

実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1093	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	138.5-140.5	—
1094	白色粉末 (エタノール)	233.5 (分解)	塩酸塩
1095	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	147.0-148.5	—
1096	白色粉末 (水)	115.0-121.0	—
1097	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	129.0-130.5	—
1098	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	139.0-140.5	—

【 0 5 2 6 】

R1-O-(CH2)3-N1CCN(C1)c2c3ccsc3cc2

実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1099	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	128.5-131.5	—
1100	白色粉末 (イソプロピルアルコール- 酢酸エチル)	227.0 (分解)	塩酸塩
1101	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	211.0-213.5	塩酸塩
1102	白色粉末 (エタノール-水)	245.0 (分解)	塩酸塩
1103	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	112.0-113.0	—
1104	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	123.5-126.0	—
1105	淡黄色粉末 (酢酸エチル)	174.0-176.5	塩酸塩
1106	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	137.0-139.0	—

【 0 5 2 7 】

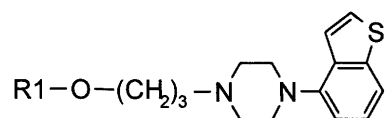
【表 1 3 0】

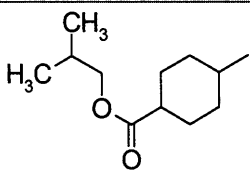
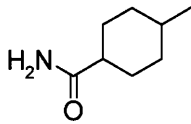
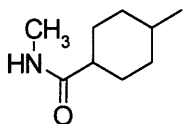
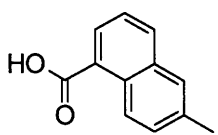
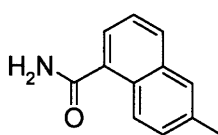
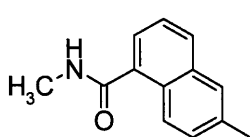
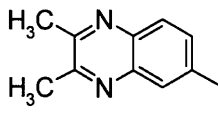
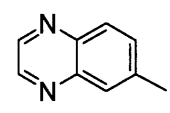
$$\text{R1-O-(CH}_2\text{)}_3\text{-N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{C}_6\text{H}_4 \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{C}_4\text{H}_3\text{S} \end{array}$$

実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1107	白色粉末 (酢酸エチル)	194.0-196.0	塩酸塩
1108	白色粉末 (酢酸エチル)	173.0-177.0	二塩酸塩
1109	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	162.5-165.0	—
1110	白色粉末 (メタノール)	202-205	塩酸塩
1111	白色粉末 (メタノール)	208-210	塩酸塩
1112	白色粉末 (エタノール)	255.0-257.0	塩酸塩
1113	白色粉末 (メタノール)	178-182	塩酸塩

【 0 5 2 8 】

【表 1 3 1】



実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点 (°C)	塩
1114 	白色粉末 (酢酸エチル)	199.0-201.5	塩酸塩
1115 	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	107.5-108.5	—
1116 	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	110.0-112.0	—
1117 	白色粉末 (水)	203.0-210.0	—
1118 	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	167.0-169.0	—
1119 	白色粉末 (酢酸エチル)	138.0-140.0	—
1120 	白色粉末 (酢酸エチル-ヘキサン)	115	—
1121 	淡茶色粉末 (エタノール)	134.7	—

【0 5 2 9】

10

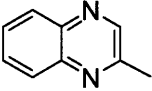
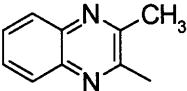
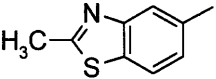
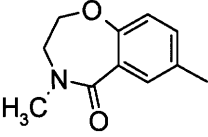
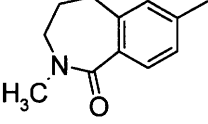
20

30

40

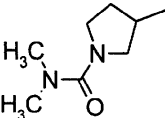
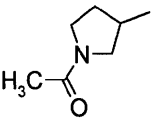
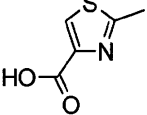
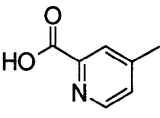
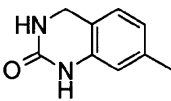
【表 1 3 2】

$R1-O-(CH_2)_3-N$ 

実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1122 	白色粉末 (エタノール)	131.3	—
1123 	白色粉末 (エタノール)	107.1	—
1124 	白色粉末 (酢酸エチル)	231.3-232.8	塩酸塩
1125 	白色粉末 (酢酸エチル)	218.9-221.0	塩酸塩
1126 	白色粉末 (酢酸エチル)	259.0-260.2	塩酸塩

【 0 5 3 0 】

R1-O-(CH2)3-N1CCN(C1)c2c3ccccc23S4=CC=CC=C4

実施例 R1	融点 (°C)	塩
1127	 ¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.80-2.10 (4H, m), 2.74 (6H, s), 3.10-3.70 (16H, m), 4.00-4.10 (1H, m), 6.97 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.32 (1H, t, J=7.9 Hz), 7.49 (1H, d, J=5.6 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 10.91 (1H, brs).	塩酸塩
1128	 ¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.80-2.10 (4H, m), 1.93 (3H, s), 3.10-3.60 (16H, m), 3.90-4.10 (1H, m), 6.95 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.30 (1H, t, J=7.9 Hz), 7.47 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.68 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.75 (1H, d, J=5.5 Hz), 11.30 (1H, brs).	塩酸塩
1129	 ¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.20-2.40 (2H, m), 2.70-3.70 (10H, m), 4.55 (2H, t, J=5.9 Hz), 6.98 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.32 (1H, t, J=7.9 Hz), 7.50 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.71 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.77 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.89 (1H, s), 10.97 (1H, brs), 12.93 (1H, brs).	塩酸塩
1130	 ¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 2.25-2.35 (2H, m), 3.20-4.00 (10H, m), 4.30 (2H, t, J=5.8 Hz), 6.97 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.24 (1H, dd, J=5.5, 2.8 Hz), 7.31 (1H, t, J=7.8 Hz), 7.49 (1H, d, J=5.4 Hz), 7.59 (1H, d, J=2.5 Hz), 7.70 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (1H, d, J=5.5 Hz), 8.53 (1H, d, J=5.7 Hz), 10.99 (1H, brs).	塩酸塩
1131	 ¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.89-2.13 (2H, m), 2.52-2.83 (6H, m), 3.03-3.3- (4H, m), 4.01 (2H, t, J = 6.3 Hz), 4.46 (2H, brs), 5.30 (1H, brs), 6.51 (1H, dd, J = 8.3, 2.3 Hz), 6.83-6.96 (2H, m), 7.19-7.45 (3H, m), 7.48 (1H, brs), 7.55 (1H, d, J = 8.0 Hz).	フマル酸塩

【 0 5 3 1 】

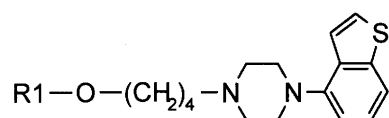
【表 1 3 4】

$$\text{R1}-\text{O}-(\text{CH}_2)_4-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{C}_4\text{H}_3\text{S} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array}$$

実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1132	淡茶色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	103.5-106.0	—
1133	淡茶色粉末 (ジクロロメタン-水)	140.5-144.0	—
1134	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	143.0-144.5	—
1135	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	211.0-213.5	塩酸塩
1136	白色粉末 (酢酸エチル)	207.5-209.5	塩酸塩
1137	白色粉末 (エタノール)	167.0-168.5	塩酸塩
1138	白色粉末 (酢酸エチル)	156.5-158.5	塩酸塩
1139	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	157.5-161.5	—

【 0 5 3 2 】

【表 1 3 5】



実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1140	白色粉末 (酢酸エチル)	203.5-206.0	塩酸塩
1141	白色粉末 (酢酸エチル)	186.0-187.5	塩酸塩
1142	白色粉末 (酢酸エチル)	203.0-207.0	塩酸塩
1143	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	146.5-148.0	—
1144	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	96.5-97.0	—
1145	白色粉末 (酢酸)	254.0 (分解)	二塩酸塩
1146	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	124.0-126.5	—
1147	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	181.5-183.5	—
1148	白色粉末 (酢酸エチル)	230.2-231.5	塩酸塩
1149	白色粉末 (酢酸エチル)	207.4-209.6	塩酸塩

【表 1 3 6】

$$\text{R1}-\text{O}-(\text{CH}_2)_4-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{---} \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{---} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{C}_4\text{H}_3\text{S} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{---} \end{array}$$

実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1150	白色粉末 (酢酸エチル)	213.8-215.2	塩酸塩
1151	白色粉末 (酢酸エチル)	217.0-218.0	塩酸塩
1152	白色粉末 (酢酸エチル)	231.6-232.9	塩酸塩
1153	淡黄色粉末 (エタノール)	135.7	—
1154	淡茶色粉末 (エタノール)	238.1-240.1	塩酸塩
1155	白色粉末 (エタノール)	210.4	塩酸塩
1156	白色粉末 (エタノール)	94.1	—

【0 5 3 4】

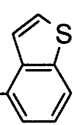
【表 1 3 7】

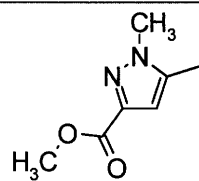
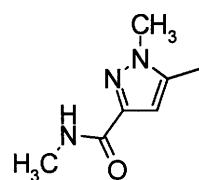
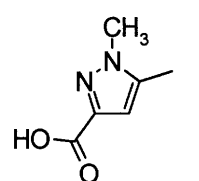
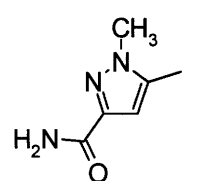
$$\text{R1}-\text{O}-(\text{CH}_2)_4-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{---} \end{array} \text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{---} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \text{C}_4\text{H}_3\text{S} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \text{---} \end{array}$$

実施例 R1	NMR	塩
1157	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.72-1.83 (2H, m), 1.83-1.98 (2H, m), 2.48-2.59 (2H, m), 2.64-2.81 (4H, m), 3.12-3.28 (4H, m), 3.46 (3H, s), 3.58 (3H, s), 4.13 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 6.62 (1H, d, $J = 2.1$ Hz), 6.80 (1H, dd, $J = 8.8, 2.1$ Hz), 6.90 (1H, d, $J = 7.6$ Hz), 7.20-7.31 (1H, m), 7.35-7.43 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 8.15 (1H, d, $J = 8.8$ Hz).	—

【0 5 3 5】

【表 1 3 8】

$R1-O-(CH_2)_5-N$ 

実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
1158 	白色粉末 (酢酸エチル)	200.5-201.5	塩酸塩
1159 	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	225.0-230.0	塩酸塩
1160 	白色粉末 (ジクロロメタン-水)	156.0-158.5	—
1161 	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	169.0-171.5	—

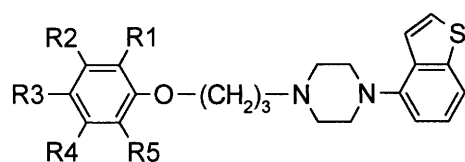
【0 5 3 6】

10

20

30

【表 1 3 9】

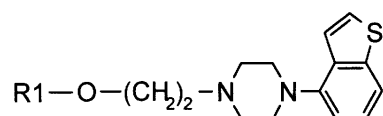


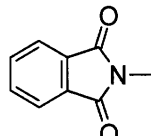
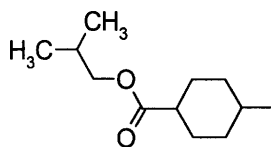
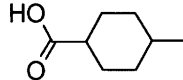
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	
1162	-OCH ₃	-H	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.51(9H, s), 1.95-2.10 (2H, m), 2.24(3H, s), 2.66-2.81(6H, m), 3.14-3.31(2H, m), 3.84(3H, s), 3.95(2H, t, J=6.3Hz), 6.36(1H, br), 6.60(1H, d, J=2.5Hz), 6.87-6.92(1H, m), 7.01(1H, d, J=2.0Hz), 7.24-7.31(1H, m), 7.37-7.44(2H, m), 7.55(1H, d, J=8.0Hz)	10
1163	-OCH ₃	-H	-I	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.92-2.10 (2H, m), 2.23(3H, s), 2.57-2.86(6H, m), 3.11-3.31(4H, m), 3.82(3H, s), 3.98(2H, t, J=6.4Hz), 6.90(1H, d, J=7.6Hz), 7.03(1H, d, J=2.0Hz), 7.13(1H, d, J=1.6Hz), 7.22-7.34(1H, m), 7.40(1H, dd, J=5.5Hz, 9.3Hz), 7.55(1H, d, J=8.0Hz)	20
1164	-OCH ₃	-H	-NHCONH(CH ₂) ₂ Cl	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.94-2.13 (2H, m), 2.26(3H, s), 2.60-2.90(6H, m), 3.12-3.33(4H, m), 3.49-3.75(4H, m), 3.83(3H, s), 3.97(2H, t, J=6.4Hz), 5.22(1H, br), 6.25(1H, br), 6.59(1H, d, J=2.3Hz), 6.86(1H, d, J=2.3Hz), 6.91(1H, d, J=7.4Hz), 7.21-7.33(1H, m), 7.41(1H, dd, J=5.6Hz, 7.6Hz), 7.56(1H, d, J=8.0Hz)	30
1165	-OCH ₃	-H	-NH(CH ₂) ₂ NH ₂	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.91-2.08 (2H, m), 2.22(3H, s), 2.62-2.81(6H, m), 2.95(2H, t, J=5.7Hz), 3.08-3.27(6H, m), 3.80(3H, s), 3.91(2H, t, J=6.4Hz), 6.05(1H, d, J=2.6Hz), 6.10(1H, d, J=2.6Hz), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.20-7.32(1H, m), 7.34-7.46(2H, m), 7.55(1H, d, J=8.0Hz)	40
1166	-OCH ₃	-H	-NH(CH ₂) ₂ NHCOCH ₂ Cl	-H	-CH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.91-2.11 (2H, m), 2.23(3H, s), 2.60-2.84(6H, m), 3.11-3.26(4H, m), 3.26-3.36(2H, m), 3.45-3.63(2H, m), 3.81(3H, s), 3.91(2H, t, J=6.4Hz), 4.06(2H, s), 6.04(1H, d, J=2.5Hz), 6.10(1H, d, J=2.5Hz), 6.78-6.96(2H, m), 7.21-7.33(1H, m), 7.35-7.47(2H, m), 7.55(1H, d, J=8.1Hz)	

【表 1 4 0】

 </						

【表 1 4 1】



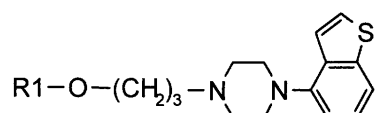
実施例 R1	NMR
1173 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 2.70-2.87(4H, m), 2.95(2H, t, J=5.1Hz), 2.99-3.14(4H, m), 4.42(2H, t, J=5.1Hz), 6.78(1H, dd, J=0.6Hz, 7.6Hz), 7.18-7.30(1H, m), 7.38 (2H, s), 7.54(1H, d, J=8.0Hz), 7.69-7.80(2H, m), 7.80-7.89(2H, m).
1174 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 0.93(6H, d, J=6.7Hz), 1.41-1.75(5H, m), 1.75-2.02 (4H, m), 2.23-2.48(1H, m), 2.65-2.87(6H, m), 3.06-3.25(4H, m), 3.42-3.54(1H, m), 3.62(2H, t, J=6.2Hz), 3.85(2H, d, J=6.5Hz), 6.89(1H, d, J=7.6Hz), 7.20-7.34(1H, m), 7.34-7.46 (2H, m), 7.54(1H, d, J=8.0Hz).
1175 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.41-1.75(4H, m), 1.75-2.01 (4H, m), 2.18-2.44(1H, m), 2.72-3.04(6H, m), 3.14-3.31(4H, m), 3.44-3.54(1H, m), 3.64(2H, t, J=6.0Hz), 6.88(1H, d, J=7.6Hz), 7.20-7.31(1H, m), 7.31-7.44 (2H, m), 7.55(1H, d, J=8.0Hz).

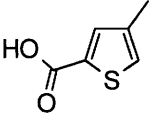
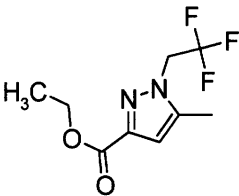
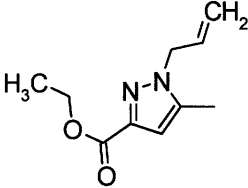
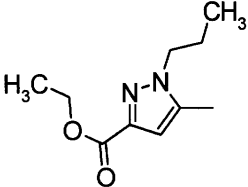
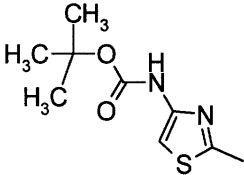
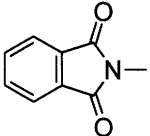
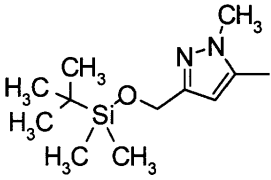
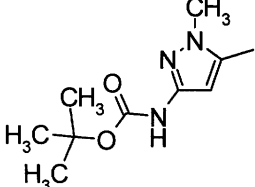
10

【 0 5 3 9】

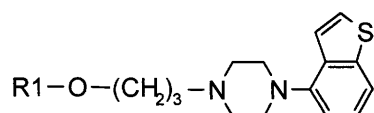
20

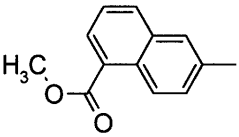
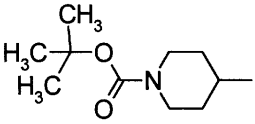
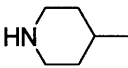
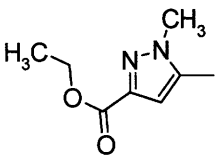
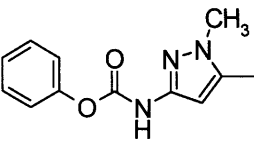
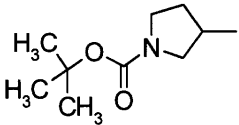
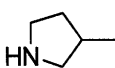
【表 1 4 2】



実施例	R1	NMR
1176		$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm: 1.85-1.95 (2H, m), 2.57 (2H, t, $J=7.1$ Hz), 2.60-2.75 (4H, m), 3.05-3.15 (4H, m), 4.03 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 6.85-6.95 (2H, m), 7.20-7.31 (2H, m), 7.35-7.41 (1H, m), 7.60 (1H, d, $J=8.1$ Hz), 7.68 (1H, d, $J=5.5$ Hz).
1177		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.39 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.00-2.11 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.0$ Hz), 2.63-2.80 (4H, m), 3.09-3.25 (4H, m), 4.24 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.40 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.64 (2H, q, $J=8.3$ Hz), 6.12 (1H, s), 6.90 (1H, dd, $J=0.5$ Hz, 7.5Hz), 7.25-7.31 (1H, m), 7.38-7.43 (2H, m), 7.56 (1H, d, $J=8.1$ Hz).
1178		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.39 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 2.00-2.06 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.67-2.83 (4H, m), 3.13-3.28 (4H, m), 4.18 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.39 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 4.61 (2H, m), 5.08-5.23 (2H, m), 5.87-6.09 (1H, m), 6.11 (1H, s), 6.75 (1H, dd, $J=0.6$ Hz, 7.5Hz), 7.25-7.37 (1H, m), 7.40-7.43 (2H, m), 7.65 (1H, d, $J=8.0$ Hz).
1179		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 0.91 (3H, t, $J=7.5$ Hz), 1.38 (3H, t, $J=7.0$ Hz), 1.72-1.93 (2H, m), 1.98-2.13 (2H, m), 2.61 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.67-2.83 (4H, m), 3.09-3.28 (4H, m), 4.01 (2H, t, $J=7.0$ Hz), 4.18 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.39 (2H, q, $J=7.0$ Hz), 6.08 (1H, s), 6.90 (1H, dd, $J=0.7$ Hz, 7.5Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.37-7.43 (2H, m), 7.56 (1H, d, $J=8.0$ Hz).
1180		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.51(9H, s), 1.97-2.12 (2H, m), 2.52-2.67(2H, m), 2.67-2.80(4H, m), 3.07-3.29(4H, m), 4.38(2H, t, $J=6.3$ Hz), 6.52(1H, br), 6.90(1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.03(1H, br), 7.21-7.33(1H, m), 7.40(2H, dd, $J=5.6$ Hz, 7.3Hz), 7.55(1H, d, $J=8.0$ Hz).
1181		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.95-2.13 (2H, m), 2.65-2.83(6H, m), 3.09-3.27(4H, m), 4.33(2H, t, $J=6.4$ Hz), 6.89(1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.20-7.32(1H, m), 7.40(1H, dd, $J=5.6$ Hz, 9.0Hz), 7.54(1H, d, $J=8.0$ Hz), 7.71-7.80(2H, m), 7.80-7.90(2H, m).
1182		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 0.10(6H, s), 0.92(9H, s), 1.93-2.13 (2H, m), 2.62 (2H, t, $J=7.5$ Hz), 2.70-2.83 (4H, m), 3.09-3.28 (4H, m), 3.59(3H, s), 4.13 (2H, t, $J=6.3$ Hz), 4.60 (2H, s), 5.54 (1H, s), 6.90 (1H, dd, $J=0.7$ Hz, 7.5Hz), 7.20-7.33 (1H, m), 7.35-7.48 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz).
1183		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.50 (9H, s), 1.94-2.12 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.0$ Hz), 2.66-2.80 (4H, m), 3.10-3.27 (4H, m), 3.52(3H, s), 4.15 (2H, t, $J=6.4$ Hz), 5.85 (1H, s), 6.81-6.97 (2H, m), 7.20-7.33 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz).

【表 1 4 3】



実施例	R1	NMR
1184		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 2.01-2.20 (2H, m), 2.62-2.87 (6H, m), 3.10-3.30 (4H, m), 3.99(3H, s), 4.20 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 6.91 (1H, dd, $J=0.7\text{Hz}$, 7.6Hz), 7.20(1H, d, $J=2.6\text{Hz}$), 7.22-7.34 (2H, m), 7.35-7.50 (3H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 7.90(1H, d, $J=8.1\text{Hz}$), 8.03(1H, dd, $J=1.2\text{Hz}$, 7.3Hz), 8.83(1H, d, $J=9.4\text{Hz}$).
1185		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.46 (9H, s), 1.45-1.60 (2H, m), 1.75-1.90 (4H, m), 2.50-2.60 (2H, m), 2.65-2.80 (4H, m), 3.05-3.25 (6H, m), 3.40-3.50 (1H, m), 3.53 (2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 3.70-3.80 (2H, m), 6.89 (1H, dd, $J=7.6$, 0.7 Hz), 7.20-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.54 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 8.02 (1H, s).
1186		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.30-1.60 (2H, m), 1.75-2.00 (4H, m), 2.50-2.75 (4H, m), 3.05-3.25 (6H, m), 3.30-3.40 (1H, m), 3.55 (2H, t, $J=6.5\text{Hz}$), 6.90 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.20-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$).
1187		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.38 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.00-2.10 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.65-2.75 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 3.72 (3H, s), 4.17 (2H, t, $J=6.4\text{Hz}$), 4.38 (2H, q, $J=7.1\text{Hz}$), 6.08 (1H, s), 6.89 (1H, d, $J=7.6\text{Hz}$), 7.20-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.54 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$).
1188		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.94-2.10 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.65-2.78 (4H, m), 3.10-3.25 (4H, m), 3.57(3H, s), 4.15 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 5.93 (1H, s), 6.89(1H, d, $J=7.5\text{Hz}$), 7.12-7.32 (3H, m), 7.33-7.45 (4H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$), 7.93(1H, br).
1189		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.75-2.00 (4H, m), 2.50-2.60 (2H, m), 2.70-2.75 (4H, m), 3.15-3.25 (4H, m), 3.35-3.80 (6H, m), 4.00-4.05 (1H, m), 6.91 (1H, dd, $J=7.6$, 0.5 Hz), 7.25-7.35 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.56 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$).
1190		$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.75-1.95 (4H, m), 2.51 (2H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.50-2.75 (8H, m), 3.10-3.20 (4H, m), 3.46 (2H, t, $J=6.3\text{Hz}$), 4.00-4.10 (1H, m), 6.88 (1H, d, $J=7.1\text{Hz}$), 7.20-7.30 (1H, m), 7.30-7.45 (2H, m), 7.53 (1H, d, $J=8.0\text{Hz}$).

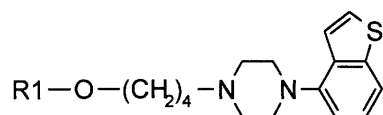
10

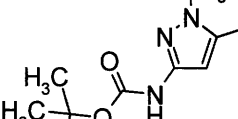
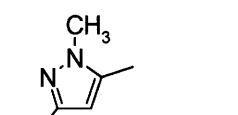
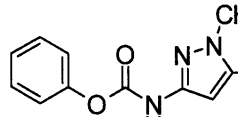
20

30

【0 5 4 1】

【表 1 4 4】



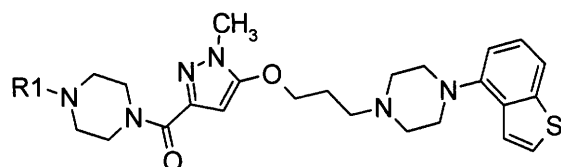
実施例 R1	NMR
1191 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm:: 1.50 (9H, s), 1.59-1.77(2H, m), 1.77-1.93 (2H, m), 2.50 (2H, t, J=7.3Hz), 2.61-2.80 (4H, m), 3.11-3.27 (4H, m), 3.54(3H, s), 4.09 (2H, t, J=6.3Hz), 5.85 (1H, s), 6.90 (1H, d, J=7.5Hz), 7.23-7.32 (1H, m), 7.36-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.80(1H, br).
1192 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm:: 1.64-1.93 (4H, m), 2.51 (2H, t, J=7.3Hz), 2.61-2.79 (4H, m), 3.11-3.29 (4H, m), 3.46(3H, s), 3.49(2H, br), 4.02 (2H, t, J=6.2Hz), 4.94 (1H, s), 6.90 (1H, dd, J=0.7hz, 7.6Hz), 7.22-7.33 (1H, m), 7.35-7.46 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz).
1193 	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm:: 1.64-1.78(2H, m), 1.78-1.94 (2H, m), 2.50 (2H, t, J=7.3Hz), 2.61-2.81 (4H, m), 3.10-3.28 (4H, m), 3.57(3H, s), 4.09 (2H, t, J=6.3Hz), 5.92 (1H, s), 6.77-6.98(4H, m), 7.11-7.32 (2H, m), 7.32-7.47 (4H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 8.47(1H, br).

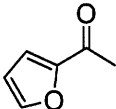
10

20

【 0 5 4 2 】

【表 1 4 5】



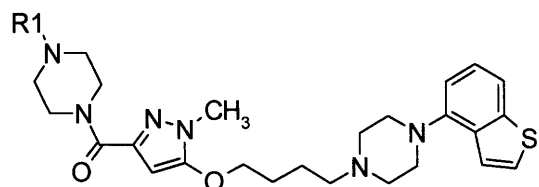
実施例	R1	MS(M+1)
1194	$-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	603
1195	$-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	541
1196	$-\text{COCH}_3$	511
1197	$-\text{CO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	569
1198	$-\text{COC}_6\text{H}_5$	573
1199	$-\text{COC}_3\text{H}_7$	539
1200		563

30

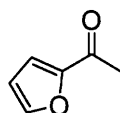
40

【 0 5 4 3 】

【表 1 4 6】

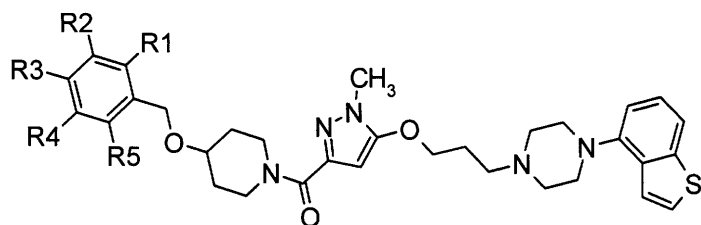


実施例	R1	MS(M+1)
1201	-CO ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	617
1202	-CO ₂ C ₂ H ₅	555
1203	-COCH ₃	525
1204	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	583
1205	-COC ₆ H ₅	587
1206	-COC ₃ H ₇	553
1207		577



【 0 5 4 4 】

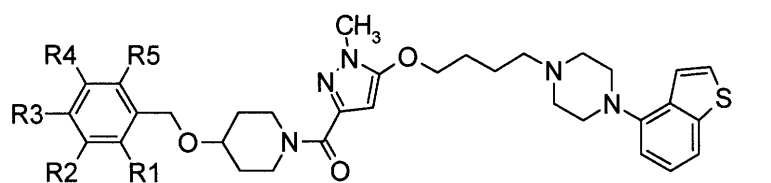
【表 1 4 7】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1208	-H	-H	-H	-Cl	-H	608
1209	-H	-H	-H	-H	-F	592
1210	-H	-H	-H	-H	-Cl	608
1211	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	642
1212	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	604
1213	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	634
1214	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	588
1215	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	588
1216	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	588
1217	-H	-H	-F	-H	-H	592
1218	-H	-H	-H	-F	-H	592
1219	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	658
1220	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	658
1221	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	658
1222	-H	-H	-OCH ₃	-Cl	-H	638
1223	-H	-H	-H	-Br	-H	652
1224	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	604
1225	-H	-H	-H	-H	-H	574

【 0 5 4 5 】

【表 1 4 8】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1226	-H	-H	-H	-Cl	-H	622
1227	-H	-H	-H	-H	-F	606
1228	-H	-H	-H	-H	-Cl	622
1229	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	656
1230	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	618
1231	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	648
1232	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	602
1233	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	602
1234	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	602
1235	-H	-H	-F	-H	-H	606
1236	-H	-H	-H	-F	-H	606
1237	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	672
1238	-H	-H	-H	-OCF ₃	-H	672
1239	-H	-H	-H	-H	-OCF ₃	672
1240	-H	-H	-OCH ₃	-Cl	-H	652
1241	-H	-H	-H	-Br	-H	666
1242	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	618
1243	-H	-H	-H	-H	-H	588

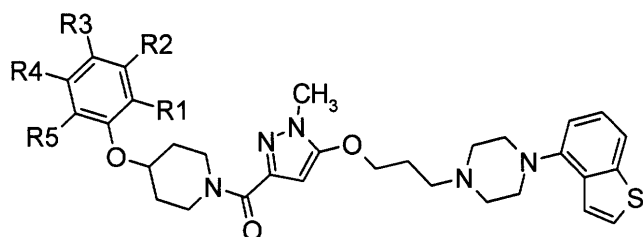
【 0 5 4 6 】

10

20

30

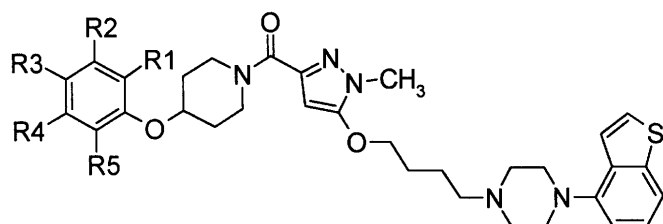
【表 1 4 9】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1244	-H	-H	-CN	-H	-H	585
1245	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	590
1246	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	590
1247	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	590
1248	-H	-H	-H	-H	-H	560
1249	-H	-H	-H	-H	-Cl	594
1250	-H	-H	-H	-Cl	-H	594
1251	-H	-H	-Cl	-H	-H	594
1252	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	574
1253	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	574
1254	-H	-H	-F	-H	-H	578
1255	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	628

【 0 5 4 7】

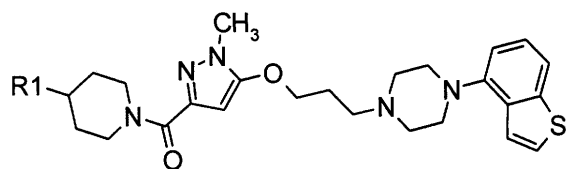
【表 1 5 0】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1256	-H	-H	-CN	-H	-H	599
1257	-H	-H	-H	-H	-OCH ₃	604
1258	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	604
1259	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	604
1260	-H	-H	-H	-H	-H	574
1261	-H	-H	-H	-H	-Cl	608
1262	-H	-H	-H	-Cl	-H	608
1263	-H	-H	-Cl	-H	-H	608
1264	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	588
1265	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	588
1266	-H	-H	-F	-H	-H	592
1267	-H	-H	-CF ₃	-H	-H	642

【 0 5 4 8】

【表 1 5 1】



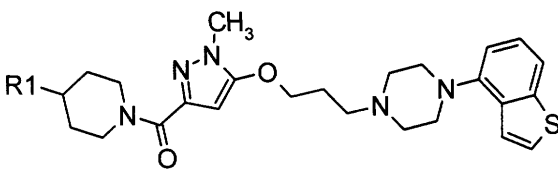
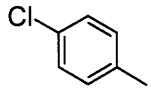
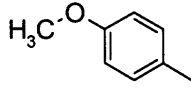
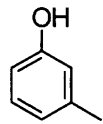
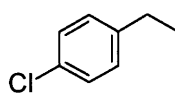
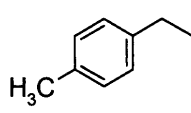
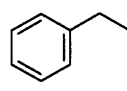
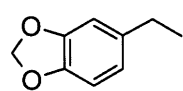
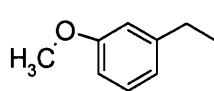
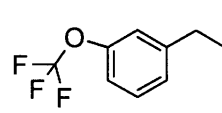
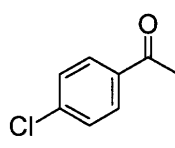
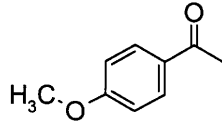
実施例	R1	MS(M+1)
1268	-OCH ₃	498
1269	-CH ₂ CONHC ₂ H ₅	553
1270	-OH	484
1271	-CO ₂ C ₂ H ₅	540
1272	-CONH ₂	511
1273	-CH ₂ OH	498
1274	-N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	597
1275	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	583
1276	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	568
1277	-NHCOCH ₃	525
1278	-N(CH ₃)COCH ₃	539
1279	-COOH	512
1280	-N(CH ₃)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	567
1281	-NHCO(CH ₂) ₂ CH ₃	553

【 0 5 4 9 】

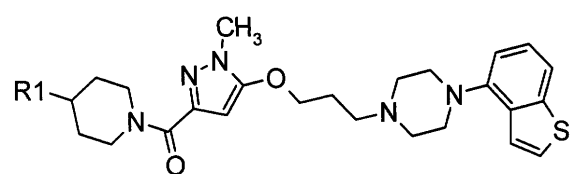
10

20

【表 1 5 2】

		
実施例	R1	MS(M+1)
1282		578
1283		574
1284		560
1285		592
1286		572
1287		558
1288		602
1289		588
1290		642
1291		606
1292		602

【表 1 5 3】



実施例	R1	MS(M+1)
1293		590
1294		572
1295		545
1296		561
1297		561
1298		575
1299		575
1300		587
1301		601

【 0 5 5 1】

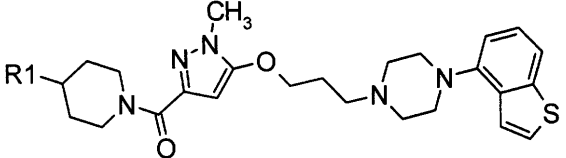
10

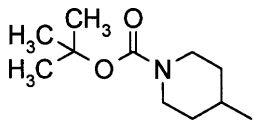
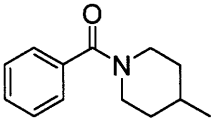
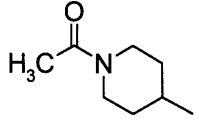
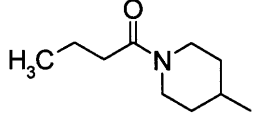
20

30

40

【表 1 5 4】



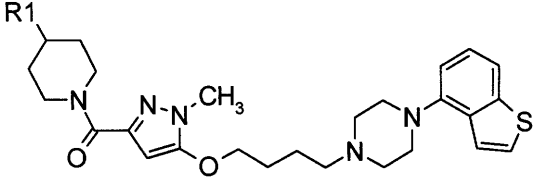
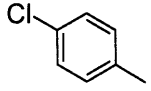
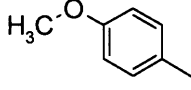
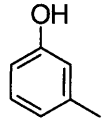
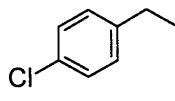
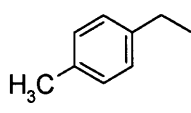
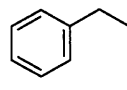
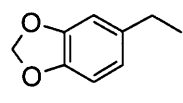
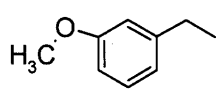
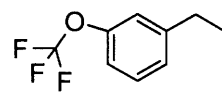
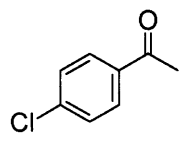
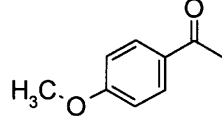
実施例	R1	MS(M+1)
1302		651
1303		655
1304		593
1305		621

10

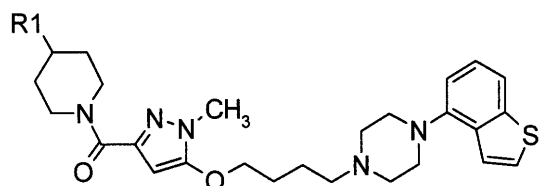
20

【 0 5 5 2】

【表 1 5 5】

		
実施例	R1	MS(M+1)
1306		592
1307		588
1308		574
1309		606
1310		586
1311		572
1312		616
1313		602
1314		656
1315		620
1316		616

【表 1 5 6】



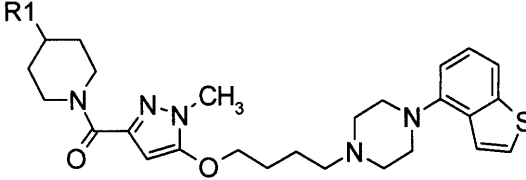
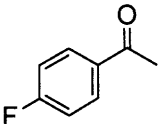
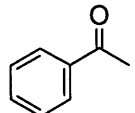
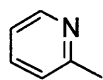
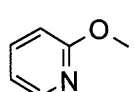
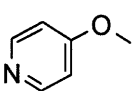
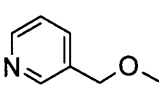
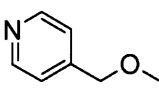
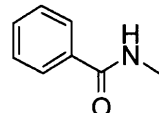
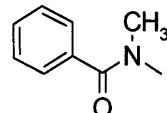
実施例	R1	MS(M+1)
1317	-OCH ₃	512
1318	-CH ₂ CONHC ₂ H ₅	567
1319	-OH	498
1320	-CO ₂ C ₂ H ₅	554
1321	-CONH ₂	525
1322	-CH ₂ OH	512
1323	-N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	611
1324	-NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	597
1325	-CO ₂ C(CH ₃) ₃	582
1326	-NHCOCH ₃	539
1327	-N(CH ₃)COCH ₃	553
1328	-N(CH ₃)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	581
1329	-NHCO(CH ₂) ₂ CH ₃	567
1330	-COOH	526

【 0 5 5 4 】

10

20

【表 1 5 7】

		
実施例	R1	MS(M+1)
1331		604
1332		586
1333		559
1334		575
1335		575
1336		589
1337		589
1338		601
1339		615

【 0 5 5 5】

10

20

30

40

【表 1 5 8】

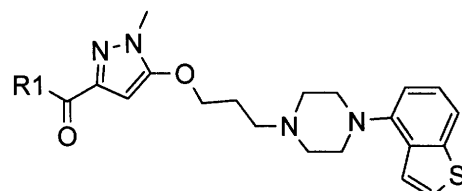
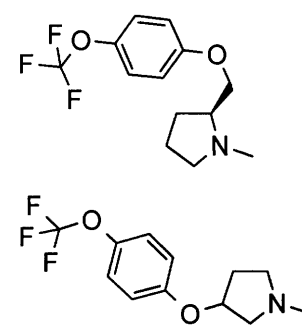
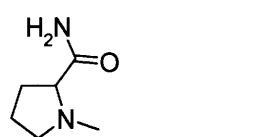
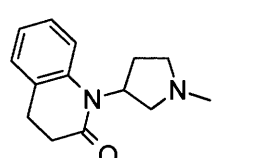
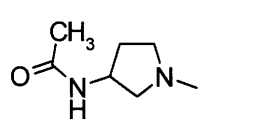
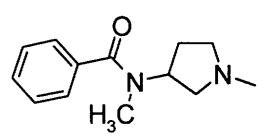
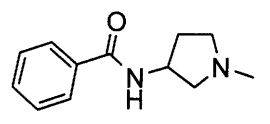
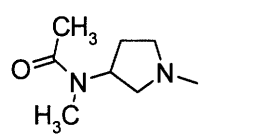
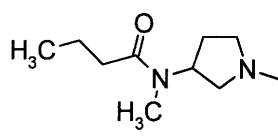
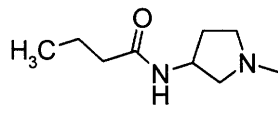
実施例	R1	MS(M+1)
1340		665
1341		669
1342		607
1343		635

10

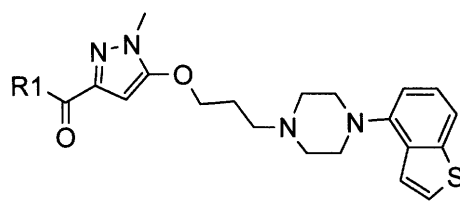
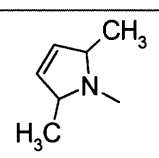
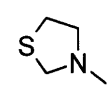
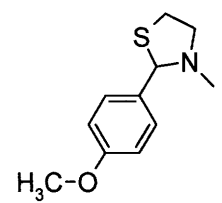
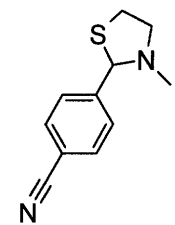
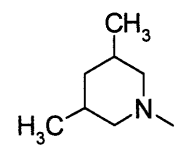
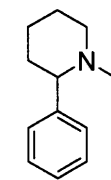
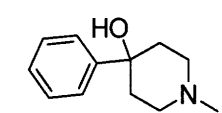
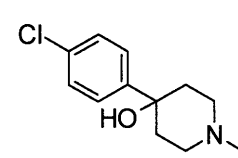
20

【 0 5 5 6 】

【表 1 5 9】

実施例	R1	MS(M+1)
1344		644
1345		630
1346		497
1347		599
1348		511
1349		587
1350		573
1351		525
1352		553
1353		539

【表 160】

		
実施例	R1	MS(M+1)
1354		480
1355		472
1356		578
1357		573
1358		496
1359		544
1360		560
1361		594

【0558】

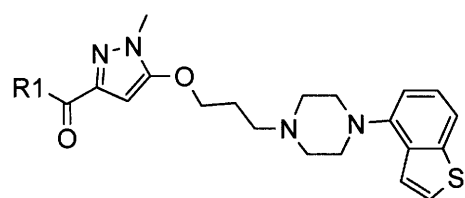
10

20

30

40

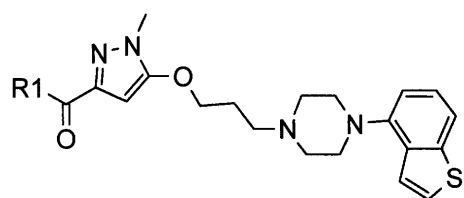
【表 1 6 1】



実施例	R1	MS(M+1)
1362		540
1363		600
1364		627
1365		484
1366		540
1367		512
1368		574
1369		526
1370		614

【 0 5 5 9】

【表 1 6 2】



実施例	R1	MS(M+1)
1371		543
1372		486
1373		470
1374		498
1375		546
1376		559
1377		539
1378		483
1379		593
1380		573

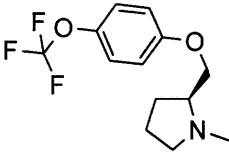
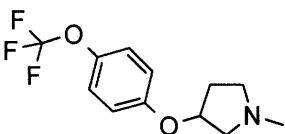
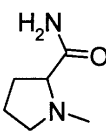
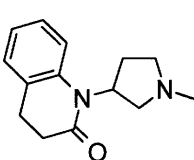
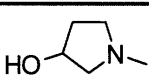
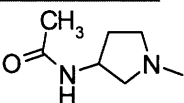
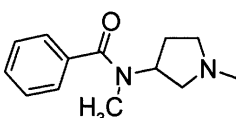
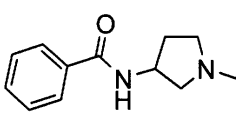
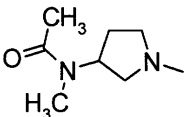
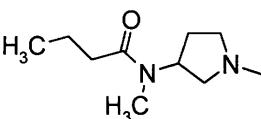
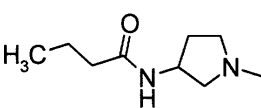
10

20

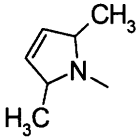
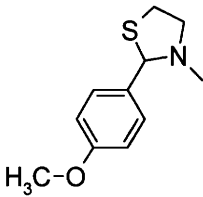
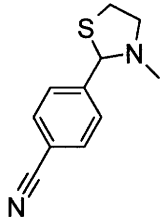
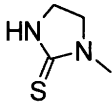
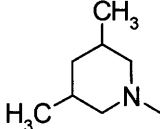
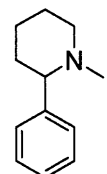
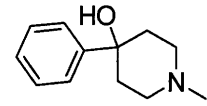
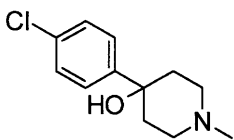
30

40

CN1C=CC(=O)N1C(=O)OCCCCN2CCN(CC2)c3c4ccccc4sc3

实施例	R1	MS(M+1)
1381		468
1382		658
1383		644
1384		511
1385		613
1386		484
1387		525
1388		601
1389		587
1390		539
1391		567
1392		553

【表 1 6 4】

実施例	R1	MS(M+1)
1393		494
1394		486
1395		592
1396		587
1397		499
1398		510
1399		558
1400		574
1401		608

【表 1 6 5】

实施例	R1	MS(M+1)
1402		554
1403		614
1404		641
1405		498
1406		554
1407		526
1408		588
1409		540
1410		628

【 0 5 6 3 】

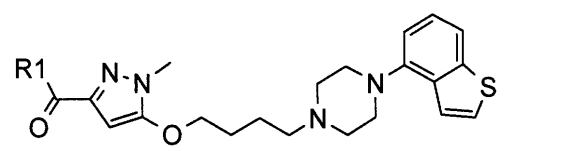
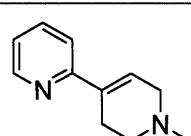
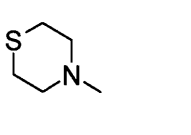
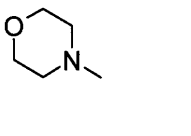
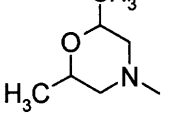
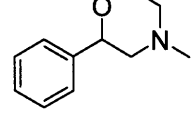
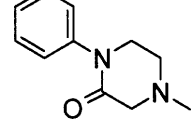
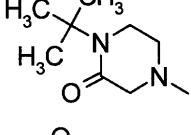
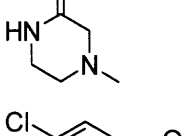
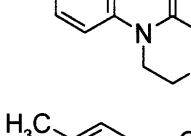
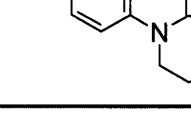
10

20

30

40

【表 1 6 6】

		
実施例	R1	MS(M+1)
1411		557
1412		500
1413		484
1414		512
1415		560
1416		573
1417		553
1418		497
1419		607
1420		587

【 0 5 6 4】

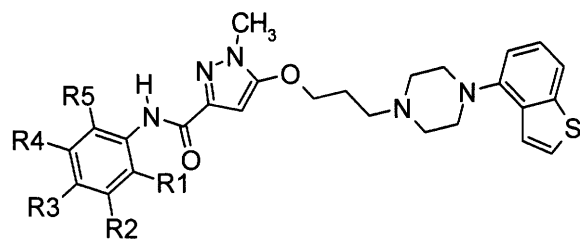
10

20

30

40

【表 1 6 7】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1421	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	560
1422	-H	-H	-H	-H	-SO ₂ NH ₂	555
1423	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	506
1424	-H	-H	-H	-OCH ₃	-H	506
1425	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	518
1426	-H	-H	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	534
1427	-H	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	536
1428	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	536
1429	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	536
1430	-OCH ₃	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	563
1431	-H	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	536
1432	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	519
1433	-H	-H	-H	-COCH ₃	-H	518
1434	-H	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	533
1435	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	533
1436	-H	-CN	-H	-H	-H	501
1437	-OCH ₃	-H	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	564
1438	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	568
1439	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	592
1440	-H	-H	-OH	-Cl	-H	526
1441	-Cl	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	567
1442	-H	-CN	-H	-H	-Cl	535
1443	-Cl	-H	-H	-CONH ₂	-H	553
1444	-H	-H	-NO ₂	-H	-H	521
1445	-H	-H	-CN	-H	-H	501

【 0 5 6 5 】

10

20

30

【表 1 6 8】

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1446	-H	-H		-H	-H	558
1447	-H	-H		-H	-H	584
1448	-H	-H		-H	-H	561
1449	-H	-H		-H	-H	605
1450	-H	-H	-H		-H	587
1451	-H	-H	-H		-H	542

10

20

30

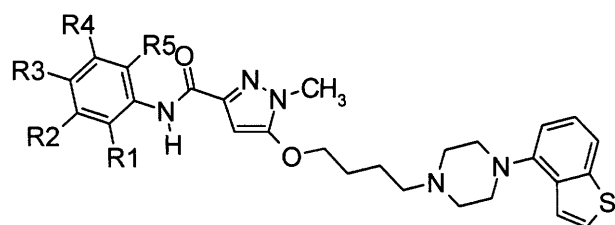
【 0 5 6 6 】

CN1C=CC(=O)N1C(=O)N2C(=C(R1)C(=C(R2)C(=C(R3)C2)R4)R5)C3=CC=C(C=C3)OCCCCN4CCN(C4)c5ccc6scccc6c5

实施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1452	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	574
1453	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	520
1454	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	520
1455	-H	-H	-COCH ₃	-H	-H	532
1456	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-H	-H	548
1457	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	550
1458	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	550
1459	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	550
1460	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	577
1461	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	550
1462	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	533
1463	-H	-COCH ₃	-H	-H	-H	532
1464	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	547
1465	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	547
1466	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	578
1467	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	582
1468	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	606
1469	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	550
1470	-H	-Cl	-OH	-H	-H	540
1471	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	-H	596
1472	-H	-H	-NHSO ₂ CH ₃	-H	-H	583
1473	-H	-H	-CONHC ₆ H ₅	-H	-H	609
1474	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	547
1475	-H	-H	-NHC ₆ H ₅	-H	-H	581
1476	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	-H	534
1477	-H	-H	-CCH	-H	-H	514
1478	-H	-H	-COC ₃ H ₇	-H	-H	560
1479	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-H	547
1480	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	-H	547

【 0 5 6 7 】

【表 170】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1481	-H	-H		-H	-H	573
1482	-H	-H		-H	-H	572
1483	-H		-H	-H	-H	601
1484	-H		-H	-H	-H	556
1485	-H		-H	-H	-H	557

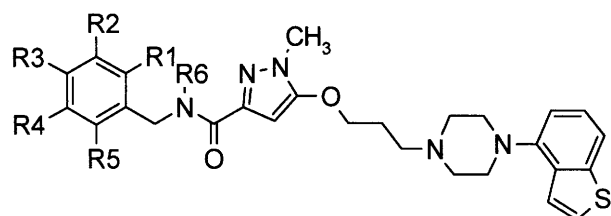
【0568】

10

20

30

【表 1 7 1】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
1486	-H	-H	-H	-H	-H	-H	490
1487	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	524
1488	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	524
1489	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	524
1490	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	561
1491	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH ₃	548
1492	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	564
1493	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-C ₂ H ₅	562
1494	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	520
1495	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	520
1496	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-CH ₃	588
1497	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	574
1498	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	550
1499	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	578
1500	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	520
1501	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	550
1502	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	634
1503	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	-H	534
1504	-H	-H	-H	-H	-H	-(CH ₂) ₃ OH	548
1505	-H	-Cl	-OCHF ₂	-H	-H	-H	590
1506	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	574
1507	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	534

【 0 5 6 9】

10

20

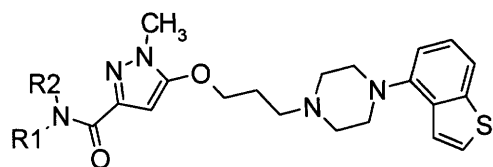
30

CN1C=CC(=O)N1C(=O)N(R6)Cc2cc(R1)c(R2)c(R3)c(R4)c(R5)c2OCCCCN2CCN(C2)c3ccc4ccccc4s3

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
1508	-H	-H	-H	-H	-H	-H	504
1509	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	538
1510	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	538
1511	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	538
1512	-H	-H	-H	-H	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	575
1513	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-CH ₃	562
1514	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	578
1515	-H	-H	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-C ₂ H ₅	576
1516	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	534
1517	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	534
1518	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-CH ₃	602
1519	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	588
1520	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	564
1521	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-C ₂ H ₅	592
1522	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	534
1523	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	564
1524	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-OC ₄ H ₉	-H	-H	648
1525	-OC ₂ H ₅	-H	-H	-H	-H	-H	548
1526	-H	-H	-H	-H	-H	-(CH ₂) ₃ OH	562
1527	-H	-Cl	-OCHF ₂	-H	-H	-H	604
1528	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	588
1529	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	548

【 0 5 7 0 】

【表 1 7 3】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
1530	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	496
1531	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	482
1532	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	512
1533	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	488
1534	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₂ H ₅	472
1535	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₂ CH ₂ OH	526
1536	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	516
1537	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	456
1538	-C ₄ H ₉	-H	456
1539	-C(CH ₃) ₃	-H	456
1540	-cyclo-C ₃ H ₅	-H	440
1541	-CH ₃	-H	414
1542	-C ₂ H ₅	-H	428
1543	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	456
1544	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	458
1545	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	-H	472
1546	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	-H	486
1547	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-H	520
1548	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-H	454
1549	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	-H	485
1550	-(CH ₂) ₅ OH	-H	486
1551	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-H	504
1552	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-H	472
1553	-CH ₂ CONH ₂	-H	457
1554	-CH(CO ₂ C ₂ H ₅) ₂	-H	558
1555	-CH(CH ₃)CO ₂ C ₂ H ₅	-H	500
1556	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	-CH ₃	486
1557	-CH ₂ CCH	-H	438
1558	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	470
1559	-(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	-CH ₃	528
1560	-(CH ₂) ₄ CO ₂ C ₂ H ₅	-H	528
1561	-CH(CONH ₂) ₂	-H	500
1562	-CH ₂ CF ₃	-H	482
1563	-NHCH ₂ CF ₃	-H	497
1564	-CH ₃	-CH ₃	428
1565	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	-H	500

【 0 5 7 1 】

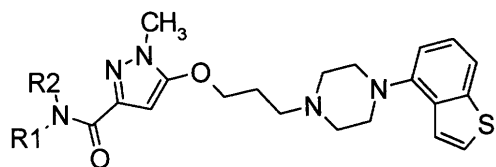
10

20

30

40

【表 1 7 4】



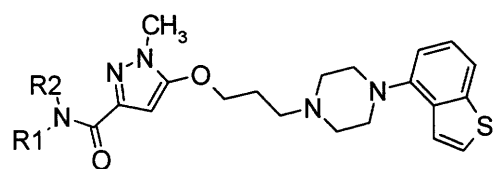
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1566	-CH ₂ CN	-H	439
1567	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	-H	486
1568	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	-H	486
1569	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	-H	472
1570	-CH ₂ CH ₂ F	-H	446
1571	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	-H	474
1572	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	471
1573	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	-H	474
1574	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	444
1575	-C ₆ H ₁₃	-H	484
1576	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	499
1577	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)COCH ₃	-H	499
1578	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	-H	527

【 0 5 7 2 】

10

20

【表 175】



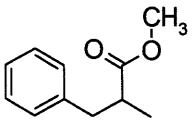
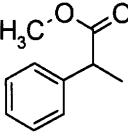
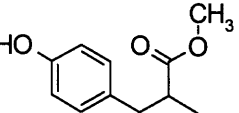
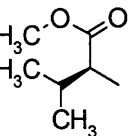
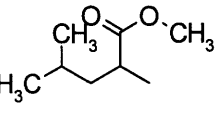
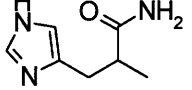
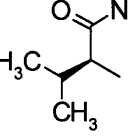
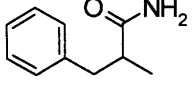
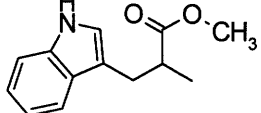
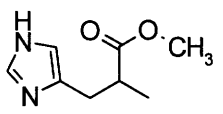
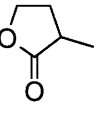
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1579		-CH ₃	519
1580		-C ₂ H ₅	526
1581		-H	518
1582		-H	491
1583		-H	491
1584		-H	491
1585		-H	480
1586		-C ₂ H ₅	533
1587		-C ₂ H ₅	578
1588		-CH ₃	534
1589		-C ₂ H ₅	591
1590		-C ₂ H ₅	633

【0573】

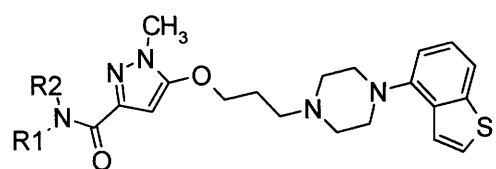
【表 1 7 6】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
1591		-C ₂ H ₅	631
1592		-CH ₃	601
1593		-CH ₃	539
1594		-CH ₃	548
1595		-C ₂ H ₅	562
1596		-C ₂ H ₅	592
1597		-H	454
1598		-H	534
1599		-H	534
1600		-H	538
1601		-H	534
1602		-H	498
1603		-H	508

【表 1 7 7】

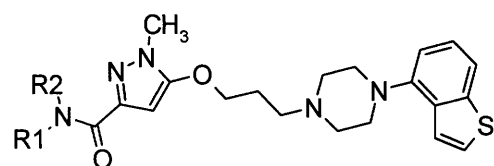
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1604		-H	562
1605		-H	548
1606		-H	578
1607		-H	514
1608		-H	528
1609		-H	537
1610		-H	499
1611		-H	547
1612		-H	601
1613		-H	552
1614		-H	484

【表 1 7 8】



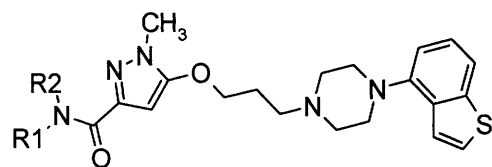
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1615		-H	471
1616		-H	485
1617		-CH ₃	577
1618		-CH ₃	561
1619		-H	534
1620		-H	518
1621		-H	518
1622		-H	545
1623		-H	559
1624		-H	505
1625		-CH(CH ₃) ₂	547
1626		-CH ₃	619

【表 179】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
1627		-CH ₃	615
1628		-CH ₃	615
1629		-CH ₃	615
1630		-CH ₃	635
1631		-CH ₃	635
1632		-C ₄ H ₉	657
1633		-CH(CH ₃) ₂	643
1634		-H	583
1635		-H	569
1636		-C ₂ H ₅	573
1637		-H	540

【表 180】



実施例	R1	R2	MS(M+1)	MW
1638		-H	558	557.72
1639		-H	558	557.68
1640		-H	572	571.70
1641		-H	543	542.71
1642		-H	530	529.67
1643		-H	559	558.63
1644		-H	525	524.69
1645		-H	484	483.64
1646		-H	506	505.65
1647		-H	486	485.61
1648		-H	505	504.66
1649		-H	505	504.66

【0578】

10

20

30

40

【表 1 8 1】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
1650		-H	494
1651		-H	494
1652		-H	493
1653		-H	522
1654		-H	508
1655		-H	508
1656		-H	480
1657		-H	497
1658		-H	510
1659		-H	532
1660		-H	454
1661		-H	524

10

20

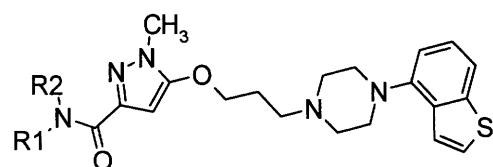
30

40

【表 1 8 2】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
1662		-H	498
1663		-H	588
1664		-CH ₃	580
1665		-H	516
1666		-H	494
1667		-H	505
1668		-H	562
1669		-H	543
1670		-H	574
1671		-H	574

【表 1 8 3】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
1672		-H	484
1673		-H	587
1674		-H	573
1675		-H	561
1676		-H	615
1677		-H	559
1678		-H	573
1679		-H	587
1680		-H	525
1681		-H	511

【 0 5 8 1】

【表 1 8 4】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
1682		-H	553
1683		-H	497
1684		-H	511
1685		-H	525
1686		-H	553
1687		-H	539
1688		-H	581
1689		-H	525
1690		-H	539
1691		-H	553
1692		-H	477

10

20

30

40

【表 1 8 5】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
1693		-H	516
1694		-H	477
1695		-H	507
1696		-H	575
1697		-H	515
1698		-H	483
1699		-H	540
1700		-H	467
1701		-H	443
1702		-H	481
1703		-H	557

10

20

30

40

【表 1 8 6】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
1704		-H	531
1705		-H	540
1706		-H	527
1707		-H	498
1708		-H	509
1709		-H	532
1710		-H	481
1711		-H	480
1712		-H	497
1713		-H	467

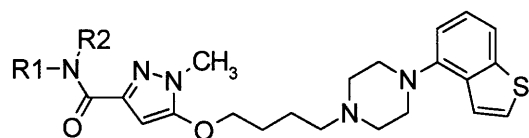
10

20

30

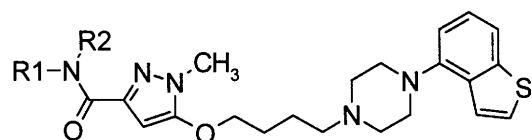
40

【表 1 8 7】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
1714	-CH ₃	-cyclo-C ₆ H ₁₁	510
1715	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	496
1716	-H	-CH(CH ₃) ₂	456
1717	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	526
1718	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	502
1719	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	486
1720	-CH ₂ CH ₂ OH	-cyclo-C ₆ H ₁₁	540
1721	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	530
1722	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	470
1723	-H	-C ₄ H ₉	470
1724	-H	-C(CH ₃) ₃	470
1725	-H	-cyclo-C ₃ H ₅	454
1726	-H	-CH ₃	428
1727	-H	-C ₂ H ₅	442
1728	-H	-C ₃ H ₇	456
1729	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	470
1730	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	472
1731	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	486
1732	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	500
1733	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	534
1734	-H	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	468
1735	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	499
1736	-H	-(CH ₂) ₅ OH	500
1737	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	518
1738	-H	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	486
1739	-H	-CH ₂ CONH ₂	471
1740	-H	-CH(CO ₂ C ₂ H ₅) ₂	572
1741	-H	-CH(CH ₃)CO ₂ C ₂ H ₅	514
1742	-CH ₃	-CH ₂ CO ₂ CH ₃	500
1743	-H	-CH ₂ CCH	452
1744	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	484
1745	-CH ₃	-(CH ₂) ₃ CO ₂ C ₂ H ₅	542
1746	-H	-(CH ₂) ₄ CO ₂ C ₂ H ₅	542
1747	-H	-CH(CONH ₂) ₂	514
1748	-H	-CH ₂ CF ₃	496
1749	-H	-NHCH ₂ CF ₃	511

【表 1 8 8】



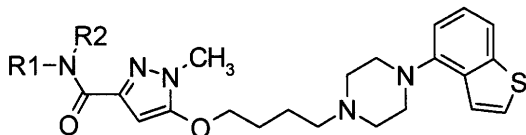
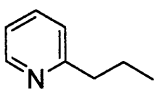
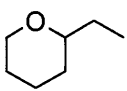
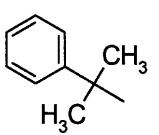
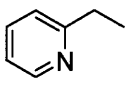
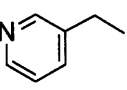
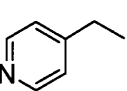
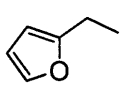
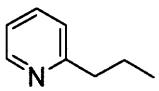
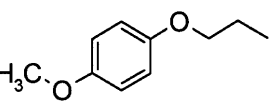
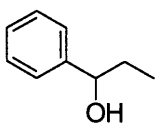
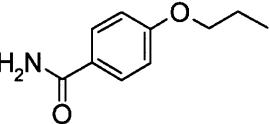
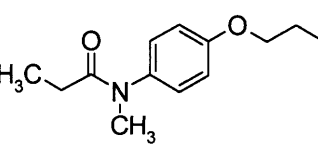
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1750	-CH ₃	-CH ₃	442
1751	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	502
1752	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	514
1753	-H	-CH ₂ CN	453
1754	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	486
1755	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	500
1756	-H	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	500
1757	-H	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	486
1758	-H	-CH ₂ CH ₂ F	460
1759	-H	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	488
1760	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	485
1761	-H	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	488
1762	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	458
1763	-H	-C ₆ H ₁₃	498
1764	-CH ₃	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	513
1765	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)COCH ₃	513
1766	-H	-(CH ₂) ₂ N(CH ₃)CO(CH ₂) ₂ CH ₃	541

【 0 5 8 6 】

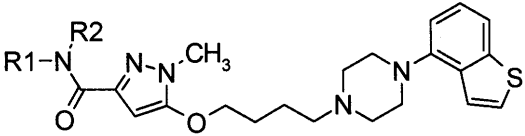
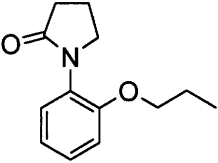
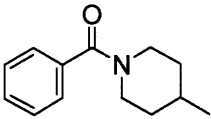
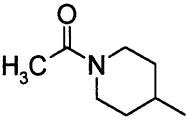
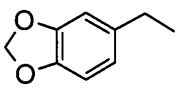
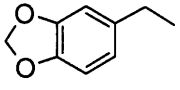
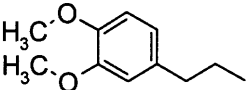
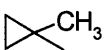
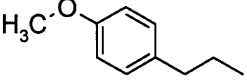
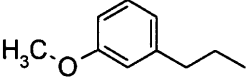
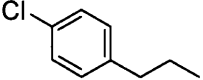
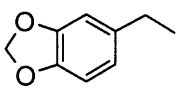
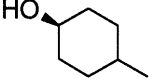
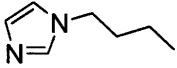
10

20

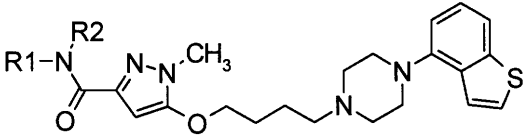
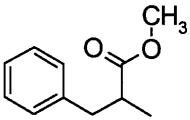
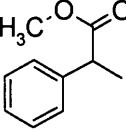
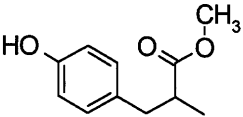
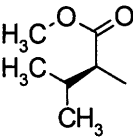
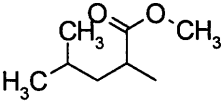
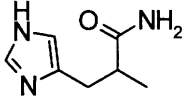
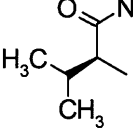
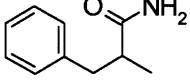
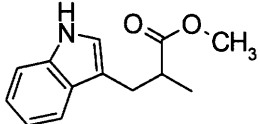
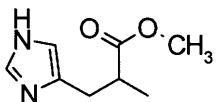
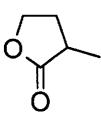
【表 1 8 9】

			
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1767		-CH ₃	533
1768		-C ₂ H ₅	540
1769		-H	532
1770		-H	505
1771		-H	505
1772		-H	505
1773		-H	494
1774		-C ₂ H ₅	547
1775		-C ₂ H ₅	592
1776		-CH ₃	548
1777		-C ₂ H ₅	605
1778		-C ₂ H ₅	647

【表 190】

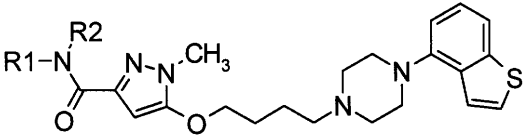
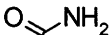
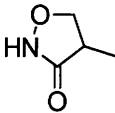
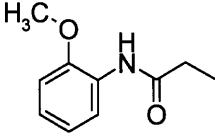
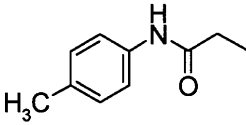
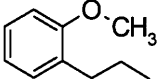
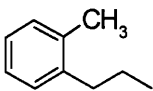
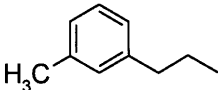
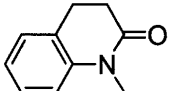
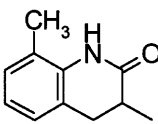
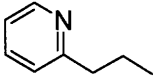
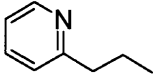
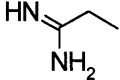
				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
1779		-C ₂ H ₅	645	10
1780		-CH ₃	615	
1781		-CH ₃	553	
1782		-CH ₃	562	20
1783		-C ₂ H ₅	576	
1784		-C ₂ H ₅	606	
1785		-H	468	30
1786		-H	548	
1787		-H	548	
1788		-H	552	40
1789		-H	548	
1790		-H	512	
1791		-H	522	

【表 191】

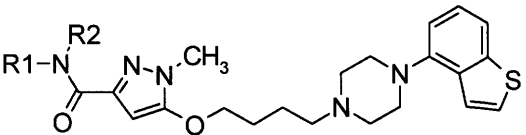
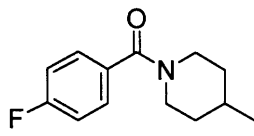
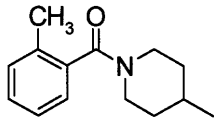
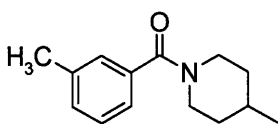
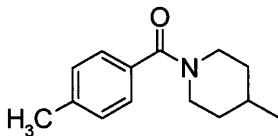
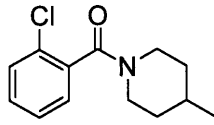
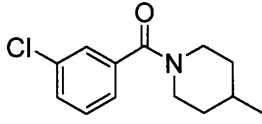
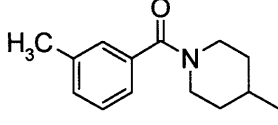
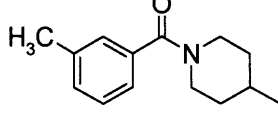
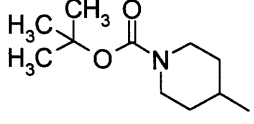
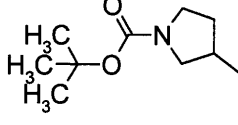
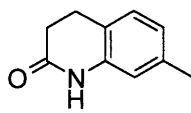
				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
1792		-H	576	10
1793		-H	562	
1794		-H	592	
1795		-H	528	20
1796		-H	542	
1797		-H	551	
1798		-H	513	30
1799		-H	561	
1800		-H	615	
1801		-H	566	40
1802		-H	498	

【0589】

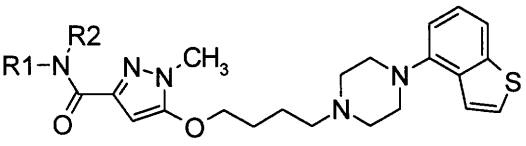
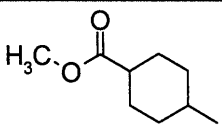
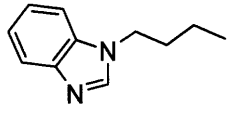
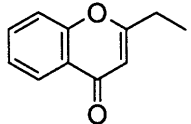
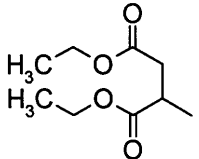
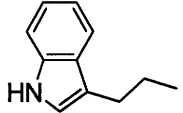
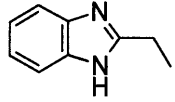
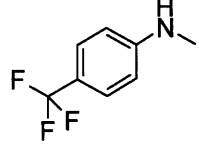
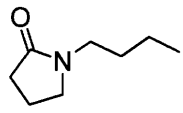
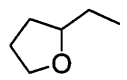
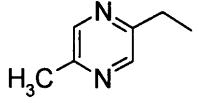
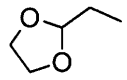
【表 192】

				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
1803		-H	485	
				10
1804		-H	499	
1805		-CH ₃	591	
1806		-CH ₃	575	20
1807		-H	548	
1808		-H	532	
1809		-H	532	
1810		-H	559	30
1811		-H	573	
1812		-H	519	
1813		-CH(CH ₃) ₂	561	40
1814		-H	470	

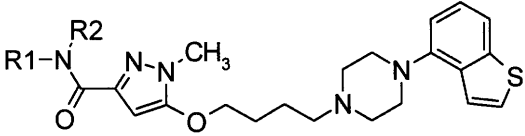
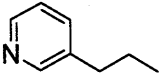
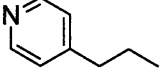
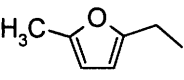
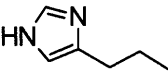
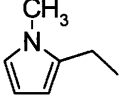
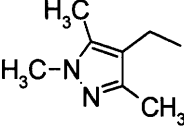
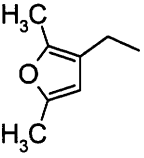
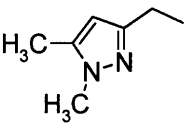
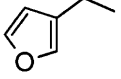
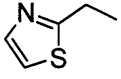
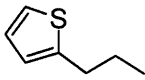
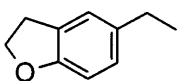
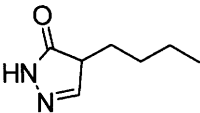
【表 193】

				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
1815		-CH ₃	633	10
1816		-CH ₃	629	
1817		-CH ₃	629	
1818		-CH ₃	629	
1819		-CH ₃	649	20
1820		-C ₄ H ₉	649	
1821		-C ₄ H ₉	671	
1822		-CH(CH ₃) ₂	657	
1823		-H	597	40
1824		-H	583	
1825		-C ₂ H ₅	587	

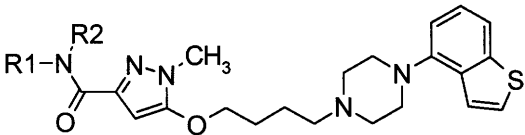
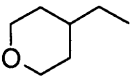
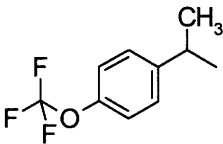
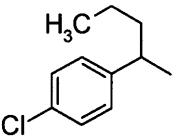
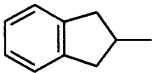
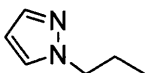
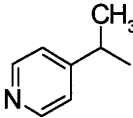
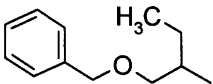
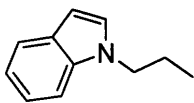
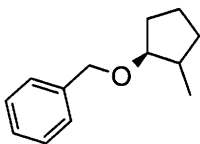
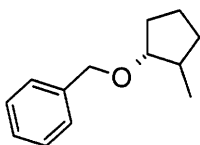
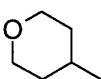
【表 194】

				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
1826		-H	554	10
1827		-H	572	
1828		-H	572	
1829		-H	586	20
1830		-H	557	
1831		-H	544	
1832		-H	573	30
1833		-H	539	
1834		-H	498	
1835		-H	520	40
1836		-H	500	

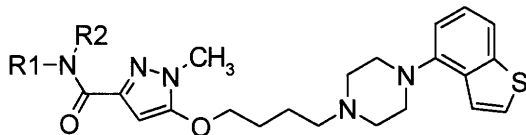
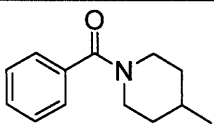
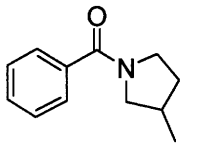
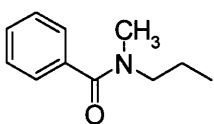
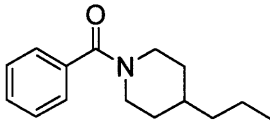
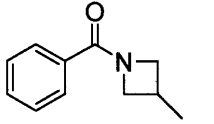
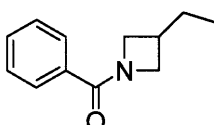
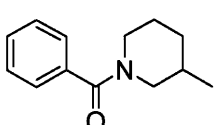
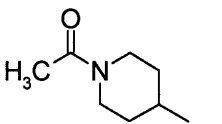
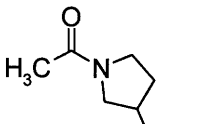
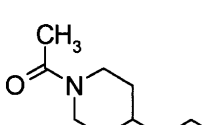
【表 195】

				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
1837		-H	519	
1838		-H	519	10
1839		-H	508	
1840		-H	508	
1841		-H	507	20
1842		-H	536	
1843		-H	522	
1844		-H	522	30
1845		-H	494	
1846		-H	511	
1847		-H	524	40
1848		-H	546	
1849		-H	538	

【表 196】

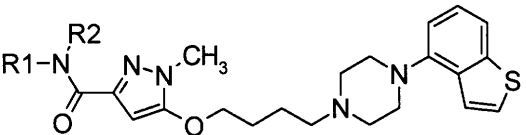
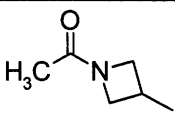
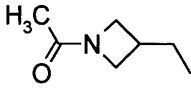
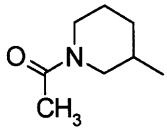
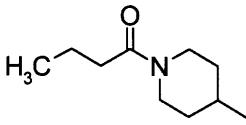
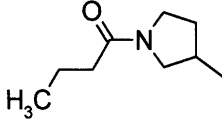
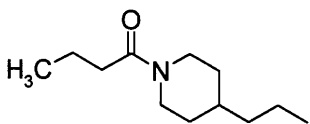
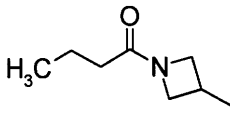
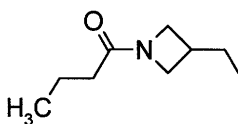
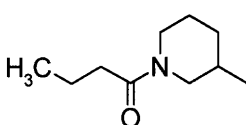
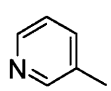
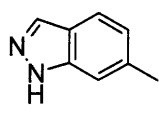
			
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1850		-H	512
1851		-H	602
1852		-CH ₃	594
1853		-H	530
1854		-H	508
1855		-H	519
1856		-H	576
1857		-H	557
1858		-H	588
1859		-H	588
1860		-H	498

【表 1 9 7】

				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
1861		-H	601	10
1862		-H	587	
1863		-H	575	
1864		-H	629	20
1865		-H	573	
1866		-H	587	
1867		-H	601	30
1868		-H	539	
1869		-H	525	
1870		-H	567	40

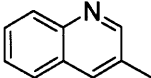
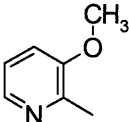
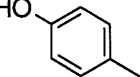
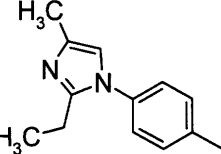
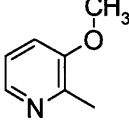
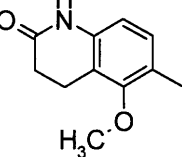
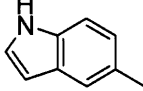
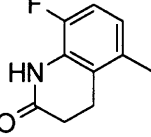
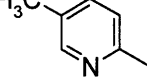
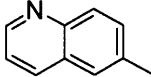
【 0 5 9 5】

【表 198】

			
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1871		-H	511
1872		-H	525
1873		-H	539
1874		-H	567
1875		-H	553
1876		-H	595
1877		-H	539
1878		-H	553
1879		-H	567
1880		-H	491
1881		-H	530

【0596】

CN1C=CC(=C1C(=O)N(R1)R2)OCCCCCN2CCN(C2)c3ccc4ccsc4c3

实施例	R1	R2	MS(M+1)
1882		-H	541
1883		-H	505
1884		-CH ₃	520
1885		-CH ₃	612
1886		-H	521
1887		-H	589
1888		-H	529
1889		-H	577
1890		-H	505
1891		-H	497
1892		-H	541

【 0 5 9 7 】

【表 2 0 0】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
1893		-H	456
1894		-H	545
1895		-H	508
1896		-H	546
1897		-H	494
1898		-H	555

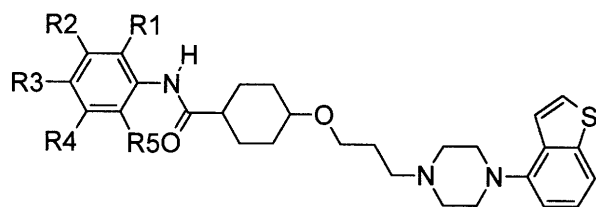
【 0 5 9 8】

10

20

30

【表 201】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1899	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	562
1900	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	508
1901	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	508
1902	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	538
1903	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	538
1904	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	538
1905	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	565
1906	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	538
1907	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	521
1908	-H	-COCH ₃	-H	-H	-H	520
1909	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	535
1910	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	535
1911	-H	-H	-H	-CN	-H	503
1912	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-H	-OCH ₃	566
1913	-H	-H	-OC ₆ H ₅	-H	-H	570
1914	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	-CO ₂ CH ₃	-H	594
1915	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	538
1916	-H	-Cl	-OH	-H	-H	528
1917	-CO ₂ C ₂ H ₅	-H	-H	-H	-Cl	584
1918	-H	-H	-CN	-H	-H	503
1919	-H	-OCH ₂ C ₆ H ₅	-H	-H	-H	584
1920	-H	-H	-NHCO ₂ CH ₃	-H	-H	571
1921	-H	-H	-CONHC ₆ H ₅	-H	-H	597
1922	-H	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	535
1923	-H	-H	-NHC ₆ H ₅	-H	-H	569
1924	-H	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	-H	522
1925	-H	-H	-C≡CH	-H	-H	502
1926	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-H	535
1927	-H	-CONHCH ₃	-H	-H	-H	535

【0599】

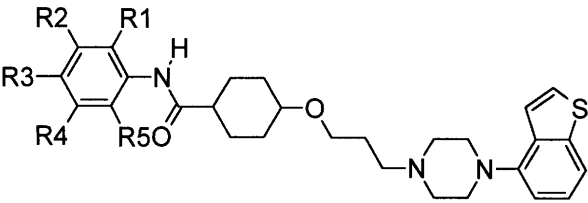
10

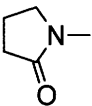
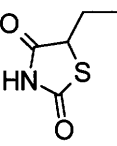
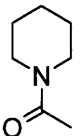
20

30

40

【表 2 0 2】



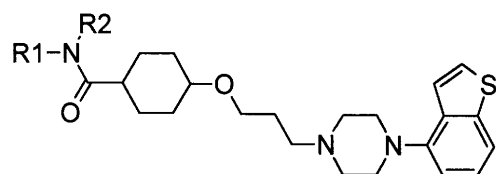
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS(M+1)
1928	-H	-H		-H	-H	561
1929	-H	-H		-H	-H	607
1930	-H		-H	-H	-H	589
1931	-H		-H	-H	-H	545

10

20

【 0 6 0 0 】

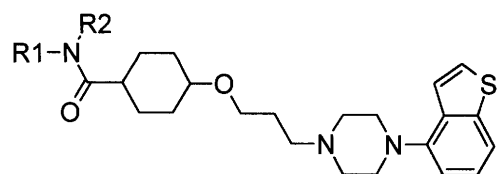
【表 203】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
1932	-CH ₃	-cyclo-C ₆ H ₁₁	498
1933	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	484
1934	-C ₄ H ₉	-C ₄ H ₉	514
1935	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	514
1936	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	490
1937	-C ₂ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	474
1938	-CH ₂ CH ₂ OH	-cyclo-C ₆ H ₁₁	528
1939	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	518
1940	-C ₃ H ₇	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	498
1941	-cyclo-C ₅ H ₉	-CH ₂ CH=CH ₂	510
1942	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	458
1943	-C ₄ H ₉	-H	458
1944	-C(CH ₃) ₃	-H	458
1945	-cyclo-C ₃ H ₅	-H	442
1946	-C ₂ H ₅	-H	430
1947	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-H	460
1948	-C ₄ H ₉	-C ₂ H ₅	486
1949	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	-H	474
1950	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	-H	488
1951	-cyclo-C ₅ H ₉	-H	470
1952	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-H	456
1953	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-H	498
1954	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	-H	487
1955	-(CH ₂) ₅ OH	-H	488
1956	-CH ₂ CONH ₂	-H	459
1957	-CH ₂ C≡CH	-H	440
1958	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	458
1959	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	472
1960	-CH(CH ₃)C(CH ₃) ₃	-H	486
1961	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	-H	472
1962	-CH ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂	-H	486
1963	-CH(CONH ₂) ₂	-H	502
1964	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	-CH ₃	470
1965	-CH(CONH ₂) ₂	-H	499

【0601】

【表 204】



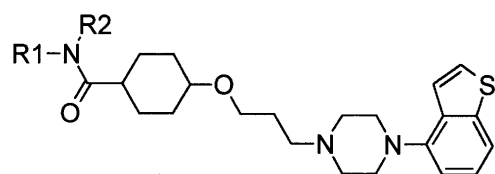
実施例	R1	R2	MS(M+1)
1966	-CH ₃	-CH ₃	430
1967	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	-H	502
1968	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	-H	486
1969	-CH(C ₂ H ₅) ₂	-H	472
1970	-CH ₂ CN	-H	441
1971	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	-H	474
1972	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	-H	488
1973	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	-H	488
1974	-CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	-H	474
1975	-CH ₂ CH ₂ F	-H	448
1976	-CH ₂ CH(OH)CH ₂ OH	-H	476
1977	-CH ₂ CONHCH ₃	-H	473
1978	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	-H	476
1979	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	446
1980	-CH ₂ CHF ₂	-H	466
1981	-C ₆ H ₁₃	-H	486
1982	-CH ₂ CH ₂ NHCONH ₂	-H	488

【0602】

10

20

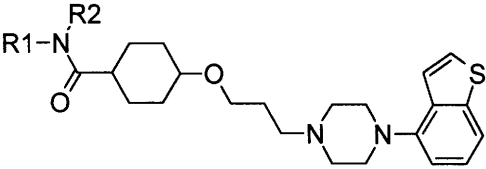
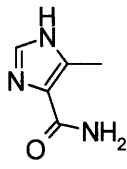
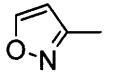
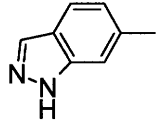
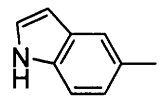
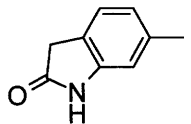
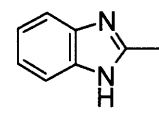
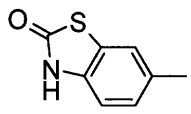
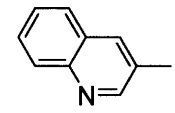
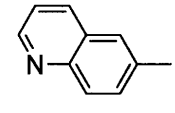
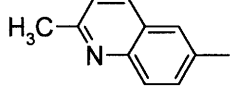
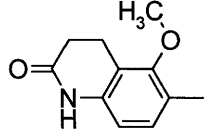
【表 205】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
1983		-CH ₃	508
1984		-H	479
1985		-H	479
1986		-H	479
1987		-H	493
1988		-H	509
1989		-H	493
1990		-H	485
1991		-H	486
1992		-H	500
1993		-H	470
1994		-H	496
1995		-H	529

【0603】

【表 206】

				
実施例	R1	R2	MS(M+1)	
1996		-H	511	10
1997		-H	469	
1998		-H	518	
1999		-H	517	20
2000		-H	533	
2001		-H	518	
2002		-H	551	30
2003		-H	529	
2004		-H	529	
2005		-H	543	40
2006		-H	577	

【0604】

【表 207】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
2007		-H	565
2008		-H	561
2009		-H	444
2010		-C ₂ H ₅	528
2011		-H	482
2012		-H	456
2013		-H	484
2014		-H	500
2015		-H	510
2016		-H	473
2017		-H	487
2018		-H	472
2019		-H	498

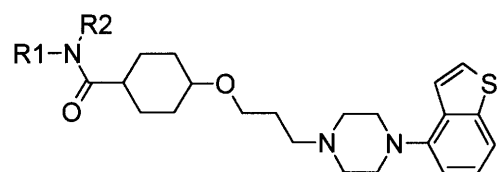
10

20

30

40

【表 208】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2020		-H	498
2021		-C ₂ H ₅	484
2022		-H	527
2023		-H	486
2024		-H	488
2025		-H	502
2026		-H	496
2027		-H	496
2028		-H	495
2029		-H	524
2030		-H	524
2031		-H	510
2032		-H	510

【0606】

10

20

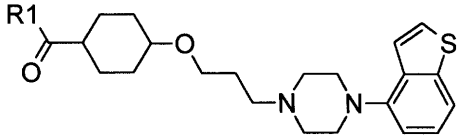
30

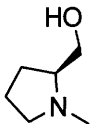
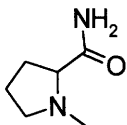
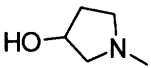
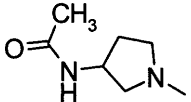
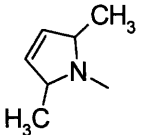
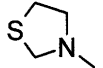
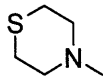
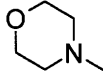
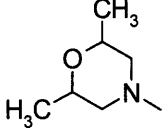
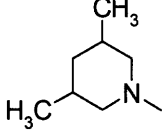
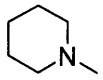
40

【表 209】

実施例	R1	R2	MS(M+1)
2033		-H	512
2034		-H	498
2035		-H	482
2036		-H	499
2037		-H	512
2038		-H	456
2039		-H	500
2040		-H	482
2041		-H	496
2042		-H	486
2043		-CH ₃	510
2044		-CH ₃	524
2045		-CH ₃	525
2046		-H	510

【表 2 1 0】



実施例	R1	MS(M+1)
2047		456
2048		486
2049		499
2050		472
2051		513
2052		482
2053		474
2054		488
2055		472
2056		500
2057		498
2058		470

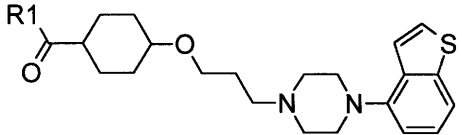
10

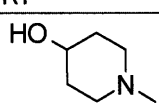
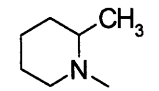
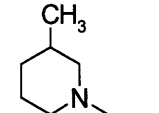
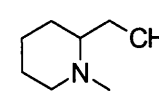
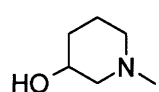
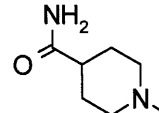
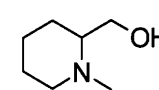
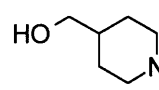
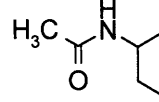
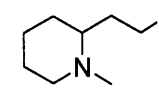
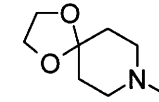
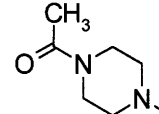
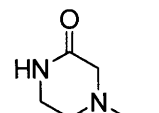
20

30

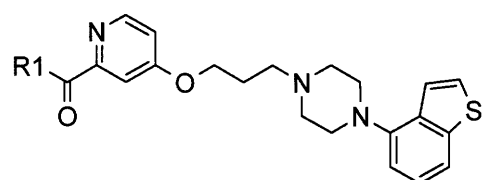
40

【表 2 1 1】



実施例	R1	MS(M+1)
2059		486
2060		484
2061		484
2062		498
2063		486
2064		513
2065		500
2066		500
2067		527
2068		514
2069		528
2070		513
2071		485

【表 2 1 2】



実施例	R1	MS(M+1)
2072		523
2073		483
2074		477
2075		469
2076		467
2077		495
2078		556
2079		513
2080		552
2081		494

10

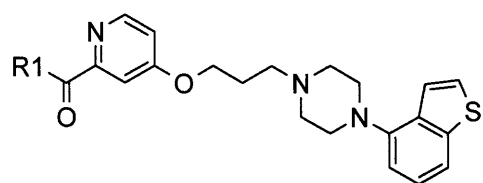
20

30

40

【0 6 1 0】

【表 2 1 3】



実施例	R1	MS(M+1)
2082		557
2083		591
2084		591
2085		571
2086		571
2087		575
2088		510
2089		508
2090		479
2091		479

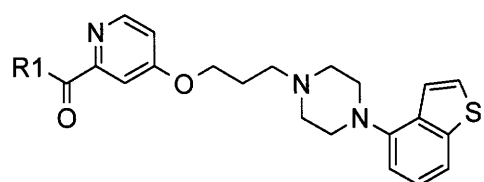
10

20

30

40

【表 2 1 4】



実施例	R1	MS(M+1)
2092		481
2093		508
2094		495
2095		509
2096		495
2097		557
2098		508
2099		495
2100		540

【 0 6 1 2 】

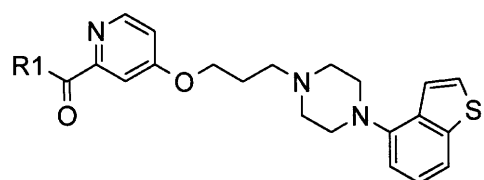
10

20

30

40

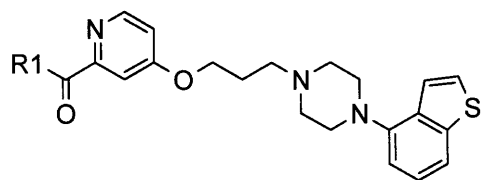
【表 2 1 5】



実施例	R1	MS(M+1)	
2101		564	10
2102		550	
2103		481	
2104		494	20
2105		499	
2106		527	30
2107		550	
2108		545	
2109		575	40

【0 6 1 3】

【表 2 1 6】



実施例	R1	MS(M+1)
2110		570
2111		563
2112		493
2113		522
2114		523
2115		480
2116		557
2117		520
2118		533

10

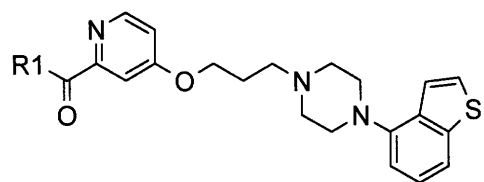
20

30

40

【 0 6 1 4】

【表 2 1 7】



実施例	R1	MS(M+1)
2119		560
2120		481
2121		543
2122		542
2123		542

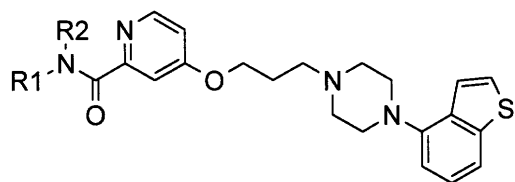
【 0 6 1 5】

10

20

30

【表 2 1 8】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2124	-CH ₃	-cyclo-C ₆ H ₁₁	493
2125	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	479
2126	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	485
2127	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	482
2128	-H	-C ₄ H ₉	453
2129	-H	-cyclo-C ₃ H ₅	437
2130	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	487
2131	-CH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	501
2132	-C ₂ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	467
2133	-H	-CH ₃	411
2134	-H	-C ₂ H ₅	425
2135	-H	-C ₃ H ₇	439
2136	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	453
2137	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	455
2138	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	469
2139	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	517
2140	-H	-cyclo-C ₅ H ₉	465
2141	-H	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	493
2142	-H	-CH(CH ₃)C ₆ H ₅	501
2143	-H	-CH ₂ CONH ₂	454

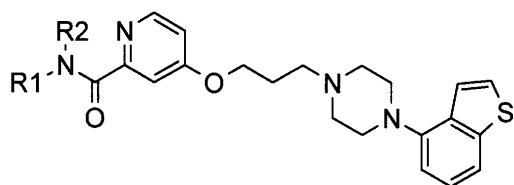
【 0 6 1 6 】

10

20

30

【表 2 1 9】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2144	-H	-CH(CH ₃) ₂	439
2145	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	453
2146	-H	-(CH ₂) ₅ OH	483
2147	-H	-CH ₂ CCH	435
2148	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	453
2149	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	467
2150	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	468
2151	-H	-CH(CONH ₂) ₂	497
2152	-CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	465
2153	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	510
2154	-H	-CH ₂ CF ₃	479
2155	-H	-NHCH ₂ CF ₃	494
2156	-CH ₃	-CH ₃	425
2157	-H	-CH ₂ CH(OCH ₃) ₂	485
2158	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	497
2159	-H	-CH(C ₂ H ₅) ₂	467
2160	-H	-CH ₂ CN	436
2161	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	483
2162	-H	-CH(C ₂ H ₅)CH ₂ OCH ₃	483
2163	-H	-CH ₂ CH ₂ F	443
2164	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	468
2165	-H	-(CH ₂) ₂ SCH ₃	471
2166	-H	-CH ₂ CHF ₂	461
2167	-CH ₃	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ NHCH ₃	512

【 0 6 1 7 】

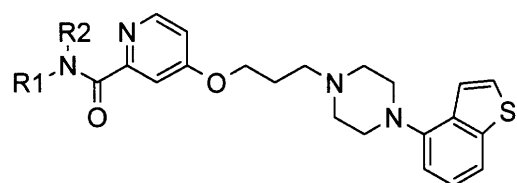
10

20

30

40

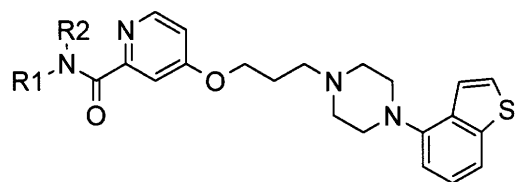
【表 2 2 0】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2168	-CH ₃		508
2169	-H		515
2170	-H		521
2171	-H		521
2172	-H		521
2173	-H		488
2174	-H		488
2175	-H		488
2176	-H		477
2177	-CH ₃		536

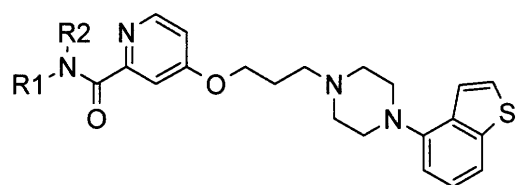
【0 6 1 8】

【表 2 2 1】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2178	-CH ₃		531
2179	-H		451
2180	-H		517
2181	-H		517
2182	-H		555
2183	-H		571
2184	-H		531
2185	-H		552
2186	-H		495
2187	-H		505

【表 2 2 2】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2188	-H		547
2189	-H		501
2190	-H		505
2191	-H		496
2192	-H		544
2193	-H		481
2194	-H		468
2195	-H		517
2196	-H		508

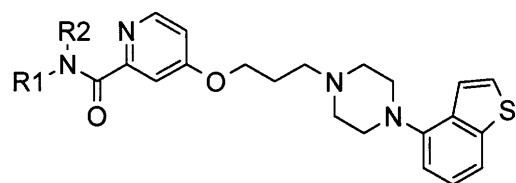
10

20

30

40

【表 2 2 3】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2197	-H		508
2198	-H		494
2199	-H		510
2200	-H		453
2201	-H		467
2202	-H		555
2203	-H		537
2204	-H		527
2205	-H		527
2206	-H		493

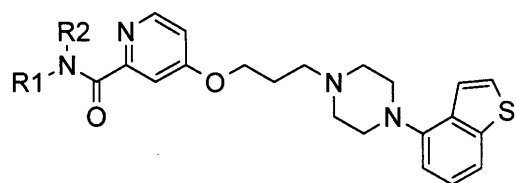
10

20

30

40

【表 2 2 4】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2207	-H		556
2208	-H		555
2209	-H		555
2210	-C ₂ H ₅		479
2211	-H		522
2212	-H		481
2213	-H		503
2214	-H		483
2215	-H		497

【 0 6 2 2 】

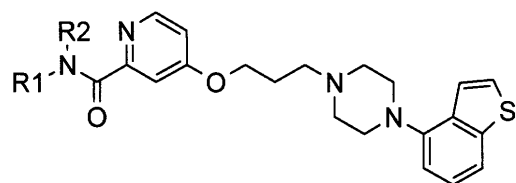
10

20

30

40

【表 2 2 5】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2216	-H		491
2217	-H		491
2218	-H		490
2219	-H		519
2220	-H		505
2221	-H		505
2222	-H		507
2223	-H		493

10

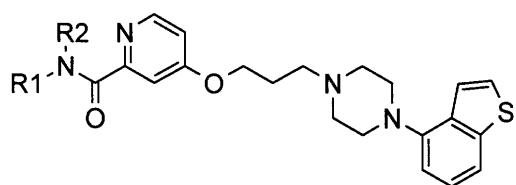
20

30

40

【 0 6 2 3 】

【表 2 2 6】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2224	-H		477
2225	-H		494
2226	-H		529
2227	-H		451
2228	-H		495
2229	-H		505
2230	-H		519
2231	-H		519
2232	-H		519

10

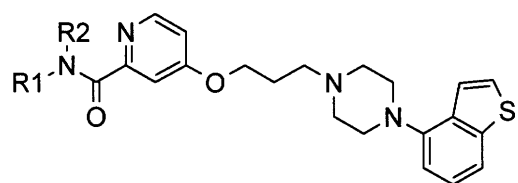
20

30

40

【0 6 2 4】

【表 2 2 7】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2233	-H		537
2234	-H		543
2235	-H		513
2236	-H		513
2237	-H		502
2238	-H		506

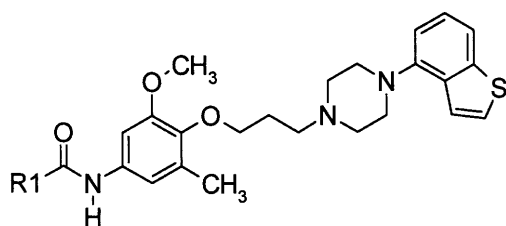
10

20

30

【0 6 2 5】

【表 2 2 8】



実施例	R1	MS(M+1)
2239	-2-PYRIDYL	517
2240	-3-PYRIDYL	517
2241	-4-PYRIDYL	517
2242	-2-FURYL	506
2243	-2-THIENYL	522
2244	-3-FURYL	506
2245	-3-THIENYL	522
2246	-CH ₃	454
2247	-C ₂ H ₅	468
2248	-C ₃ H ₇	482
2249	-CH(CH ₃) ₂	482
2250	-cyclo-C ₃ H ₅	480
2251	-cyclo-C ₅ H ₉	508
2252	-cyclo-C ₆ H ₁₁	522
2253	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	494
2254	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	536
2255	-CH ₂ OCH ₃	484
2256	-CH ₂ N(CH ₃) ₂	497
2257	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	525
2258	-(CH ₂) ₂ N(C ₂ H ₅) ₂	539
2259	-CH ₂ NHCHO	497
2260	-CH ₂ N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	557
2261	-CH ₂ N(CH ₃)CO ₂ C(CH ₃) ₃	583
2262	-(CH ₂) ₃ NHCO ₂ C(CH ₃) ₃	597
2263	-CH ₂ NHCH ₃	483
2264	-(CH ₂) ₃ NH ₂	497
2265	-CH ₂ NHCOCH ₃	511

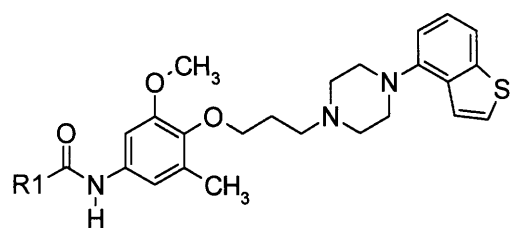
10

20

30

40

【表 2 2 9】



実施例	R1	MS(M+1)
2266		547
2267		551
2268		585
2269		563
2270		551
2271		533
2272		567
2273		551
2274		505

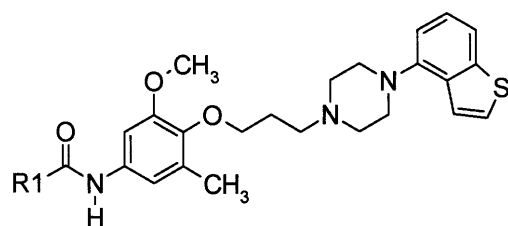
10

20

30

40

【表 2 3 0】



実施例	R1	MS(M+1)
2275		556
2276		551
2277		519
2278		535
2279		518
2280		532
2281		523
2282		534
2283		590

10

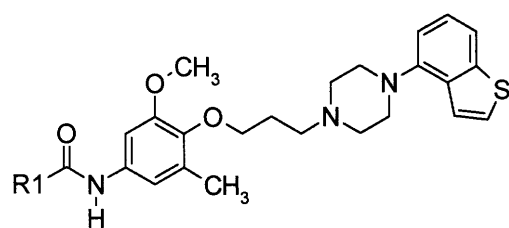
20

30

40

【 0 6 2 8 】

【表 2 3 1】



実施例	R1	MS(M+1)
2284		556
2285		589
2286		521
2287		523
2288		535
2289		549
2290		520
2291		520

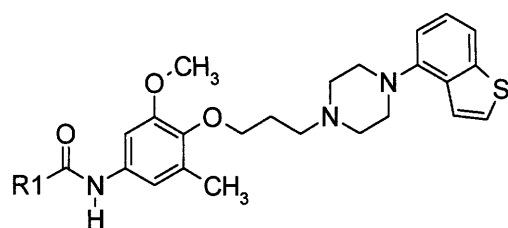
10

20

30

40

【表 2 3 2】



実施例	R1	MS(M+1)
2292		520
2293		521
2294		521
2295		565
2296		579
2297		523
2298		541
2299		510
2300		524

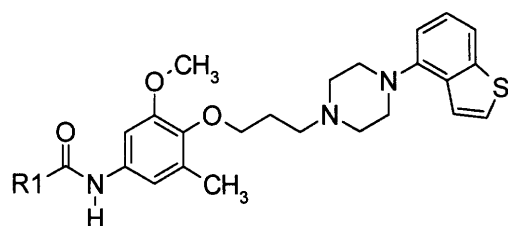
10

20

30

40

【表 2 3 3】



実施例	R1	MS(M+1)
2301		623
2302		609
2303		595
2304		595
2305		623
2306		623
2307		523
2308		509
2309		495

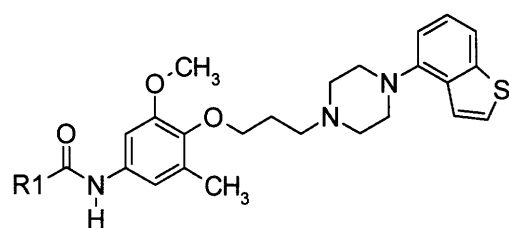
10

20

30

40

【表 2 3 4】



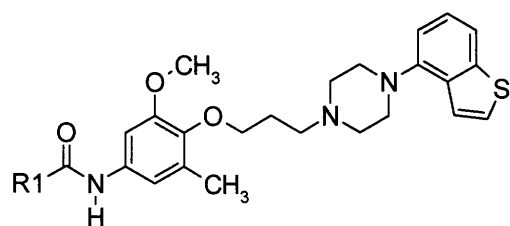
実施例	R1	MS(M+1)
2310		495
2311		523
2312		523

10

20

【 0 6 3 2 】

【表 2 3 5】



実施例	R1	MS(M+1)
2313		545
2314		531
2315		531
2316		531
2317		536
2318		536
2319		522
2320		551
2321		543

10

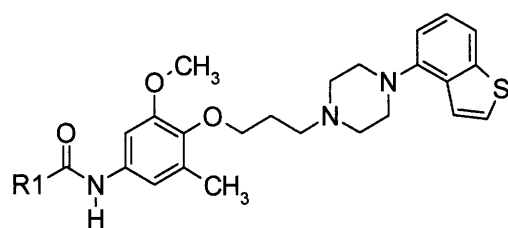
20

30

40

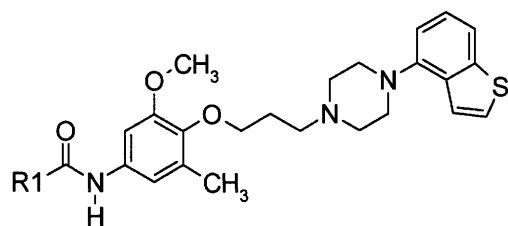
【0 6 3 3】

【表 2 3 6】



実施例	R1	MS(M+1)
2322		543
2323		563
2324		543
2325		556
2326		551
2327		532
2328		582
2329		520
2330		522

【表 2 3 7】



実施例	R1	MS(M+1)
2331		538
2332		532
2333		637
2334		651
2335		673
2336		537
2337		551
2338		573

10

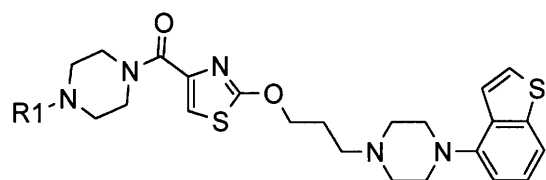
20

30

40

【 0 6 3 5】

【表 2 3 8】



実施例	R1	MS(M+1)
2339	-2-PYRIDYL	549
2340	-C ₄ H ₉	528
2341	-CH(CH ₃) ₂	514
2342	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	543
2343	-4-PYRIDYL	549
2344	-C ₆ H ₅	548
2345	-C ₃ H ₇	514
2346	-CH ₃	486
2347	-3-PYRIDYL	549
2348	-C ₆ H ₁₃	556
2349	-C ₂ H ₅	500
2350	-CH ₂ CH ₂ OH	516
2351	-COCH ₃	514
2352	-cyclo-C ₆ H ₁₁	554
2353	-SO ₂ C ₂ H ₅	564

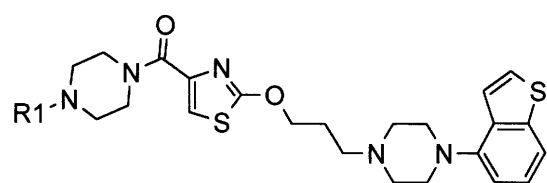
【 0 6 3 6】

10

20

30

【表 2 3 9】



実施例	R1	MS(M+1)
2354		563
2355		563
2356		563
2357		550
2358		569
2359		634
2360		550
2361		566
2362		577

【 0 6 3 7 】

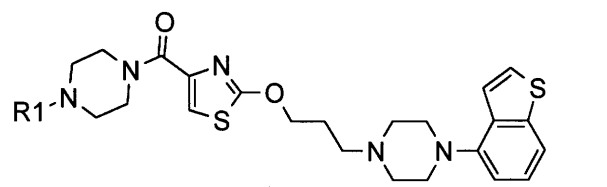
10

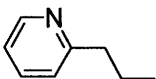
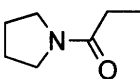
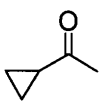
20

30

40

【表 2 4 0】



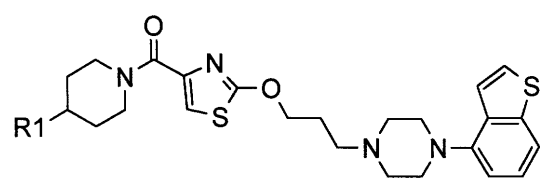
実施例	R1	MS(M+1)
2363		577
2364		583
2365		555
2366		540

10

20

【 0 6 3 8】

【表 2 4 1】



実施例	R1	MS(M+1)
2367	-OCH ₃	501
2368	-cyclo-C ₆ H ₁₁	553
2369	-C ₆ H ₅	547
2370	-OCH ₂ C ₆ H ₅	577
2371	-OC ₆ H ₅	563
2372	-OH	487
2373	-CONH ₂	514
2374	-CH ₂ OH	501
2375	-C ₂ H ₅	499
2376	-NHCOCH ₃	528
2377	-COC ₆ H ₅	575
2378	-2-PYRIDYL	548

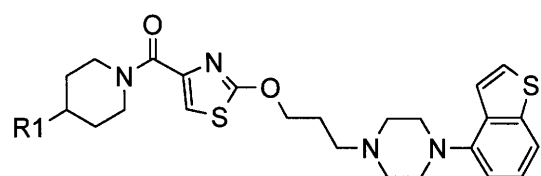
30

40

【 0 6 3 9】

50

【表 2 4 2】



実施例	R1	MS(M+1)
2379		554
2380		578
2381		578
2382		556
2383		564
2384		564

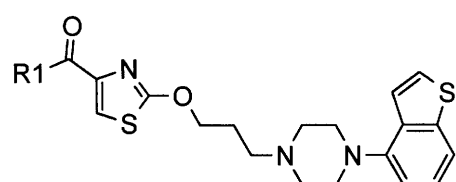
【 0 6 4 0 】

10

20

30

【表 2 4 3】



実施例	R1	MS(M+1)
2385		485
2386		502
2387		525
2388		489
2389		475
2390		511
2391		539
2392		547
2393		576

【0 6 4 1】

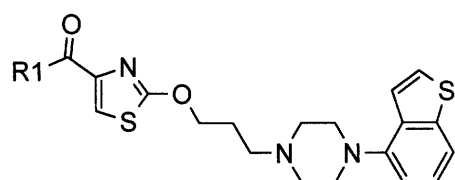
10

20

30

40

【表 2 4 4】



実施例	R1	MS(M+1)
2394		519
2395		563
2396		558
2397		519
2398		505
2399		500
2400		548
2401		563
2402		487

【 0 6 4 2 】

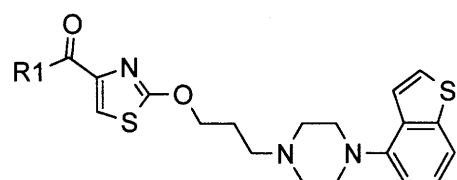
10

20

30

40

【表 2 4 5】



実施例	R1	MS(M+1)
2403		515
2404		577
2405		473
2406		546
2407		570
2408		505
2409		533
2410		486
2411		545

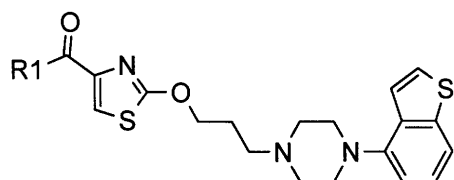
10

20

30

40

【表 2 4 6】



実施例	R1	MS(M+1)
2412		542
2413		526
2414		568
2415		539
2416		578
2417		487
2418		583
2419		549
2420		554

【 0 6 4 4 】

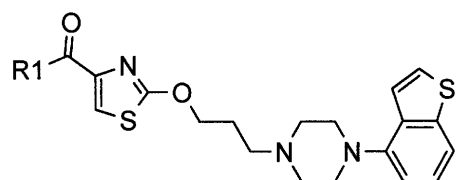
10

20

30

40

【表 2 4 7】



実施例	R1	MS(M+1)
2421		548
2422		546
2423		553
2424		561
2425		526
2426		443

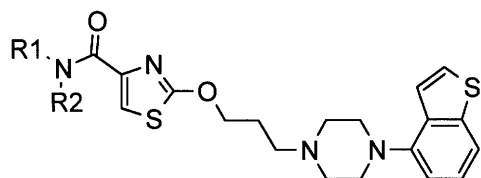
10

20

30

【 0 6 4 5 】

【表 2 4 8】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2427	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	499
2428	-H	-cyclo-C ₆ H ₁₁	485
2429	-H	-CH(CH ₃) ₂	445
2430	-C ₄ H ₉	-C ₄ H ₉	515
2431	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	515
2432	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	491
2433	-CH ₂ CH ₂ OH	-C ₂ H ₅	475
2434	-C ₆ H ₁₃	-C ₆ H ₁₃	571
2435	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₃	488
2436	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₂ CH ₂ OH	529
2437	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	519
2438	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	-(CH ₂) ₃ N(CH ₃) ₂	573
2439	-(CH ₂) ₃ N(C ₂ H ₅) ₂	-CH ₃	530
2440	-CH ₂ CH=CH ₂	-cyclo-C ₅ H ₉	511
2441	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	459
2442	-H	-C(CH ₃) ₃	459
2443	-H	-cyclo-C ₃ H ₅	443
2444	-H	-cyclo-C ₇ H ₁₃	499
2445	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	493
2446	-C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	563
2447	-CH ₂ CONHCH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	564
2448	-CH ₂ C ₆ H ₅	-cyclo-C ₆ H ₁₁	575
2449	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	521
2450	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	507
2451	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₂ C ₆ H ₅	564
2452	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₅ H ₁₁	563

10

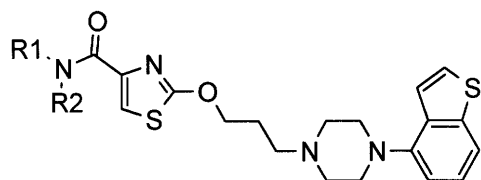
20

30

40

【 0 6 4 6 】

【表 2 4 9】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2453	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ C ₆ H ₅	583
2454	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	521
2455	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	535
2456	-CH ₂ CH ₂ CN	-CH ₂ C ₆ H ₅	546
2457	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-CH ₃	537
2458	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	513
2459	-CH(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	473
2460	-H	-C ₂ H ₅	431
2461	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	459
2462	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	461
2463	-C ₂ H ₅	-C ₄ H ₉	487
2464	-H	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	475
2465	-H	-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	489
2466	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	569
2467	-C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	507
2468	-C ₆ H ₅	-cyclo-C ₆ H ₁₁	561
2469	-CH ₂ CH ₂ CN	-C ₆ H ₅	532
2470	-2-PYRIDYL	-C ₂ H ₅	508
2471	-H	-C ₆ H ₅	479
2472	-H	-3-PYRIDYL	480
2473	-H	-2-PYRIDYL	480
2474	-H	-4-PYRIDYL	480
2475	-C ₆ H ₅	-CH ₃	493
2476	-H	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	499
2477	-H	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	521
2478	-H	-(CH ₂) ₂ NHCOCH ₃	488
2479	-H	-(CH ₂) ₅ OH	489

【 0 6 4 7 】

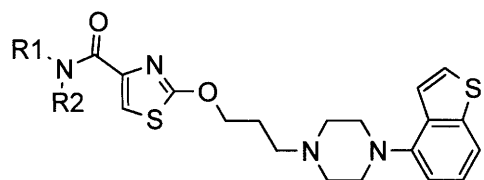
10

20

30

40

【表 2 5 0】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2480	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	507
2481	-H	-CH ₂ CONH ₂	460
2482	-H	-CH ₂ CCH	441
2483	-C ₅ H ₁₁	-CH ₃	487
2484	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	473
2485	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	473
2486	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	474
2487	-CH ₂ C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₃ OH	551
2488	-CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	471
2489	-H	-CH ₂ CF ₃	485
2490	-H	-NHCH ₂ CF ₃	500
2491	-CH ₃	-CH ₃	431
2492	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	503
2493	-H	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	487
2494	-H	-CH ₂ CN	442
2495	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	475
2496	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	489
2497	-H	-CH ₂ CH ₂ CN	456
2498	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	474
2499	-H	-(CH ₂)SCH ₃	477
2500	-H	-CH ₂ CHF ₂	467
2501	-H	-CH ₂ CH ₂ OH	447
2502	-H	-C ₆ H ₁₃	487
2503	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	502
2504	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	551
2505	-H	-(CH ₂) ₂ NHCONH ₂	489

10

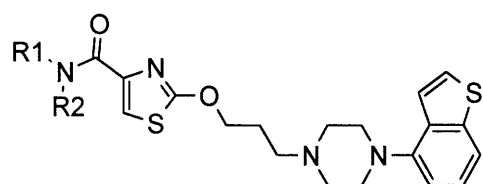
20

30

40

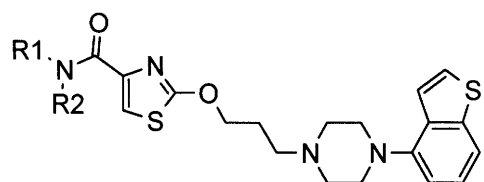
【 0 6 4 8 】

【表 2 5 1】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2506		-CH ₃	522
2507		-CH ₃	514
2508		-C ₂ H ₅	529
2509		-H	494
2510		-H	494
2511		-H	494
2512		-H	483
2513		-C ₂ H ₅	536
2514		-CH ₃	542
2515		-C ₂ H ₅	547

【表 2 5 2】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2516		-CH ₃	564
2517		-C ₂ H ₅	522
2518		-H	457
2519		-H	485
2520		-CH ₃	507
2521		-H	509
2522		-H	521
2523		-H	529
2524		-H	544
2525		-H	519

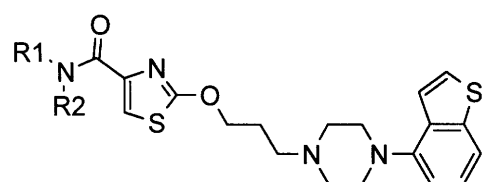
10

20

30

40

【表 2 5 3】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2526		-H	530
2527		-H	530
2528		-H	571
2529		-H	518
2530		-H	558
2531		-H	486
2532		-H	552
2533		-H	471
2534		-H	562

【0 6 5 1】

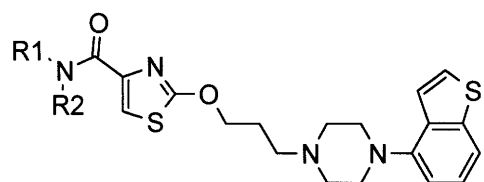
10

20

30

40

【表 2 5 4】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2535		-H	572
2536		-H	536
2537		-H	523
2538		-H	534
2539		-H	570
2540		-H	540
2541		-H	533
2542		-H	519
2543		-H	487

10

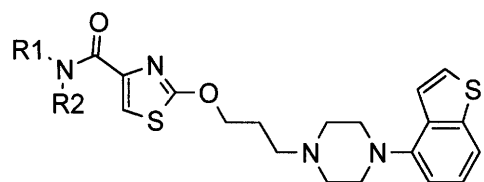
20

30

40

【 0 6 5 2 】

【表 2 5 5】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2544		-H	497
2545		-H	501
2546		-H	545
2547		-H	535
2548		-H	545
2549		-H	546
2550		-H	530
2551		-H	483

【0 6 5 3】

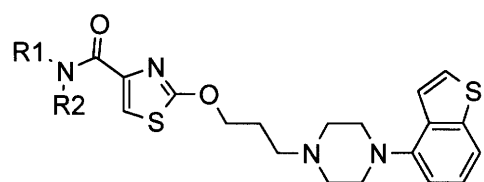
10

20

30

40

【表 2 5 6】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2552		-H	562
2553		-H	532
2554		-H	545
2555		-H	560
2556		-H	559
2557		-H	559
2558		-H	546
2559		-H	511
2560		-H	530

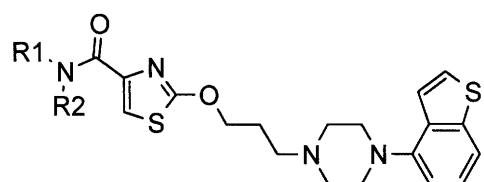
10

20

30

40

【表 2 5 7】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2561		-H	508
2562		-H	514
2563		-H	514
2564		-H	500
2565		-H	514
2566		-H	516
2567		-H	530
2568		-H	561
2569		-H	543
2570		-H	546

【 0 6 5 5 】

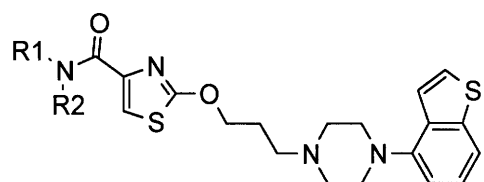
10

20

30

40

【表 2 5 8】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2571		-H	533
2572		-H	499
2573		-H	528
2574		-H	487
2575		-H	509
2576		-H	508
2577		-H	508
2578		-H	497
2579		-H	497
2580		-H	496

【 0 6 5 6 】

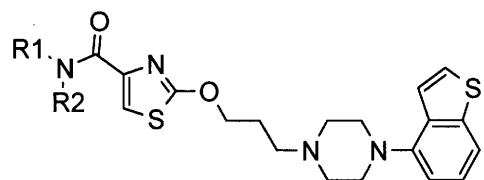
10

20

30

40

【表 2 5 9】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2581		-H	525
2582		-H	511
2583		-H	511
2584		-H	513
2585		-H	499
2586		-H	483
2587		-H	500
2588		-H	513
2589		-H	535
2590		-H	457

【 0 6 5 7 】

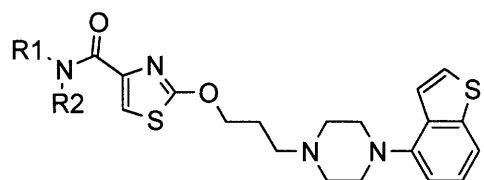
10

20

30

40

【表 2 6 0】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2591		-H	527
2592		-H	554
2593		-H	549
2594		-H	519
2595		-H	519
2596		-H	497
2597		-H	546
2598		-H	497
2599		-H	528
2600		-H	487

10

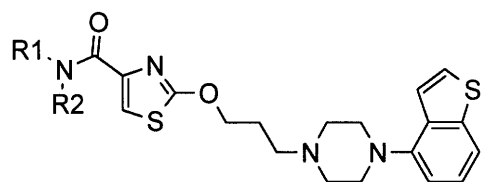
20

30

40

【 0 6 5 8】

【表 2 6 1】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2601		-H	575
2602		-CH ₃	511
2603		-CH ₃	525
2604		-CH ₃	557
2605		-CH ₃	528
2606		-CH ₃	544
2607		-H	547
2608		-CH ₃	526
2609		-CH ₃	564

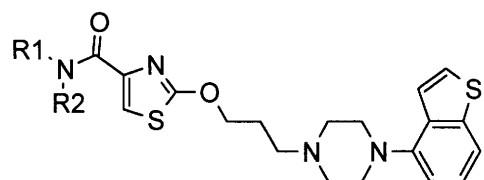
10

20

30

40

【表 2 6 2】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2610		-CH ₃	574
2611		-CH ₃	547
2612		-H	511
2613		-CH ₃	561
2614		-CH ₃	564
2615		-H	512
2616		-H	515
2617		-CH ₃	560
2618		-H	566

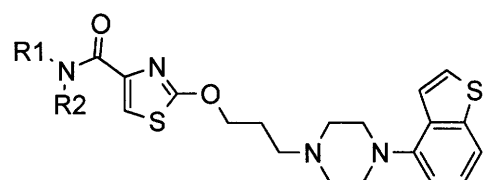
10

20

30

40

【表 2 6 3】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2619		-H	573
2620		-CH ₃	571
2621		-CH ₃	584
2622		-CH ₃	587
2623		-H	560
2624		-H	547
2625		-H	549

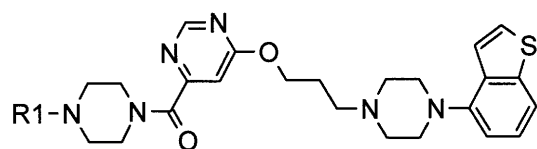
10

20

30

【0 6 6 1】

【表 2 6 4】



実施例	R1	MS(M+1)
2626	-2-PYRIDYL	544
2627	-C ₄ H ₉	523
2628	-CH(CH ₃) ₂	509
2629	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	538
2630	-4-PYRIDYL	544
2631	-C ₆ H ₅	543
2632	-C ₃ H ₇	509
2633	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	525
2634	-CH ₃	481
2635	-3-PYRIDYL	544
2636	-C ₆ H ₁₃	551
2637	-C ₂ H ₅	495
2638	-CH ₂ CH ₂ OH	511
2639	-COCH ₃	509
2640	-cyclo-C ₆ H ₁₁	549
2641	-SO ₂ C ₂ H ₅	559

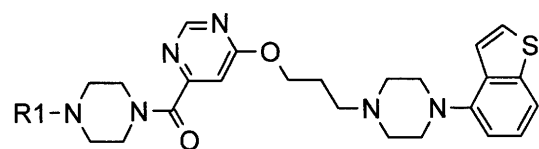
【 0 6 6 2 】

10

20

30

【表 2 6 5】



実施例	R1	MS(M+1)
2642		558
2643		558
2644		558
2645		545
2646		564
2647		629
2648		545
2649		551
2650		561

【 0 6 6 3 】

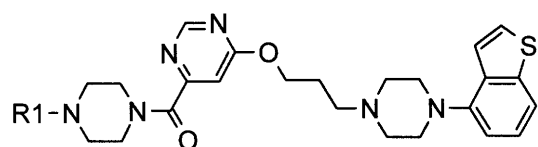
10

20

30

40

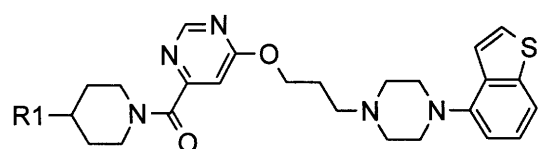
【表 2 6 6】



実施例	R1	MS(M+1)
2651		572
2652		572
2653		578
2654		550
2655		535

【 0 6 6 4】

【表 2 6 7】



実施例	R1	MS(M+1)
2656	-OCH ₃	496
2657	-cyclo-C ₆ H ₁₁	548
2658	-C ₆ H ₅	542
2659	-OCH ₂ C ₆ H ₅	572
2660	-OC ₆ H ₅	558
2661	-OH	482
2662	-CONH ₂	509
2663	-C ₂ H ₅	494
2664	-NHCOCH ₃	523
2665	-COC ₆ H ₅	570
2666	-2-PYRIDYL	543

【 0 6 6 5】

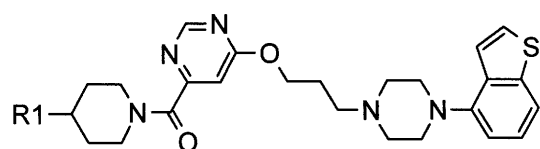
10

20

30

40

【表 2 6 8】



実施例	R1	MS(M+1)
2667		549
2668		573
2669		573
2670		551
2671		559
2672		559

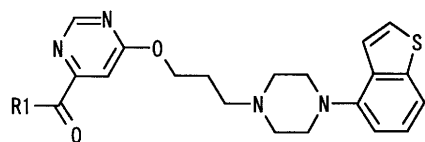
【 0 6 6 6 】

10

20

30

【表 2 6 9】



実施例	R1	MS(M+1)
2673		480
2674		520
2675		484
2676		470
2677		506
2678		534
2679		542
2680		571
2681		514
2682		558

【 0 6 6 7 】

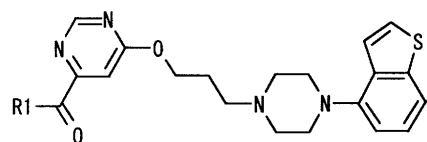
10

20

30

40

【表 270】



実施例	R1	MS(M+1)
2683		553
2684		514
2685		500
2686		495
2687		543
2688		558
2689		510
2690		572
2691		468

【0668】

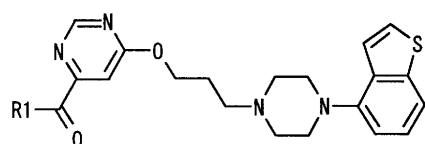
10

20

30

40

【表 2 7 1】



実施例	R1	MS(M+1)
2692		541
2693		565
2694		500
2695		528
2696		481
2697		540
2698		537
2699		521
2700		563
2701		534

【 0 6 6 9 】

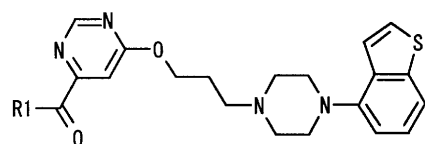
10

20

30

40

【表 2 7 2】



実施例	R1	MS(M+1)
2702		573
2703		482
2704		578
2705		544
2706		549
2707		543
2708		541
2709		548

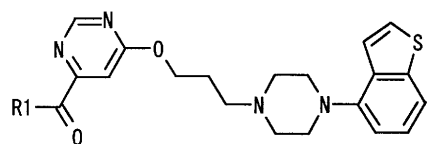
10

20

30

40

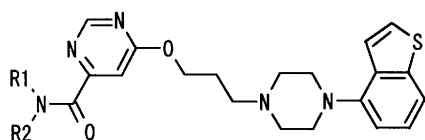
【表 2 7 3】



実施例	R1	MS(M+1)
2710	1-methyl-4-(benzyl)piperidine	556
2711	1-methyl-4-(2-oxo-2,3-dihydro-1H-indolizin-5-yl)piperidine	521
2712	1-methylazetidine	438

【 0 6 7 1 】

【表 2 7 4】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2713	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-CH ₃	494
2714	-H	-CH(CH ₃) ₂	440
2715	-C ₄ H ₉	-C ₄ H ₉	510
2716	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	510
2717	-CH ₂ CH ₂ OH	-CH ₂ CH ₂ OH	486
2718	-C ₆ H ₁₃	-C ₆ H ₁₃	566
2719	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₃	483
2720	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	514
2721	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	568
2722	-(CH ₂) ₃ N(C ₂ H ₅) ₂	-CH ₃	525
2723	-CH ₂ CH=CH ₂	-cyclo-C ₅ H ₉	506
2724	-H	-C ₄ H ₉	454
2725	-H	-cyclo-C ₃ H ₅	438
2726	-H	-cyclo-C ₇ H ₁₃	494
2727	-H	-CH ₂ C ₆ H ₅	488
2728	-C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	558
2729	-CH ₂ CONHCH ₃	-CH ₂ C ₆ H ₅	559
2730	-CH ₂ C ₆ H ₅	-cyclo-C ₆ H ₁₁	570
2731	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	516
2732	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₃	502
2733	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	-CH ₂ C ₆ H ₅	559
2734	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₅ H ₁₁	558
2735	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ C ₆ H ₅	578
2736	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	516
2737	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH(CH ₃) ₂	530
2738	-CH ₂ CH ₂ CN	-CH ₂ C ₆ H ₅	541
2739	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	-CH ₃	532
2740	-cyclo-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	508

【0 6 7 2】

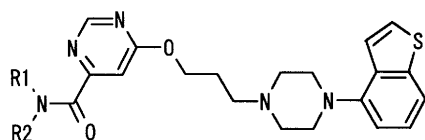
10

20

30

40

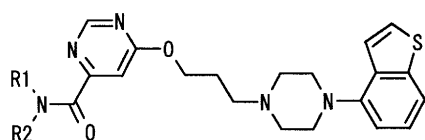
【表 2 7 5】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2741	-CH(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	468
2742	-H	-C ₂ H ₅	426
2743	-H	-C ₃ H ₇	440
2744	-H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	456
2745	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	-C ₂ H ₅	522
2746	-C ₂ H ₅	-C ₄ H ₉	482
2747	-H	-1-CH ₃ -CYCLOHEXYL	494
2748	-H	-(CH ₂) ₂ OC ₆ H ₅	518
2749	-CH ₂ C ₆ H ₅	-C ₆ H ₅	564
2750	-C ₆ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OH	518
2751	-C ₆ H ₅	-C ₂ H ₅	502
2752	-CH ₂ CH ₂ CN	-C ₆ H ₅	527
2753	-2-PYRIDYL	-C ₂ H ₅	503
2754	-H	-C ₆ H ₅	474
2755	-H	-3-PYRIDYL	475
2756	-H	-2-PYRIDYL	475
2757	-H	-4-PYRIDYL	475
2758	-C ₆ H ₅	-CH ₃	488
2759	-H	-CH ₂ -cyclo-C ₆ H ₁₁	494
2760	-H	-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅	516
2761	-H	-(CH ₂) ₂ C ₆ H ₅	502
2762	-H	-CH ₂ CONH ₂	455
2763	-H	-CH ₂ CCH	436
2764	-C ₅ H ₁₁	-CH ₃	482
2765	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	454
2766	-H	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	468
2767	-H	-CH ₂ C(CH ₃) ₃	468
2768	-H	-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	469

【 0 6 7 3 】

【表 2 7 6】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2769	-CH ₂ C ₆ H ₅	-(CH ₂) ₃ OH	546
2770	-CH ₃	-CH ₂ -cyclo-C ₃ H ₅	466
2771	-H	-CH ₂ CF ₃	480
2772	-H	-NHCH ₂ CF ₃	495
2773	-CH ₃	-CH ₃	426
2774	-H	-(CH ₂) ₃ OCH(CH ₃) ₂	498
2775	-H	-CH ₂ CH ₂ C(CH ₃) ₃	482
2776	-H	-CH ₂ CN	437
2777	-H	-(CH ₂) ₃ OCH ₃	470
2778	-H	-(CH ₂) ₂ OCH(CH ₃) ₂	484
2779	-H	-CH ₂ CH ₂ CN	451
2780	-H	-CH ₂ CONHCH ₃	469
2781	-H	-(CH ₂)SCH ₃	472
2782	-H	-CH ₂ CHF ₂	462
2783	-H	-C ₆ H ₁₃	482
2784	-CH ₂ CON(CH ₃) ₂	-CH ₃	497
2785	-CH ₂ C ₆ H ₅	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	546
2786	-H	-(CH ₂) ₂ NHCONH ₂	484

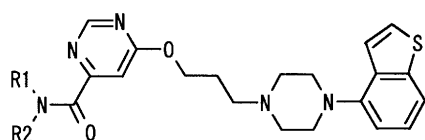
【 0 6 7 4 】

10

20

30

【表 2 7 7】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2787		-CH ₃	517
2788		-CH ₃	509
2789		-C ₂ H ₅	524
2790		-H	489
2791		-H	489
2792		-H	489
2793		-H	478
2794		-C ₂ H ₅	531
2795		-CH ₃	537
2796		-C ₂ H ₅	542

10

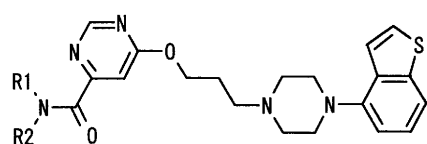
20

30

40

【0 6 7 5】

【表 2 7 8】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2797		-CH ₃	559
2798		-C ₂ H ₅	517
2799		-H	452
2800		-H	480
2801		-CH ₃	536
2802		-CH ₃	502
2803		-H	508
2804		-H	504
2805		-H	516
2806		-H	524
2807		-H	539

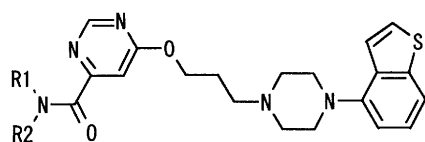
10

20

30

40

【表 2 7 9】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2808		-H	514
2809		-H	525
2810		-H	525
2811		-H	566
2812		-H	513
2813		-H	553
2814		-H	481
2815		-H	476
2816		-H	519
2817		-H	547

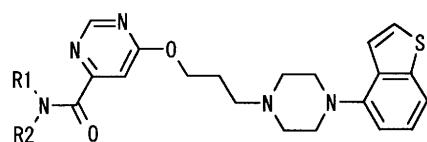
10

20

30

40

【表 280】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2818		-H	465
2819		-H	466
2820		-H	479
2821		-H	557
2822		-H	567
2823		-H	531
2824		-H	518
2825		-H	529
2826		-H	565

【0678】

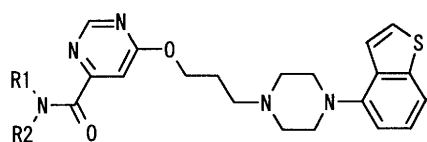
10

20

30

40

【表 2 8 1】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2827		-H	535
2828		-H	514
2829		-H	492
2830		-H	525
2831		-H	496
2832		-H	493
2833		-H	540
2834		-H	530
2835		-H	540

【0 6 7 9】

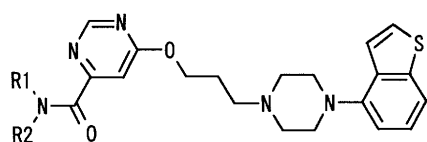
10

20

30

40

【表 2 8 2】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2836		-H	541
2837		-H	525
2838		-H	478
2839		-H	476
2840		-H	495
2841		-H	465
2842		-H	557
2843		-H	527
2844		-H	540

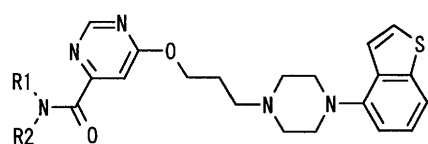
10

20

30

40

【表 2 8 3】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2845		-H	555
2846		-H	554
2847		-H	554
2848		-H	541
2849		-H	506
2850		-H	525
2851		-H	503
2852		-H	509
2853		-H	509
2854		-H	495

【0 6 8 1】

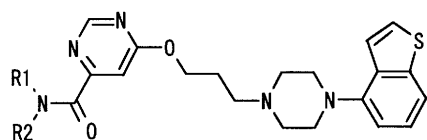
10

20

30

40

【表 2 8 4】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2855		-H	509
2856		-H	511
2857		-H	525
2858		-H	556
2859		-H	538
2860		-H	541
2861		-H	528
2862		-H	494
2863		-H	523
2864		-H	482

【0 6 8 2】

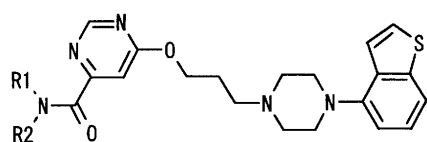
10

20

30

40

【表 2 8 5】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2865		-H	504
2866		-H	503
2867		-H	503
2868		-H	492
2869		-H	492
2870		-H	491
2871		-H	520
2872		-H	506
2873		-H	506
2874		-H	508

10

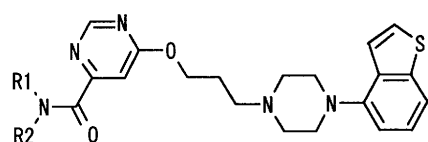
20

30

40

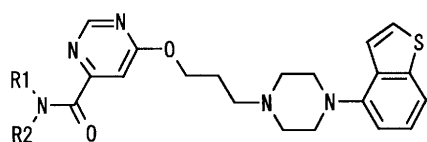
【0 6 8 3】

【表 2 8 6】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2875		-H	494
2876		-H	478
2877		-H	495
2878		-H	508
2879		-H	530
2880		-H	452
2881		-H	522
2882		-H	495
2883		-H	549
2884		-H	544
2885		-H	514

【表 2 8 7】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2886		-H	514
2887		-H	492
2888		-H	541
2889		-H	492
2890		-H	482
2891		-H	570
2892		-CH ₃	506
2893		-CH ₃	520
2894		-CH ₃	552
2895		-CH ₃	523
2896		-CH ₃	539

【 0 6 8 5 】

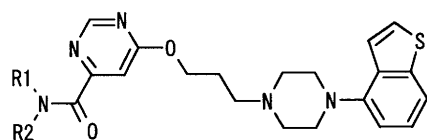
10

20

30

40

【表 2 8 8】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2897		-H	542
2898		-CH ₃	521
2899		-CH ₃	559
2900		-CH ₃	569
2901		-CH ₃	542
2902		-H	506
2903		-CH ₃	556
2904		-CH ₃	559
2905		-H	507

【0 6 8 6】

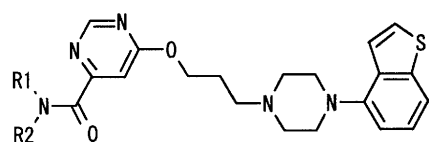
10

20

30

40

【表 2 8 9】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
2906		-H	510
2907		-CH ₃	555
2908		-H	561
2909		-H	568
2910		-CH ₃	566
2911		-CH ₃	579
2912		-CH ₃	582
2913		-H	544

【 0 6 8 7 】

10

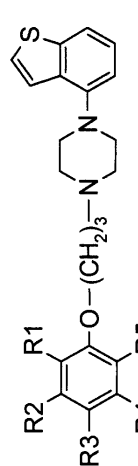
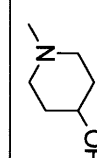
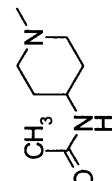
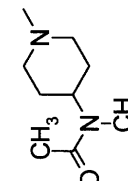
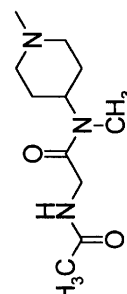
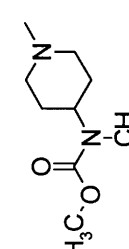
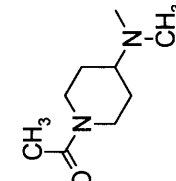
20

30

40

【表 290】

【 0 6 8 8 】

					R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(℃)	塩
実施例												
2914	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	230.0 (分解)	塩酸塩				
2915	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃							
2916	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	235.0 (分解)	塩酸塩				
2917	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	227.0 (分解)	塩酸塩				
2918	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	240.0 (分解)	塩酸塩				
2919	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	211.0-213.5	塩酸塩				

10

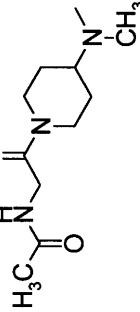
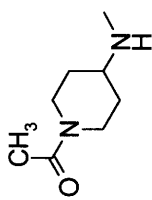
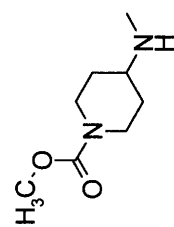
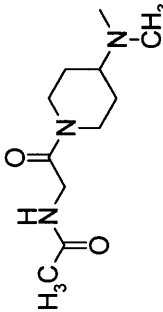
20

30

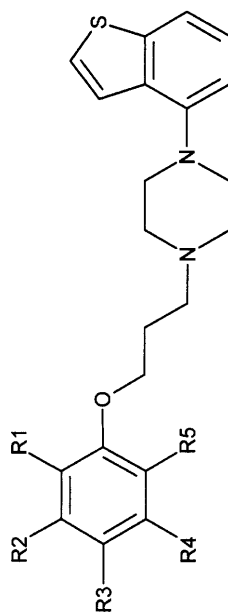
【表 2 9 1】

[0 6 8 9]

Chemical structure of a substituted benzene ring with a piperazine group and a thienyl group. The benzene ring has substituents R1, R2, R3, R4, and R5. The piperazine group is attached at position 1, and the thienyl group is attached at position 4.

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
2920	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	207.5-210.0	塩酸塩
2921	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	247.0 (分解)	—
2922	-CH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-OC ₃ H ₇	白色粉末 (エタノール)	178.5-179.5	塩酸塩
2923	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃			塩酸塩
2924	-OCH ₃	-H		-H	-CH ₃	白色粉末 (酢酸エチル)	248.5-257.5	塩酸塩

【表 2 9 2】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	NMR	塩
2925	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.36-1.65(4H, m), 1.88-2.11 (3H, m), 2.25(3H, s), 2.47(3H, s), 2.60-2.82(8H, m), 3.12-3.29(4H, m), 3.47-3.63(2H, m), 3.82(3H, s), 3.93(2H, t, J=6.4Hz), 6.34(1H, d, J=2.7Hz), 6.40(1H, d, J=2.7Hz), 6.90(1H, d, J=7.1Hz), 7.21-7.34(1H, m), 7.40 (2H, dd, J=5.5Hz, 9.9Hz), 7.55(1H, d, J=8.0Hz).	—
2926	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.48(9H, s), 1.67-1.92(4H, m), 1.95-2.11 (2H, m), 2.25(3H, s), 2.61-2.87(12H, m), 3.11-3.28(4H, m), 3.54-3.70(2H, m), 3.83(3H, s), 3.94(2H, t, J=6.3Hz), 6.34(1H, d, J=2.6Hz), 6.39(1H, d, J=2.6Hz), 6.90(1H, d, J=6.9Hz), 7.17-7.34(1H, m), 7.35-7.47 (2H, m), 7.55(1H, d, J=8.0Hz).	—
2927	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.96-2.11(2H, m), 2.27(3H, s), 2.57(4H, t, J=6.0Hz), 2.64-2.84(6H, m), 3.13-3.27(14H, m), 3.51(4H, t, J=6.0Hz), 3.84(3H, s), 3.96(2H, t, J=6.4Hz), 6.38(1H, d, J=2.7Hz), 6.20(1H, d, J=2.7Hz), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.21-7.32(1H, m), 7.40 (2H, dd, J=5.5Hz, 10.0Hz), 7.55(1H, d, J=8.1Hz).	—
2928	-CH ₃	-H		-H	-OCH ₃	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.83-1.95 (4H, m), 1.95-2.10(2H, m), 2.25(3H, s), 2.61-2.81(6H, m), 3.07-3.28(14H, m), 3.82(3H, s), 3.93(2H, t, J=6.5Hz), 6.30-6.43(2H, m), 6.90(1H, d, J=7.5Hz), 7.29-7.34(1H, m), 7.41 (2H, dd, J=6.0Hz, 10.0Hz), 7.55(1H, d, J=7.9Hz).	—

【0 6 9 0】

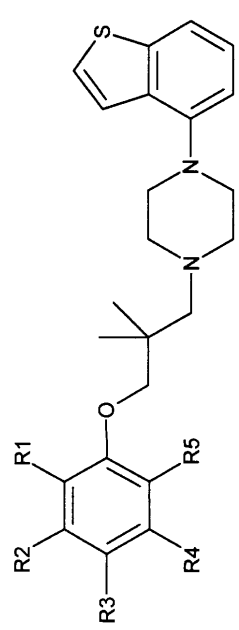
10

20

30

40

【表 2 9 3】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(℃)	塩
2929	-OCH ₃	-H	-CONH ₂	-H	-CH ₃	白色粉末 (エタノール)	189.0-192.5	塩酸塩
2930	-OCH ₃	-H	-CONHCH ₃	-H	-CH ₃	白色粉末 (イソプロピルアルコール-水)	165.5-167.0	—

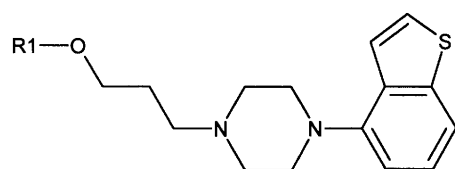
【 0 6 9 1 】

10

20

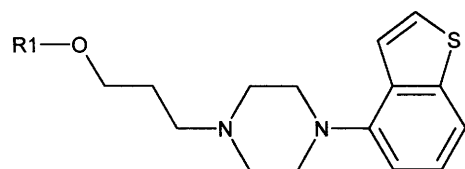
30

【表 2 9 4】



実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点 (°C)	塩
2931	白色粉末 (酢酸エチル-メタノール)	214-217	塩酸塩
2932	白色粉末 (酢酸エチル-メタノール)	218-222	1/2 フマル酸塩
2933	無色針状晶 (エタノール)	195-196	—
2934	白色粉末 (酢酸エチル)	145-146	—
2935	白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	219-221	二塩酸塩
2936	白色粉末 (酢酸エチル)	162-164	—
2937	白色粉末 (エタノール-エーテル)	208.5-209.5	二塩酸塩
2938	白色粉末 (n-ヘキサン-酢酸エチル)	137-139	—
2939	白色粉末 (エタノール)	137-139	—
2940	白色粉末 (酢酸エチル)	163-165	—
2941	白色粉末 (酢酸エチル)	196-199	—

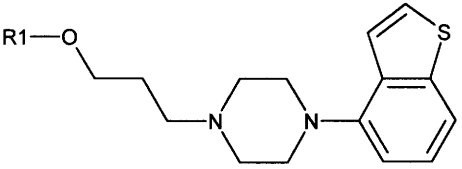
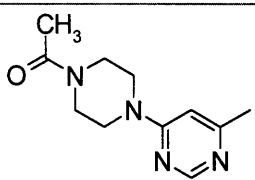
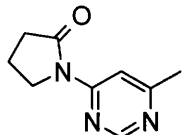
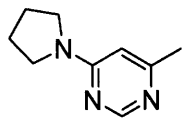
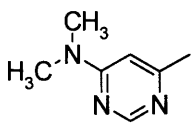
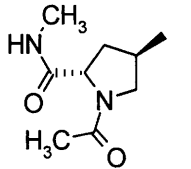
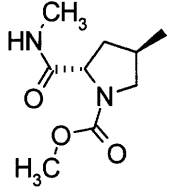
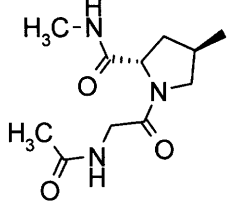
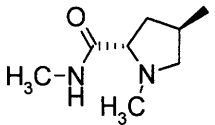
【表 295】



実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
2942 	白色粉末 (酢酸エチル)	197-199	—
2943 	白色粉末 (エタノール)	232-233	二塩酸塩
2944 	白色粉末 (エタノール-エーテル)	255-257	塩酸塩
2945 	白色粉末 (エタノール)	169.5-172.5	—
2946 	白色粉末 (エタノール)	195.0-196.5	—
2947 	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	151.5-153.5	—
2948 	白色粉末 (酢酸エチル)	235.0 (分解)	塩酸塩
2949 			
2950 	白色粉末 (酢酸エチル)	224.0-227.5	塩酸塩
2951 	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	175.0-178.5	—

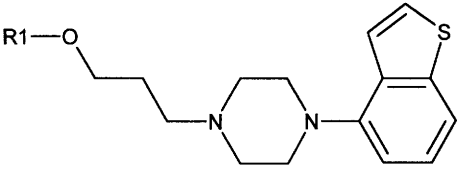
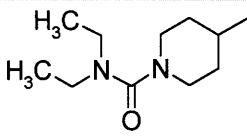
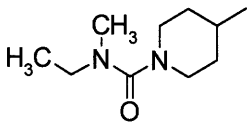
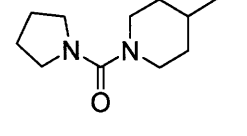
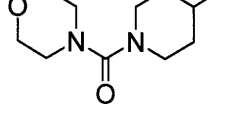
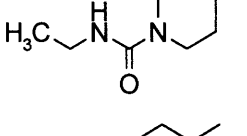
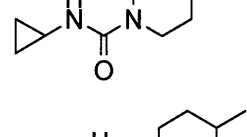
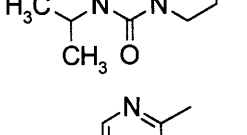
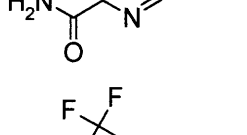
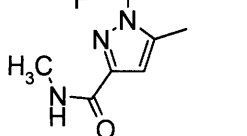
【0693】

【表 2 9 6】

実施例 R1		結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
2952		白色粉末 (酢酸エチル)	169.0-173.0	3塩酸塩
2953				
2954		白色粉末 (酢酸エチル)	210.0-217.0	2塩酸塩
2955				
2956		白色粉末 (酢酸エチル)	181.0-188.0	2塩酸塩
2957		白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	163.5-167.0	塩酸塩
2958		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	172.5-176.5	塩酸塩
2959		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	145.0-151.0	2塩酸塩
		白色粉末 (エタノール-酢酸エチル)	144.0-150.0	2塩酸塩

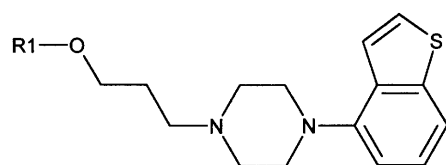
【 0 6 9 4】

【表 2 9 7】

実施例 R1		結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	177-182	2塩酸塩
		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	198-201	塩酸塩
		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	195-200	塩酸塩
		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	215-218	塩酸塩
		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	152-157	塩酸塩
		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	158-161	塩酸塩
		白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	168-172	塩酸塩
		白色粉末 (酢酸エチル)	178.5-181.5	—
		白色粉末 (酢酸エチル)	228.0 (分解)	塩酸塩

【0 6 9 5】

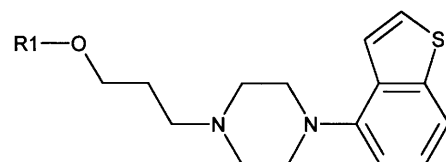
【表 2 9 8】



実施例 R1	NMR	塩
2969	¹ H-NMR (DMSO-d ₆) δppm: 1.95-2.10 (2H, m), 2.85-2.95 (2H, m), 3.00-3.15 (4H, m), 3.15-3.30 (4H, m), 4.41 (2H, t, J=5.8Hz), 6.89 (1H, d, J=5.0 Hz), 7.15 (1H, s), 7.26 (1H, t, J=7.9Hz), 7.43 (1H, d, J=5.5 Hz), 7.63 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.71 (1H, d, J=5.5 Hz), 8.73 (1H, s).	—
2970	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.72-1.98 (4H, m), 2.30-2.46(1H, m), 2.46-2.58(2H, m), 2.62-2.77 (5H, m), 2.80(3H, d, J=5.1Hz), 3.04-3.29 (5H, m), 3.38-3.55 (2H, m), 3.83-4.04 (2H, m), 6.90 (1H, dd, J=0.5Hz, 7.6Hz), 7.22-7.34 (1H, m), 7.34-7.47 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.63(1H, br).	—
2971	¹ H-NMR (CDCl ₃) δppm: 1.46 (9H, s), 1.70-1.89 (2H, m), 1.90-2.17(1H, — m), 2.44-2.60(2H, m), 2.62-2.75 (4H, m), 2.81(3H, d, J=4.7Hz), 3.09-3.26 (4H, m), 3.39-3.57 (4H, m), 3.93-4.21 (1H, m), 4.21-4.46(1H, m), 6.65-6.95(1H, br), 6.90 (1H, d, J=7.0 Hz), 7.20-7.34 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, J=8.0 Hz).	—

10

20

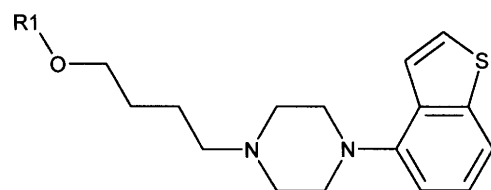


実施例 R1	MS(M+1)	塩
2972	440	塩酸塩
2973	360	マレイン酸塩

30

【0 6 9 6】

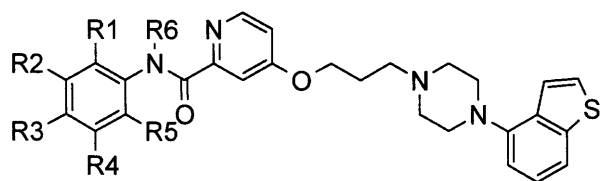
【表 299】



実施例 R1	結晶形 (再結晶溶媒)	融点(°C)	塩
2974	白色粉末 (酢酸エチル-エーテル)	215.5-216.5	塩酸塩
2975			
2976	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	132.5-135.0	—
2977	白色粉末 (2-プロパノール-水)	180.0-182.0	—
2978	白色粉末 (酢酸エチル)	216.0-220.0	塩酸塩
2979	白色粉末 (酢酸エチル)	203.0-207.0	塩酸塩
2980	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	146.5-148.0	—
2981	白色粉末 (酢酸エチル)	197.0-201.0	塩酸塩
2982	白色粉末 (酢酸エチル- イソプロピルエーテル)	133.0-134.5	—

【0697】

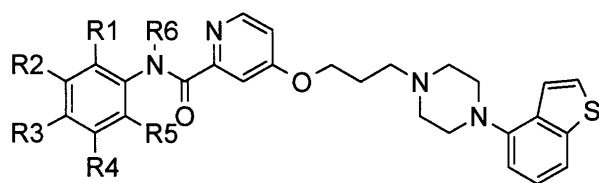
【表 3 0 0】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
2983	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	517
2984	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-CH ₃	501
2985	-H	-H	-Cl	-H	-H	-CH ₃	521
2986	-H	-SCH ₃	-H	-H	-H	-H	519
2987	-SCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	519
2988	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	541
2989	-H	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	557
2990	-H	-H	-H	-H	-H	-H	473
2991	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	507
2992	-H	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	503
2993	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	503
2994	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	503
2995	-Cl	-H	-H	-H	-H	-H	507
2996	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	507
2997	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	487
2998	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	-H	533
2999	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	-H	516
3000	-1-PYRRYL	-H	-H	-H	-H	-H	538
3001	-H	-Cl	-H	-H	-OCH ₃	-H	537
3002	-H	-OCH ₃	-H	-H	-OCH ₃	-H	533
3003	-H	-OCH ₃	-H	-OCH ₃	-H	-H	533
3004	-OCH ₃	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	517
3005	-H	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	533
3006	-C(CH ₃)=CH ₂	-H	-H	-H	-H	-H	513
3007	-H	-OCF ₃	-H	-H	-H	-H	557
3008	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-H	487
3009	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	487
3010	-F	-H	-H	-H	-H	-H	491

【 0 6 9 8 】

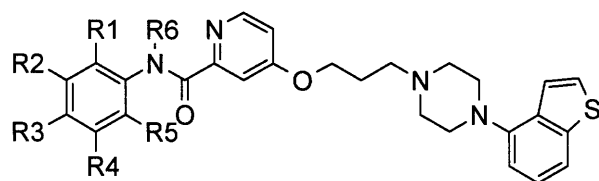
【表 3 0 1】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
3011	-H	-H	-F	-H	-H	-H	491
3012	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	-H	516
3013	-H	-H	-N(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	516
3014	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	-H	541
3015	-H	-CF ₃	-H	-H	-H	-H	541
3016	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	-H	530
3017	-H	-H	-NHCOCH ₃	-H	-H	-H	530
3018	-H	-H	-H	-H	-CN	-H	498
3019	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	498
3020	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	-CH ₃	501
3021	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	501
3022	-H	-Cl	-H	-H	-H	-CH ₃	521
3023	-H	-H	-OH	-H	-H	-CH ₃	503
3024	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	-H	501
3025	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	-H	501
3026	-CH ₃	-H	-H	-H	-CH ₃	-H	501
3027	-H	-CH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	501
3028	-H	-CH ₃	-H	-CH ₃	-H	-H	501
3029	-F	-F	-H	-H	-H	-H	509
3030	-H	-F	-F	-H	-H	-H	509
3031	-H	-F	-H	-F	-H	-H	509
3032	-H	-F	-OCH ₃	-H	-H	-H	521
3033	-H	-OCH ₃	-CH ₃	-H	-H	-H	517
3034	-H	-Cl	-OCH ₃	-H	-H	-H	537
3035	-H	-Cl	-CH ₃	-H	-H	-H	521
3036	-OCH ₃	-OCH ₃	-H	-H	-H	-H	533
3037	-H	-Cl	-OH	-H	-H	-H	523
3038	-Cl	-H	-H	-CH ₃	-H	-H	521

【 0 6 9 9 】

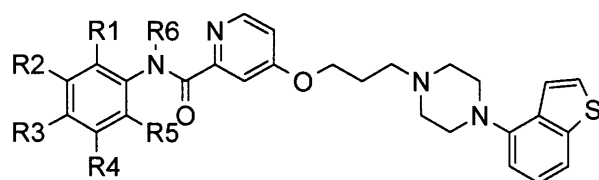
【表 3 0 2】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
3039	-H	-CONH ₂	-H	-H	-Cl	-H	550
3040	-CH ₃	-H	-Br	-H	-CH ₃	-H	579
3041	-H	-H	-CN	-H	-H	-H	498
3042	-H	-H	-SCH ₃	-H	-H	-H	519
3043	-H	-H	-CH(CH ₃) ₂	-H	-H	-H	515
3044	-H	-H	-2-FURYL	-H	-H	-H	539

【 0 7 0 0】

【表 3 0 3】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
3045	-H		-H	-H	-H	-H	539
3046	-H		-H	-H	-H	-H	540
3047	-H		-H	-H	-H	-H	542
3048	-H	-H		-H	-H	-H	554
3049	-H		-H	-H	-H	-H	553
3050	-H	-H		-H	-H	-H	553
3051	-H		-H	-H	-H	-H	540

【 0 7 0 1】

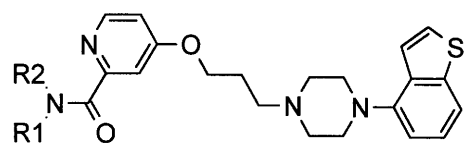
10

20

30

40

【表 3 0 4】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
3052		-H	474
3053		-H	523
3054		-H	513
3055		-H	474
3056		-H	474
3057		-H	524
3058		-H	504
3059		-H	512
3060		-H	560

【 0 7 0 2】

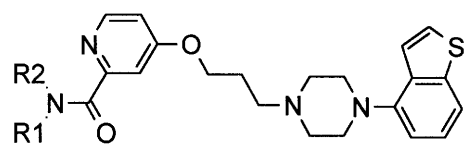
10

20

30

40

【表 3 0 5】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
3061		-H	556
3062		-H	556
3063		-H	572
3064		-H	488
3065		-H	480
3066		-H	524
3067		-H	546
3068		-H	478

【 0 7 0 3】

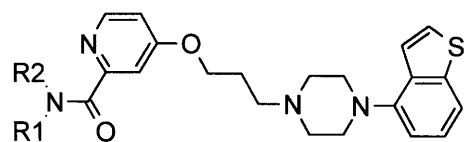
10

20

30

40

【表 3 0 6】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
3069		-H	556
3070		-H	528
3071		-H	564
3072		-H	534
3073		-H	513
3074		-H	491
3075		-H	506
3076		-H	492
3077		-H	529

【 0 7 0 4】

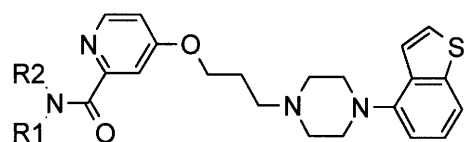
10

20

30

40

【表 3 0 7】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
3078		-H	480
3079		-H	477
3080		-H	494
3081		-H	464
3082		-H	478
3083		-H	566
3084		-H	556
3085		-H	526

【 0 7 0 5】

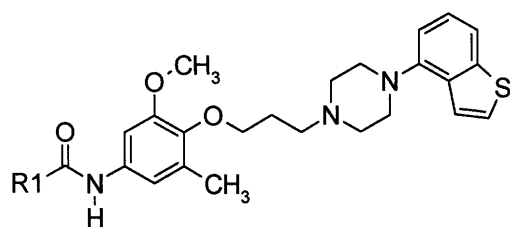
10

20

30

40

【表 308】



実施例	R1	MS(M+1)	
3086		553	10
3087		525	
3088		567	20
3089		499	
3090		497	30
3091		543	
3092		549	
3093		559	40

【0706】

実施例 3094

3-アミノ-4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-N-エチルベンズアミドの合成

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-N-エチル-3-ニトロベンズアミド 1.0 g (2.1ミリモル)のエタノール溶液(30ml)に5%パラジウム炭素0.8gを加え、上記原料化合物を室温常圧で接

触還元した。触媒をろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。残渣に水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン：メタノール＝30：1→20：1）で精製した。精製物を減圧下に濃縮して黄色無定形固体の3-アミノ-4-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-N-エチルベンズアミド0.78 g（収率83%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.23 (3H, t, $J=7.4$ Hz), 2.00-2.15 (2H, m), 2.67 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 2.75 (4H, brs), 3.21 (4H, brs), 3.40-3.50 (2H, m), 3.50-4.30 (2H, br), 4.13 (2H, t, $J=6.5$ Hz), 5.99 (1H, brs), 6.80 (1H, d, $J=8.4$ Hz), 6.90 (1H, d, $J=7.6$ Hz), 7.08 (1H, dd, $J=2.1, 8.3$ Hz), 7.19 (1H, d, $J=2.1$ Hz), 7.25-7.30 (1H, m), 7.35-7.45 (2H, m), 7.55 (1H, d, $J=8.0$ Hz)。

【0707】

実施例3095

1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4-[3-(1-アセチルピペリジン-4-イルオキシ) プロピル] ピペラジン 塩酸塩の合成

1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4-[3-(ピペリジン-4-イルオキシ) プロピル] ピペラジン0.45 g（1.25ミリモル）のジクロロメタン溶液（15 ml）にトリエチルアミン0.28 ml（2.0ミリモル）を加え、混合液を氷水浴で冷却した。冷却した溶液に塩化アセチル0.1 ml（1.4ミリモル）を加え、得られた混合液を室温で一晩攪拌した。反応液に水を加えてジクロロメタンで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ジクロロメタン：メタノール＝30：1）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣に0.5N塩化水素メタノール溶液3 mlを加えた。生成した結晶をろ取し、乾燥して白色粉末の1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4-[3-(1-アセチルピペリジン-4-イルオキシ) プロピル] ピペラジン 塩酸塩0.36 g（収率66%）を得た。融点 208-210°C。

【0708】

実施例3096

1-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] ピロリジン-2, 5-ジオン 塩酸塩の合成

3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロパノール1.00 g（3.6ミリモル）のTHF溶液（50 ml）にPS-トリフェニルホスフィン（3 mmol/g）1.80 g、ジ tert-ブチルアゾジカルボキシラート1.27 g（5.4ミリモル）及びN-ヒドロキシスクシンイミド510 mg（4.3ミリモル）を加え、混合液を室温で4時間攪拌した。レジンをろ過して除き、ろ液を減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル＝1：2）で精製した。精製物を減圧下に濃縮して白色無定形固体762 mg（収率47%）を得た。157 mgをエタノールに溶解し、得られた溶液に1N-塩化水素エタノール溶液0.42 mlを加え、エーテルを加え、混合液を冷蔵庫に放置した。生成した結晶をろ取し、乾燥して白色粉末の1-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] ピロリジン-2, 5-ジオン 塩酸塩158 mgを得た。融点 255.0-257.0°C。

【0709】

実施例3097

6-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-1-ナフトアミドの合成

6-[3-(4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ]-1-ナフトレンカルボン酸0.52 g（1.2ミリモル）のアセトニトリル溶液（10 ml）に氷冷下トリエチルアミン0.24 ml（1.7ミリモル）及びクロロ炭酸イソブチル0.19 ml（1.4ミリモル）を加え、混合液を20分攪拌した。攪拌後の

溶液にアンモニア水（28%）0.5mlを加え、混合液を室温で20分攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、混合液を水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル=2：1→0：1）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の6-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-ナフトアミド0.27g（収率53%）を得た。

融点 167.0-169.0°C。

【0710】

実施例3098

1-アリル-5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチルアミドの合成

1-アリル-5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチルエステル0.5g（1.1ミリモル）のメタノール溶液（5ml）に40%メチルアミンメタノール溶液5mlを加え、混合液を室温で3日間攪拌した。攪拌後の溶液を減圧下に濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル=5：1→0：1）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の1-アリル-5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸メチルアミド0.32g（収率67%）を得た。

融点 138.5-140.5°C。

【0711】

実施例3099

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]シクロヘキサンカルボキサミドの合成

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]シクロヘキサンカルボン酸0.5g（1.2ミリモル）のジクロロメタン溶液（10ml）にアンモニア水（28%）0.5ml、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩（WSC）0.36g（1.9ミリモル）及び4-ジメチルアミノピリジン（DMAP）0.05g（0.4ミリモル）を加え、混合液を室温で19時間攪拌した。反応液にジクロロメタンを加え、混合液を水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル=3：1→0：1）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]シクロヘキサンカルボキサミド0.1g（収率22%）を得た。

融点 107.5-108.5°C。

【0712】

実施例3100

エタンスルホン酸{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}アミド 塩酸塩の合成

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニルアミン0.2g（0.49ミリモル）のジクロロメタン溶液（4ml）を氷冷し、N-エチルジイソプロピルアミン0.15ml（0.87ミリモル）及びエタンスルホンクロリド0.07ml（0.73ミリモル）を加え、混合液を室温で1時間攪拌した。攪拌後の混合液にN-エチルジイソプロピルアミン0.15ml（0.87ミリモル）及びエタンスルホンクロリド0.07ml（0.73ミリモル）を追加し、得られた混合液を室温で19時間攪拌した。攪拌後の混合液に6N-水酸化ナトリウム水溶液0.5ml及びエタノール2mlを加え、得られた混合液を室温

10

20

30

40

50

で一夜攪拌した。反応液にジクロロメタンを加え、得られた混合液を水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝2：1→0：1）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣に4*N*-塩化水素酢酸エチル溶液を加えた。生成した結晶をろ取り、乾燥して白色粉末のエタンスルホン酸〔4-〔3-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）プロポキシ〕-3-メトキシ-5-メチルフェニル〕アミド 塩酸塩 222 mg（収率85%）を得た。

融点 235.5-237.5°C。

【0713】

実施例3101

5-〔3-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）プロポキシ〕-1-メチル-1*H*-ピラゾール-3-イルカルバミン酸メチルエステルの合成

5-〔3-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）プロポキシ〕-1-メチル-1*H*-ピラゾール-3-イルアミン 0.17 g（0.47ミリモル）のジクロロメタン溶液（2 ml）を氷冷し、この溶液にピリジン 0.08 ml（0.94ミリモル）及びクロロ炭酸メチル 0.04 ml（0.52ミリモル）を加え、混合液を室温で17時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、得られた混合液を水で洗浄した。水層を酢酸エチルで抽出した。有機層を合わせて無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝2：1→1：1）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジオソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の5-〔3-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）プロポキシ〕-1-メチル-1*H*-ピラゾール-3-イルカルバミン酸メチルエステル 0.10 g（収率51%）を得た。

融点 162.5-165.0°C。

【0714】

実施例3102

3-〔5-〔3-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）プロポキシ〕-1-メチル-1*H*-ピラゾール-3-イル〕1,1-ジメチル尿素 塩酸塩の合成

5-〔3-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）プロポキシ〕-1-メチル-1*H*-ピラゾール-3-イルアミン 0.27 g（0.73ミリモル）のジクロロメタン溶液（5 ml）を氷冷し、この溶液にトリエチルアミン 0.36 ml（2.5ミリモル）、ジメチルカルバモイルクロリド 0.20 ml（2.1ミリモル）及びピリジン 0.06 ml（0.73ミリモル）を加え、混合液を室温で一夜攪拌した。反応液に水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン：酢酸エチル＝3：1→0：1）で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、得られた溶液に4*N*-塩化水素酢酸エチル溶液を加えた。生成した結晶をろ取り、乾燥して淡黄色粉末の3-〔5-〔3-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）プロポキシ〕-1-メチル-1*H*-ピラゾール-3-イル〕1,1-ジメチル尿素 塩酸塩 0.10 g（収率30%）を得た。

融点 174.0-176.5°C。

【0715】

実施例3103

3-〔5-〔4-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）ブトキシ〕-1-メチル-1*H*-ピラゾール-3-イル〕1,1-ジメチル尿素 塩酸塩の合成

5-〔4-（4-ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル）ブトキシ〕-1-メチル-1*H*-ピラゾール-3-イルカルバミン酸フェニルエステル 0.26 g（0.52ミリモル）のDMF溶液（3 ml）にジメチルアミン水溶液（50%）0.

10

20

30

40

50

16 ml (1.6 mmol) を加え、混合液を室温で16時間攪拌した。反応液に水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=7:3→0:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、1N-塩化水素エタノール溶液を加えた。生成した結晶をろ取し、乾燥して白色粉末の 3- {5- [4- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} 1, 1-ジメチル尿素 塩酸塩 95 mg (収率37%) を得た。

融点 186.0-187.5°C。

【0716】

実施例3104

N- {5- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} アセトアミドの合成

5- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イルアミン 0.20 g (0.54 mmol) のジクロロメタン溶液 (4 ml) に無水酢酸 1 ml 及びトリエチルアミン 0.09 ml (0.65 mmol) を加え、混合液を室温で6時間攪拌した。反応液に炭酸カリウム水溶液を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル=2:1→0:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の N- {5- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル} アセトアミド 0.19 g (収率89%) を得た。

融点 137.0-139.0°C。

【0717】

実施例3105

3- {4- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-ヒドロキシメチル-5-メトキシフェニル} オキサゾリジン-2-オン 塩酸塩の合成

2- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-メトキシ-5- (2-オキソオキサゾリジン-3-イル) ベンズアルデヒド 塩酸塩 1.28 g (2.4 mmol) を炭酸カリウム水溶液に加えて、混合物をジクロロメタンで抽出した。抽出物を減圧下に濃縮し、残渣を THF 15 ml に溶解した。得られた溶液に、氷冷水素化硼素ナトリウム 0.05 g (1.2 mmol) を加え、この混合液を室温で3時間攪拌した。反応液に氷冷下10%塩酸を加えて過剰の試薬を分解した。この溶液に6N-水酸化ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性にした後、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ジクロロメタン：酢酸エチル=3:7→ジクロロメタン：メタノール=100:3) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣をエタノールに溶解し、得られた溶液に1N-塩化水素エタノール溶液を加えた。生成した結晶をエタノールから再結晶して白色粉末の 3- {4- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-ヒドロキシメチル-5-メトキシフェニル} オキサゾリジン-2-オン 塩酸塩 0.52 g (収率41%) を得た。

融点 224.0-226.5°C (分解)。

【0718】

実施例3106

1-アセチル-4- {4- [3- (4-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル) プロポキシ] -3-メトキシ-5-メチルフェニル} ピペラジン 塩酸塩の合成

1-ベンゾ [b] チオフェン-4-イル-4- [3- (4-ブロモ-2-メトキシ-6

10

20

30

40

50

ーメチルフェノキシ) プロピル] ピペラジン 塩酸塩 0.5 g (0.98ミリモル)、1-アセチルピペラジン 0.15 g (1.2ミリモル)、酢酸パラジウム 11 mg (0.048ミリモル)、2, 2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフチル(BINAP) 63 mg (0.098ミリモル) 及びナトリウムt-ブトキシド 0.23 g (2.3ミリモル) をトルエン 10 ml に加え、混合液をアルゴン雰囲気下 90℃で 22時間攪拌した。反応液を室温まで冷却し、セライトろ過した。ろ物を酢酸エチルで洗浄し、ろ液と洗液を合わせて減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン: 酢酸エチル=11:1→1:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、得られた溶液に 1N-塩化水素エタノール溶液を加えた。生成した結晶をろ取し、乾燥して白色粉末の 1-アセチル-4-{4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-メトキシ-5-メチルフェニル}ピペラジン 塩酸塩 75 mg (収率 14%) を得た。

融点 257.0-261.0℃(分解)。

【0719】

実施例 3107

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-4-[3-(4-イミダゾール-1-イル-2-メトキシ-6-メチルフェノキシ)プロピル]ピペラジン 二塩酸塩の合成

1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-4-[3-(4-ヨード-2-メトキシ-6-メチルフェノキシ)プロピル]ピペラジン 0.6 g (0.69ミリモル)、イミダゾール 0.07 g (1.03ミリモル)、よう化銅(I) 13 mg (0.069ミリモル)、trans-N,N'-ジメチル-1,2-シクロヘキサジアミン 0.02 ml (0.14ミリモル) 及び炭酸セシウム 0.47 g (1.38ミリモル) を 1,4-ジオキササン 6 ml に加え、混合液をアルゴン雰囲気下 50時間加熱還流した。反応液を室温まで冷却し、これに水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン: 酢酸エチル=5:1→1:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解し、1N-塩化水素エタノール溶液を加えた。生成した結晶をろ取し、乾燥して淡黄色粉末の 1-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-4-[3-(4-イミダゾール-1-イル-2-メトキシ-6-メチルフェノキシ)プロピル]ピペラジン 二塩酸塩 60 mg (収率 17%) を得た。

融点 234.0-240.0℃(分解)。

【0720】

実施例 3108

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3,N-ジメチル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ベンズアミド 塩酸塩の合成

4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-ヒドロキシ-5,N-ジメチルベンズアミド 188 mg (0.39ミリモル) の DMF 溶液 (2 ml) に炭酸セシウム 0.34 g (0.99ミリモル) 及び 1,1,1-トリフルオロ-2-ヨードエタン 0.05 ml (0.47ミリモル) を加え、混合液を 40℃で 2時間攪拌した。これに 1,1,1-トリフルオロ-2-ヨードエタン 0.1 ml (0.94ミリモル) を追加し、混合液を 40℃で 5時間攪拌した。反応液を室温まで冷却し、これに水を加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣を塩基性シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン: 酢酸エチル=3:1→0:1) で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣をイソプロピルアルコールに溶解し、1N-塩化水素エタノール溶液を加えた。反応液を減圧下に濃縮した。残渣をイソプロピルアルコール-酢酸エチル混合溶媒から再結晶して淡黄色粉末の 4-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3,N-ジメチル-5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ベンズアミド 塩酸塩 88 mg (収率 40%) を得た。

融点 156.0-157.5℃。

【0721】

実施例3109

3-アセチル-5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール 塩酸塩の合成

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 メトキシメチルアミド 塩酸塩0.61g(1.3ミリモル)を水酸化ナトリウム水溶液に加え、混合物をジクロロメタンで抽出した。抽出物を減圧下に濃縮し、残渣をTHF12mlに溶解した。得られた溶液を-78℃に冷却し、これに1N-メチルリチウムエーテル溶液1.2mlを加え、混合液を同温度で2時間攪拌した。反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、混合液を室温まで加熱し、これに炭酸カリウムを加え、生成物を酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ジクロロメタン:酢酸エチル=3:1→0:1)で精製した。精製物を減圧下に濃縮して残渣をエタノールに溶解し、1N-塩化水素エタノール溶液を加えた。得られた結晶を含水エタノールから再結晶して白色粉末の3-アセチル-5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-1-メチル-1H-ピラゾール 塩酸塩0.22g(収率40%)を得た。

融点 245.0℃(分解)。

【0722】

実施例3110

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-ヒドロキシメチル-1-メチル-1H-ピラゾールの合成

5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-(tert-ブチルジメチルシラニルオキシメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール0.75g(1.5ミリモル)のTHF溶液(8ml)を氷冷し、この溶液に1M-テトラブチルアンモニウムフルオリドTHF溶液1.7mlを加え、これを室温で16時間攪拌した。反応液に酢酸エチルを加え、混合液を水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ジクロロメタン:メタノール=1:0→30:1→15:1)で精製した。精製物を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して白色粉末の5-[3-(4-ベンゾ[b]チオフェン-4-イル-ピペラジン-1-イル)プロポキシ]-3-ヒドロキシメチル-1-メチル-1H-ピラゾール0.46g(収率79%)を得た。

融点 123.5-126.0℃。

【0723】

薬理試験1

1) ドパミンD₂受容体結合実験

Kohlerらの方法(Kohler C, Hall H, Ogren SO and Gawell L. Specific in vitro and in vivo binding of 3H-raclopride. A potent substituted benzamide drug with high affinity for dopamine D-2 receptors in the rat brain. Biochem. Pharmacol., 1985; 34: 2251-2259)に従って、実験を行った。

【0724】

ウイスター系雄性ラットを断頭し、脳をすみやかに取り出し、線条体を摘出した。組織重量の50倍量の50mMトリス(ヒドロキシメチル)アミノメタン(トリス)-塩酸緩衝液(pH:7.4)中で高速回転刃によるホモジナイザーを用いてホモジナイズし、4℃、48,000×gで10分間遠心した。得られた沈渣を再度組織重量の50倍量の上記緩衝液で懸濁し、37℃で10分間インキュベーションした後、上記条件で遠心した。得られた沈渣を組織重量の25倍量の50mMトリス-塩酸緩衝液(120mM NaCl、5mM KCl、2mM CaCl₂、1mM MgCl₂含有、pH:7.4)で

懸濁し、これらを膜標本として結合実験に用いるまで -85°C で凍結保存した。

【0725】

結合実験は、膜標本 $40\mu\text{l}$ 、 $[^3\text{H}]$ ーラクロプライド $20\mu\text{l}$ （最終濃度 $1-2\text{nM}$ ）、被験薬物 $20\mu\text{l}$ 及び 50mM トリスー塩酸緩衝液（ 120mMNaCl 、 5mMKCl 、 $2\text{mM}\text{CaCl}_2$ 、 1mMMgCl_2 含有、 $\text{pH}:7.4$ ）で全容量 $200\mu\text{l}$ にして行った（最終ジメチルスルホキシド濃度 1% ）。反応は室温で1時間行い、セルハーベスターを用い、グラスファイバー製フィルタープレートに吸引ろ過することにより終了した。グラスファイバー製フィルタープレートを 50mM トリスー塩酸緩衝液（ $\text{pH}:7.4$ ）で洗浄した後、乾燥後、マイクロプレート液体シンチレーションカクテルを加えて、マイクロプレートシンチレーションカウンターで放射活性を測定した。 $10\mu\text{M}$ （+）ー塩酸ブタクラモール存在下での放射活性を非特異結合とした。

10

【0726】

IC_{50} 値は、濃度依存性反応から非線形解析プログラムを用いて算出した。 Ki 値は、Cheng-Prusoff 式を用いて IC_{50} 値から算出した。結果を次表に示す。

【0727】

【表 3 0 9】

供 試 化 合 物	K _i (nM)	
実施例 1 の化合物	0. 2	
実施例 3 の化合物	0. 5	
実施例 4 の化合物	0. 5	
実施例 5 の化合物	0. 6	
実施例 6 の化合物	0. 8	
実施例 7 の化合物	0. 5	
実施例 1 0 の化合物	0. 4	
実施例 1 1 の化合物	0. 1	10
実施例 1 2 の化合物	0. 1	
実施例 1 3 の化合物	2. 4	
実施例 1 4 の化合物	3. 2	
実施例 1 5 の化合物	0. 2	
実施例 1 6 の化合物	0. 7	
実施例 1 7 の化合物	2. 2	
実施例 1 8 の化合物	2. 6	
実施例 1 9 の化合物	1. 2	
実施例 2 0 の化合物	1. 5	
実施例 2 2 の化合物	4. 0	20
実施例 2 3 の化合物	0. 7	
実施例 2 4 の化合物	5. 0	
実施例 2 6 の化合物	3. 5	
実施例 2 7 の化合物	4. 9	
実施例 2 8 の化合物	1. 2	
実施例 3 0 の化合物	0. 7	
実施例 3 1 の化合物	1. 4	
実施例 3 2 の化合物	1. 5	
実施例 3 3 の化合物	1. 1	
実施例 3 4 の化合物	1. 2	
実施例 3 5 の化合物	1. 6	30
実施例 3 6 の化合物	1. 0	
実施例 3 7 の化合物	1. 9	
実施例 3 8 の化合物	1. 2	
実施例 3 9 の化合物	1. 2	
実施例 4 0 の化合物	4. 8	
実施例 4 1 の化合物	1. 9	

【 0 7 2 8 】

【表 3 1 0】

供試化合物	Ki (nM)	
実施例 64 の化合物	3.2	
実施例 68 の化合物	1.0	
実施例 69 の化合物	0.8	
実施例 73 の化合物	4.0	
実施例 79 の化合物	4.7	
実施例 80 の化合物	1.5	
実施例 81 の化合物	0.8	10
実施例 84 の化合物	2.4	
実施例 85 の化合物	2.0	
実施例 90 の化合物	0.4	
実施例 91 の化合物	1.4	
実施例 92 の化合物	1.7	
実施例 116 の化合物	4.5	
実施例 117 の化合物	4.7	
実施例 118 の化合物	3.5	
実施例 122 の化合物	3.3	20
実施例 128 の化合物	1.3	
実施例 139 の化合物	0.2	
実施例 155 の化合物	2.3	
実施例 163 の化合物	2.8	
実施例 184 の化合物	2.6	
実施例 185 の化合物	2.7	
実施例 186 の化合物	2.3	
実施例 188 の化合物	1.6	
実施例 190 の化合物	0.8	

30

【 0 7 2 9】

【表 3 1 1】

供試化合物	Ki (nM)	
実施例 802 の化合物	0.6	
実施例 1059 の化合物	0.4	
実施例 1060 の化合物	0.1	
実施例 1061 の化合物	0.1	
実施例 1071 の化合物	0.1	
実施例 1076 の化合物	1.2	10
実施例 1079 の化合物	0.4	
実施例 1080 の化合物	0.6	
実施例 1083 の化合物	0.3	
実施例 1084 の化合物	0.1	
実施例 1086 の化合物	1.0	
実施例 1087 の化合物	0.3	
実施例 1089 の化合物	1.0	
実施例 1106 の化合物	1.0	
実施例 1110 の化合物	1.2	20
実施例 1113 の化合物	0.7	
実施例 1138 の化合物	1.4	

【0 7 3 0】

2) セロトニン 5-H T_{2A} 受容体結合実験

Leysen JEらの方法 (Leysen JE, Niemegeers CJE, Van Nueten JM, and Laduron PM. [3H]Ketanserin (R 41 468), a selective 3H-ligand for serotonin 2 receptor binding sites. Mol. Pharmacol., 1982; 21: 301-314) に従って、実験を行った。

【0 7 3 1】

ウイスター系雄性ラットを断頭し、脳をすみやかに取り出し、前頭皮質を摘出した。組織重量の 10 倍量の 0.25 M ショ糖中でテフロン (登録商標) ガラスホモジナイザーを用いてホモジナイズし、4℃、1,000×g で 10 分間遠心した。得られた上清を別の遠心管に移し、沈渣を組織重量の 5 倍量の 0.25 M ショ糖で懸濁し、上記条件で遠心した。得られた上清を先に得られた上清と合わせ 50 mM トリス-塩酸緩衝液 (pH: 7.4) で組織重量の 40 倍量に調製し、4℃、35,000×g で 10 分間遠心した。得られた沈渣を再度組織重量の 40 倍量の上記緩衝液で懸濁し、上記条件で遠心した。得られた沈渣を組織重量の 20 倍量の上記緩衝液で懸濁し、これらを膜標本として結合実験に用いるまで -85℃ で凍結保存した。

【0 7 3 2】

結合実験は、膜標本 40 μl、[³H]-ケタンセリン 20 μl (最終濃度 1-3 nM)、被験薬物 20 μl 及び 50 mM トリス-塩酸緩衝液 (pH: 7.4) で全容量 200 μl にして行った (最終ジメチルスルホキシド濃度 1%)。反応は 37℃ で 20 分間行い、セルハーベスターを用い、グラスファイバー製フィルタープレートに吸引ろ過することにより終了した。

【0 7 3 3】

グラスファイバー製フィルタープレートを 50 mM トリス-HCl 緩衝液 (pH: 7.4) で洗浄した後、乾燥後、マイクロプレート液体シンチレーションカクテルを加えて、マイクロプレートシンチレーションカウンターで放射活性を測定した。10 μM スピペロン存在下での放射活性を非特異結合とした。

【0 7 3 4】

I C₅₀値は、濃度依存性反応から非線形解析プログラムを用いて算出した。K_i値は、Cheng-Prusoff 式を用いて I C₅₀値から算出した。結果を次表に示す。

【 0 7 3 5 】

【表 3 1 2】

供 試 化 合 物	K _i (nM)	
実施例 1 の化合物	2. 3	
実施例 2 の化合物	1. 5	
実施例 3 の化合物	2. 3	
実施例 4 の化合物	4. 9	
実施例 5 の化合物	6. 4	10
実施例 7 の化合物	4. 0	
実施例 8 の化合物	0. 6	
実施例 9 の化合物	2. 6	
実施例 10 の化合物	3. 0	
実施例 11 の化合物	5. 7	
実施例 12 の化合物	2. 1	
実施例 15 の化合物	3. 3	
実施例 16 の化合物	7. 0	
実施例 17 の化合物	2. 8	
実施例 18 の化合物	8. 0	20
実施例 19 の化合物	1. 2	
実施例 20 の化合物	3. 3	
実施例 21 の化合物	1. 0	
実施例 22 の化合物	2. 9	
実施例 23 の化合物	1. 7	
実施例 24 の化合物	2. 3	
実施例 25 の化合物	4. 6	
実施例 26 の化合物	4. 4	
実施例 27 の化合物	4. 1	
実施例 28 の化合物	2. 8	
実施例 30 の化合物	2. 0	30
実施例 31 の化合物	4. 5	
実施例 32 の化合物	8. 6	
実施例 33 の化合物	6. 6	
実施例 34 の化合物	1. 5	
実施例 35 の化合物	2. 1	
実施例 36 の化合物	2. 1	
実施例 37 の化合物	3. 1	
実施例 38 の化合物	7. 3	
実施例 39 の化合物	2. 1	
実施例 40 の化合物	5. 1	40
実施例 41 の化合物	3. 2	

【 0 7 3 6 】

【表 3 1 3】

供試化合物	Ki (nM)
実施例 64 の化合物	8.2
実施例 68 の化合物	7.0
実施例 69 の化合物	6.1
実施例 73 の化合物	1.3
実施例 79 の化合物	5.5
実施例 80 の化合物	2.5
実施例 81 の化合物	2.6
実施例 84 の化合物	3.3
実施例 89 の化合物	3.1
実施例 90 の化合物	5.3
実施例 91 の化合物	6.5
実施例 92 の化合物	5.7
実施例 116 の化合物	4.2
実施例 117 の化合物	1.3
実施例 118 の化合物	3.4
実施例 122 の化合物	2.9
実施例 128 の化合物	6.3
実施例 139 の化合物	4.0
実施例 155 の化合物	3.0
実施例 163 の化合物	7.4
実施例 184 の化合物	4.3
実施例 185 の化合物	5.0
実施例 186 の化合物	8.8
実施例 188 の化合物	6.3
実施例 190 の化合物	2.9

10

20

30

【 0 7 3 7 】

【表 3 1 4】

供試化合物	Ki (nM)
実施例 802 の化合物	1.4
実施例 1059 の化合物	3.8
実施例 1060 の化合物	1.2
実施例 1061 の化合物	1.2
実施例 1071 の化合物	1.3
実施例 1076 の化合物	12.4
実施例 1079 の化合物	2.8
実施例 1080 の化合物	3.4
実施例 1083 の化合物	1.5
実施例 1084 の化合物	1.4
実施例 1086 の化合物	5.8
実施例 1087 の化合物	2.6
実施例 1089 の化合物	13.9
実施例 1106 の化合物	7.1
実施例 1110 の化合物	4.9
実施例 1113 の化合物	5.0
実施例 1138 の化合物	19.7

10

20

【0738】

3) アドレナリン α_1 受容体結合実験

Grob Gらの方法 (Grob G, Hanft G, and Kolassa N. Urapidil and some analogues with hypotensive properties show high affinities for 5-hydroxytryptamine (5-HT) binding sites of the 5-HT1A subtype and for α_1 -adrenoceptor binding sites. Naunyn-Schmiedeberg's Arch Pharmacol, 1987; 336: 597-601) に従って、実験を行った。

30

【0739】

ウイスター系雄性ラットを断頭し、脳をすみやかに取り出し、大脳皮質を摘出した。組織重量の20倍量の50mMトリス-塩酸緩衝液(100mM NaCl、2mM エチレンジアミン四酢酸二水素二ナトリウム含有、pH: 7.4)中で高速回転刃によるホモジナイザーを用いてホモジナイズし、4℃、80,000×gで20分間遠心した。得られた沈渣を組織重量の20倍量の上記緩衝液で懸濁し、37℃で10分間インキュベーションした後、上記条件で遠心した。得られた沈渣を再度組織重量の20倍量の上記緩衝液で懸濁し、上記条件で遠心した。得られた沈渣を組織重量の20倍量の50mMトリス-塩酸緩衝液(1mM エチレンジアミン四酢酸二水素二ナトリウム含有、pH: 7.4)で懸濁し、これらを膜標本として結合実験に用いるまで-85℃で凍結保存した。

40

【0740】

結合実験は、膜標本40μl、 $[^3\text{H}]$ -プラゾシン20μl(最終濃度0.2-0.5nM)、被験薬物20μl及び50mMトリス-塩酸緩衝液(1mM EDTA含有、pH: 7.4)で全容量200μlにして行った(最終ジメチルスルホキシド濃度1%)。反応は30℃で45分間行い、セルハーベスターを用い、ガラスファイバー製フィルタープレートに吸引ろ過することにより終了した。

【0741】

ガラスファイバー製フィルタープレートを50mMトリス-塩酸緩衝液(pH: 7.4)で洗浄した後、乾燥後、マイクロプレート液体シンチレーションカクテルを加えて、マイクロプレートシンチレーションカウンターで放射活性を測定した。10μM塩酸フェントールアミン存在下での放射活性を非特異結合とした。

50

【0742】

IC₅₀値は、濃度依存性反応から非線形解析プログラムを用いて算出した。Ki値は、Cheng-Prussoff 式を用いて IC₅₀値から算出した。

【0743】

薬理試験 2

ドパミンD₂受容体発現細胞を用いたドパミンD₂受容体に対する部分作動性（パーシャルアゴニスト性）

フォルスコリン刺激して環状アデノシン3', 5'-リン酸（サイクリックAMP）産生を誘導したドパミンD₂受容体発現細胞において、測定化合物のサイクリックAMP産生抑制作用を定量することによって、ドパミンD₂受容体に対するパーシャルアゴニスト性を評価した。

10

【0744】

ヒト型ドパミンD₂受容体発現チャイニーズハムスター卵巣/DHFR（-）細胞を培地（イスコフ修飾ダルベッコ培地（IMDM培地）、10%牛胎仔血清、50 I. U. / ml ペニシリン、50 µg / ml ストレプトマイシン、200 µg / ml ジェネティシン、0.1 mM ヒポキサンチンナトリウム、16 µM チミジン）中、37℃、5%炭酸ガス条件で培養した。ポリ-L-リジン塗布された96穴マイクロプレートに10⁴細胞/ウェルの細胞を播き、2日間同条件下で培養した。各ウェルを洗浄液100 µl（IMDM培地、0.1 mM ヒポキサンチンナトリウム、16 µM チミジン）で洗浄し、試験化合物3 µMを溶解した試験化合物添加培地50 µl（IMDM培地、0.1%アスコルビン酸ナトリウム、0.1 mM ヒポキサンチンナトリウム、16 µM チミジン）に置換した。37℃、5%炭酸ガス条件で20分静置した後、同試験化合物3 µMを溶解した試験化合物添加フォルスコリン刺激培地100 µl（IMDM培地、0.1%アスコルビン酸ナトリウム、0.1 mM ヒポキサンチンナトリウム、16 µM チミジン、10 µM フォルスコリン、500 µM 3-イソブチル-1-メチルキサンチン）に置換し、37℃、5%炭酸ガス条件で10分間静置した。培地を除去後、リシス（Lysis）1B水溶液200 µl（アマシャムバイオサイエンス サイクリックAMP バイオトラック エンザイムイムノアッセイシステム添付試薬）を分注し、約10分間振盪した。各ウェル中の水溶液を測定サンプルとした。4倍希釈した測定サンプルを上記エンザイムイムノアッセイシステムを用いてサイクリックAMP量の測定を行った。試験化合物を加えていないウェルのサイクリックAMP量を100%として各試験化合物の抑制率を計算した。この実験系において、対照薬として用いたドパミンは最大活性として、サイクリックAMP量を約10%まで抑制した。

20

30

【0745】

上記試験において、試験化合物がドパミンD₂受容体に対するパーシャルアゴニスト性を有していることを確認した。

【0746】

試験化合物がドパミンD₂受容体に対するパーシャルアゴニスト性を有していることにより、統合失調症患者においてドパミン神経伝達を正常な状態へ安定化させることができ、その結果、副作用を発現することなく、例えば陽性及び陰性症状改善作用、認知障害改善作用等の臨床改善作用を発現することができる。

40

【0747】

薬理試験 3

ラットを用いたアポモルヒネ誘発常同行動に対する抑制作用

試験動物として、ウィスターラット（雄、6-7週齢、日本エスエルシー株式会社）を用いた。試験化合物は、これをメノウの乳鉢を用いて5%アラビアゴム／（生理食塩水もしくは水）にて懸濁し、必要に応じ同液にて希釈したものを使用した。

【0748】

試験動物を前日より一晩絶食とした。各試験化合物を経口投与し（5 ml / kg）、その1時間後に0.7 mg / kg アポモルヒネを皮下投与した（1 ml / kg）。アポモル

50

ヒネ投与20、30及び40分後に常同行動を1分間ずつ観察した。

【0749】

各動物の常同行動を下記の条件にて点数化し、3回の点数を合計し、抗アポモルヒネ作用の評価を行った。なお、各群とも試験動物を6匹ずつ使用した。

0：生理食塩水を投与したラットと観察上差がない状態

1：探索行動は継続的に行うが、におい嗅ぎ動作は断続的にしか行わない状態

2：におい嗅ぎ動作を継続的に行い、探索行動はときどきしか行わない状態

3：におい嗅ぎ動作を継続的に行うが、噛み付き動作や舌舐めずり動作は断続的にしか行わない状態。なお、このときの自発運動量は極めて少ない。

4：継続的な噛み付き動作や舌舐めずり動作を行う状態。なお、このとき探索行動は観られない。

10

【0750】

統計処理には、全て非臨床統計解析システムを用いた。有意確率値が0.05より低い場合に有意差有りとした。溶媒投与群と各試験化合物投与群との間の点数の差はウィルコクソンの順位和検定もしくはスティール検定を用いて解析した。また、50%有効用量（95%信頼区間）の算出には直線回帰分析を用いた。

【0751】

上記試験において、試験化合物がアポモルヒネ誘発常同行動に対する抑制作用を示したことから、試験化合物がD₂受容体拮抗作用を有することを確認した。

【0752】

20

薬理試験4

ラットを用いた(±)D-2, 5-ジメトキシ-4-ヨードアンフェタミン(DOI)誘発首振り行動に対する抑制作用

試験動物として、ウィスターラット（雄，6-7週齢，日本エスエルシー株式会社）を用いた。試験化合物は、これをメノウの乳鉢を用いて5%アラビアゴム／（生理食塩水もしくは水）にて懸濁し、必要に応じ同液にて希釈したものを使用した。

【0753】

試験動物を前日より一晩絶食させた。各試験化合物を経口投与し（5ml/kg）、その1時間後に5.0mg/kgのDOIを皮下投与し（1ml/kg）、その直後から10分間に誘発される首振り行動の回数を数えた。なお、各群とも試験動物を6匹ずつ使用した。

30

【0754】

統計処理には、全て非臨床統計解析システムを用いた。有意確率値が0.05より低い場合に有意差ありとした。溶媒投与群と各試験化合物投与群との間の首振り回数の差はt検定もしくはダネット検定を用いて解析した。また、50%有効用量（95%信頼区間）の算出には直線回帰分析を用いた。

【0755】

上記試験において、試験化合物がDOI誘発首振り行動に対する抑制作用を示したことから、試験化合物はセロトニン5HT_{2A}受容体拮抗作用を有していることが確認された。

【0756】

40

薬理試験5

ラットにおける硬直状態（カタレプシー）惹起作用

試験動物として、ウィスターラット（雄，6-7週齢，日本エスエルシー株式会社）を用いた。試験化合物は、これをメノウの乳鉢を用いて5%アラビアゴム／（生理食塩水もしくは水）にて懸濁し、必要に応じ同液にて希釈したものを使用した。

【0757】

試験動物を前日より一晩絶食させた。各試験化合物を経口投与し（5ml/kg）、その1、2、4、6及び8時間後にカタレプシー及び眼瞼下垂の観察を行った。なお、各群とも試験動物を6匹ずつ使用した。

【0758】

50

スチール製の小箱（幅：6.5 cm，奥行き：4.0 cm，高さ：7.2 cm）の縁にラットの片手を乗せ（不自然な姿勢）、30秒以上、その姿勢を維持していた場合をカタレプシー陽性と判定した。観察は各時点で3回行い、一度でも陽性であった場合、その個体はカタレプシーを惹起したと判定した。

【0759】

上記試験の結果、試験化合物のカタレプシー惹起作用とアポモルヒネ誘発常同行動抑制作用とが乖離しており、そのため臨床における錐体外路性副作用惹起の懸念が低いことが確認できた。

【0760】

薬理試験6

ラット脳シナプトソームによる化合物のセロトニン(5-HT)取り込み阻害活性測定

雄のウィスターラットを断頭し、脳を取り出し、前頭皮質を分離し、これを重量の20倍量の0.32モラー（M）ショ糖溶液内にいれ、ポッター型ホモジナイザーでホモジナイズした。ホモジネートを1000g 10分間、4℃で遠心し、その上清をさらに20000g 20分間、4℃で遠心し、そのペレットをインキュベーションバッファー（10ミリ（m）M グルコース，145mM 塩化ナトリウム，4.5mM 塩化カリウム，1.2mM 塩化マグネシウム，1.5mM 塩化カルシウムを含む20mM ヘペスバッファー（pH7.4））に懸濁させたものを粗シナプトソーム画分として用いた。取り込み反応は96穴のラウンドボトムプレートを用いて容量200マイクロ（μ）リットル（l）で行い、反応時にはインキュベーションバッファーにパージェリン（最終濃度10μM）とアスコルビン酸（最終濃度0.2mg/ml）を加え使用した。100%取り込み値は化合物の溶媒のみを加えたときの取り込み活性、0%取り込み値（非特異的取り込み値）は未標識の5-HT（最終濃度10μM）を加えたときの取り込み活性とし、測定用の各穴を準備した。評価化合物は最終濃度が300nMになるように希釈を行ったものを入れた穴を準備した。各穴にシナプトソーム画分を最終容量の10分の1量加え37℃で10分間プレインキュベーション後、トリチウムラベル5-HT溶液（最終濃度8nM）を加えて37℃で取り込み反応を開始した。取り込み時間は10分とし、96穴ガラス繊維濾紙プレートに吸引濾過することで反応を終了させ、さらに濾紙を冷生理食塩水で洗った後、十分に乾燥させてマイクロシンチ0（パーキンエルマー）を加え、フィルター上の残存放射活性を測定した。100%と0%の取り込み時の放射活性と各化合物の放射活性から各化合物の阻害活性を計算した。

【0761】

【数1】

$$\text{セロトニン取り込み阻害率(\%)} = \left(1 - \frac{\text{化合物添加時のカウント} - 0\% \text{取り込みのカウント}}{100\% \text{取り込みのカウント} - 0\% \text{取り込みのカウント}} \right) \times 100$$

【0762】

【表 3 1 5】

供試化合物	セロトニン取り込み阻害率 (%) (300nM)	
実施例 1 の化合物	92.4	
実施例 2 の化合物	78.8	
実施例 3 の化合物	84.8	
実施例 4 の化合物	91.0	
実施例 5 の化合物	89.1	
実施例 6 の化合物	91.3	
実施例 7 の化合物	91.0	10
実施例 8 の化合物	95.0	
実施例 9 の化合物	97.3	
実施例 10 の化合物	92.6	
実施例 11 の化合物	95.2	
実施例 13 の化合物	77.0	
実施例 14 の化合物	85.2	
実施例 15 の化合物	95.3	
実施例 16 の化合物	86.7	
実施例 17 の化合物	86.3	
実施例 18 の化合物	91.1	
実施例 19 の化合物	86.3	20
実施例 20 の化合物	92.8	
実施例 21 の化合物	81.4	
実施例 22 の化合物	90.8	
実施例 23 の化合物	95.5	
実施例 24 の化合物	97.5	
実施例 25 の化合物	91.9	
実施例 26 の化合物	92.0	
実施例 27 の化合物	94.0	
実施例 28 の化合物	95.3	
実施例 30 の化合物	95.8	
実施例 31 の化合物	96.3	30
実施例 32 の化合物	96.9	
実施例 33 の化合物	94.3	
実施例 34 の化合物	94.2	
実施例 35 の化合物	93.4	
実施例 36 の化合物	97.4	
実施例 37 の化合物	97.7	
実施例 38 の化合物	96.7	
実施例 39 の化合物	99.2	
実施例 40 の化合物	91.6	
実施例 41 の化合物	95.1	40
実施例 64 の化合物	73.0	
実施例 65 の化合物	72.9	
実施例 66 の化合物	74.1	
実施例 67 の化合物	93.9	
実施例 68 の化合物	95.7	
実施例 69 の化合物	96.3	

【0 7 6 3】

【表 3 1 6】

供試化合物	セロトニン取り込み阻害率 (%) (300nM)	
実施例 802 の化合物	96.6	
実施例 1071 の化合物	94.4	
実施例 1076 の化合物	87.8	
実施例 1089 の化合物	85.0	
実施例 1083 の化合物	96.3	
実施例 1106 の化合物	69.9	10
実施例 1079 の化合物	82.3	
実施例 1080 の化合物	95.6	
実施例 1138 の化合物	67.2	
実施例 1059 の化合物	97.2	
実施例 1060 の化合物	97.5	
実施例 1061 の化合物	97.5	
実施例 1110 の化合物	38.5	
実施例 1086 の化合物	98.6	
実施例 1087 の化合物	97.1	20
実施例 1113 の化合物	59.3	

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

<i>C 0 7 D 417/14</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 417/14</i>	
<i>C 0 7 D 411/12</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 411/12</i>	
<i>C 0 7 D 495/04</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 495/04</i>	1 0 5 A
<i>C 0 7 D 491/113</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 491/113</i>	
<i>C 0 7 D 471/10</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 471/10</i>	1 0 3
<i>C 0 7 D 487/04</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 487/04</i>	1 4 0
<i>C 0 7 D 413/14</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 413/14</i>	
<i>C 0 7 D 453/02</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 453/02</i>	
<i>C 0 7 D 498/04</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 487/04</i>	1 4 5
<i>C 0 7 D 471/04</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 471/10</i>	1 0 1
<i>A 6 1 K 31/496</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 498/04</i>	1 0 5
<i>A 6 1 K 31/538</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 471/04</i>	1 0 5 E
<i>A 6 1 K 31/517</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>C 0 7 D 495/04</i>	1 0 1
<i>A 6 1 K 31/506</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/496</i>	
<i>A 6 1 K 31/497</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/538</i>	
<i>A 6 1 K 31/536</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/517</i>	
<i>A 6 1 K 31/5415</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/506</i>	
<i>A 6 1 K 31/55</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/497</i>	
<i>A 6 1 K 31/5377</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/536</i>	
<i>A 6 1 K 31/551</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/5415</i>	
<i>A 6 1 K 31/553</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/55</i>	
<i>A 6 1 K 31/5513</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/5377</i>	
<i>A 6 1 K 31/498</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/551</i>	
<i>A 6 1 K 31/541</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/553</i>	
<i>A 6 1 P 43/00</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/5513</i>	
<i>A 6 1 P 25/24</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/498</i>	
<i>A 6 1 P 25/28</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 K 31/541</i>	
<i>A 6 1 P 25/20</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 43/00</i>	1 1 1
<i>A 6 1 P 25/18</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 43/00</i>	1 1 4
<i>A 6 1 P 15/10</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 25/24</i>	
<i>A 6 1 P 3/04</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 25/28</i>	
<i>A 6 1 P 1/14</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 25/20</i>	
<i>A 6 1 P 25/32</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 25/18</i>	
<i>A 6 1 P 25/36</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 15/10</i>	
<i>A 6 1 P 25/16</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 3/04</i>	
<i>A 6 1 P 1/08</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 1/14</i>	
<i>A 6 1 P 25/06</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 25/32</i>	
<i>A 6 1 P 25/04</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 25/36</i>	
<i>A 6 1 P 25/00</i>	<i>(2006.01)</i>	<i>A 6 1 P 25/16</i>	
		<i>A 6 1 P 1/08</i>	
		<i>A 6 1 P 25/06</i>	
		<i>A 6 1 P 25/04</i>	
		<i>A 6 1 P 25/00</i>	

(72)発明者 大島 邦生

徳島県徳島市川内町加賀須野463-10 大塚製菓株式会社内

(72)発明者 黒田 英明

- 徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 伊藤 展明
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 宮村 伸
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 清水 聡
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 田中 達義
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 平良 伸一
徳島県徳島市川内町平石夷野 2 2 4-1 8 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 近藤 一見
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 糸谷 元宏
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 福島 多恵
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 高橋 永
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 櫻井 庸二
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内
(72)発明者 黒田 武志
徳島県徳島市川内町加賀須野 4 6 3-1 0 大塚製菓株式会社内

審査官 齋藤 恵

- (56)参考文献 特開平 0 2-2 1 8 6 6 5 (JP, A)
特開平 0 6-0 0 9 6 1 7 (JP, A)
特開 2 0 0 6-3 1 6 0 5 2 (JP, A)
特表平 1 0-5 1 2 8 6 1 (JP, A)
特表平 0 8-5 0 1 5 5 9 (JP, A)
特表 2 0 0 6-5 1 3 1 6 7 (JP, A)
特表 2 0 0 7-5 0 3 3 8 6 (JP, A)
特表 2 0 0 6-5 0 3 1 0 6 (JP, A)
特表 2 0 0 3-5 1 9 2 2 9 (JP, A)
特表 2 0 0 3-5 1 9 2 2 6 (JP, A)
特表 2 0 0 4-5 3 5 4 4 8 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D

A 6 1 K

CA/REGISTRY (STN)